

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALICIA LLOREDA RICAURTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 07-062939- -00002-0000
Fecha: 2011-02-17 14:46:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	07-062939
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	202762
	Folios	10

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☒
		Cap. II	☐

No. Sol. Internacional	PCT/EP2005/056609
Fecha de Presentación Internal.	Diciembre 08 de 2005

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

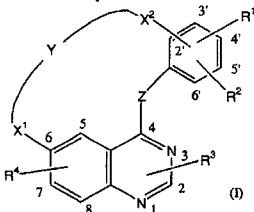
- | | | | |
|------|-------------------|---|-----------------------------|
| 1.1. | Descripción: | Folios: 37 a 170 | como se radicó inicialmente |
| 1.2. | Reivindicaciones: | Folios: 171 a 192 | como se radicó inicialmente |
| 1.3. | Prioridad: | US No. 60/634,228 del 08 de Diciembre de 2004 | |
| | | EP No. 04106383.5 del 08 de Diciembre de 2004 | |

2. Objeto de la invención

Título: "DERIVADOS DE QUINAZOL MACROCICLICOS Y SU USO COMO MTKI"

El problema planteado en esta solicitud es el de proporcionar inhibidores de cinasa dirigidos a múltiples blancos (MTKI), que son derivados macrociclos de quinazolina, los cuales poseen una actividad anti-proliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y los cuales se usan en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio presenta compuestos de fórmula (I) y su composición farmacéutica.



El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/529

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

Se recomienda ajustar el título, a lo que se desea proteger a través del capítulo reivindicatorio; ya que los usos de acuerdo a la normatividad vigente no son patentables.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- Las Reivindicaciones 1 a 8; no son concisas, porque los radicales tienen muchos significados y sustituciones; solicitando un número demasiado grande de compuestos posibles reclamados bajo la característica esencial de la fórmula (I).

Además, las expresiones: "formas estereoquímicamente isoméricas", "uno o más", "donde sea posible", no dan claridad a las reivindicaciones. Hacer la aclaración pertinente.

- La Reivindicación 7; desea proteger un compuesto inhibidor de cinasa de fórmula (I), el cual no se encuentra definido de manera inequívoca por sus características técnicas esenciales y no se presenta en esta ni siquiera la estructura química; además siendo un inhibidor de cinasa debe hacerse dependiente de la reivindicación independiente 1. La misma no se acepta.
- La Reivindicación 8; desea proteger un compuesto de fórmula (I), el cual no se encuentra definido por sus características técnicas esenciales sino por su uso. La misma no se acepta.

Por consiguiente es necesario que el solicitante concrete la materia reclamada bajo la fórmula (I), haciendo una generalización razonable de los compuestos que se han ejemplificado y de acuerdo con los compuestos que evidencian ser inhibidores de cinasa dirigidos a múltiples blancos (MTKI), que son derivados macrociclos de quinazolina, los cuales poseen una actividad anti-proliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y los cuales se usan en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

La Reivindicación 9, reclama usos, y de acuerdo con la legislación Colombiana, los usos reclamados no se consideran para protección por patente.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: Diciembre 08 de 2004

Teniendo en cuenta la fecha indicada se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

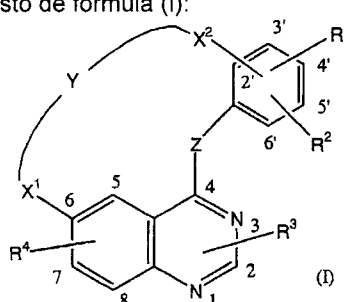
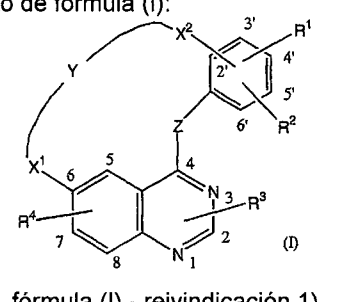
Nº	Documento	Título	Fecha
D1	CO 2005/119403	DERIVADOS DE DIFENILAZETIDINONA PARA TRATAR TRANSTORNOS DEL METABOLISMO DE LIPIDOS	Mayo 27 de 2003 Fecha de prioridad

D1, se refiere a derivados macrociclos de quinazolina, los cuales poseen una actividad anti-proliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y los mismos se usan en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer (folio 226, líneas 1-7).

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1 Novedad (artículo 16 D486)

- Reivindicación 1: Compuesto de fórmula (I)

CARACTERISTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 07-062939	D1 = CO 2005/119403
Compuesto de fórmula (I): 	Compuesto de fórmula (I): 
R1= Hidrógeno, ciano, halo, hidroxi	(Folio 227, fórmula (I) - reivindicación 1) (SI)
R2= Hidrógeno, ciano, halo, hidroxi, hidroxycarbonilo, Het16-carbonilo, alquiloxicarbonilo C1-4, alquilcarbonilo C1-4, Het1, alquilo C1-4-alquino C2-6, Ar5, dihidroxiborano	(Folio 228, reivindicación 1) (SI)
R3= Hidrógeno, alquilo C1-4, alquilo C1-4 sustituido con halo	(Folio 228, reivindicación 1) (SI)
R4= Ar4-alquilo C1-4, alquilo C1-4, alquilo C1-4 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de: alquilo C1-4, hidroxi, halo, Het2, NR7R8, NR9R10-carbonil, Het3-carbonilo	(Folio 228, reivindicación 1) (SI)
X1= O, -O-alquilo C1-2, -O-N=CH-, NR11, -NR11-alquilo C1-2; siendo: R11= Hidrógeno, alquilo C1-4	(Folio 229, reivindicación 1) (SI)
X2= O, -O-alquilo C1-2, CO, -CO-alquilo C1-2, NR12, -NR12-alquilo C1-2, -O-N=CH, alquilo C1-2; siendo: R12= Hidrógeno, alquilo C1-4, alquilo C1-4-carbonilo	(Folio 229, reivindicación 1) (SI)
Y= Alquilo C3-, alqueno C2-9, alquilo C1-5-alquilo C1-5, alquilo C1-5-NR13-alquilo C1-5, alquilo C1-5-NR14-CO-alquilo C1-5, alquilo C1-6-NH-CO, NH-CO-alquilo C1-6, CO-alquilo C1-7, alquilo C1-7-CO, alquilo C1-6-CO-alquilo C1-6,	(Folio 229, reivindicación 1) (SI)

alquilo C1-2-NR23-CO-CR16R17-NH, alquilo C1-2-CO-NH-CR18R19-CO, alquilo C1-2-CO-NR20-alquilo C1-3-CO, alquilo C1-2-NR21-CH2-CO-NH-alquilo C1-3, NR22-CO-alquilo C1-3-NH, alquilo C1-3-NH-CO-Het20, alquilo C1-2-CO-Het21-CO, Het22-CH2-CO-NH-alquilo C1-3	alquilo C1-2-NR23-CO-CR16R17-NH, alquilo C1-2-CO-NH-CR18R19-CO, alquilo C1-2-CO-NR20-alquilo C1-3-CO, alquilo C1-2-NR21-CH2-CO-NH-alquilo C1-3, NR22-CO-alquilo C1-3-NH, alquilo C1-3-NH-CO-Het20, alquilo C1-2-CO-Het21-CO, Het22-CH2-CO-NH-alquilo C1-3
(Folio 227, reivindicación 1)	(SI)
Z= NH	Z= NH (Folio 227, reivindicación 1) (SI)

D1 divulga derivados macrociclos de quinazolina, los cuales poseen una actividad anti-proliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y los cuales se usan en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer (Folio 226, líneas 1-7).

Las características esenciales del compuesto de fórmula (XV) que se encuentran descritas en la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en D1, es decir: los significados para los radicales R1, R2, R3, R4, X1, X2, Y y Z (ver tabla anterior) en (folios 227 a 229, reivindicación 1). Por lo tanto el compuesto de fórmula (I) de la reivindicación 1 y sus dependientes, con sus respectivas composiciones farmacéuticas, no son nuevos.

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO 2005/119403	1 a 9 y 10	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto (5), del título primero de la circular única N° 10 de 2001.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 08 FEB. 2011

CONCEPTO TÉCNICO No. 0085	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202080
---------------------------	---

2006 / 06 14 17 .

248

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
ALICIA LLOREDA RICAURTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-062939- -00002-0000

Fecha: 2011-02-17 14:46:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO Radicación 07-062939
 Trámite 011
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 1 2 5 2 4

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐
Vía Nacional ☐
Vía PCT (Fase Nacional) ☒ Cap. I ☒ Cap. II ☐
No. Solicitud Internacional PCT/EP2005/056609
Fecha de Presentación Internacional 08-12-2005

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios 37-170 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 171 A 192 como se radicó inicialmente
 Folios 240-247 modificadas en fase Nacional

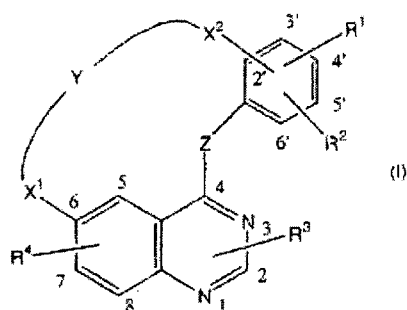
Prioridad: US 60/634,228 del 08 de diciembre de 2004
 EP 04106383.5 del 08 de diciembre de 2004

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "DERIVADOS DE QUINAZOL MACROCÍCLICOS Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN" (f. 234)

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de proporcionar inhibidores de cinasa dirigidos a múltiples blancos (MTKI), que son derivados macrocíclicos de quinazolina, los cuales poseen una actividad anti-proliferativa, tal como una actividad anticáncer, útiles en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I) y su composición farmacéutica.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/529; A61P35/00; C07D239/00; C07D273/00; C07D498/08.

3. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de concisión debido a que comprende un número demasiado alto de alternativas posibles dentro de la misma.

La expresión "caracterizado adicionalmente en que ya sea" (f. 242), en la reivindicación 1 no es clara, ya que no se entiende si los sustituyentes de Y, R4 y Het², son solo los divulgados luego de dicha expresión o corresponden a los presentados previamente. Adicionalmente, esta expresión y condición de los compuestos no se encuentra sustentada en la descripción.

4. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la Fecha de Presentación de la Solicitud de Prioridad: 08 de diciembre de 2004 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

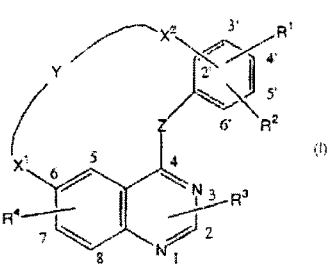
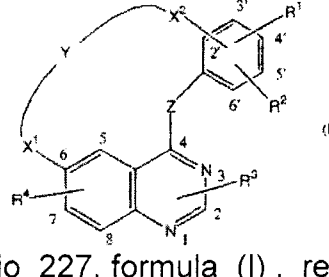
Item	Documento	Título	Fecha de Prioridad
D1	CO2005/119403	DERIVADOS DE DIFENILAZETIDINONA PARA TRATAR TRASTORNOS DEL METABOLISMO DE LÍPIDOS	27-05-2003

D1 se refiere a derivados macrociclos de quinazolina, los cuales poseen una actividad antiproliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y los mismos se usan en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer (folio 226, líneas 1-7).

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

Reivindicación 1 reclama compuestos de fórmula (I)

Características esenciales	D1
	 Folio 227, formula (I) , reiv. 1
R1 = H, ciano, halo	R1 = H, ciano, halo
R2= H, ciano, halo, alquínilo C2-6,	R2= H, ciano, halo, alquínilo C2-6,
R3 = H,	R3 = H,
R4 = alquiloxi C1-4 ó alquiloxi C1-4 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de: alquiloxi C1-4, hidroxi, alquiloxi C1-4- alquiloxi C1-4, NR7R8, NR9R10-carbonil, Het2-	R4 = alquiloxi C1-4 ó alquiloxi C1-4 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de: alquiloxi C1-4, hidroxi, NR7R8, NR9R10-carbonil, Het2-
X1 = O, -O-alquilo C1-2,	X1 = O, -O-alquilo C1-2,
Y = alquilo C3-9, alquilo C1-5-NR13-alquilo C1-5, alquilo C1-5-NR14CO-alquiloC1-5, alquilo C1-2NR23-CO-CR16R17-NH-,	Y = alquilo C3-9, alquilo C1-5-NR13-alquilo C1-5, alquilo C1-5-NR14CO-alquiloC1-5, alquilo C1-2NH-CO-CR16R17-NH-,
Z= NH	Z= NH

D1 divulga derivados macrocíclicos de quinazolina (f. 228 reiv. 1), los cuales poseen actividad antiproliferativa, tal como una actividad anti-cáncer y que son útiles en la preparación de medicamentos para tratar trastornos hiperproliferativos como aterosclerosis, restenosis y cáncer (f. 226, líneas 1-7).

La reivindicación 7 reclama una composición farmacéutica que comprende un vehículo farmacéuticamente aceptable y, como ingrediente activo, una cantidad efectiva inhibidora de cinasa de un compuesto como el que se describe en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6.

D1 enseña composiciones que comprenden compuestos inhibidores de cinasa de la fórmula (I) (reiv. 12), que como se evidenció anteriormente, corresponde a los compuestos de la presente solicitud. En consecuencia, la reivindicación 7 carece de novedad.

6. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO2005/119403	1-7	Novedad

7. Respuesta a los argumentos del solicitante

El solicitante presenta un nuevo capítulo reivindicatorio (f. 240-247), luego del estudio de este documento, esta Oficina encuentra que el mismo no amplía la materia contenida en la solicitud original y por lo tanto es aceptado para estudio de patentabilidad.

1. Afirma el solicitante que *"...me permito manifestar que dada la significativa limitación realizada por el solicitante sobre la reivindicación 1 actualmente presentada de acuerdo con las sugerencias y observaciones planteadas en el Concepto Técnico No. 0085, es completamente claro que tales objeciones han sido plenamente atendidas."* (f. 236)

Se aclara que la solicitud continúa siendo una generalidad que abarca un indeterminado número de posibilidades. En consecuencia, se mantiene la objeción por falta de concisión de la solicitud.

2. Con respecto a la novedad de la solicitud, el solicitante manifiesta lo siguiente: *"... las reivindicaciones han sido modificadas de forma tal que ahora resultan mucho más específicas y restringidas, pero más importante aún, me permito remitir al señor Examinador al hecho de que tal como ha sido consignado al final de la reivindicación 1., se ha señalado que los compuestos de la invención se caracterizan "...adicionalmente en que ya sea..", haciendo a los compuestos de la invención novedosos frente a las enseñanzas de D1"* (f. 238)

En respuesta a los anteriores argumentos, esta Oficina reitera al solicitante que se mantiene la objeción por falta de concisión de la solicitud, debido a que se reclama un número demasiado alto de alternativas posibles. Adicionalmente, es importante aclarar que el restringir el número de sustituyentes de la estructura no le imprime novedad a la solicitud, ya que los compuestos reclamados habían sido previamente divulgados en D1. Del mismo modo, esta Superintendencia hace una objeción de claridad frente a la expresión "caracterizado adicionalmente en que ya sea" (f. 242), ya que no se entiende si los sustituyentes Y, R4 y Het², son solo los divulgados en el folio 242 o en el folio 240, y adicionalmente esta expresión y selección de sustituyentes no se encuentra soportada en la descripción.

3. Asegura el solicitante que *"...dadas las restricciones que han sido realizadas por parte del solicitante a las definiciones de los sustituyentes que hacen parte de la fórmula (I) de la reivindicación 1 modificad, particularmente en relación con los grupos Y y R⁴, se evita cualquier tipo de superposición o coincidencia con los compuestos que se pueden derivar de la fórmula general (I) del documento D1..."* (f. 238)

Se aclara al solicitante que, las restricciones realizadas no le restituyen la novedad a los compuestos divulgados previamente en D1. Adicionalmente, la solicitud sigue siendo una generalidad expresada mediante un fórmula Markush, cuyos elementos estaban comprendidos en la anterioridad y que

limitar de forma somera el alcance de la solicitud no la hace nueva. Adicionalmente, "las restricciones" a las que hace mención el solicitante con respecto a los sustituyentes Y, R4 y Het², no se encuentran claramente definidas en la reivindicación y del mismo modo y como se ha mencionado anteriormente, dicho condicionamiento no había sido considerado en la descripción.

En consecuencia a lo anterior, se mantienen las objeciones frente a claridad, concisión y novedad de la presente solicitud.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

22 AGO. 2011

CONCEPTO TÉCNICO No.2169	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202073
--	---