

86
86

SEÑORES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-089734-00001-0000

Fecha: 2007-04-22 12:13:27 Dep: 2020 NULCREACIONE
Tr: 11 PATENTABILIDAD L: 378 FASENACIONALI
Act: 508 PETICION Folios: 2

Ref.: Expediente N°. 07-089.734

Solicitud de Patente de Invención titulada: **“COMPOSICION FARMACEUTICA QUE COMPRENDE UN DERIVADO DE INDOLIL-MALEIMIDA”.**

Solicitante: NOVARTIS A.G.

SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 584

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad de la referencia, respetuosamente me permito solicitar que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina. Adjunto recibo por el monto de \$420.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 44372 de 26 de diciembre 2007.

Atentamente

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Recibo por \$420.000 pesos

88
89

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 07-089734

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **584** DE

FECHA **31 DE DICIEMBRE DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL **31 DE MARZO DEL 2008**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI ☐ NO ☒ X ☐

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



03 037623 0

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 03037623 00000000

Folios: 129

Fecha (AMB): 2003-05-06 16:17:12

Procedimiento : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PROCEDIMC

Dependencia: 2000 DEPARTAMENTO DE NUEVAS CREACIONES

**FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:

1



Patente de Invención



Patente de Modelo de Utilidad



Capítulo I



Capítulo II

2

**S LICITANTE
(71)**

Nombre: **NOVARTIS AG**

Dirección: Lichtstrasse 35

Nacionalidad o Domicilio: CH -4056 Basilea,
Suiza.

Lugar de Constitución : Suiza

Teléfono: 41813241111 Fax: 41613227532

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)**

Nombre: JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección: Cra. 11A No. 94-76 (Of. 305)

Teléfono: 6 162051/81 Fax: 6 161889

E-mail: tm-patent@escobaruribe.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.779.452T.P 68228

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

Nombre: **VER ANEXOS**

Dirección:

Nacionalidad o domicilio:

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP01/12785

Fecha Noviembre 5, 2001

Publicación Internacional No. WO 02/38581 A1

Fecha Mayo 16, 2002

6 TÍTULO (54) DERIVADOS DE INDOLILMALEIMIDA COMO INHIBIDORES DE PROTEÍNA DE
CINASA C.

6 Clasificación Internacional (51) C 07D 403/04 ; A 61K 31/404

7 Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

Estados Unidos de América

Estados Unidos de América

(32) Fecha

Noviembre 7, 2000

Abril 13, 2001

(31) Número de Solicitud

60/246,400

60/283,705

9 Comprobante de pago No. 03 - 17.316

Fecha Marzo 11, 2003

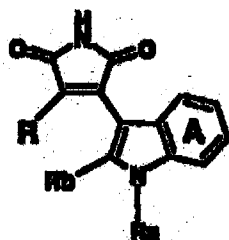
40 90
33

DERIVADOS DE INDOLIMALEIMIDA COMO INHIBIDORES DE PROTEÍNA DE
CINASA C

La presente invención se refiere a derivados de indol-
5 lilmaleimida, a un proceso para su producción, y a composicio-
nes farmacéuticas que los contienen.

De una manera más particular, la presente invención
proporciona un compuesto de la fórmula I:

10



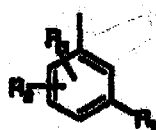
en donde:

R_A es H; alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o alquilo
15 de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por OH, NH_2 , NH-alquilo de
1 a 4 átomos de carbono, ó N(dialquilo de 1 a 4 átomos de car-
bono) $_2$;

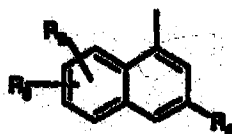
R_B es H; o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R es un radical de la fórmula (a), (b), (c), (d), (e),

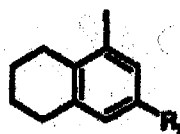
20 ó (f):



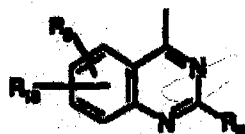
(a)



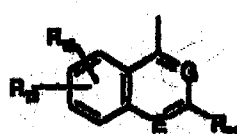
(b)



(c)



(d)



(e)



(f)

25

en donde:

cada uno de R_1 , R_4 , R_7 , R_8 , R_{11} , y R_{14} es OH; SH; un residuo heterocíclico; $NR_{16}R_{17}$, en donde cada uno de R_{16} y R_{17} es independientemente H o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o R_{16} y R_{17} forman, junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, un residuo heterocíclico; o un radical de la fórmula α :



en donde X es un enlace directo, O, S, ó NR_{18} , en donde R_{18} es H o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,

R_c es alquileo de 1 a 4 átomos de carbono, o alquileo de 1 a 4 átomos de carbono en donde un CH_2 es reemplazado por CR_xR_y , en donde uno de R_x y R_y es H y el otro es CH_3 , cada uno de R_x y R_y es CH_3 , ó R_x y R_y forman juntos $-CH_2-CH_2-$, e

Y está enlazado con el átomo de carbono terminal, y se selecciona a partir de OH, un residuo heterocíclico, y $NR_{19}R_{20}$, en donde cada uno de R_{19} y R_{20} es independientemente H, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, arilalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono opcionalmente sustituido sobre el átomo de carbono terminal por OH, o R_{19} y R_{20} forman, junto con el átomo de nitrógeno con el que están enlazados, un residuo heterocíclico;

cada uno de R_2 , R_3 , R_5 , R_6 , R_9 , R_{10} , R_{12} , R_{13} , R_{15} , y R'_{15} es independientemente H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de

92
35

carbono, CF_3 , OH, SH, NH_2 , alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, NH-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, N(dialquilo de 1 a 4 átomos de carbono) $_2$, o CN;

E es $-\text{N}=\text{}$ y G es $-\text{CH}=\text{}$, o bien E es $-\text{CH}=\text{}$ y G es $-\text{N}=\text{}$; y
5 el anillo A está opcionalmente sustituido.

Cualquier alquilo o fracción de alquilo en, por ejemplo, alcoxilo, puede ser lineal o ramificada. Halógeno puede ser F, Cl, Br, ó I, de preferencia F ó Cl. Cualquier arilo puede ser fenilo o naftilo, de preferencia fenilo.
10

Un residuo heterocíclico como R_1 , R_4 , R_7 , R_8 , R_{11} , R_{14} , ó Y, o formado respectivamente por $\text{NR}_{15}\text{R}_{17}$ ó $\text{NR}_{19}\text{R}_{20}$, es un anillo heterocíclico de 3 a 8, de preferencia de 5 a 8 miembros, saturado, insaturado, o aromático, que comprende 1 ó 2 heteroátomos, de preferencia seleccionados a partir de N, O, y S, y está
15 opcionalmente sustituido. Los ejemplos adecuados incluyen, por ejemplo, piridilo, por ejemplo 3- ó 4-piridilo, piperidilo, por ejemplo piperidin-1-ilo, 3- ó 4-piperidilo, homopiperidilo, piperazinilo, homopiperazinilo, morfolin-4-ilo, imidazolilo, imidazolidinilo, pirrolilo, o pirrolidinilo, opcionalmente sustituido, por ejemplo mono- ó poli-sustituido. Cuando el residuo heterocíclico está sustituido, esto puede ser sobre uno o más átomos de carbono del anillo, y/o sobre un átomo de nitrógeno cuando está presente. Los ejemplos de un sustituyente sobre un
20 átomo de carbono del anillo incluyen, por ejemplo, alquilo de 1

93
115

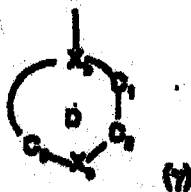
alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, NH-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, N(dialquilo de 1 a 4 átomos de carbono)₂, o CN;

E es -N= y G es -CH=, o bien E es -CH= y G es -N=, y el anillo A está opcionalmente sustituido,

o una sal del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el residuo heterocíclico como R₁, R₄, R₇, R₈, R₁₁, R₁₄, ó Y, o formado, respectivamente, por NR₁₆R₁₇ ó NR₁₉R₂₀, es un anillo heterocíclico de 3 a 8 miembros, saturado, insaturado, o aromático, que comprende uno o dos heteroátomos, y opcionalmente sustituido sobre uno o más átomos de carbono del anillo, y/o sobre un átomo de nitrógeno del anillo cuando esté presente.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el residuo heterocíclico como R₁, R₄, R₇, R₈, R₁₁, R₁₄, ó Y, o formado, respectivamente, por NR₁₆R₁₇ ó NR₁₉R₂₀, es un residuo de la fórmula (γ):



en donde:

el anillo D es un anillo de 5, 6, ó 7 miembros, saturado, insaturado, o aromático;

X₅ es -N-, -C=, ó -CH-;

94

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO

Radicación 07-89734
Trámite 011
Evento 379
Actuación 519
Oficio
Folios 009

№ 0 233.1

Patente de Invención
Vía Nacional
Vía PCT (fase nacional)
No. Sol. Internacional
Fecha de Presentación Internal.



Patente de Modelo de Utilidad
Cap. I Cap. II
PCT/EP2006/001767
Febrero 27 de 2006



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

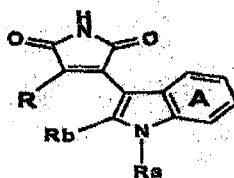
- 1.1. Descripción: Folios: 43 a 74 como se radicó inicialmente
1.2. Reivindicaciones: Folios: 75 a 82 como se radicó inicialmente
1.3. Prioridad: Marzo 1 de 2005, GB;0504203.1

2. Objeto de la invención

Título de la invención: COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE COMPRENDE UN DERIVADO DE INDOLIL-MALEIMIDA.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de una composición farmacéutica con un compuesto derivado de Indolil-maleimida, para administración oral, en el tratamiento de enfermedades mediadas por los linfocitos-T y/o PKC, por ejemplo rechazo agudo o crónico de alo-o xeno-injertos de órganos o tejidos, entre otras(folio 43 y 66-67).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición, que comprende un compuesto de formula (I),



en donde los significados de los radicales son como lo muestra la reivindicación 1 (folio 75, pg32); y el proceso para su obtención (folios 81 y 82, pgs 38-39).

IPC: A61K31/404, A61K9/20.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1, no esta soportada en la descripción, por una composición particular definida concretamente, caracterizada por sus componentes (principio activo y excipientes específicos); por el contrario, lo que se menciona, de manera general, es que la composición puede contener cualquier derivado de la formula X, como principio activo (folios 44-57) y que en dicha composición farmacéutica sólida, pueden estar presentes vehículos o diluyentes farmacéuticamente aceptables los cuales son ampliamente conocidos en el estado de la técnica).

Las reivindicaciones 3, 5, 7, 9, 11, 13, mencionan la expresión "cuando menos", la cual no es concisa.

Las reivindicaciones 12, 14, no son concisas, porque mencionan un porcentaje de o por ciento.

La reivindicación 24 esta caracterizada por un uso, lo cual no es la forma de caracterizar una composición.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal d))

El objeto de las reivindicaciones 27 no es patentable porque se refiere a un método de tratamiento.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 28 no es patentable porque se refieren a un uso.

6. 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 Marzo 1 de 2005

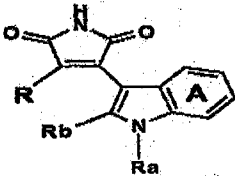
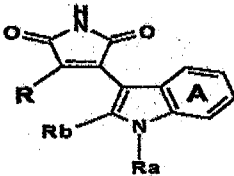
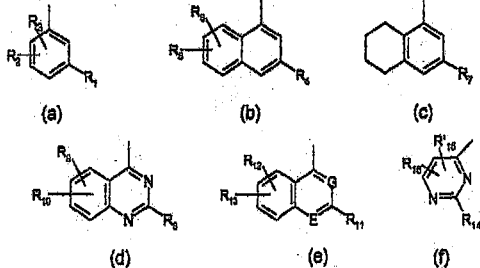
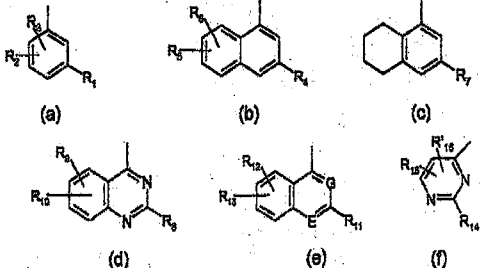
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	CO0337623	Derivados de Indolilmaleimida como inhibidores de proteína cinasa C.	Mayo 16 de 2002.

D1 (folios: 89-93); se refiere a compuestos derivados de indolilmaleimida, a un proceso para su producción y a composiciones farmacéuticas que los contienen.

7. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

7.1 Novedad (artículo 16 D486)

Características esenciales de la Solicitud Colombiana No. 2007089734	W003/0337623
Una composición la cual comprende un compuesto de la formula (I) 	composición la cual comprende un compuesto de la formula (I) 
En donde: Ra es H; alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por OH, NH2, NH-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o N-(di-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono)	En donde: Ra es H; alquilo de 1 a 4 átomos de carbono; o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono sustituido por OH, NH2, NH-alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o
Rb=es H; o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono	Rb=es H; o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono
R= es un radical de fórmula: 	R= es un radical de fórmula: 
En donde cada uno de R1, R4, R7, R8, R11 y R14 es OH; SH; un residuo heterocíclico... (ver folios 76 -77 , pgs 33-34, reivindicación 1), o en forma de sal.	En donde cada uno de R1, R4, R7, R8, R11 y R14 es OH; SH; un residuo heterocíclico... (ver folios 91-92, pgs 2-3 de la descripción); o en forma de sal (folio 93, pg 83)

Las características esenciales de la reivindicación 1, fueron divulgadas previamente en D1, es decir la composición farmacéutica que comprende un compuesto de la formula (I), por lo cual la reivindicación no es nueva, como tampoco sus dependientes 2-23 y 25-26.

8. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO0337623	1-23 y 25-26	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 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


JOSE LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (E)

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

CONCEPTO TÉCNICO No.142	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202078
--------------------------------	---