

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	07-129343
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	E 1 0 4 7 2
	Folios	7

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (Fase Nacional) ☒ Capítulo I ☒ Capítulo II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/US2006/022919

Fecha de Presentación Internacional 12 de junio 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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 134 a 245	06/12/2007
Reivindicaciones:	Folios 246 a 279	06/12/2007
Prioridad:	US 60/690.541	14/06/2005

2. Análisis de la Prioridad

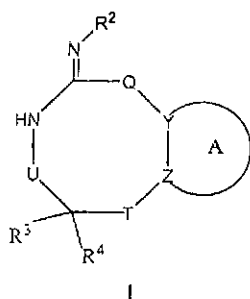
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486), y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "PREPARACIÓN Y USO DE COMPUESTOS COMO INHIBIDORES DE PROTEASAS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar agentes moduladores de proteasas útiles en el tratamiento de enfermedades cognitivas o neurodegenerativas.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I) y composiciones que los contienen:



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D209/44; C07D471/04; C07D487/04

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literales (a) – (d))

El objeto de las reivindicaciones 17 a 20, 23, 27 a 30 y 33 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque no define la materia objeto de la solicitud y hace referencia a uso, por lo cual se sugiere al Solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las Reivindicaciones 1 y 24 junto con sus dependientes carecen del requisito de concisión debido al uso de términos que no limitan el alcance de la solicitud, tales como: cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclilo, heterociclenilo, arilo, heteroarilo, arilalquilo, heterocicloalquilo, heterocicloalquilo, quilalquilo, arilcicloalquilo, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilalquilo, cicloalquenilo, heterocicloalquilalquilo, cicloalquilo, heterociclenilo, arilcicloalquilalquilo, heteroarilcicloalquilalquilo, arilheterocicloalquilalquilo, heteroarilheterocicloalquilalquilo, arilcicloalquilo, heteroarilcicloalquilo, heterocicloalquilo, arilheterociclilo, heteroarilheterociclilo, alquenilo, arilalquenilo, arilcicloalquenilo, heteroarilheterocicloalquenilo, arilalquinilo, cicloalquilarilo, heterocicloalquilarilo, heterocicloalquilheteroarilo, cicloalquenilarilo, heterocicloalquenilarilo. Adicionalmente los sustituyentes A, R, R¹, R², R³ y R⁴, abarcan un indeterminado número de sustituyentes que comprenden una elevada variabilidad estructural, siendo imposible a partir de la descripción asegurar que todos estos sean una solución al problema técnico planteado.

Las reivindicaciones 1 y 24 carecen de sustento descriptivo, en razón a que no corresponden a una generalización racional de los ejemplos y la materia ensayada. Se recomienda al solicitante realizar una restricción de la materia con fundamento en la descripción, particularmente en los ejemplos ensayados tal como se define a continuación:

- Q es un enlace.
- T es un enlace.
- U es -C(R⁶)(R⁷)-.
- Y es C o N.
- Z es C o N.

A es fenil.
R² es H, .
R³ es alquilo C1-C6
R⁴ es fenil, sustituido,

Las reivindicaciones 21, 22 y 32 caracterizan una composición por contener una segunda composición que contiene un agente mediante el uso de términos funcionales que abarcan un indeterminado número de compuestos que incluye sustancias conocidas como aquellas que se desarrollen a futuro.

6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La Solicitud no cumple con el Requisito de Unidad de Invención debido a que no posee un núcleo central definido, y se refiere a , Grupos Inventivos.

Los Grupos Inventivos están definidos por las siguientes características **esenciales**:

- 1° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es isoindolina.
- 2° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es pirrolo[3,4-b]piridina (formula 1B).
- 3° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es pirrolo[3,4-c]piridina (formula 1C)
- 4° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico pirrolo[3,4-c]piridina (formula 1D)
- 5° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es pirrolo[3,4-b]piridina (formula 1E).
- 6° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es pirazolo[4,3-c]piridina (formula 1F).
- 7° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es pirrolo[3,4-c]pirazol (formula 1G).
- 8° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es imidazo[1,2-a]pirazina (formula 1H).
- 9° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es imidazo[1,2-c]pirimidina (formula 1I).
- 10° Compuestos en los cuales el núcleo bicíclico es imidazo[1,2-c]pirimidina (formula 1J).

Se sugiere presentar las Solicitudes Divisionales que considere necesarias, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

7. 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: 14 de junio de 2005, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	JP8225753	Carboxylate Salt, Its Production And Heat-Sensitive Recording Material Using The Salt Compound	03/09/1996
D2	EP0742217	Isoindoline pigments based on aminoquinoxalindiones	13/11/1996
D3	DE 2430354	Neue Substituierte 1-Amino-Isoindole, Verfahren Zu Deren Herstellung Sowie Diese Enthaltende Pharmazeutische Zubereitungen	15/01/1976
D4	WO 2005/058311	Heterocyclic Aspartyl Protease Inhibitors	30/06/2005

D1
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=JP&NR=8225753A&KC=A&FT=D&ND=4&date=19960903&DB=EPODOC&locale=en_EP divulga el compuesto derivado de la fórmula I

de la presente solicitud donde R1 es H, R3 es -O-CH2Ph y R4 es -O-CH2Ph. (pág. 2, figura 3)

D2
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19961113&CC=EP&NR=0742217A1&KC=A1 . divulga isoindolinas donde R2 es H, R3 es CN y R4 es -OCH2CH2OH (pág. 9, líneas 18-29)

D3
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19760115&CC=DE&NR=2430354A1&KC=A1 divulga isoindolinas donde R2 es fenil, R3 es metil y R4 es metil (pág. 21 línea 29).

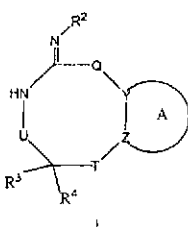
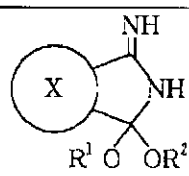
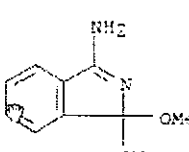
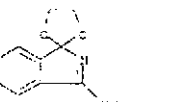
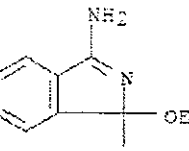
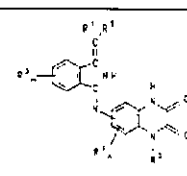
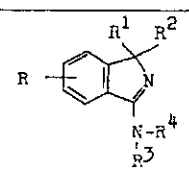
D4
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050630&CC=WO&NR=2005058311A1&KC=A1. Se refiere a inhibidores de la proteasa derivados de heterocicloalquil útiles en el tratamiento de desórdenes neurodegenerativos (resumen).

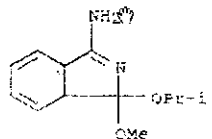
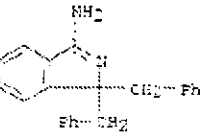
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en derivados de la fórmula estructural (I).

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales de la solicitud en estudio	D1	D2	D3
	 (3)  RN 172902-44-2  RN 172902-54-4  RN 172902-55-5		

	 RN 172902-56-6  RN 861362-24-3		
R2 = H	R4 es -O-CH2Ph		
R3 = -O-CH2Ph	R1= -CH2Ph, OMe	R1 = H	
R4 = -O-CH2Ph	R2= -CH2Ph; -OMe	R2 = H	R2 = fenil
A = fenil	X = fenil	R3 = CN	R3 y R4 son metil

Las características **esenciales** de los compuestos de las reivindicaciones 1 y 24 habían sido divulgadas previamente en D1, D2 y D3 los cuales enseñan derivados de isoquinolina sustituidos. El documento D1 divulga entre otros el derivado en que R1 es H, R3 es -O-CH2Ph y R4 es -O-CH2Ph. (pág. 2, figura 3). Por su parte, el documento D2 enseña isoindolinas donde R2 es H, R3 es CN y R4 es -OCH2CH2OH (pág. 9, líneas 18-29). Finalmente la anterioridad D3 divulga isoindolinas donde R2 es fenil, R3 es metil y R4 es metil (pág. 21 línea 29)

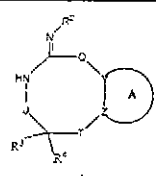
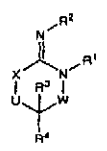
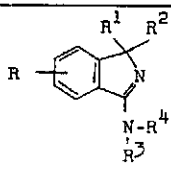
En consecuencia, las reivindicaciones 1 y 24 no son nuevas, según lo divulgado en los documentos D1, D2 y D3. Del mismo modo, las reivindicaciones dependientes no mencionan alguna característica que haga nuevos los compuestos y composiciones reivindicados, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La evaluación de nivel inventivo se realizará con respecto a los compuestos del grupo inventivo 1.

La reivindicación 1 consiste en derivados derivado de isoquinolina

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D4	D3
		
Q, U y T son un enlace	X es N	Ver figura
A es aril.	R1 es aril aunque no esta fusionado.	Ver figura
R2 es H	R2 es H, alquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo, entre otros. (pág. 4, líneas 13 a 18)	R3 y R4 son metil.
R3 y R4 son H, alquilo	R3 y R4 son H, alquilo, cicloalquilo, alquinilo, alquenilo. (pág. 4 líneas 19 y 20)	R2 es fenil R1 es H (páginas 4 y 5)

Los documentos D3 y D4 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D3 enseña derivados de isoquinolina comprendidos en el alcance de la presente solicitud (resumen).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D3 consiste en que la anterioridad no especifica que estos compuestos tengan utilidad como inhibidores de proteasa.

El documento D4 divulga derivados de heterociclilo útiles como inhibidores de proteasa, para el tratamiento de desórdenes neurológicos

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D4 consiste en que no se especifica en la anterioridad la presencia de un anillo heterociclilo fusionado. .

El efecto que logran los compuestos de la presente solicitud es que previenen el desarrollo de desordenes neurodegenerativos al igual que los divulgados en D4.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos conocidos en D4 para conseguir compuestos alternativos como inhibidores de proteasas".

Sin embargo, la existencia de derivados de isoquinolina como agentes farmacéuticamente activos, ya está divulgada en el documento D3 que se compuestos específicos comprendidos en el alcance de la presente solicitud.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, al establecer una actividad adicional de los compuestos de D3 como inhibidores de la proteasa, incluiría los sustituyentes para el heterociclo divulgados en D4, que dan lugar a compuestos igualmente útiles en el tratamiento de desordenes neurodegenerativos Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:
La reivindicación 1 y 24 y sus dependientes cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	JP8225753	1 y 24	Novedad
D2	EP0742217	1 y 24	Novedad
D3	DE 2430354	1 y 24 1 a 16, 21, 22, 24 a 26, 31 y 32	Novedad Nivel Inventivo
D4	WO 2005/058311	1 a 16, 21, 22, 24 a 26, 31 y 32	Nivel Inventivo

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
15 JUN 2012

Elaborado por: Emilce Cano Urrego.
Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso.

ox lt