

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-47250- -3	FECHA: 2015-01-19 14:11:37
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 14-47250- -3
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 409
 Folios: 7

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2012/068203				
Fecha de Presentación Internacional	17/09/2012				

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:	14-047250-00000-0000	05 de marzo de 2014
Reivindicaciones:	14-047250-00000-0000	05 de marzo de 2014
Prioridad:	EP11181752.4	19 de septiembre de 2011

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: “COMPUESTOS DE TRIAZOLOPIRIDINA COMO INHIBIDORES DE LA PED10A”

El problema técnico se refiere a la necesidad de proporcionar compuestos inhibidores de PED10A que mejoren los síntomas negativos y cognitivos asociados con la esquizofrenia, para solucionar este problema la solicitud presenta compuestos derivados de [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 25/00.

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

El objeto de las reivindicaciones 10 a 13 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de las reivindicaciones 10 y 11 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es dado que la solicitud contiene 14, es decir más de diez (10) reivindicaciones y se pagó la tasa complementaria, se estudiarán todas las reivindicaciones presentadas porque fueron cubiertas por la tasa pagada.

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 invocada, es decir el 19 de septiembre de 2011.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2009047514	“[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyridine and [1,2,4]triazolo[1,5-c]pyrimidine compounds and their use”	16/Abril/2009
D2	Molecules	“Synthesis and Anti-tumor Activities of Novel [1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidines”	25/Mayo/2007
D3	tesis.uson.mx/digital	Antecedentes	2009

El documento D1¹ divulga compuestos de triazolo (denominados en este documento como compuestos TAZ), y especialmente [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina y [1,2,4]triazolo[1,5-c]pirimidina que, entre otras cosas, inhiben la función de la tirosina quinasa del receptor de AXL. Este documento también se refiere a composiciones farmacéuticas que comprenden tales compuestos y a su uso, tanto in vitro como in vivo, para inhibir la función del receptor tirosina quinasa AXL y en el tratamiento de enfermedades y afecciones que están mediadas por el receptor AXL tirosina quinasa, que se mejoran por la inhibición de la función de AXL receptor tirosina quinasa, etc., incluyendo las condiciones proliferativas tales como cáncer, etc. (resumen).

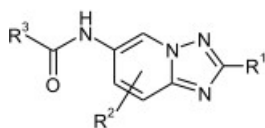
El documento D2² divulga que se diseñó una serie de derivados [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina para encontrar nuevos compuestos antitumorales. Las estructuras de todos los compuestos fueron confirmadas por IR, H-NMR, MS y análisis elemental. Se probaron sus actividades antitumorales contra las líneas celulares de cáncer (HT-1080 y Bel-7402) por el método in vitro MTT. El compuesto 19 muestra la mejor actividad antitumoral con valores de IC₅₀ de 12,3 y 6.1 µM contra las líneas celulares Bel-7402 y HT-1080, respectivamente (resumen).

El documento D3³ divulga la obtención de amidas por reacción de la amina con un ácido orgánico (Pág. 4).

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “*Un compuesto*



de la fórmula (I): (I) en la que R1 es arilo, heteroarilo o NR4R5...; R2 es hidrógeno, halógeno...; R3 es arilo o heteroarilo...” (Pág. 74 del radicado 14-047250-00000-0000).

La tabla 1 presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2 que representan el estado de la técnica.

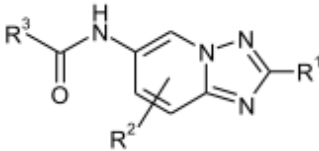
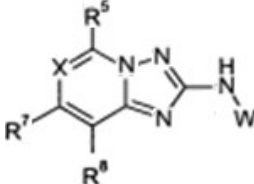
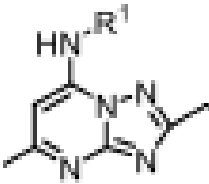
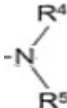
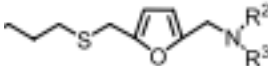
¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090416&CC=WO&NR=2009047514A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090416&CC=WO&NR=2009047514A1&KC=A1

²www.mdpi.org/molecules

³<http://tesis.uson.mx/digital/tesis/docs/22837/Antecedentes.pdf>

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
Reiv 1		
Compuesto	Compuesto	Compuesto
		
	R5	
	-NH-R1	-NH-R1
H	R1 = alquil-fenil, alquil-bencil	R1 = morfolin, piperidin, pirrolidin, piperazin
-NH-C(O)-R3	X = -CR6	
-NH-C(O)-aril sust con alquil	-NH-heterociclo	H
-NH-C(O)-aril sust con OH	-NH-alquil-fenil	
-NH-C(O)-aril sust con halo	-NH-alquil-bencil	
-NH-C(O)-aril sust con carboxilo		
R2	R7	
H, halo o alquil	H, halo o alquil	-CH3
	R8	
H	H	H
R1		
		
aril, heteroaril, -NR4R5 (-Nalquil-alquil ó -Ncicloalquil-cicloalquil), heterociclo,	-NR4R5 (-Nalquil-alquil ó -Ncicloalquil-cicloalquil), heterociclo, fenil, piperazin-(O, S, N ó alquil)-het-alquil-(het, amina o amina-het)	R2R3 = morfolin, piperidin, pirrolidin, piperazin
	(reiv 1)	(Pág. 1137)

El documento D2, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga que se diseñó una serie de derivados [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina para encontrar nuevos compuestos antitumorales. Las estructuras de todos los compuestos fueron confirmadas por IR, H-NMR, MS y análisis elemental. Se probaron sus actividades antitumorales contra las líneas celulares de cáncer (HT-1080 y Bel-7402) por el método in vitro MTT. El compuesto 19 muestra la mejor actividad antitumoral con valores de IC₅₀ de 12,3 y 6.1 µM contra las líneas celulares Bel-7402 y HT-1080, respectivamente (resumen).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos divulgados en el documento D2 consiste en que tienen el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina.

No hay evidencia de que el incluir específicamente el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina proporcione un compuesto con algún efecto técnico diferente al que ya

proporcionaba el del documento D2, puesto que el compuesto del documento D2 ya tiene actividad contra las enfermedades proliferativas tales como cáncer.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar el compuesto conocido en documento D2 para proporcionar otro compuesto alternativo.

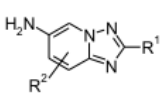
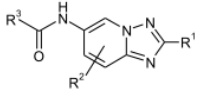
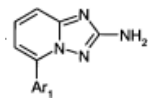
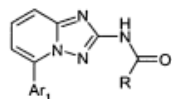
El documento D1 divulga compuestos de triazolo (denominados en este documento como compuestos TAZ), y especialmente [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina y [1,2,4]triazolo[1,5-c]pirimidina que, entre otras cosas, inhiben la función de la tirosina quinasa del receptor de AXL. Este documento también se refiere a composiciones farmacéuticas que comprenden tales compuestos y a su uso, tanto in vitro como in vivo, para inhibir la función del receptor tirosina quinasa AXL y en el tratamiento de enfermedades y afecciones que están mediadas por el receptor AXL tirosina quinasa, que se mejoran por la inhibición de la función de AXL receptor tirosina quinasa, etc., incluyendo las condiciones proliferativas tales como cáncer, etc. (resumen).

Por lo tanto, la persona normalmente conocedora de la materia, incluiría el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina en los compuestos que se conocen en el documento D1, tal como enseña el documento D2, logrando así los compuestos alternativos reivindicados. De manera que la reivindicación 1 de la solicitud se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al objeto de la reivindicación independiente, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

En el presente caso, el proceso reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 9 se refiere a: “Un proceso para la obtención de los compuestos de la fórmula (I)... consiste en: a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (2)... con un compuesto de la fórmula (3)...” (Pág. 79 del radicado 14-047250-00000-0000).

La tabla 2 presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 9, y las reveladas en los documentos D1 y D3 que representan el estado de la técnica.

Tabla 2					
Solicitud		+		→	
D1	i. CICOR, Et₃N, DCM ii. NH₃, MeOH	+		→	
D3		+	R-NH₂	→	

El documento D3, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 9, divulga la obtención de amidas por reacción de la amina con un ácido orgánico (Pág. 4).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el proceso divulgado en el documento D3 consiste en el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina de la amina.

No hay evidencia de que el incluir específicamente el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina proporcione un proceso con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el del documento D3, puesto que por el proceso del documento D3 ya se logra obtener el compuesto amida.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar el proceso conocido en documento D3 para proporcionar otro proceso alternativo.

El documento D1 divulga el proceso para obtener compuestos de triazolo (denominados en este documento como compuestos TAZ), y especialmente [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina y [1,2,4]triazolo[1,5-c]pirimidina (Pág. 235, esquema 1).

Por lo tanto, la persona normalmente conocedora de la materia, realizaría el proceso que consiste en la reacción de la amina que tiene el núcleo [1,2,4]triazolo[1,5-a]piridina con un ácido orgánico, tal como enseña el documento D1, logrando así el proceso alternativo reivindicado. De manera que la reivindicación 9 de la solicitud se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009047514	1 – 9	Nivel Inventivo
D2	Molecules	1 – 8	Nivel Inventivo
D3	tesis.uson.mx/digital	9	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 del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2015-01-27

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon