

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado

ALICIA LLOREDA RICAURTE

allorede@lloredacamacho.com; jlcco@lloredacamacho.com

ASUNTO	Radicación	08 41390
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	014

E 14587

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

No. Solicitud Internacional PCT/JP2006/321335

Fecha de Presentación Internacional 26 octubre 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 19 a 299	23/abril/2008
Reivindicaciones:	Folios 300 a 315	23/abril/2008
Prioridad:	JP 2005 – 312076	27/octubre/2005
	JP 2006 – 223875	21/agosto/2006

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.

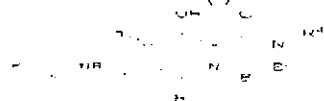
3. Objeto de la invención

Expediente 08 41390 Artículo 45

Título de la solicitud: "Derivado de Carbamoilpiridona policíclico que tiene actividad inhibidora de integrasa del VIH".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos con actividad anti-viral, inhibidora de la integrasa del VIH.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I)



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 471/04

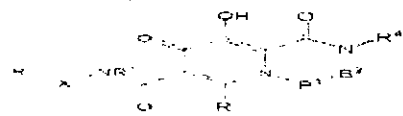
4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

- 1- Las reivindicaciones 1 – 14 y 16 no son concisas porque las definiciones de R1, X, R2, R3, R4 B1, B2, R20, R21, R22, Ra, R5 son géneros funcionales tales como arilo opcionalmente sustituido, ariloxi, grupo heterocíclico, heterociclooxi, arilo heterociclo alquilo, aralquilo, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

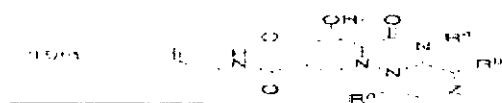
Tabla 1: Estructuras Soportadas.

Fórmula:



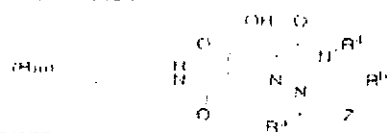
Radical	Sustituyente
R ₂	Fenilo
X	Metilo
R ₁	Hidrógeno
R ₃	Hidrógeno
R ₄	Metilo, CH ₂ CH ₂ OCH ₃ .
B ₁ , B ₂	CH ₂

Fórmula



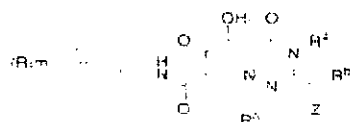
Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl.
Ra	H
Rb	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
R4	CH ₃ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₂ (4F-Fenilo)
Z	C, cero

Fórmula:



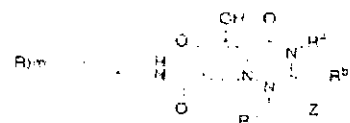
Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl.
Ra	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
Rb	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
R4	CH ₃ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₂ (4F-Fenilo)
Z	NRc (Rc= CH ₃)

Fórmula:



Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl.
Ra	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
Rb	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
R4	CH ₃ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₂ (4F-Fenilo)
Z	NRc (Rc= CH(CH ₃) ₂)

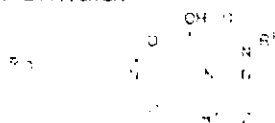
Fórmula:



Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl.

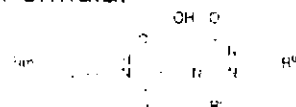
Ra	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
Rb	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂ ,H
R4	CH ₃ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₂ (4F-Fenilo)
Z	NRc (Rc= CH ₂ CH ₂ OCH ₃)

Fórmula:



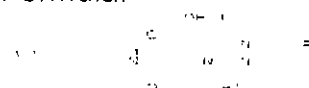
Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl
Ra	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂
Rb	CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂
R4	CH ₃ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₂ (4F-Fenilo)
Z	C, Cero, NRc (Rc= CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , CH ₃ , CH(CH ₃) ₂)

Fórmula:



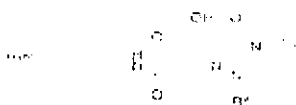
Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl
Ra	H, CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Rb	H, CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂

Fórmula:



Radical	Sustituyente
(R)m	F, Cl
Ra	H, CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Rb	H, CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , N(CH ₃)COCH ₃ , N(CH ₃) ₂

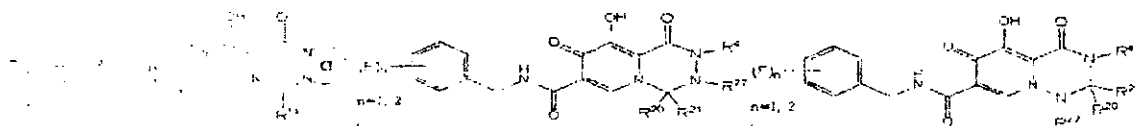
Fórmula:



Radical	Sustituyente
---------	--------------

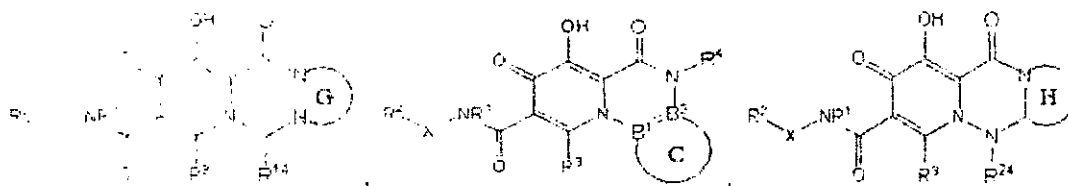
(R)m	F, Cl
Ra	H, CH ₃ , CH(CH ₃) ₂ , CH ₂ CH ₂ OCH ₃

Fórmula:



Radical	Sustituyente
G	Sustituyentes R ₄ , R ₂₂ , R ₂₁
R ₁₄ , R ₂₀ , R ₂₁ , R ₂₂	Etilacetamida, etanol, hidrógeno, tetrahydrofurano, morfolina, etilbenceno, isopropanol, terbutilo, metilo, metilpiridina, propanona, dimetilsulfona, etilo, dimetilacetamida, butano, feniletanona, metoxipropanona, metoxifeniletanona, dimetilpropanamida, metiletiler, metilbenceno, etilmetoxibenceno, 
R ₄	Metilo, isopropilo, etilmetileter, etilacetato, etiloxi, etilo, propilo, metilfurano, metiltiofeno, isopropiletiler,  , ciclopropilo, dioxano, tetrahydrofurano,  , benzodioxol,  , dipropileter, propilisopropileter, metildioxano,  , dimetilpropanamina, butoximetilheptano, 
R ₂₂ , R ₂₁ , R ₂₀	Fusionado con R ₂₂ ciclo hexilo, ciclopentilo,  Metilo, etilo, dietileter, metilpropileter, hidrógeno, metiletiler, dimetilacetamida, etanoato de etilo, propanol, metanol, etilacetamida, dimetiletilamina, metilpiridina,  ,  ,  ,  ,  , 

2- Las reivindicaciones 2, 11, 12 incluyen compuestos de fórmula:



En los que se observa que no hay un núcleo definido que los unifique, por lo tanto las reivindicaciones carecen de concisión, por lo que se sugiere al solicitante restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

- 3- En las reivindicaciones 1 – 6, 8 – 17, se menciona que el compuesto se encuentra en forma de sal farmacéuticamente aceptable o solvato; pero tanto la sal como el solvato no se definen mediante una caracterización del compuesto como tal, a través de la especificación de las condiciones de obtención, los solventes empleados y las técnicas mismas de caracterización de dichos solvatos o de las sales, por lo tanto se sugiere al solicitante restringir la solicitud a la razonable generalización de los compuestos sintetizados o probados, es decir que se encuentran debidamente sustentados.

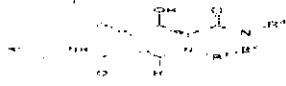
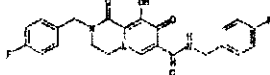
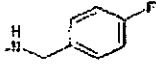
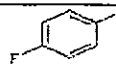
Descripción (Art 28 D 486)

- 1- En el folio 41 no es claro el ejemplo de poliedro cubano, por lo que se sugiere realizar la correspondiente aclaración.
- 2- Los términos "trithilamino" (folio 46), "sonambos" (folio 50), "alternativamente" (folio 53), "Fs" (folio 57), "cudanometilo" (folio 67), "anullo" (folio 71), "solvatep" (folio 73), "alcoholatos" (folio 74), "ejemplificna" (folio 89), "susualmente" (folio 91), "reracción" (folio 93), "preventive" (folio 95), útil (folio 96), presentan errores de transcripción y no se reconocen en el campo técnico, se sugiere definirlos correctamente.
- 3- En el folio 89, en el paso cuarenta, se presentan errores de transcripción "reaciona don un reactivo de N-aminación", por lo cual se sugiere al solicitante realizar la correspondiente corrección.

5. Unidad de invención (Art 25 D 486)

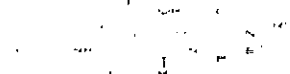
La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 4 grupos inventivos, que aunque son derivados de la estructura de la reivindicación 1 no guardan un único concepto inventivo entre sí:

Lo encontrado a priori, se confirma a posteriori con el documento D1 en el que se anticipa el concepto común el cual corresponde a los compuestos de fórmula I

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula 	Compuesto de fórmula: 
R1: H X=alquileo inferior	
R2: Arilo opcionalmente sustituido	H
R3: H B1 – B2: C	C
R4: arilo opcionalmente sustituido	

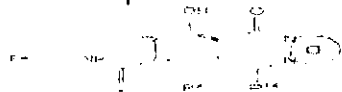
Para los compuestos, los grupos Inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

1° Compuestos de fórmula (I) reivindicaciones 1, 3 – 10:

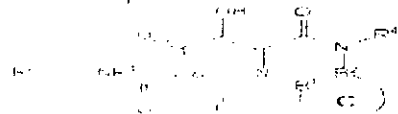


(Están divulgados en D1 WO2005016927).

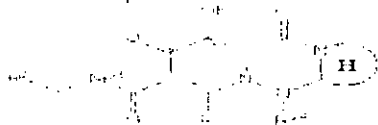
2° Compuestos de fórmula reivindicación 2:



3° Compuestos de fórmula según la reivindicación 11:



4° Compuestos de fórmula según la reivindicación 12:



Los anteriores grupos inventivos no se relacionan entre si mediante un único concepto inventivo, ya que más de una estructura con núcleo básico teniendo en cuenta las diversas opciones de sustituyentes presentes en cada fórmula. Se encuentra que la invención del grupo 1° ya estaba divulgada en el estado de la técnica mediante el documento D1, el cual divulga compuestos derivados de

piridopirazina y pirimidopirazina útiles en el tratamiento de inhibición de la HIV integrasa (Pág.1, Resumen).

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

El presente examen se llevará a cabo sobre los grupos inventivos definidos.

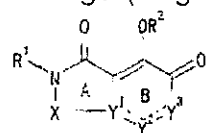
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la solicitud de prioridad octubre 27 de 2005 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2005016927	Nitrogenous condensed-ring compound and use thereof as HIV integrase inhibitor	24/Febrero/2005
D2	WO2005087766	HIV Integrase Inhibitors	22/Septiembre/2005

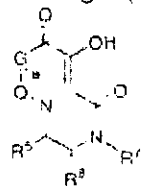
D1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005087766A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20050922&DB=EPODOC&locale=en_EP

Divulga (Pág. 1, resumen), compuesto de fórmula:



D2 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005087766A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20050922&DB=EPODOC&locale=en_EP

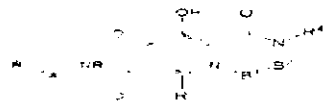
Divulga (Pág.1, resumen) un compuesto de la fórmula:



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula:



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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula 	Compuesto de fórmula:
R ¹ : H X=alquileo inferior R ² : Arilo opcionalmente sustituido	
R ³ : H	H
B ¹ - B ² : C	C
R ⁴ : arilo opcionalmente sustituido	

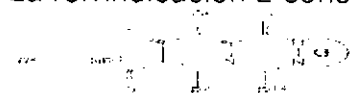
Las características **esenciales** de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer compuestos que presentan la misma fórmula del compuesto 1 (Pág. 250, ejemplo 378).

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

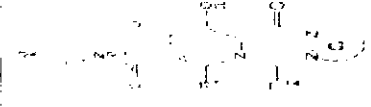
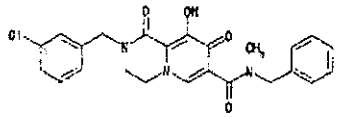
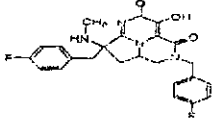
Las reivindicaciones dependientes 3 – 10 no mencionan alguna característica que haga nuevo el compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 2 consiste en un compuesto de fórmula:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula: 
R ¹ : alquileo inferior	Metilo	No lo menciona
X: alquileo inferior	Metilo	No lo menciona
R ² : Arilo	Fenilo	No lo menciona
G: Heterociclo opcionalmente sustituido	No lo menciona	No lo menciona
R ³ : H, cicloalquilo	H	Cicloalquilo
R ¹⁴ : H, cicloalquilo	H	Cicloalquilo

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos derivados de la pirido triazina. (Pág. 250 ejemplo 370 y pág. 79 ejemplo 453).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en el grupo heterociclo en la posición G y la triazina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en la posición del anillo G y la sustitución de la amida.

El efecto que logra el incluir la presencia del nitrógeno o la posición del anillo G es actuar como inhibidor de la actividad de la VIH integrasa.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo incluir el grupo heterociclo de D1 en la posición G del compuesto de D1 para llegar al compuesto de la presente invención".

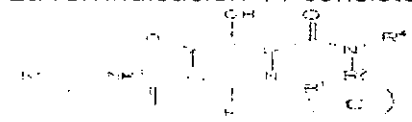
Sin embargo, la presencia del heterociclo en esa posición específica no genera ningún efecto inesperado, pues la actividad es la misma para todos estos compuestos.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el heterociclo de D2 en el compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 2 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 11 consiste en un compuesto de fórmula:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula:
R ¹ : alquilo inferior	Metilo	No lo menciona
X: alquilenos inferior	Metilo	No lo menciona
R ² : Arilo	Fenilo	No lo menciona
C: Heterociclo opcionalmente sustituido	No lo menciona	No lo menciona
R ³ : H, cicloalquilo	H	Cicloalquilo
R ⁴ : Arilo opcionalmente sustituido	H	4-fluor metilbenceno

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos derivados de la pirido triazina. (Pág. 250 ejemplo 370 y pág. 79 ejemplo 453).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en el grupo heterociclo en la posición C y la triazina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en la posición del anillo C y la sustitución de la amida.

El efecto que logra el incluir la presencia del nitrógeno o la posición del anillo C es actuar como inhibidor de la actividad de la VIH integrasa.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se

puede formular así: "cómo incluir el grupo heterociclo de D1 en la posición C del compuesto de D1 para llegar al compuesto de la presente invención".

Sin embargo, la presencia del heterociclo en esa posición específica no genera ningún efecto inesperado, pues la actividad es la misma para todos estos compuestos.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el heterociclo de D2 en el compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 11 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 12 consiste en un compuesto de fórmula:



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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula:
R ¹ : alquileo inferior	Metilo	No lo menciona
X: alquileo inferior	Metilo	No lo menciona
R ² : Arilo	Fenilo	No lo menciona
H: Heterociclo opcionalmente sustituido	No lo menciona	No lo menciona
R ³ : H, cicloalquilo	Hidrógeno	Cicloalquilo
R ²⁴ : H, cicloalquilo	Hidrógeno	4-fluor metilbenceno

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuestos derivados de la pirido triazina. (Pág. 250 ejemplo 370 y pág. 79 ejemplo 453).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en el grupo heterociclo en la posición H y la triazina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en la posición del anillo H y la sustitución de la amida.

El efecto que logra el incluir la presencia del nitrógeno o la posición del anillo H es actuar como inhibidor de la actividad de la VIH integrasa.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo incluir el grupo heterociclo de D1 en la posición H del compuesto de D1 para llegar al compuesto de la presente invención".

Sin embargo, la presencia del heterociclo en esa posición específica no genera ningún efecto inesperado, pues la actividad es la misma para todos estos compuestos.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el heterociclo de D2 en el compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 12 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

8. Conclusión

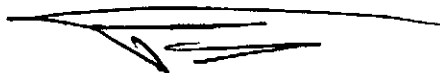
Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005016927	1 – 17	Novedad / Nivel inventivo
D2	WO2005087766	2, 11 – 17	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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante para sesenta (60) días y presentarla por escrito

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 ,
_____ **21 AGO. 2012**

Elaborado por: Angela Susana Pardo González 
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 
Aprobado por: José Luis Salazar López