

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALVARO CORREA ORDOÑEZ

ASUNTO	Radicación	08 52929
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	8

08779

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

No. Solicitud Internacional PCT/US2006/060958
Fecha de Presentación Internacional 16/Noviembre/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 837 a 1834	23/Mayo/2008
Reivindicaciones:	Folios 1835 a 2053	23/Mayo/2008
Prioridad:	US 60 739 374	23/Noviembre/2005
	US 11 558 979	13/Noviembre/2006

2. Análisis de la Prioridad

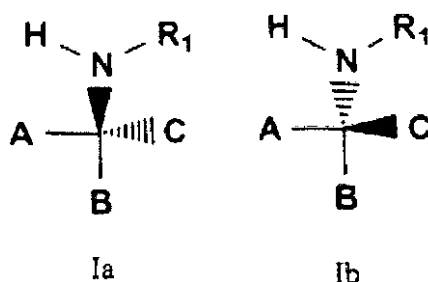
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Compuestos homo- y heterociclos adecuados como inhibidores de la proteína de transferencia de éster de colesteroilo"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos alternativos para elevar niveles de HDL y reducir niveles de LDL para el tratamiento de enfermedades asociadas a dislipidemias.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos que tienen las estructuras generales Ia y Ib que pueden ser útiles como inhibidores de la proteína de transferencia de éster de colesteroilo.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07C211/29, C07C215/08, C07C217/58, C07C229/36, C07C229/38, C07C233/09, C07C233/13, C07C233/18, C07C233/56, C07C233/60, C07C233/66, C07C233/73, C07C233/78, C07C235/20, C07C235/34

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D486 literal d)

El objeto de las reivindicaciones 15 a 19 relacionado con un método de tratamiento no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque el término "Compuestos homo- y heterociclos adecuados" no es claro ya que se refiere a un número indefinido de compuestos. Se sugiere al Solicitante hacer la corrección necesaria.

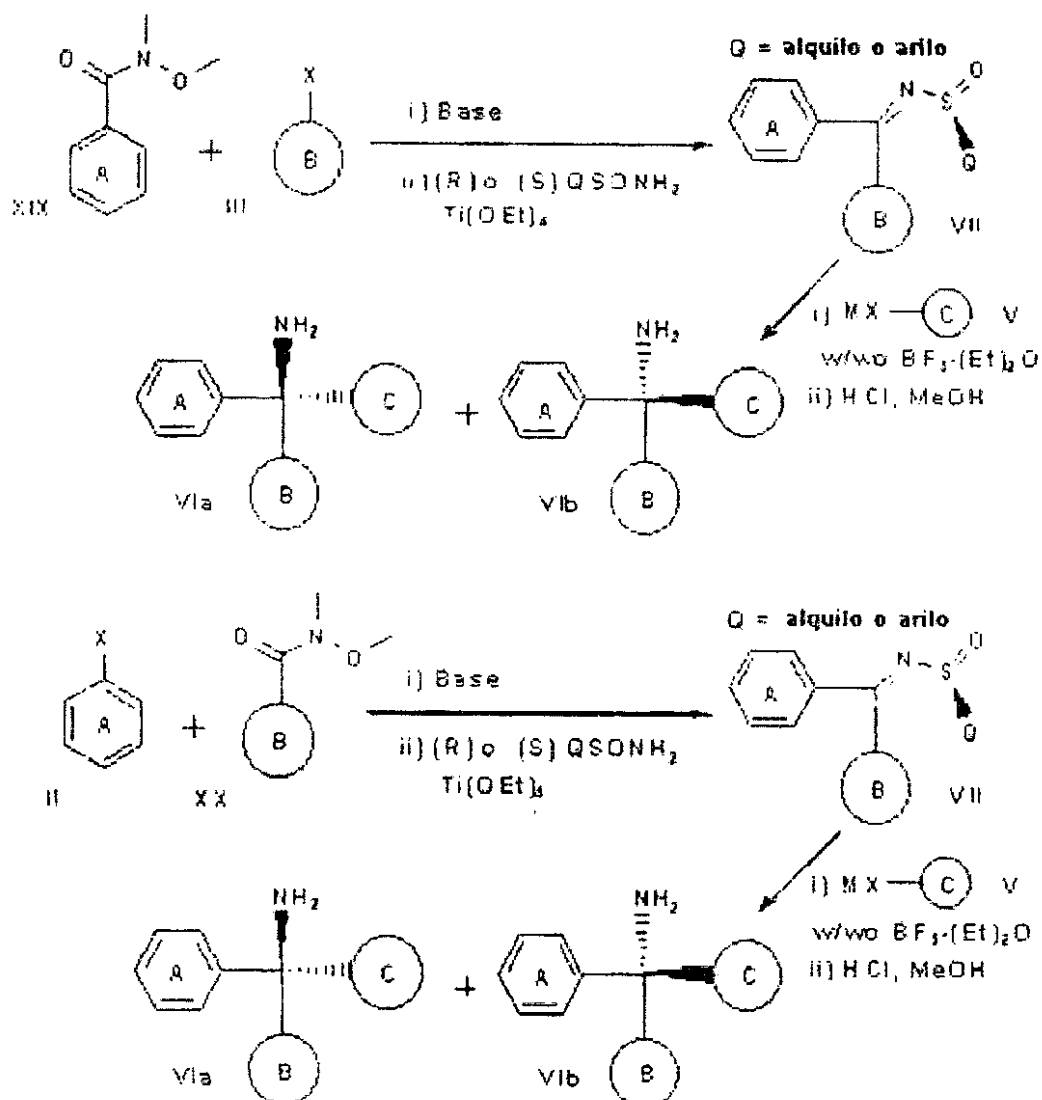
Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

En las reivindicaciones 1, 3 a 10 y 21 a 23 el término "opcionalmente", es ambiguo, lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un rango concreto.

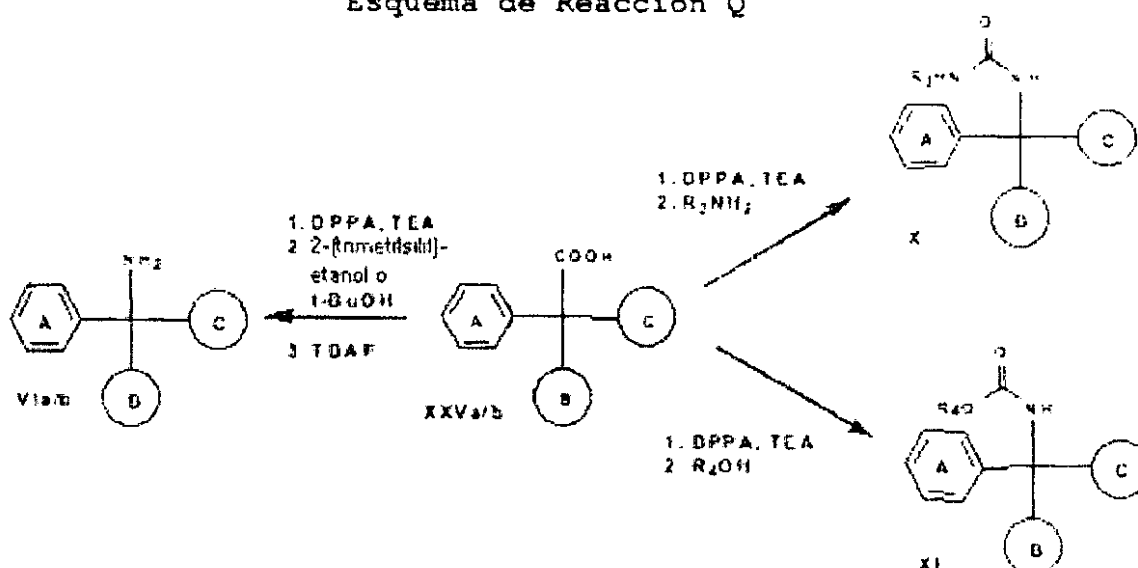
En la reivindicación 14 no hay sustento descriptivo frente a las combinaciones de agentes terapéuticos. Se sugiere modificar la reivindicación.

En la reivindicación 20 se hace referencia a los ejemplos de la descripción, según la expresión "caracterizado porque se ejemplifica en los ejemplos". Se sugiere eliminar la referencia a la descripción.

Las reivindicaciones 21, 22 y 23 mencionan los términos "WW" "YY" y "ZZ", los cuales no son reconocidos en el campo técnico de farmacia porque no se conoce su significado o alcance en el área técnica y por lo tanto no son claros al leer las reivindicaciones; además estos términos no están sustentados en la descripción. Adicionalmente en las reivindicaciones 21, 22 y 23 se menciona un proceso, pero este no se define mediante sus características, es decir, la secuencia lógica de etapas y las condiciones que median la transformación química. Se sugiere definir general e inespecíficamente los términos de las reivindicaciones y el proceso definirlo de acuerdo a los esquemas (Fl. 1076 y 1083).



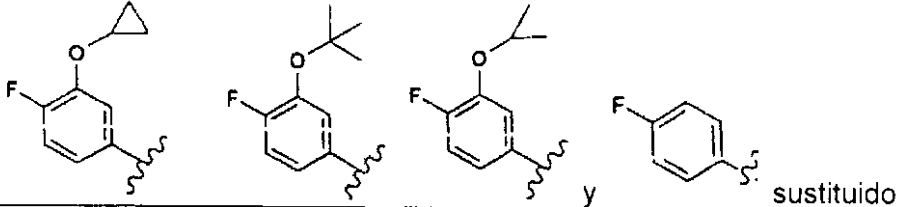
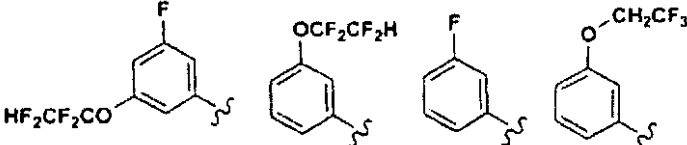
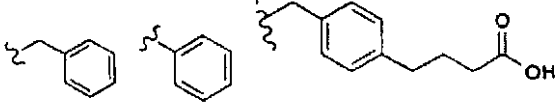
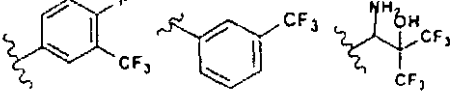
Esquema de Reacción Q



Las reivindicaciones 1, 3 a 9, 10 y 11 no son concisas, asimismo tienen una excesiva complejidad para el examinador a la hora de analizar las reivindicaciones y no permite ver claramente el alcance de las reivindicaciones. En las reivindicaciones 1 y 3 a 9 se encuentran definiciones de A, B, C y R1 como heteroarilo, arilo, alquilo, heteroarilalquilo, heterociclilalquilo, cicloalquilo, haloalquilo, alquenilo, alquinilo, entre otros, los cuales corresponden a grupos funcionales, son ambiguos y no definen de manera inequívoca los sustituyentes

de los compuestos reclamados. Por lo tanto se le sugiere al solicitante, en lo posible, restringir el capítulo reivindicatorio de la solicitud a una generalización razonable de las realizaciones preferidas. Adicionalmente se debe establecer el número de carbonos que los conforman, el número y tipo de heteroátomos.

Las reivindicaciones 1 y 3 a 11 carecen de soporte porque los radicales A, B,C y R1 difieren a los mencionados en el capítulo descriptivo. Se sugiere limitar a los sustituyentes preferidos los cuales se muestran a continuación.

Radical	Soporte en la descripción
A	
B	
C	
R1	 -C(O)R donde R es:

Descripción (Art 28 D 486)

La Descripción no es clara porque la información que contiene no permite que la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda comprender el problema técnico y la solución aportada por la invención puesto que:

La descripción tiene errores de tipografía y de redacción. Se sugiere corregir los errores de escritura y de traducción del capítulo descriptivo para darle claridad.

Se relacionan las marcas como Adalat y Calan entre otras, en el folio 1137 o página 301. Se le sugiere al solicitante definir los nombres genéricos.

Los términos "ISCO y CLEM" (folio 1285, pág. 449 y folio 1570, pág. 736) son poco reconocidos en el campo técnico. Se sugiere definirlos correctamente.

Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 6 grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

- 1° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)R donde R es fenil sustituido.
- 2° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)R donde R es alcoxi.
- 3° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)R donde R es alquilo sustituido.
- 4° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)R donde R es heterociclilo.
- 5° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)R donde R es cicloalquilo.
- 6° Compuestos en los cuales A = fenil sustituido, B = fenil sustituido, C = fenil sustituido y R1 = -C(O)NR donde R es cicloalquilo, alquilo sustituido

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 prioridad (23/Noviembre/2005) y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2005037796	Compounds and methods for treating dyslipidemia	28/Abril/2005
D2	US2002177708	(R)-chiral halogenated substituted N-benzyl-N-phenyl aminoalcohol compounds useful for inhibiting cholesteryl ester transfer protein activity	28/Noviembre/2002

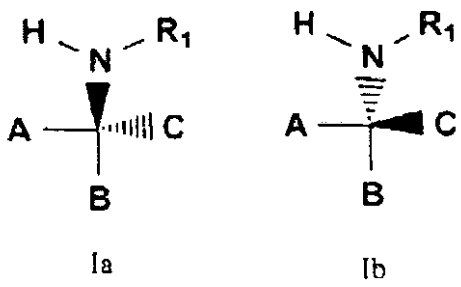
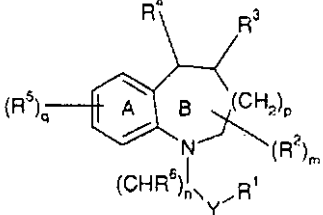
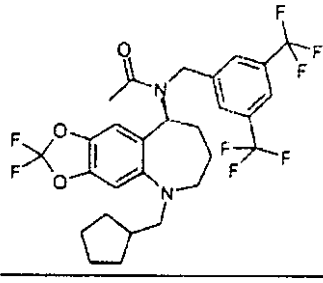
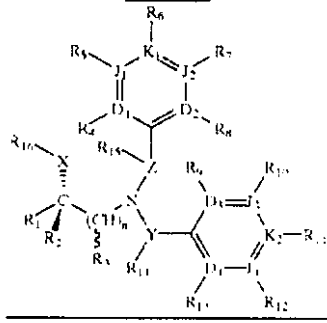
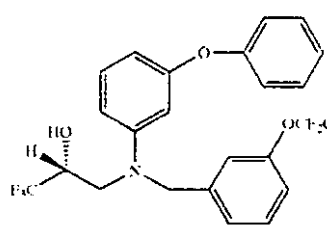
D1http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005037796A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20050428&DB=&locale=en_EP.
Divulga compuestos de la formula I que modulan la actividad de los receptores CETP, para el tratamiento de la dislipidemia. (Pág. 8 y Pág. 173, columna 2, línea 20-38)
D2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2002177708A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20021128&DB=&locale=en_EP
Divulga compuestos quirales que pueden ser usados para inhibir la actividad de los receptores CETP, para el tratamiento de dislipidemias. (Pág.2, columna 1 y Pág. 3, columna 2, líneas 20 a 38)

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de la formula Ia o Ib en donde: (Fl. 1835, Pág. 1002 a Fl.1886, Pág. 1054, líneas 1-8).

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

Características esenciales	D1	D2
<u>Compuesto de formula I</u>  Ia Ib	<u>Compuesto de formula I</u>  <u>Ejemplo 206</u> 	<u>Compuestos de formula General</u>  <u>Ejemplo 4</u> 
A=fenilo que puede sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, CN, NO2, entre otros.	A=fenilo sustituido con alcoxi.	No menciona
B= fenilo que puede sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, CN, NO2, entre otros. Heteroarilo que puede sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, CN, NO2, entre otros.	No menciona	Sugiere el enlace covalente con el carbono, (C(R14)2)a donde R14 puede ser haloariloxialquil (página 3, columna 2, lineas 20 a 38)
C= alquilo,arilo,alquenilo,cicloalquilo,heterociclo que pueden sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, cicloalquilo CN, NO2, entre otros	Alquilo	arilo sustituido con haloalquiloxi
R1=-C(O)R3, -C(O)S3,-C(O)NR2R3, CR8R8R8, Donde R3 es alquilo,alquenilo,arilo, cicloalquilo,heterociclo que pueden sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, CN, NO2, entre otros Donde R8 es H, alquilo, cicloalquilo,heterociclo que pueden sustituirse con alcoxi,halógenos, alquilo, CN, NO2, entre otros	C-alquilo sustituido por arilo	C-Arilo sustituido
Estereoisómeros o profármacos o sales farmacéuticamente aceptables	Estereoisómeros o profármacos o sales farmacéuticamente aceptables	Estereoisómeros o sales farmacéuticamente aceptables

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 divulga compuestos de la formula I que modulan la actividad de los receptores CETP, para el tratamiento de la dislipidemia. (Pág. 8) y D2 divulga compuestos quirales que pueden ser usados para inhibir la actividad de los receptores CETP, para el tratamiento de dislipidemias. (Pág. 2, columna 1)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de formula I de D1 específicamente el ejemplo 206, corresponde al radical B que

se define como un fenilo o heteroarilo que puede sustituirse con alcoxi, halógenos, alquilo, CN, NO2, etc., en lugar del hidrógeno.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el ejemplo 4 de D2 elegido entre los compuestos de fórmula general del cuadro, consiste en el radical A que se define como un fenilo que puede sustituirse con alcoxi, halógenos, alquilo, CN, NO2, etc., en lugar del hidrógeno.

El efecto que logra el incluir el radical B que se define como un fenilo o heteroarilo sustituido y el radical A que se define como un fenilo sustituido, frente a los compuestos divulgados en cualquiera de D1 y D2; se relaciona con el diseño de una alternativa adicional a los compuestos conocidos en el estado de la técnica para inhibir la actividad de los receptores CETP.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar los compuestos de fórmula I conocidos en D1 y los compuestos de fórmula general conocidos en D2, para conseguir compuestos alternativos que capaces de inhibir la actividad de los receptores CETP y que puedan utilizarse en el tratamiento de dislipidemias”.

Sin embargo, la utilización del radical A y el radical B unido al carbono quiral para obtener una alternativa a los compuestos que inhiben la actividad de los receptores CETP y que puedan utilizarse en el tratamiento de dislipidemias; ya se encontraba divulgado en el documento D1 que revela un radical de fenilo sustituido con un grupo funcional alcoxi unido al carbono quiral. Además, D2 sugiere un radical haloariloxialquil unido por un enlace covalente con el carbono definido en la letra Y de la fórmula Markush de la solicitud (Pág. 3, columna 2, líneas 20 a 38).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría dos radicales de fenilo sustituido al carbono quiral unidos por enlace covalente, empleando las fórmulas estructurales de los documentos D1 y D2, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo que la materia reivindicada se deriva evidentemente a partir del estado de la técnica o es obvia a partir de las enseñanzas de los documentos.

Conclusión:
La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 14 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

9. Conclusión.

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005037796	1 a 14	Nivel Inventivo
D2	US2002177708	1 a 14	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 de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento 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
30 MAYO 2012

Elaborado por: Ruth Angélica Lizarazo Pedraza 
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 