

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

2020
Bogotá,

Abogado
JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR
info@reyes-abogados.com

ASUNTO	Radicación	08 89267
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	013

1 45 8 9

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

No. Solicitud Internacional PCT/IN2007/000039
Fecha de Presentación Internacional 29 Enero 2007

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 4 a 103	26/Agosto/2008
Reivindicaciones:	Folios 104 a 122	26/Agosto/2008
Prioridad:	INDIA 131/MUM/06	27/Enero/2006

2. Análisis de la Prioridad

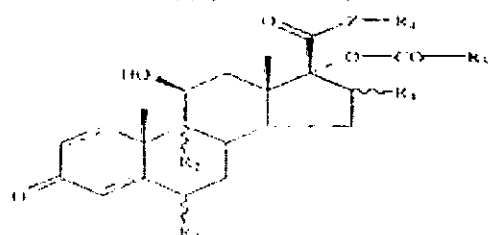
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Novedosas 11 β -Hidroxiandrosta-4-en-3-onas"

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar corticosteroides (glucocorticoides) para el tratamiento de enfermedades inflamatorias de la piel, vías respiratorias, ojos, tracto digestivo, articulaciones, SNC, entre otros, sin ocasionar reacciones adversas ya que actúan en el sitio específico de la inflamación y sus efectos secundarios son insignificantes.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I) y las composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 J 3/00 // 31/00

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

- 1- En los folios 105, 106, 107, 109, 110, se encuentra el término "opcionalmente", el cual es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere al Solicitante sustituirlo por un término preciso.
- 2- Las reivindicaciones 1 – 6 no concisas porque las definiciones de, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, G, J, K, L, P y Q porque contienen géneros funcionales tales como arilo, anillo heterocíclico, Fracción de A, B o C; 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.

Radical	Sustituyente
R ₆	4-cloro-fenilo, 2,4-difluoro-fenilo, 3,4-dicloro-fenilo, 2-tienilo, 5-cloro-2-tienilo, 5-metil-2-furilo, 1-butilo, metilo, 4-metoxifenilo, 1-adamantilo, 4-trifluorometiloxifenilo, 2,4,6-trimetilfenilo, 4-metano-sulfonil-fenilo, fenilo, 4-metil-fenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-benzofurilo, 4-t-butil-fenilo, 7-metoxi-2-benzofurilo, 2-fluoro-4-metoxi-fenilo, 2-fluoro-4-metoxi-fenilo, 2-metoxi-fenilo, 2,4-dimetoxifenilo, 2-trifluoro-metilfenilo, 4-fluoro-fenilo, 3,5-

	bis(trifluoro-metil)fenilo, 3-trifluoro-metilfenilo, 4-isobutilfenilo, 4-etilfenilo, 4-ciclohexilfenilo, 4-isopropil-fenilo, 4-ciclopentil-oxifenilo, 4-metilsulfonil-fenilo, 4-trifluoro metilfenilo, 3,5-dimetoxifenilo, 4-nitrofenilo, 2-naftilo, 1-naftilo, fenilo.
R ₁	H, CH ₃ .
R ₂	H, F, Cl.
R ₃	H, F.
R ₅	Etoxi, etilo, 5-cloro-2-tienilo, diclorometilo, 2-furilo, ciclopropilo, ciclohexilo, ciclopentilo, isopropilo, 2-furilo, butilo, 3-metil-2-furilo, 3-furilo, ciclohexilmetilo, 4-cloro-fenilo, 3-clorofenilo, ciclobutilo.
P	H, CH ₃ .
Q	H, CH ₃ .
m ₁	1.
m ₂	0, 1.
m ₃	0, 1.
Z	O, S.
n ₁	0, 1.
n ₂	2
G	Fenilo
J	H, (CH ₂) ₅ , CH ₃ , O.
K	H, (CH ₂) ₅ , O.
X	Doble enlace, triple enlace
L	OH, F, 1,4-dioxaspiro[4,5]decan-2-il metoxi-carboniloxi, OCO-O(CH ₂) ₄ -ONO ₂ , 1,4-dioxaspiro[4,4]decan-2-il metoxi-carboniloxi, OCOC ₂ H ₅ , OCOC ₃ H ₇ , OCOCH(CH ₃) ₂ , OCO-C ₄ H ₉ , OCO-ciclobutil, OCOC ₅ H ₁₁ , OCH ₃ , OCOCO-OC ₂ H ₃ , OCOCO-OC ₂ H ₅ , 2-acetoxipropioniloxi, OCOC ₃ H ₇ , OCO-ciclopropil, OCO-ciclobutil, OCO-ciclopentil, OCO-OCH ₃ , OCO-OC(CH ₃) ₃ , OCO-OCH ₂ CH-(CH ₃) ₂ , OCO-(CH ₂) ₂ CH ₂ Cl, OCOCHCl ₂ , 2-metilpropiletil carboniloxi, OCO-COOCH ₂ CH ₃ , adamantilcarboniloxi, OCOCH ₂ -OCH ₃ , 2-metilpropil-etil-carboniloxi, OCOCH ₂ -CF ₃ , CH ₂ COOH, OCOCH ₃ , 2,2-dimetil-butylcarbonyloxi, canfanilcarboniloxi, OCONH-C(CH ₃) ₃ , COOC ₂ H ₅ , metilcarboniloxi, OCOCH ₂ NH-COCH ₃ , OCOCH=CH-COOC ₂ H ₅ , 3-cloro, 2,2-dimetilpropioniloxi, OCOCH=CH-COOC ₃ H ₇ , OCO-CCl(CH ₃) ₂ , OCO(CH ₂) ₂ -COOCH ₂ F, 2-metilbutiriloxi, OCO-2-(furil), 3-hidroxi-2,2-dimetilpropioniloxi, OCO-CH=CH ₂ , OCOC(OH)-(C ₂ H ₅) ₂ , OCOOCH ₂ -ciclopropil, OCOC≡C-COOH ₃ , OCOO-ciclopentil, OCOO-CH ₂ -ciclopentil, 2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il-etoxi-etil-carboniloxi, OCON(C ₂ H ₅) ₂ , piperidin-1-il-etil-carboniloxi, 4-metil-piperazin-1-iletal-carboniloxi, N(C ₂ H ₅) ₂ , OCOOCH ₂ -ciclohexil, OCOO-(CH ₂) ₈ CH ₃ , OCOOCH -(furan-2-il), 2,2-dimetil-3-fluoro-propioniloxi, 2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il-metoxi-etil-

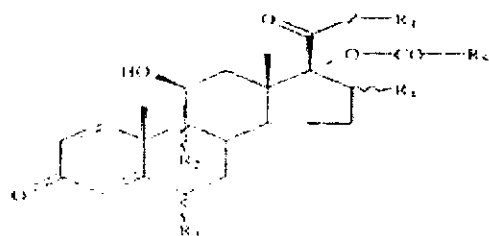
carboniloxi, (morfolin-4-il)etil-carboniloxi, 2,2,7,7-tetrametiltetrahydro-bis [1,3]dioxolol[4,5-b;4',5'-d]piran-5-ilmetoxi-etil-carboniloxi.

5. Unidad de invención (Art 25 D 486)

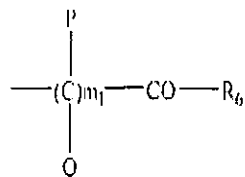
La Solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 3 grupos inventivos, que aunque son derivados de la estructura de la reivindicación 1 no guardan un único concepto inventivo entre sí:

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) cuyo radical R₄ corresponde con las fórmulas (A) y (C):

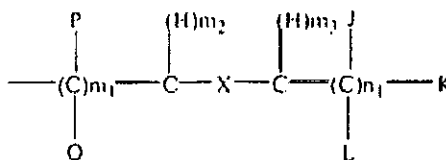
Fórmula (I)



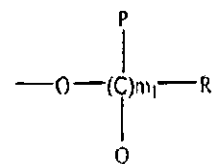
En los cuales el radical R₄ corresponde a las fracciones:



(A)



(B)

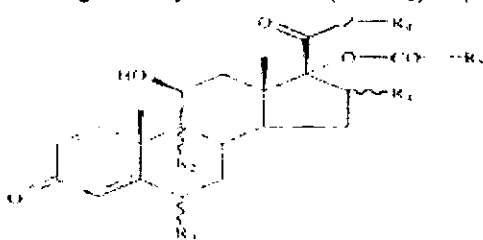


(C)

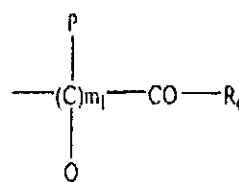
Para los compuestos, los grupos Inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

$\begin{array}{c} \text{P} \\ \\ \text{---}(\text{C})_{m_1}\text{---C---X---C---}(\text{C})_{n_1}\text{---K} \\ \quad \quad \\ \text{Q} \quad \quad \text{L} \end{array}$ $\text{R}_4 =$ Fracción B P,Q= Hidrógeno M1=1 X=doble enlace M3=Hidrógeno J,L,K=Hidrógeno	
	R1= Alquenilo C ₂₋₁₀

1° Compuestos en los cuales el radical R4 corresponde a la fracción A, y P,Q son hidrógenos y R6 es O-(C₁-C₈)alquilo.



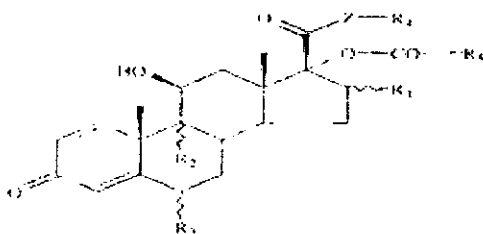
, con R4 fracción A:



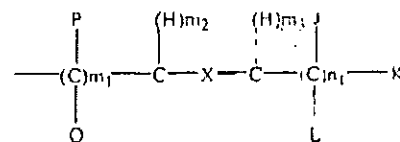
(A)

Están divulgados en D1 BE889563 Pág. 6 – 9.

2° Compuestos en los cuales el radical R4 corresponde a la fracción B, y P,Q,M3 ,J; K y L son hidrógenos, M1 es 1, y X es un doble enlace.



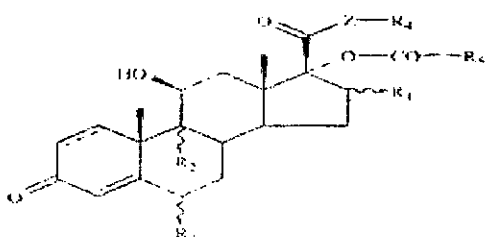
, con R4 fracción B:



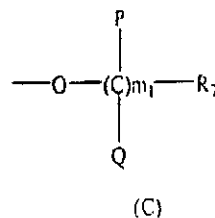
Están divulgados en D1 BE889563 Pág. 6 – 9.

3° Compuestos en los cuales el radical R4 corresponde a la fracción C.

2° Compuestos en los cuales el radical R4 corresponde a la fracción C, y P,Q,M3 ,J; K y L son hidrógenos, M1 es 1, y X es un doble enlace.



, con R₄ fracción C:



Los anteriores grupos inventivos no se relacionan entre si mediante un único concepto inventivo, ya que no presentan las mismas características técnicas. Se encuentra que la invención del grupo 1° y grupo 2° ya estaban divulgados en el estado de la técnica mediante el documento D1, el cual da a conocer compuestos derivados de androsterona útiles como antiinflamatorios. (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 1° y 2° definidos.

6. Determinación del Estado de la Técnica

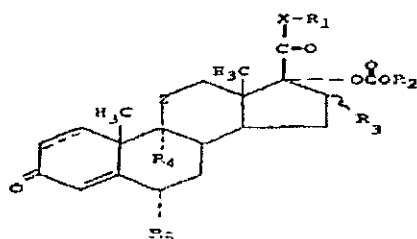
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: enero 27 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	BE889563	Stéroïdes doux exerçant une activité anti-inflammatoire	03/Noviembre/1981
D2	US4996335	Soft steroids having anti-inflammatory activity	26/Febrero/1991

D1

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=19811103&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=BE&NR=889563A1&KC=A1&ND=4

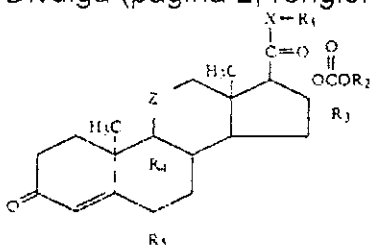
Divulga (página 6) un compuesto de la fórmula:



D2

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=4996335A&KC=A&FT=D&ND=3&date=19910226&DB=EPODOC&locale=en_EP

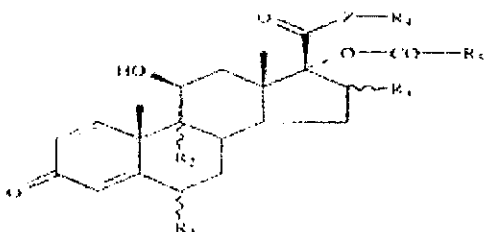
Divulga (página 2, renglones 45 – 55) un compuesto de la fórmula:



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de 11β-hidroxiandrosta-4-3-ona, de fórmula (I) y su sal fisiológicamente aceptable:



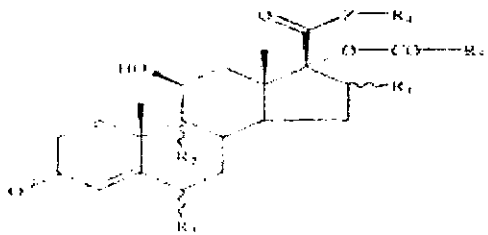
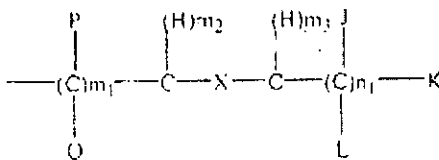
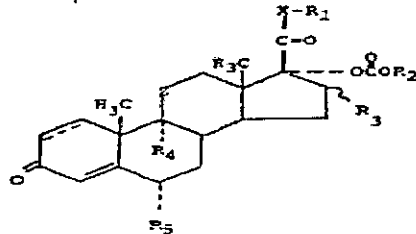
Las características **esenciales** de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer el compuesto de la presente solicitud (Pág. 6 – 9).

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

La reivindicación dependiente 2 no menciona alguna característica que haga nueva al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

La reivindicación 3 consiste en un compuesto 11 β -hidroxiandrosta-4-3-ona, de fórmula (I) y su sal fisiológicamente aceptable, como se define en la reivindicación 1, en donde R₄ representa una fracción (B).

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula (I)  $R_4 =$  P, Q= Hidrógeno M1=1 X=doble enlace M3=Hidrógeno J, L, K=Hidrógeno	Compuesto de fórmula:  R1= Alquenilo C₂₋₁₀

Las características **esenciales** de la reivindicación 3 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer el compuesto de la presente solicitud

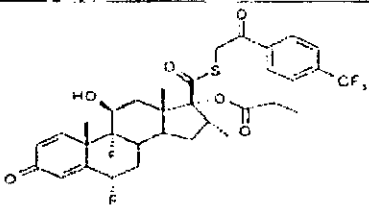
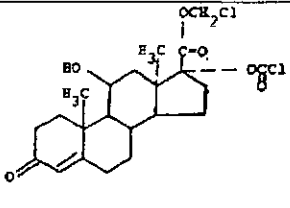
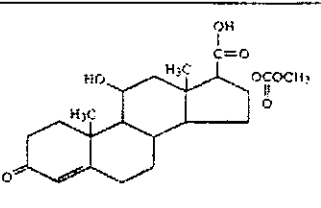
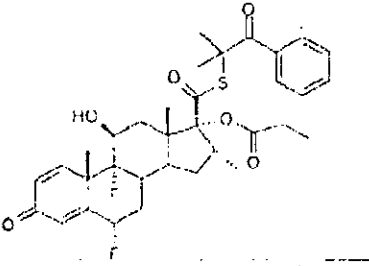
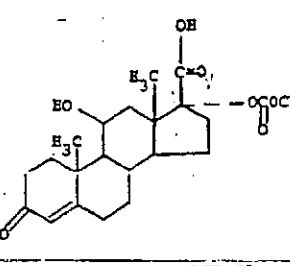
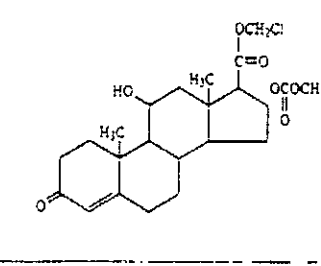
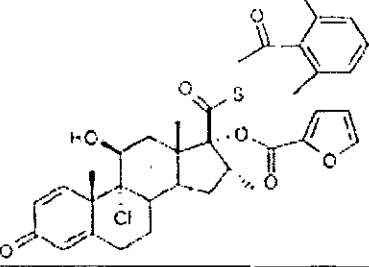
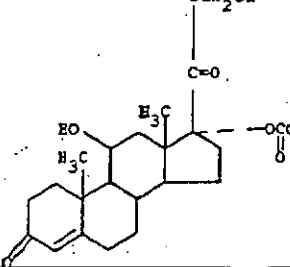
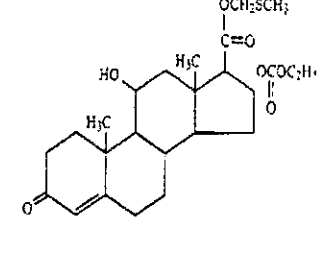
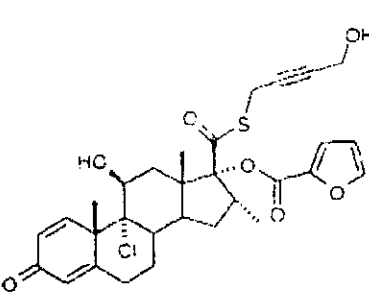
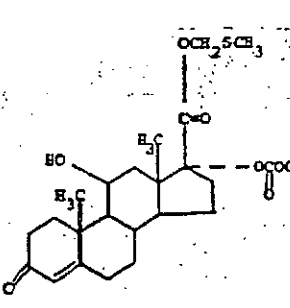
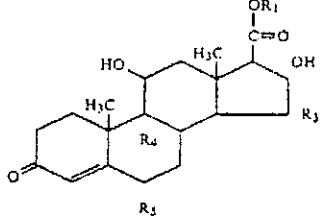
En consecuencia, la reivindicación 3 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones 4 – 6 no mencionan alguna característica que haga nuevo el compuesto de la reivindicación 3, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 7 consiste en 1 β -hidroxiandrosta4-en-3-ona como se reivindica en la reivindicación 1 seleccionada del grupo conformado por

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

Características esenciales	D1	D2
		
		
		
		 R_4 y R_5 = Fluor, R_1 = Propilo R_3 = Metilo

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 7 porque divulgan compuestos que son glucocorticoides con propiedades anti-inflamatorias, los cuales han sido divulgados como realizaciones preferidas; en la tabla se incluyen solo algunos de los ejemplos presentes tanto en la invención como en los documentos D1 y D2.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 7 y los compuestos de D1 consiste en la sustitución de Z por un azufre y la presencia de halógenos sustituyendo R₂.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 7 y los compuestos de D2 consiste en la presencia de un doble enlace en la ciclohexadiona; la sustitución de Z por un azufre y la presencia de un metilo en R1.

El efecto que logra el incluir estos sustituyentes específicos es evitar efectos colaterales, gracias a que estos compuestos actúan sobre el sitio específico de la inflamación.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo sintetizar glucocorticoides que posean actividad antiinflamatoria y presenten menos efectos secundarios".

Sin embargo, la actividad antiinflamatoria de compuestos glucocorticoides ya había sido divulgada tanto en D1 (Pág. 3, renglón 2) como en D2 (Pág. 1, párrafo [57]) y los resultados presentes en la invención no demuestran que los efectos secundarios se disminuyan considerablemente por lo tanto no se encuentra nivel inventivo en la solicitud.

Conclusión:

La reivindicación 7 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	BE889563	1 – 7	Novedad /Nivel Inventivo
D2	US4996335	1 – 7	Novedad /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

Expediente 08 89267 Artículo 45

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.



JOSE LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
27 AGO. 2012

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