

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogado
 JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

ASUNTO	Radicación	08-108771
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	6

09232

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

No. Solicitud Internacional PCT/JP2007/059408
 Fecha de Presentación Internacional 25/Abril/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 299 a 358	10/Octubre/2008
Reivindicaciones:	Folios 359 a 363	10/Octubre/2008
Oposiciones:	Folios 401 a 421	Lafrancol 25/Mayo/2010
Prioridad:	JP2006 124208	27/Abril/2006

2. Análisis de la Prioridad

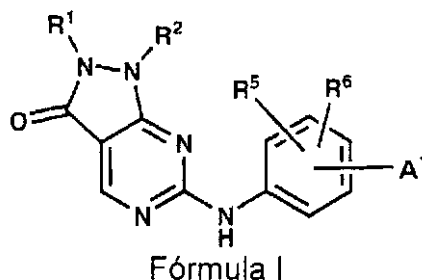
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Derivados de dihidropirazolopirimidinona"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar nuevos inhibidores de quinasa Wee1 para el tratamiento de diversos cánceres.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I) que tienen efecto inhibidor de quinasa Wee1.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D487/04, A61K31/519, A61P35/00, A61P43/00.

4. Reivindicaciones relativas a un uso (Art 14 D 486)

El uso de la reivindicación 13 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

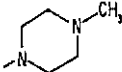
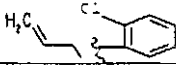
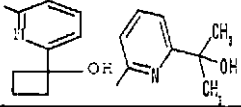
En las reivindicaciones 1 y 5 el término: "opcionalmente sustituido", es ambiguo porque hace eventual la selección y no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un rango concreto.

La reivindicación 8 define una composición en términos de su función (agente anti cancerígeno), por lo tanto se considera que tal reivindicación se refiere a todo agente que permita cumplir la función anticancerígeno, por lo tanto se sugiere definir bajo la denominación común los compuestos que fueron objeto de comprobación para el caso de las composiciones de los compuestos de fórmula (I) de la presente solicitud y otros agentes terapéuticos.

La reivindicación 9 no es clara, porque menciona una preparación combinada que comprende la administración separada, secuencial o simultánea por lo tanto es un método de tratamiento ya que no tiene sustento como un único sistema de dosificación. Se sugiere eliminar porque el método terapéutico es una excepción a la patentabilidad.

Las reivindicaciones 10 y 11 definen una composición en términos de su función (sensibilizador), por lo tanto se considera que tal reivindicación se refiere a todo agente que permita cumplir la función de sensibilización en radioterapia, por lo tanto se sugiere definir bajo la denominación común los compuestos que fueron objeto de comprobación para el caso de las composiciones de los compuestos de fórmula (I) de la presente solicitud y otros agentes terapéuticos.

En la definición de los radicales más representativos de la fórmula (I), de acuerdo con lo que se encuentra debidamente sustentado en el capítulo descriptivo, se encuentra que siempre varían entre los siguientes grupos funcionales:

Radical	Soporte en la descripción
A3	
R ¹	
R ²	
R ⁵	H, Me
R ⁶	H, Me

Por lo tanto se sugiere al solicitante presentar una generalización razonable y eliminar aquellas definiciones que exceden el sustento descriptivo.

6. Análisis de las Oposiciones

Oposición de Lafrancol

Afirma el opositor que esta solicitud incumple los requisitos de patentabilidad porque las composiciones y combinaciones farmacéuticas que comprenden compuestos como los especificados en la fórmula (I) de la solicitud, que tienen efecto inhibidor de quinasa Wee1 y que son útiles en el tratamiento de diversos tipos de cáncer, son prácticas y eventos totalmente conocidos en la industria farmacéutica. Además el opositor argumenta que no existe novedad sobre estos preceptos y mucho menos nivel inventivo y que por lo tanto no debe concederse dicho beneficio a composiciones y combinaciones farmacéuticas que ya son mundialmente conocidas.

El opositor manifiesta que con respecto a las composiciones farmacéuticas de las cuales se hace referencia, donde se involucran agentes tales como ifosfamida, Gemcitabina, entre otros y es imprescindible manifestar que no puede la solicitante pretender acceder a un beneficio patentario sobre composiciones que comprenden moléculas que se encuentran plenamente identificadas, por lo cual el opositor con el fin de demostrar lo argumentado, anexa copias del libro "The Merck Index" (Fl. 409 a 413) para mostrar que los principios activos ifosfamida y Gemcitabina, obtuvieron derechos patentarios antes del año 2000.

Respuesta del Solicitante

El solicitante no se pronunció frente a la oposición de Lafrancol.

Respuesta del Examinador Técnico

Las copias del libro "The Merck Index" (Fl. 409 a 413) no desvirtúan el nivel inventivo porque no dan a conocer composiciones; es decir, no basta con la información divulgada en esos documentos para concluir la falta de nivel inventivo, por lo cual no se considerarán dentro del examen de patentabilidad.

Los documentos FR1530962 y US3732340 divulgan la fórmula estructural de los compuestos esteres diamidas del ácido fosfórico a los que pertenece el ifosfamida y las preparaciones farmacéuticas.

Los documentos GB2136425 y US4808614 divulgan la fórmula estructural de los compuestos difluor empleados como antivirales a los que pertenece la Gemcitabina.

El documento WO9640210 divulga el Cetuximab como anticuerpo para el tratamiento de tumores y las preparaciones farmacéuticas.

Los documentos EP432677 y US5344932 divulgan la fórmula estructural de los compuestos ácido pirrol pirimidin glutámico empleados como antineoplasicos a los que pertenece el Pemetrexed.

Los documentos EP564409 y US5521184 divulgan la fórmula estructural de los compuestos derivados de pirimidina empleados en el tratamiento de tumores a los que pertenece el Imatinib y composiciones.

Si bien las reivindicaciones 9 y 10 reclaman composiciones que combinan compuestos de la fórmula (I) con agentes anticancerígenos como Gemcitabina, Pemetrexed, Ifosfamida e Imatinib, en ningún caso estas reivindicaciones reclaman los agentes anticancerígenos individualmente comprendidos, por el contrario estas combinaciones consisten en un compuesto de formula I y un agente anticancerígeno. Por lo tanto estos documentos no se considerarán dentro del Examen de Patentabilidad.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de prioridad (27/Abril/2006) y se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters Volume 15, Issue 7, Pages 1931–1935 Brian D. Palmera, Jeff B. Smailla,	Structure–activity relationships for 2-anilino-6-phenylpyrido[2,3-d]pyrimidin-7(8H)-ones as inhibitors of the cellular checkpoint kinase Wee1	27/Enero/2005

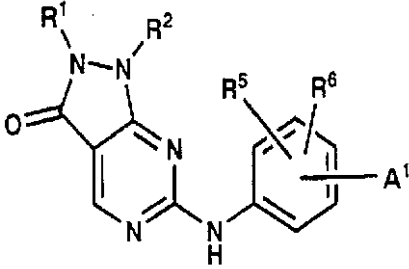
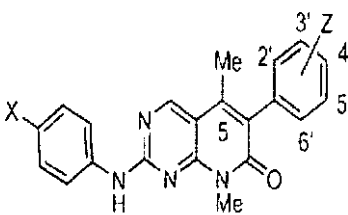
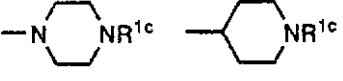
D1<http://www.sinab.unal.edu.co:2053/science/article/pii/S0960894X05001472>
Divulga 2-anilino-6-phenylpyrido[2,3-d]pyrimidin-7(8H)-ones, como inhibidores de la quinasa Wee1y que pueden ser usados en el tratamiento del cáncer. (Pág. 1931 a 1935, Fl. 453 a 457)

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula I: (Fl. 359, Pág. 62 y Fl. 360, Pág. 63, líneas 1 a 18)

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula I 	Compuestos fenilpiridopirimidinonas 
$A^1 =$  R^{1c}: H, alquenoilo, Q3-A3(R1d)R1e A3=N o metino Q3=enlace o alquileo sustituidos por halógeno o CN R1d y R1e= H, CN,OH	X= Alquilpiperazina sustituidas
R^5 y R^6 : H, alquilo,	H, alquilo
R^1 : alquilo	Fenilo
R^2 : alquilo	Metilo

El documentos D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 divulga Compuestos fenilpiridopirimidinonas, como inhibidores de la quinasa Wee1 y que pueden ser usados en el tratamiento del cáncer. (Pág. 1931 a 1935).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en el anillo pirazol unido a la pirimidina.

El efecto que logra el incluir el anillo pirazol unido a la pirimidina es tener una alternativa adicional a los compuestos derivados de pirimidinona.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar los compuestos del fórmula I conocidos en D1 para conseguir un compuesto alternativo derivado a la pirimidinona para inhibir la quinasa Wee1”.

Sin embargo, el solicitante se encuentra motivado a utilizar el anillo pirazol unido a la pirimidina porque el documento D1 menciona que el grupo farmacóforo es el fenilo en posición ortogonal al anillo heterociclo central, por lo tanto un rango de sustituyentes simétricos con variedad electrónica y propiedades estéricas similares, tienen una correlación en potencia de inhibición de quinasas Wee1 e

incluso con sustituyentes no simétricos, no hay cambios significativos en la actividad. (Página 1934 columna 2).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, cambiaría el núcleo indaceno, el pirrol y otros sustituyentes de la molécula, manteniendo las propiedades estéricas, la variedad electrónica y el grupo farmacóforo de los compuestos de D1. Adicionalmente emplearía la información divulgada en D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

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 6 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	Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters Volume 15, Issue 7, Pages 1931-1935 Brian D. Palmera, Jeff B. Smailla,	1 a 6	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 01 JUN. 2012

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