

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

ASUNTO	Radicación	08 118686
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	07

009100

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

No. Solicitud Internacional PCT/EP2007/003186
Fecha de Presentación Internacional 10/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 100 a 153	06/Noviembre/2008
Reivindicaciones:	Folios 154 a 177	06/Noviembre/2008
Dibujos:	Folios 179 a 183	06/Noviembre/2008
Oposiciones:	Folios 236 a 255	Lafrancol 25/Mayo/2010
Prioridad:	EP 06007454.9	07/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.

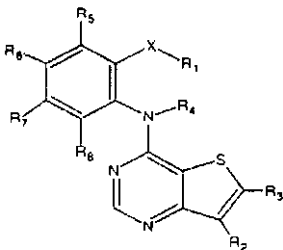
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Tienopirimidinas con actividad inhibidora de MNK1/MNK2 para composiciones farmacéuticas"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar potentes y selectivos inhibidores de MnK1 y MnK2 que pueden utilizarse, de manera efectiva y segura, para el tratamiento de enfermedades metabólicas,

enfermedades inflamatorias y sus complicaciones y trastornos consecutivos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de tienopirimidina de fórmula general (1) como potentes inhibidores de las enzimas quinasas MnK1 y MnK2, pueden ser útiles para el tratamiento de enfermedades que puedan verse influenciadas por la inhibición de la actividad de la quinasa MnK1 y MnK2.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D495/04, A61K31/519, A61P9/00, A61P11/00, A61P17/06, A61P29/00, A61P35/00

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

El objeto de las reivindicaciones 29 a 47 relacionado con un método de tratamiento no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es claro porque:

En las reivindicaciones 1 y 5 el término "opcionalmente sustituido", es impreciso porque hace eventual la sustitución, y no permite una comparación con el estado de la técnica. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes.

La reivindicación 1 no es concisa porque se encuentran definiciones de X, R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 como heterociclo, heterocicloarilo, arilo, alquilo, heteroarilalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, cicloalquilo, alquenilo, entre otros los cuales corresponden a grupos funcionales, son ambiguos y no definen de manera inequívoca los sustituyentes de los compuestos reclamados. Teniendo en cuenta lo anterior, se reclama un número indefinido de compuestos lo cual hace que no se pueda determinar todos los compuestos que se obtienen finalmente y presentan la actividad reclamada. 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.

RADICAL	SOPORTE EN LA DESCRIPCION
X	
R1	
R2	

R3	H
R4	H
R5	H
R6	O H₂N , F, H
R7	H
R8	H

Es importante mencionar que en la reivindicación 23 solo se hace referencia a un solo compuesto, por lo cual no es claro si este compuesto es la realización preferida y única que se desea proteger.

6. Análisis de las Oposiciones

Oposición de Lafrancol

Dice el opositor que las composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos de tienopirimidina, no son novedosas ni inventivas. Con el fin de demostrar lo argumentado, el opositor anexa copias del libro The Merck Index donde puede observarse que el principio activo Insulina lispro ostenta beneficios patentarios en Europa y la Gemcitabina en Estados Unidos. Por lo tanto el opositor argumenta que no puede existir un beneficio patentario que reivindique composiciones farmacéuticas útiles para el tratamiento de enfermedades que pueden ser influenciadas por la inhibición MnK1 y MnK2 (Fl. 240 líneas 22-36 y Fl. 241).

Respuestas del Solicitante

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

Respuesta del Examinador Técnico

Las copias del libro The Merck Index no desvirtúan la Novedad del objeto de esta solicitud, ya que estos no dan a conocer las tienopirimidinas y composiciones, por lo tanto 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 (07/Abril/2006) y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US6265410	Bicyclic compounds capable of inhibiting tyrosine kinases of the epidermal growth factor receptor family	24/Julio/2001
D2	US2003162795	Thienopyrimidine and thienopyridine derivatives useful as anticancer agents	24/Agosto/2003

D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en> EP&FT=D&date=20010724&CC=US&NR=6265410B1&KC=B1

Divulga el ejemplo 71 y tienopirimidinas que hacen parte de los compuestos heteroaromaticos bicclicos que inhiben las tirosinquinasa. (Columna 11, lineas 10 a 15 y columna 51, lineas 5 a 15)

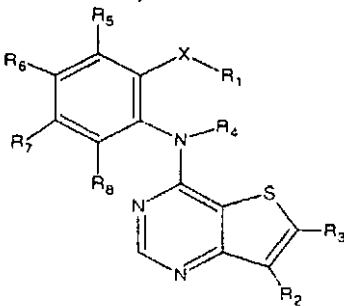
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2003162795&KC=&FT=E&locale=en> EP

Divulga derivados de tienopirimidinas usados en el tratamiento de c ncer por inhibici n de las tirosinquinasa. (P g.1, columna 2; P g.37 y P g. 38, columna 1)

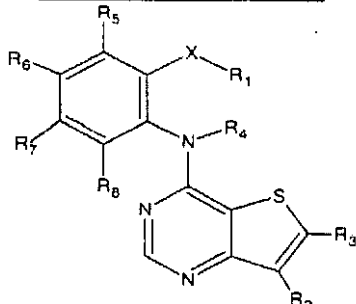
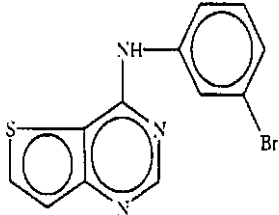
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicaci n 1 consiste en la formula general (1) donde: (Fl. 154 y 155, P g. 55 y 56, Fl. 156, P g. 57, lineas 1-12).



Comparaci n de las **caracter sticas t cnicas esenciales**, con las del Estado de la T cnica:

Caracter�sticas esenciales	D1
<u>Compuesto de formula I</u> 	<u>Ejemplo 71</u> 
X= enlace sencillo, O, S, CH2,	Enlace sencillo
R1= H, alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo seleccionado de N, S y O opcionalmente sustituido	H
R2 y R3= se seleccionan independientemente de hidrogeno, alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo	H
R4=H, alquilo, tiourea, puede formar anillo heteroc�clico con X	H
R5, R6, R7 y R8 = se seleccionan independientemente de hidrogeno y R9. R9= CN, COOR, CONR, NROCOR	H

Las caracter sticas t cnicas esenciales del compuesto de la reivindicaci n 1 hab an sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer el ejemplo 71 y

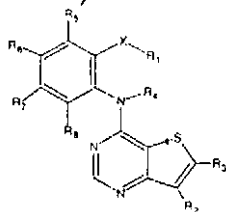
cuya actividad es la inhibición de las enzimas tirosinquinasa. Asimismo, el radical X es un enlace sencillo y se definen los radicales R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7 Y R8 como hidrógeno (columna 51, líneas 5 a 15) los cuales presentan correspondencia directa con los compuestos de la invención.

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

Las reivindicaciones dependientes 6 a 15, 17 y 18 no mencionan alguna característica que haga nueva al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en la formula general (1) donde: (Fl. 154 y 155, Pág. 55 y 56, Fl. 156, Pág. 57, líneas 1-12).



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

Características esenciales	D1	D2
<u>Compuesto de formula I</u> 		<u>Compuesto de formula 1</u>
R4=H	H	R1= H
X=O	<u>R2= OCOR</u>	R2= C6arilo sustituido por OC(O)R8
R1= H, alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo opcionalmente sustituido por O	R2= H, <u>OCOR</u>	R2= C6arilo sustituido por OC(O)R8 donde R8 es alquilo, heterociclo
R5 = H	R2=H	R2= C6arilo sustituido por H
R7 = H	R2=H	R2= C6arilo sustituido por H
R8 = H	R2=H	R2= C6arilo sustituido por H
R6= CONR, F	R2=CONH2	R2= C6arilo sustituido por halo
R2 y R3= H	R4=H	R11= H

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 divulga las tienopirimidinas como compuestos heteroaromaticos bicíclicos que inhiben tirosinquinasa (Columna 11, líneas 10 a 15 y columnas 12 a 13).

D2 divulga derivados de tienopirimidinas, que inhiben tirosinquinasa y pueden ser usados en el tratamiento del cáncer. (Pág. 1, columna 2; Pág. 37, columna 2 y

Pág. 38, columna 1). Los compuestos tienen similaridad con los compuestos de la que reclaman los radicales R4, X, R1, R5, R7, R8, R6, R2 y R3, tal como se muestra en la tabla.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 corresponde a que la invención tiene un grupo funcional amida ó fluor en el radical R6 y un anillo heterociclo el radical R1.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en que la invención tiene un H en el radical R1 formando una amina secundaria.

No se evidencia que el cambio en los radicales 1 y 6 inhiba de mejor manera la actividad quinasa con respecto a lo divulgado en el estado de la técnica pues no muestra resultados de los estudios de actividad quinasa.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos de formula I conocidos en D1 para conseguir compuestos alternativos derivados a la tienopirimidina, para la inhibición de la actividad quinasa".

Sin embargo, la utilización del grupo funcional amida o fluor en la posición equivalente al radical R6 y un anillo heterociclo en la posición equivalente al radical R1 de tienopirimidinas con actividad quinasa, ya se encuentra divulgada en D2 (Página 38, columna 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir el grupo funcional amida o fluor en el radical R6 y un anillo heterociclo en la posición equivalente al radical R1 de tienopirimidinas con actividad quinasa del documento D2 en el documento D1. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 23 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	US6265410	1, 6 a 15, 17 y 18	Novedad
D1	US6265410	1-23	Nivel Inventivo
D2	US2003162795	1-23	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 