

y 559

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

2012
Bogotá, D.C.,

Abogada
ALICIA LLOREDA RICAURTE

ASUNTO	Radicación	08 115 223
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	6

10916

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒ Capítulo I	☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/US2007/00856	
	2	
Fecha de Presentación Internacional	06/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 50 a 291	28/Octubre/2008
	Folios 484 a 486	21/Noviembre/2008
Reivindicaciones:	Folios 292 a 438	28/Octubre/2008
	Folios 500 a 557	19/Mayo/2011
Dibujos:	Folios 439 a 477	28/Octubre/2008
Prioridad:	US 60 790 168	06/Abril/2006
	US 60 816 968	27/Junio/2006
	US 60 836 155	07/Agosto/2006
	US 60 844 132	12/Septiembre/2006
	US 60 885 379	17/Enero/2007

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: "Síntesis total de salinosporamida A y análogos de la mismas".

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar nuevos agentes quimioterapéuticos, agentes antimicrobianos y agentes antiinflamatorios para tratar el cáncer, enfermedades inflamatorias y enfermedades infecciosas.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona la síntesis total de salinosporamida A y sus intermediarios, con actividad quimiosensibilizante, antimicrobiana, antiinflamatoria, radiosensibilizante y actividad anticáncer.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 207/26

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La Reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de "arilo" y "arilalquilo" en R_2 y R_3 ; "alquilo C_{1-12} ", "alquenilo C_{2-12} ", "alquinilo C_{2-12} ", "cicloalquilo C_{3-12} ", "cicloalquenilo C_{3-12} ", "cicloalquinilo C_{3-12} ", "heterociclilo C_{3-12} ", "arilo", "heteroarilo", "arilalquilo", "heteroarilalquilo", "(cicloalquil)alquilo", "(heterociclil)alquilo", "acilo", "acilalquilo", "alquiloxicarbonilo", "carbonilacilo", "aminocarbonilo", "azido", "azidoalquilo", "aminoalquilo", "sal de aminoalquilo", "carboxialquilo", "sal de un carboxialquilo", "alquilaminoalquilo", "sal de un alquilaminoalquilo", "dialquilaminoalquilo", "sal de un dialquilaminoalquilo", "alquiltioalquilo", "ariltioalquilo", "carboxi", "alcanosulfonilalquilo", "alcanosulfinilalquilo", "alcoxisulfonilalquilo", "tiocianoalquilo", "acidalquilo borónico", "esteralquilo borónico", "guanidinoalquilo", "sal de guanidinoalquilo", "sulfoalquilo", "sal de un sulfoalquilo", "alcoxisulfonilalquilo", "sulfooxialquilo", "sal de un sulfooxialquilo", "alcoxisulfoniloxialquilo", "fosfonooxialquilo", "(alquilfosfooxi)alquilo", "fosforilalquilo", "sal de un fosforilalquilo", "(alquilfosforil)alquilo", "piridinilalquilo", "sal de un piridinilalquilo", "sal de un heteroarilalquilo" y "alquilo halogenado incluyendo alquilo polihalogenado" en R_4 ; "alquilo C_{1-24} ", "acilo", "alquilacilo", "arilacilo", "arilo", "arilalquilo" y "heteroarilo" en R_6 , pueden incluir un número indeterminado de compuestos, 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, como por ejemplo como se muestra en la Descripción, ejemplos 31 a 36, compuesto XVI-1A. De manera similar, en todo el pliego reivindicatorio se encuentran términos como los señalados anteriormente, que se consideran demasiados amplios, por lo cual se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

La Reivindicación 1 no es clara porque los grupos de protección PG_1 , PG_2 y PG_3 que se señalan en las etapas de síntesis (e) – (h), (j) – (m) y (o) – (p) no se encuentran debidamente identificados, se puede observar que inclusive el PG_2 ni siquiera es mencionado en las definiciones subsiguientes a las etapas de síntesis, sin embargo en la posterior Reivindicación 6 se menciona específicamente las definiciones de PG_1 y PG_2 , pero no se menciona PG_3 . Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

Las Reivindicaciones 2 – 5 (dependientes de la Reivindicación 1) no son concisas, ya amplían la materia reclamada en la reivindicación independiente cuando se adicionan etapas al proceso de síntesis. Se sugiere adicionar las Reivindicaciones 2 – 5 en la Reivindicación 1, o realizar las aclaraciones necesarias.

Las Reivindicaciones 6 – 8 (dependientes de la Reivindicación 1) no son concisas, ya amplían la materia reclamada en la reivindicación independiente cuando se mencionan las definiciones de PG_1 , PG_2 (Reivindicación 6), y del residuo

organometálico (Reivindicaciones 7 y 8). Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias. Adicionalmente, las definiciones de "bencilo", "bencilo sustituido", "alquilcarbonilo", "arilalquilcarbonilo", "metil éter sustituido", "etil éter sustituido", "bencil éter sustituido", "silil éter", "éster" y "carbonato" en la Reivindicación 6; "compuesto de organomagnesio", "compuesto de organolitio", "compuesto de organoestaño", "compuesto de organocupratos", "compuesto de organozinc", "compuesto de organoboro", "compuesto de organopaladio", "carbonilo metálico", "metaloceno", "complejo de carbina" y un organometaloide, en la Reivindicación 7; "alquilo", "alquenilo", "cicloalquilo", "arilo", "arilalquilo", "isopinocameflo", "alcoxi", "carbonilalcoxi", "anillo de cicloalquilo, cicloalquenilo, heteroalquilo o heteroalquenilo", en R₇, en la Reivindicación 8, pueden presentar múltiples opciones de posibles compuestos, dificultando entender el alcance de la materia reclamada en la solicitud. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción.

En las Reivindicaciones 45 – 60 (en donde se reclaman compuestos intermediarios del método de síntesis de la Reivindicación 1) se sugiere modificar el preámbulo para que representen un único concepto inventivo. Por ejemplo, se sugiere un preámbulo como: "Un compuesto de la fórmula (X), el cual es un intermediario del método de síntesis reclamado en la Reivindicación 1:..."

Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

5. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 27, grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

Grupo Inventivo 1: Método para la síntesis química que comprende las etapas de la ruta sintética, los compuestos intermediarios de fórmula (I), (II), (III), (IV), (V), (VI), (VII), (VIII), (IX), (X), (XIII), (XXIV), (XXV), (XXVp), (XXVI), (XXVII), (XXVIII), (XV), (XVI-B), (XII) y (XVI-A) en donde los sustituyentes son como se encuentran allí definidos (Reivindicaciones 1 – 12 y 45 – 60).

Grupo Inventivo 2: Método para formar un compuesto de la fórmula (X), a partir de un compuesto de la fórmula (V) (Reivindicación 13).

Grupo Inventivo 3: Método para formar un compuesto de la fórmula (XV), a partir de un compuesto de la fórmula (X) (Reivindicaciones 14 – 16).

Grupo Inventivo 4: Método para formar un compuesto de la fórmula (XVII), a partir de un compuesto de la fórmula (V) (Reivindicación 17).

Grupo Inventivo 5: Método para formar un compuesto de la fórmula (XXII), a partir de un compuesto de la fórmula (XVII) (Reivindicaciones 18 – 20).

Grupo Inventivo 6: Método para preparar un compuesto de la fórmula (III), en donde las etapas involucradas comprenden hacer reaccionar un compuesto de fórmula (I) con un compuesto de la fórmula (II) para formarlo (Reivindicación 21).

Grupo Inventivo 7: Método para preparar un compuesto de la fórmula (IV), a partir de la desprotección del compuesto de la fórmula (III) (Reivindicación 22).

4 562

Grupo Inventivo 8: Método para preparar un compuesto de la fórmula (V), que comprende llevar a cabo una reacción de aldol intramolecular en el compuesto de la fórmula (IV) (Reivindicación 23).

Grupo Inventivo 9: Método para preparar un compuesto de la fórmula (VI), que comprende romper el enlace doble del compuesto de fórmula (V) y ciclar el enlace doble roto con el grupo hidroxilo terciario para formarlo (Reivindicación 24).

Grupo Inventivo 10: Método para preparar un compuesto de la fórmula (VII), que comprende proteger el sustituyente hidroxilo enlazado al anillo heterocíclico que contiene oxígeno del compuesto de la fórmula (VI) para formar un compuesto de fórmula (VII) (Reivindicación 25).

Grupo Inventivo 11: Método para preparar un compuesto de la fórmula (VIII), en donde se reduce el grupo COOR₂ del compuesto de la fórmula (VII) a un alcohol para formarlo (Reivindicación 26).

Grupo Inventivo 12: Método para preparar un compuesto de la fórmula (IX), que comprende oxidar el grupo alcohol del compuesto de la fórmula (VIII) a un aldehído para formarlo (Reivindicación 27).

Grupo Inventivo 13: Método para preparar un compuesto de la fórmula (X), que comprende agregar R₄ al compuesto de la fórmula (IX) (Reivindicación 28).

Grupo Inventivo 14: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXIII), que comprende retirar el residuo del grupo de protección de la fórmula (X) y abrir reductivamente el hemiacetal para su formación (Reivindicación 29).

Grupo Inventivo 15: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXIV), que comprende proteger el grupo hidroxilo primario del compuesto de la fórmula (XXIII) para su formación (Reivindicación 30).

Grupo Inventivo 16: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXV), que comprende romper el grupo amina del compuesto de la fórmula (XXIV) para su formación (Reivindicación 31).

Grupo Inventivo 17: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVp), que comprende proteger el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXV) para su formación (Reivindicación 32).

Grupo Inventivo 18: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVI), que comprende convertir el grupo alcohol primario y retirar el residuo de protección PG₂ en el alcohol secundario del compuesto de la fórmula (XXVp) para su formación (Reivindicación 33).

Grupo Inventivo 19: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVII), que comprende retirar el residuo del grupo de protección PG₃ en el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVI) para su formación (Reivindicación 34).

Grupo Inventivo 20: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVI), que comprende proteger el alcohol primario del compuesto de la fórmula (XXVII) con el residuo del grupo de protección PG₃ para su formación y donde el PG₃ puede ser el mismo o diferente del PG₃ en la Reivindicación 30 (Reivindicación 35).

5563

Grupo Inventivo 21: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXVIII), que comprende llevar a cabo una reacción de lactonización en el compuesto de la fórmula (XXVI) para su formación (Reivindicación 36).

Grupo Inventivo 22: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XV), que comprende llevar a cabo una reacción de lactonización en el compuesto de la fórmula (XXVII) para su formación (Reivindicación 37).

Grupo Inventivo 23: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XV), que comprende retirar el residuo del grupo de protección PG3 en el compuesto de la fórmula (XXVIII) para su formación (Reivindicación 38).

Grupo Inventivo 24: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI), que comprende sustituir el grupo hidroxilo primario del compuesto de la fórmula (XV) para su formación (Reivindicación 39).

Grupo Inventivo 25: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XXII), que comprende oxidar el grupo alcohol enlazado al carbono C-5 adyacente al R4 de un compuesto de la fórmula (XVI) a una cetona para su formación (Reivindicación 40).

Grupo Inventivo 26: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI), que comprende reducir la cetona enlazada al carbono adyacente al R4 de un compuesto de la fórmula (XXII) a un alcohol para su formación (Reivindicación 41 – 43).

Grupo Inventivo 27: Método para preparar un compuesto de la fórmula (XVI-A), que comprende invertir la estereoquímica del grupo hidroxilo secundario en el compuesto de la fórmula (XVI-B) para su formación (Reivindicación 44).

El problema a ser solucionado en esta invención consiste en proporcionar un método de síntesis de salinosporamida A y sus intermediarios, que presentan actividad quimiosensibilizante, antimicrobiana, antiinflamatoria, radiosensibilizante y actividad anticáncer. En la solicitud se presentan 27 grupos inventivos diferentes. No se presenta unidad de invención comparando grupo inventivo 1 con los demás grupos listados, porque los grupos inventivos 2 – 27 corresponden a métodos de síntesis de los intermediarios involucrados en el método de síntesis de la Reivindicación 1, por lo tanto no reúnen un solo concepto inventivo, pues la característica técnica esencial es que la síntesis total está dirigida a Salinosporamida A y no a sus posibles intermediarios.

Por lo tanto, esta solicitud carece de unidad de invención, los diferentes grupos no ofrecen un concepto inventivo común. Cada uno de los grupos listados se caracteriza por tener su propia característica técnica esencial. Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

Debido a la falta de unidad de invención, el examen de patentabilidad se limita al grupo inventivo 1.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de Presentación Internacional: Abril 06 de 2007, y no se encontraron documentos que anticipen el objeto de esta solicitud:

8564

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.

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)

7 2 JUN. 2012

Elaborado por: Ricardo Velasco González
Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso.

ort