

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO
clientes@cavalier.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-001102- -00002-0000

Fecha: 2012-08-24 07:26:13 Dep. 2020 DIR.NUEVAS
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	09-1102
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	06 E 15207

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

No. Solicitud Internacional PCT/EP2007/056860
Fecha de Presentación Internacional 5 de julio de 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 118-145	07 de enero de 2009
Reivindicaciones:	Folios 146-150	07 de enero de 2009
Prioridad:	EP 06116826,6	07 de julio de2006

2. Análisis de la Prioridad

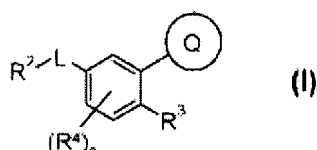
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque:
Esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486).
Y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: “Derivados de Heteroaril-sustituídos con fenilo y su uso como agentes antitumorales”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar nuevos compuestos activos útiles para la prevención y/o tratamiento de enfermedades que se caracterizan por proliferación celular excesiva.

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



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/12

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicación 14 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

La reivindicación 12 aunque su definición encabeza con la expresión “compuestos o sales farmacéuticamente inocuas”, pretende reclamar un uso, lo cual, no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

5. De la Solicitud de Patente

Titulo

Se sugiere modificar el título puesto que el mismo infiere un uso el cual es una característica no patentable. Se sugiere cambiarlo por “agentes antitumorales derivados de Heteroaril-sustituidos con fenilo”.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las Reivindicaciones 1, 2, 7, 8, 11 no son concisas cuando se usan los términos:

- Heteroarilo 5-12 miembros, heterocicloalquilo de 3-7 miembros, heterocicloalquilo de 3-14 miembros: porque no definen el número y tipo de heteroátomos utilizados.
- heteroalquilo de 2-6 miembros: porque no definen el número y tipo de heteroátomos utilizados.
- heteroarilalquilo de 6-18 miembros, heterocicloalquilalquilo de 4-14 miembros: porque no definen el número y tipo de heteroátomos utilizados, y no se comprende si el número de miembros corresponde a la parte cíclica o aromática únicamente, o comprende al conjunto que comprende al anillo y a la porción alquilo.
- heteroarilo a lo sumo de 6 miembros: porque no definen el número y tipo de heteroátomos utilizados, y la expresión “a lo sumo” no es precisa lo que no permite definir el alcance del sustituyente.
- Alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alquilo C₁₋₆, heteroalquilo C₂₋₆, haloalquilo C₁₋₆, arilalquilo C₇₋₁₆, y similares dan lugar a una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

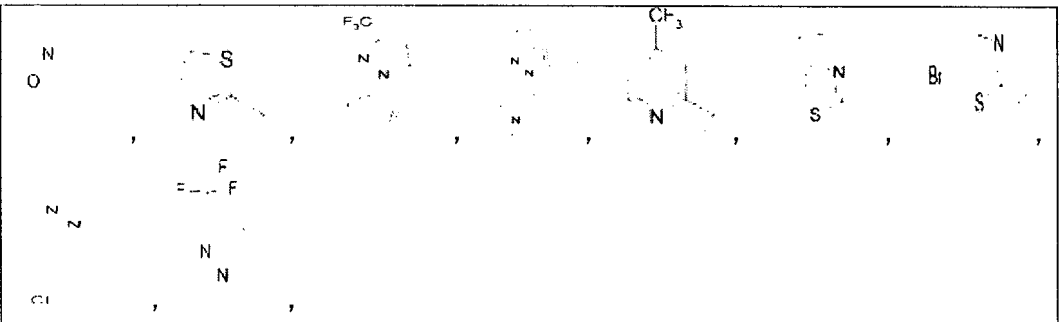
- cicloalquilo C₃₋₇, arilo C₆₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₁₀ y similares dan lugar a una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.
- cicloalquil C₄₋₁₆-alquilo, arilo C₇₋₁₆-alquilo y similares dan lugar a una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Y no son claras porque no definen el número de miembros que tiene la porción alquilo
- cicloalquilalquilo C₄₋₁₆ y similares dan lugar a una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Y no se comprende si el número de miembros corresponde a la parte cíclica o aromática únicamente, o comprende al conjunto que comprende al anillo y a la porción alquilo.
- El uso de expresiones como “opcionalmente sustituido” “uno o más” no son concisas porque no limitan el alcance la reivindicación, ni la definen de manera adecuada.
- El uso del término “n” que se define común número entero 0, 1, 2 y 3, no es conciso, porque dan lugar a una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción porque no limitan el alcance la reivindicación, ni la definen de manera adecuada.

De acuerdo a lo anterior, se obtienen un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

Se sugiere al solicitante, definir cada término de manera apropiada y restringir la solicitud a una generalización razonable de los compuestos ejemplificados.

Para este efecto esta Oficina manifiesta que en la descripción se encuentran soportados los siguientes compuestos a los cuales el solicitante puede tener en cuenta para la respectiva restricción:

(II)	
Q	(vi) (vii) (viii) (ix) (x) (xi)
L	-NHC(O)-, -C(O)NH-
R1	
R2	

	
R3	CH3, Cl
R4	H

El uso de las expresiones “eventualmente sustituido con uno o varios” e “iguales o diferentes, principalmente”, es impreciso, y no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término preciso.

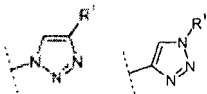
La expresión: “de modo independiente entre sí” precediendo una característica no es limitativo, porque hace opcional a la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

La reivindicación 15 no es clara ni concisa porque no se define adecuadamente utilizar la expresión “al menos otra sustancia citostática o citotóxica” ya que en primer lugar no define cuantos principios activos diferentes de los compuestos de fórmula uno serán utilizados para formar las combinaciones, y en segundo lugar, la expresión incluye a todos los principios activos citostáticos y citotóxicos, lo que da lugar a una innumerable variedad de combinaciones que no se encuentran soportadas, por lo tanto se sugiere al solicitante que defina de manera inequívoca la expresión objetada, limitando su alcance a lo que se encuentra debidamente soportado.

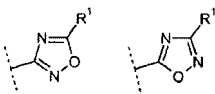
6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La Solicitud no cumple con el Requisito de Unidad de Invención porque se refiere a 8, Grupos Inventivos.

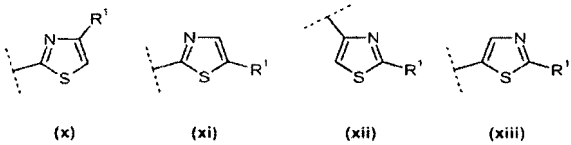
Los Grupos Inventivos están definidos por las siguientes características **esenciales**:



1° Compuestos en los cuales Q= (vi) , (vii) , que hacen referencia a las Reivindicaciones 1, 5 y 6 y que fueron previamente divulgados en D1, (página 5, columna derecha, línea 13)



2° Compuestos en los cuales Q= (viii) (ix)



3° Compuestos en los cuales Q=

Se sugiere presentar las Solicitudes Divisionales que considere necesarias, ó limitar a 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 Presentación de la Solicitud de Patente Nacional: 7 de julio de 2006

Y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US2006100204	Anti-cytokine heterocyclic compounds	11 de mayo de 2006
D2	WO2005056535	1,2,3-Triazole Amide Derivatives As Inhibitors Of Cytokine Production	23 de junio de 2005
D3	WO2005090333	3'-4-Heterocyclyl -1,2,3-Triazol-1-Yl-N-Aryl-Benzamides As Inhibitors Of The Cytokines Production For The Treatment Of Chronic Inflammatory Diseases	29 de septiembre de 2005
D4	WO2005115991	Anti-Cytokine Heterocyclic Compounds	08 de diciembre de 2005

D1
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2006100204A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20060511&DB=&locale=en> EP

Se describen compuestos de fórmula (I), que inhiben la producción de citoquinas que participan en los procesos inflamatorios y por tanto son útiles para tratar enfermedades y condiciones patológicas que implican inflamación tales como la enfermedad inflamatoria crónica. También se describen procedimientos para preparar estos compuestos y composiciones farmacéuticas que comprenden estos compuestos.

D2
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005056535A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20050623&DB=&locale=en> EP

Se describen compuestos de fórmula (I), los cuales inhiben la producción de citoquinas y son por tanto útiles para el tratamiento de enfermedades mediadas por citoquinas. También se describen procedimientos para preparar estos compuestos y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

D3
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2005090333&KC=&FT=E&locale=en> EP

Compuestos descritos de fórmula (I), que inhiben la producción de citoquinas que participan en los procesos inflamatorios y por tanto son útiles para tratar enfermedades y condiciones patológicas que implican inflamación tales como la enfermedad inflamatoria crónica. También se describen procedimientos para preparar estos compuestos y composiciones farmacéuticas que comprenden estos

compuestos.

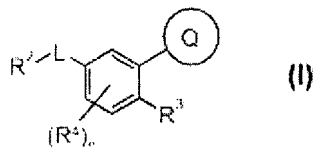
D4
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005115991A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20051208&DB=&locale=en_EP

Divulgan compuestos del fórmula (I), con actividad inhibitoria de la producción de citoquinas que participan en los procesos inflamatorios y por tanto, son útiles para tratar enfermedades y condiciones patológicas que implican inflamación tales como la enfermedad inflamatoria crónica. También se describen procedimientos para preparar estos compuestos y las composiciones farmacéuticas que los comprenden.

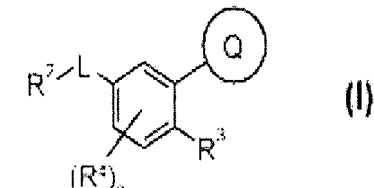
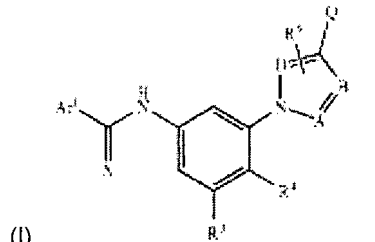
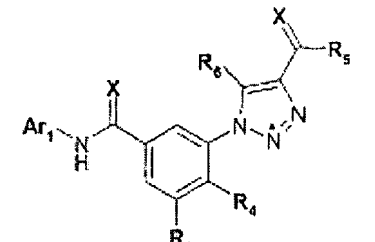
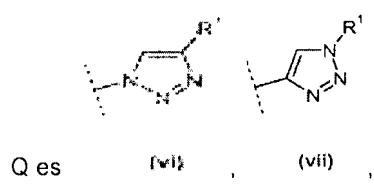
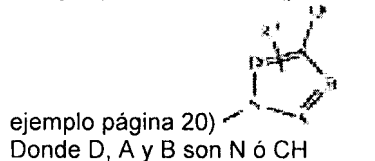
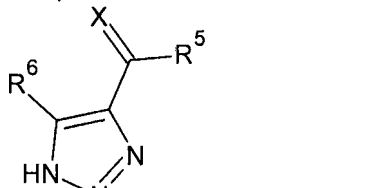
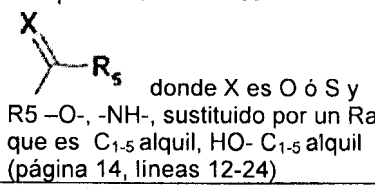
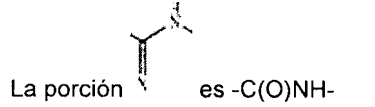
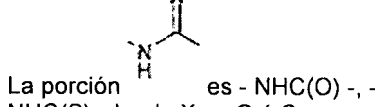
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

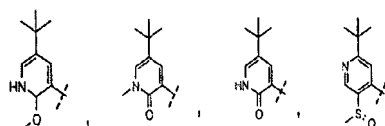
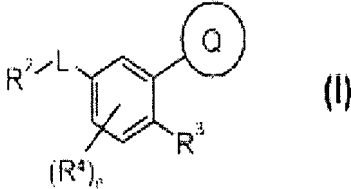
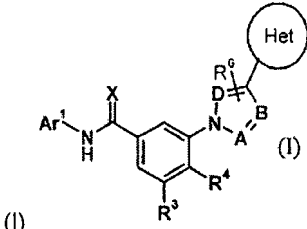
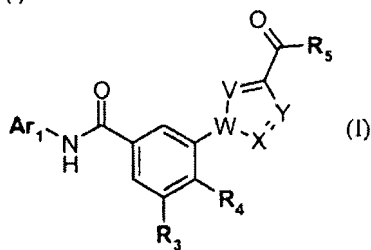
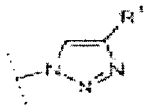
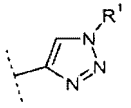
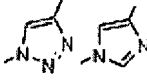
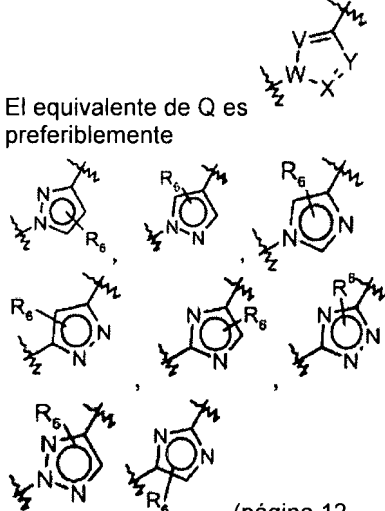
Novedad (Art 16 D486)

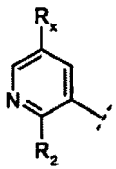
La reivindicación 1 consiste en compuestos de la fórmula general (1)



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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de la fórmula general (1) 	Un compuesto de fórmula general 	Un compuesto de fórmula (I) 
 Q es (vi) , (vii) ,	Un ejemplo de la tabla 1 (primer ejemplo página 20) Donde D, A y B son N ó CH 	El equivalente de Q es  donde R6 es H
Donde R1 es -C(O)OR, -C(O)N(R)2, heterociclo, heteroarilo.	Donde Q es -C(O)OR, -C(O)N(R)2, heterociclo, o heteroarilo	El equivalente de R1 es  donde X es O ó S y R5 -O-, -NH-, sustituido por un Ra que es C1-5 alquil, HO- C1-5 alquil (página 14, líneas 12-24)
R3 es alcoxi, halógeno	R4 es C1-3 alcoxy, C1-3 alquilo, halógeno.	R4 es H, halógeno. Alcoxi C1-5 (página 14, líneas 8-10)
L es -C(O)NH-, -NH(CO)-,	La porción  es -C(O)NH-	La porción  es - NHC(O) -, -NHC(S)- donde X es O ó S.

R2 es heteroarilo de 5 miembros	Ar 1 es 	Ar1 es 
Características esenciales	D3	D4
Un compuesto de la fórmula general (I)	Un compuesto de fórmula general (I)	Un compuesto de fórmula general (I)
		
Q es  (vi),  (vii)	El equivalente de Q es  (ejemplos página 23-26), (último ejemplo página 26),	El equivalente de Q es preferiblemente  (página 12, líneas 4-9)
Donde R1 es -C(O)OR-, -C(O)N(R)2, heterociclo, heteroarilo.	Donde  es el equivalente de Q el cual es seleccionado de  (ejemplo 4 página 27),  (página 30, ejemplo 2),  (página 41 último ejemplo)	Donde R5 es arilo, heteroarilo, heterociclo, (página 14, línea 20-21)
R3 es alcoxi, halógeno	R4 es C1-3 alcoxy, C1-3 alquilo, halógeno.	R4 es C1-3 alcoxy, C1-3 alquilo, halógeno.
L es -C(O)NH-, -NH(CO)-,	La porción  es -C(O)NH-	El equivalente de L es C(O)NH (resumen)

R2 es heteroarilo de 5 miembros	Ar 1 es fenil piridinil	 Ar1 es (página 17, líneas 5-10)
---------------------------------	-------------------------	--

Novedad frente a D1

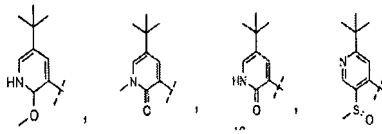
Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual divulga un compuesto heteroarilo sustituido con fenilo como los de acuerdo a la reivindicación uno, donde el anillo



equivalente a Q en la actual reivindicación tiene como sustituyentes de D, A y B a N ó CH (página 5, columna derecha, línea 13), Q el cual, es el equivalente de R1 en la actual solicitud es -C(O)OR, -C(O)N(R)₂, heterociclo, o heteroarilo (página 5,



columna derecha, línea 17-19), La porción , el cual es equivalente de L en la actual solicitud es -C(O)NH-, -C(S)NH- (párrafo 31), y Ar1 el cual es equivalente de



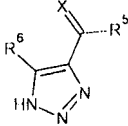
R2 en la actual solicitud, (página 19, línea 29)

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

Las reivindicaciones dependientes 2–13 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Novedad frente a D2

Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D2, el cual divulga un compuesto heteroarilo sustituido con fenilo como los de acuerdo a la reivindicación uno, donde el anillo



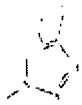
equivalente a Q en la actual reivindicación tiene como sustituyentes a R6 que es H, el equivalente de R1 es donde X es O ó S y R5 -O-, -NH-, sustituido por un Ra que es C1-5 alquil, HO- C1-5 alquil (página 14, líneas 12-24), y Ar1 el cual es equivalente de R2 en la actual solicitud es pirazol sustituido (párrafo 34)

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D2.

Las reivindicaciones dependientes 2–13 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Novedad frente a D3

Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D3, el cual divulga un compuesto heteroarilo sustituido con fenilo como los de acuerdo a la reivindicación uno, donde el anillo



equivalente a Q en la actual reivindicación es tiene como sustituyentes de D, A

y B a N ó CH (resumen), El equivalente de Q es (ejemplos página 23-26

último ejemplo página 26), Donde es el equivalente de Q el cual es

seleccionado de , , (ejemplo 4 página 27), (página 30, ejemplo

2), (página 41 último ejemplo), R4 es C1-3 alcoxy, C1-3 alquilo, halógeno. La

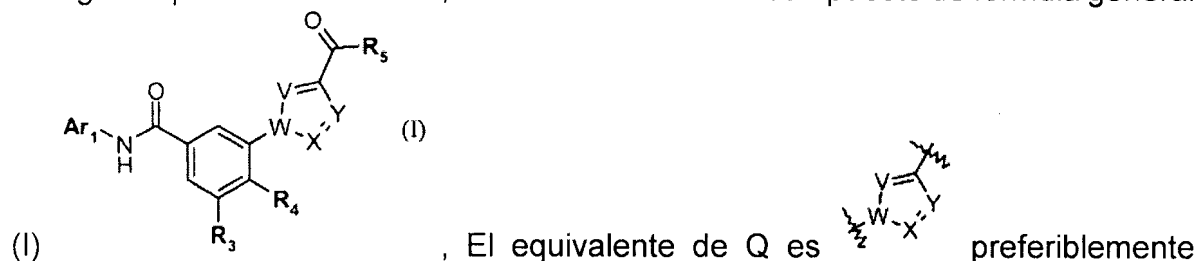
porción es -C(O)NH-, Ar 1 es fenil piridinil.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D3.

Las reivindicaciones dependientes 2-13 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Novedad frente a D4

Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D4, el cual consiste en un compuesto de fórmula general



, , , , , , (página 12, líneas 4-9), Donde R5 es arilo, heteroarilo, heterociclo, (página 14, línea 20-21), R4 es C1-3 alcoxy, C1-3 alquilo, halógeno. El equivalente de L es C(O)NH (resumen),

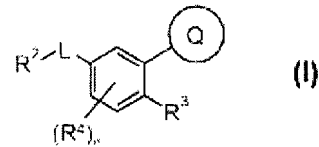
Ar1 es (página 17, líneas 5-10)

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D4.

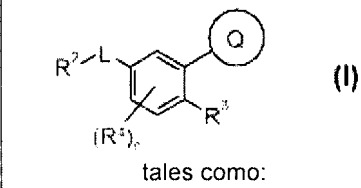
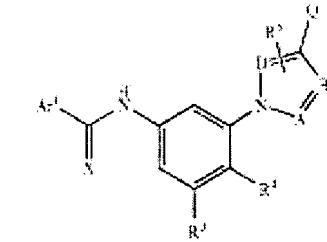
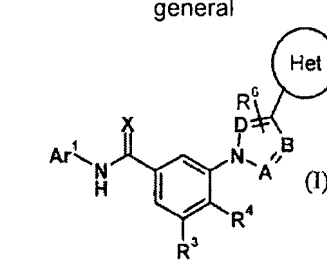
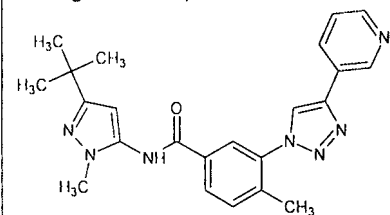
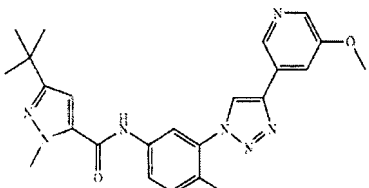
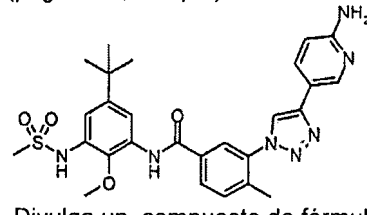
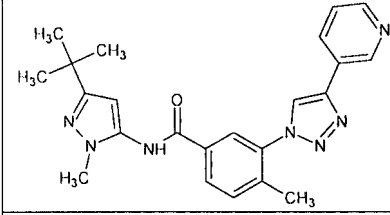
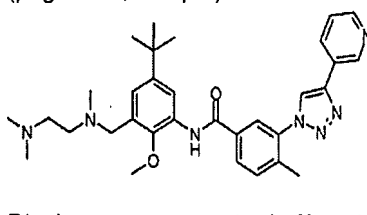
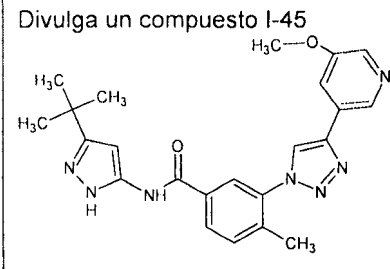
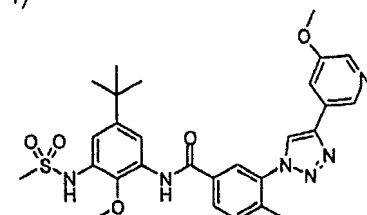
Las reivindicaciones dependientes 2–13 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

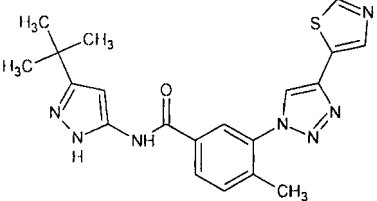
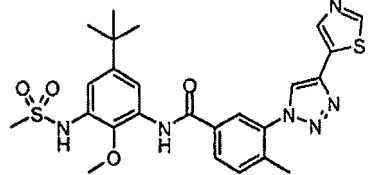
Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en compuestos de formula general (I)



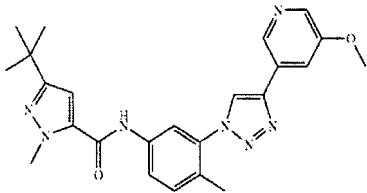
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D3
Divulga compuesto de fórmula (I)  tales como:	Divulga compuesto de fórmula (I)  tales como:	Divulga compuesto de fórmula general  tales como:
Divulga un compuesto I-33 	Divulga un compuesto de fórmula (página 20, comp 1) 	Divulga un compuesto de fórmula (página 27, comp 4) 
Divulga un compuesto I-34 		Divulga un compuesto de fórmula (página 27, comp 6) 
Divulga un compuesto I-45 		Divulga un compuesto de fórmula (página 35, comp 1) 

Divulga un compuesto I-49 	Divulga un compuesto de fórmula (página 40, comp 5) 
---	---

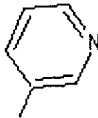
Nivel inventivo D1 con D3

Los documentos D1 o D3 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan compuesto heteroarilo

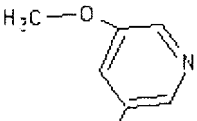


sustituidos con fenilo de fórmula (I) (página 20, comp 1)

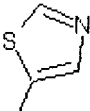
La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que la actual solicitud en los compuestos I-33, I-34, I-45 e I-49 tiene como



sustituyente L un grupo -NH(CO)- y el sustituyente R1 es (para I-33 e I-34),



(para I-45) y,

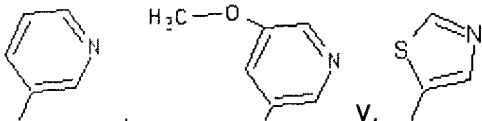


(para I-45)

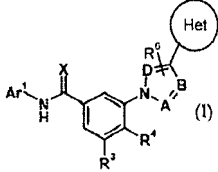
El efecto técnico que logra la diferencia, consiste en que se obtienen compuestos alternativos de fórmula I que incluyen primero, un anillo piridina sustituido o sin sustituir, o un anillo 1,3-tiazol y segundo un grupo -NH(CO)- en la estructura de los compuestos de D1.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo presentar compuestos alternativos a los conocidos en D1 para y que sean útiles como agentes antitumorales”.

Sin embargo, la utilización un grupo -NH(CO)- como equivalente del sustituyente L y



como equivalente de R1, ya está divulgada en el documento D3 (página 27, comp 6, página 35, comp 1, página 40, comp 5,



respectivamente), que se refiere a compuestos de formula general que tienen actividad inhibitoria de las citoquinas y

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, se veria motivada incluir los radicales equivalentes de R1 y de L de D3 en los compuestos de

fórmula (I) de 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).

Las reivindicaciones 2-13 no mencionan características que hagan nueva o inventiva la reivindicación 1, por lo cual, se consideran obvias.

9. Conclusión

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

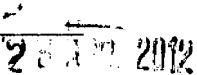
Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2006100204	1-13	Novedad
		1-13	Nivel Inventivo
D2	WO2005056535	1-13	Novedad
		1-13	Nivel Inventivo
D3	WO2005090333	1-13	Novedad
		1-13	Nivel Inventivo
D4	WO2005115991	1-13	Novedad
		1-13	Nivel Inventivo

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.

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


Elaborado por: Harvey Jaramillo. 
Revisado Por: Jacqueline Alfonso