

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
J. IAN RAISBECK

ASUNTO	Radicación	09 17337
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	05 1 14 5 81

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

No. Solicitud Internacional PCT/GB2007/003173
Fecha de Presentación Internacional 21/Agosto/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 468 a 909	20/Febrero/2009
Reivindicaciones:	Folios 910 a 919	20/Febrero/2009
	Folios 930 a 934	27/Febrero/2009
Prioridad:	GB 0616747.2	24/Agosto/2006
	US 60/948,544	09/Julio/ 2007

2. Análisis de la Prioridad

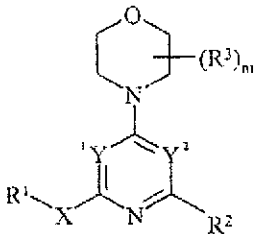
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Derivados de morfolino pirimidina útiles en el tratamiento de desórdenes proliferativos"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar inhibidores de la enzima PI3K para el tratamiento de enfermedades proliferativas como el cáncer.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de morfolino pirimidina de fórmula (I) como inhibidores de las enzimas PI3K, pueden ser útiles para el tratamiento de enfermedades proliferativas como el cáncer.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D239/42, C07D401/04, C07D401/12, C07D401/14, C07D403/04, C07D403/12, C07D405/12, C07D409/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/506, A61K31/5377, C07D413/04, C07D413/14, C07D417/14.

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

El uso de las reivindicaciones 12,13 y 15 no es patentable, de acuerdo con el Art 14. Aunque las reivindicaciones 12 y 15 se encabezan por un compuesto su contenido se refiere a un uso.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

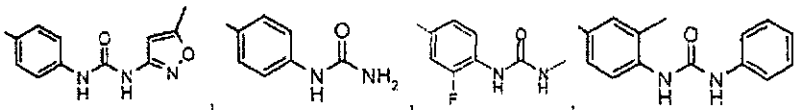
El capítulo reivindicatorio no es claro porque:

La reivindicación 1 tiene el término “opcionalmente sustituido”, el cual 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 R1, X, Y1, Y2, R2 y R3 como carbociclil, heterociclil, carbociclilalquil, heterociclilalquil, entre otros los cuales corresponden a grupos funcionales 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
R1	
X	
Y1	C

Y2	N
R2	
R3	H ₁

6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de prioridad (24/Agosto/2006) y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

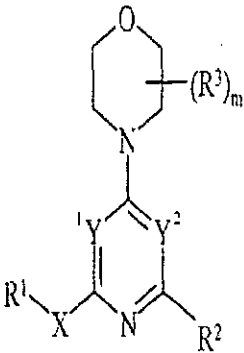
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006005918	2, 4,6-TRISUBSTITUTED PYRIMIDINES AS PHOSPHOTIDYLINOSITOL (PI) 3-KINASE INHIBITORS AND THEIR USE IN THE TREATMENT OF CANCER	19/enero/2006
D2	WO2006005915	2, 4,6-TRISUBSTITUTED PYRIMIDINES AS PHOSPHOTIDYLINOSITOL (PI) 3-KINASE INHIBITORS AND THEIR USE IN THE TREATMENT OF CANCER	19/enero/2006

D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2006005918&KC=&FT=E&locale=en> EP
Divulga pirimidinas trisustituídas como inhibidores de quinasas PI3K para el tratamiento del cáncer (Pág. 1, 2 y 102 a 109).
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2006005915&KC=&FT=E&locale=en> EP
Divulga pirimidinas trisustituídas como inhibidores de quinasas PI3K para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 y 92 a 96).

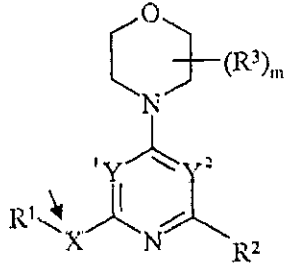
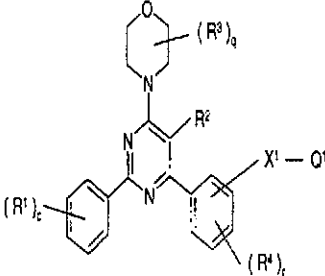
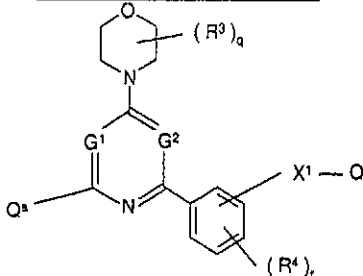
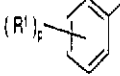
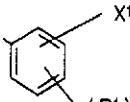
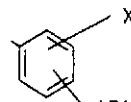
7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde: (Fl. 930 a 934).



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

Características esenciales	D1	D2
<u>Compuesto de fórmula I</u> 	<u>Compuesto de fórmula I</u> 	<u>Compuesto de fórmula I</u> 
R1= alquil, carbociclíl,		
X= SO2CR, CR donde R=H, alquil, carbociclíl	R1 puede ser Q2-X2 Q2= alquil, carbociclíl, X2= SO2CR, CR donde R=H, alquil, arilo	Qa puede ser Q2-X2 Q2= alquil, carbociclíl, X2= SO2CR, CR donde R=H, alquil, arilo
Y1=C	N	G1=CH
Y2=N	C	G2=N
R2=carbociclíl sustituido por NCONR donde R=H, alquil, carbociclíl, heterociclíl		
	X1-Qb donde X1= NCONR donde R=H, alquil y Qb = alquil, heterociclíl R4= H	X1-Qb donde X1= NCONR donde R=H, alquil y Qb = alquil, heterociclíl R4= H
R3= H	R3= H	R3= H
sal farmacéuticamente aceptable	sal farmacéuticamente aceptable	sal farmacéuticamente aceptable

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 divulga pirimidinas trisustituidas como inhibidores de quinasas PI3K para el tratamiento del cáncer (Pág.1, 2 y 102 a 109).

D2 divulga pirimidinas trisustituidas como inhibidores de quinasas PI3K para el tratamiento del cáncer (Pág. 2 y 92 a 96).

Los compuestos de los documentos D1 y D2 tienen similitud con los compuestos de la solicitud que reclaman los radicales R1, X, Y1, Y2, 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 alquilsulfónico que une al anillo pirimidina con una cadena de alquilo o carbociclo.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en que la invención tiene un anillo carbocíclico en el radical R2.

No se evidencia que por el hecho de cambiar los radicales de la pirimidina se tenga un efecto técnico inesperado o se inhiba de mejor manera la actividad quinasa PI3K con respecto a lo divulgado en el estado de la técnica, en comparación a las pirimidinas trisustituidas como inhibidores de quinasas PI3K para el tratamiento del cáncer divulgados en el estado de la técnica.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar los compuestos de fórmula I conocidos en

D1 para conseguir compuestos alternativos derivados de pirimidinas, para la inhibición de la actividad quinasa PI3K".

Sin embargo, la utilización del grupo alquilsulfónico que une al anillo pirimidina con un alquilo o carbocíclico, ya se encuentra divulgada en D2 (Pág. 92 a 93), adicionalmente el documento D12 del reporte de búsqueda internacional "4-PYRIMIDINECARBOXAMIDE, 2,6-DI-4-MORPHOLINYL-N-(2-PHENYLETHYL)-" CHEMCATS, 2004, XP002348927 divulga la materia reclamada en la reivindicación 1.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un grupo alquilsulfónico que une al anillo pirimidina con un alquilo o carbocíclico de los derivados heteroarilo como inhibidores de quinasas PI3K 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 11 y 14 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006005918	1 a 11 y 14	Nivel Inventivo
D2	WO2006005918	1 a 11 y 14	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

29 JUN. 2012

Elaborado por: Ruth Angélica Lizarazo Pedraza 

Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 