

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada **DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN**
clarkemodet@clarkemodet.com.co

ASUNTO Radicación 09-53035
 Trámite 011
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 006

1507.1

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

No. Solicitud Internacional PCT/US2006/017988
Fecha de Presentación Internacional 09 Mayo 2006

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 21 a 273	22/Mayo/2009
Reivindicaciones:	Folios 274 a 358	22/Mayo/2009
	Folios 380 a 389	22/Mayo/2009
	Folios 448 a 414	08/Febrero/2011
Prioridad:	US 60 862 569	23/Octubre/2006

2. Análisis de la Prioridad

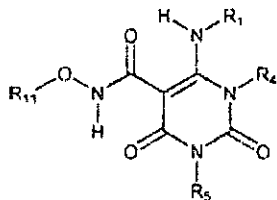
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486), y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Inhibidores de cinasa MAPK/ERK".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos inhibidores de proteínas cinasas activadas con mitógeno (también conocidas cinasas MEK y MAPK/ERK).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula y sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 401/12

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

El uso de la reivindicación 26 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y 2 no son claras ni concisas porque la definición de la invención en término de sustituyentes "heteroarilo", es un género funcional que no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Esto debido a que no se especifican la clase de heteroátomos que los pueden llegar a conformar, motivo por el cual se obtienen un sin número de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

El capítulo reivindicatorio no es conciso, ni está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se hayan obtenido los compuestos con los sustituyentes tal como se encuentran allí definidos. Se encuentra que los compuestos obtenidos corresponden a los que comprenden preferiblemente los siguientes sustituyentes:

Radical	Radical sustentado en la descripción
R1:	Fenilo opcionalmente sustituido
R4 y R5:	Metilo
R11:	Alquilo C1-10, sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo B B: Grupo hidroxí

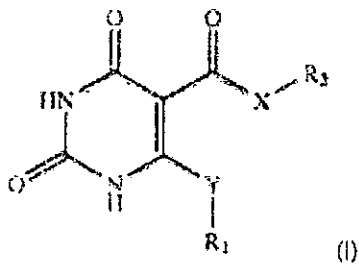
Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. Determinación del Estado de la Técnica

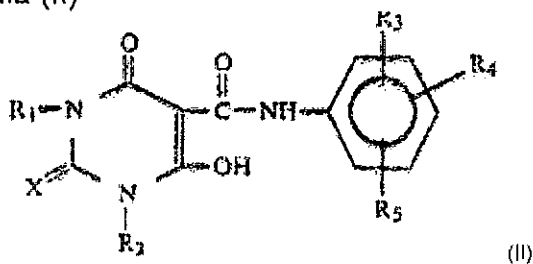
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la Solicitud de Prioridad: Octubre 23 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US 2003100549	Inhibitors of C-JUN terminal kinases (JNK)	29/Mayo/2003
D2	US 4920126	Barbituric and derivative and treatment of leukemia and tumors therewith	24/Abril/1990

D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2003100549A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20030529&DB=EPODOC&locale=en> EP divulga (párrafo 19) un compuesto de fórmula (I)



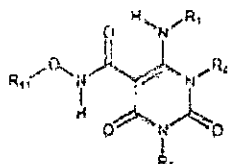
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=4920126A&KC=A&FT=D&ND=&date=19900424&DB=&locale=en> EP divulga (Columna 1 línea 46) un compuesto de la fórmula (II)



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto que tiene fórmula



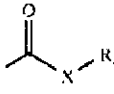
Y las sales farmacéuticamente aceptables. (Fl. 448).

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula 	Compuesto de fórmula (I)
R4: y R5: Átomo de hidrógeno	Átomo de hidrógeno
R1: Arilo C4-12 y heteroarilo C1-10, opcionalmente sustituido.	Y: NR
Átomo de Nitrógeno	R: Arilo C5-7, heterociclo
OR11	X: Átomo de nitrógeno
R11: Alquilo C1-10, C4-12 arilo, heterociclo.	R2: OR
	R: C1-6, C5-7carbociclo o heterociclo aromático o no, anillo heterociclo, C9-10 anillo biciclo aromático, o una carbociclo no aromático.

Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer un compuesto de formula (I), en donde se encuentra sustituido cada nitrógeno del anillo principal con un átomo de hidrógeno, en la posición 2 del anillo principal se encuentra unido al compuesto de

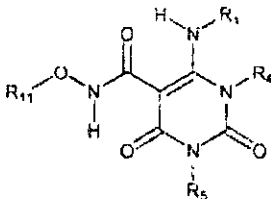
estructura , en donde Y es un átomo de nitrógeno sustituido con R que corresponde a un compuesto aromático C5-7 o un compuesto heterociclo. En

posición 3 del anillo se encuentra enlazado al compuesto de estructura , en donde X corresponde a un átomo de nitrógeno, sustituido con R2, el cual corresponde OR, donde R es seleccionado de un grupo C1-6, C5-7carbociclo o heterociclo aromático o no, anillo heterociclo, C9-10 anillo biciclo aromático, o una carbociclo no aromático.

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

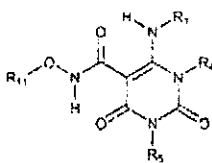
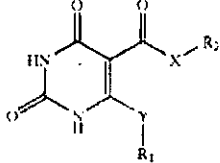
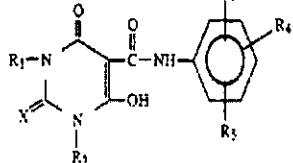
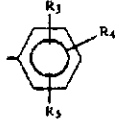
Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto que tiene fórmula



Y las sales farmacéuticamente aceptables. (Fl. 448).

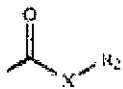
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula 	Compuesto de fórmula 	Compuesto de formula (II) 
R4: y R5: C 1-5 Alquilo	No menciona	R1 y R2: Grupo Alquilo
R1: Arilo C4-12 y heteroarilo C1-10, opcionalmente sustituido.	Y: NR R1: Arilo C5-7, heterociclo	No menciona
Átomo de Nitrógeno	X: Átomo de nitrógeno	Átomo de nitrógeno
OR11 R11: Alquilo C1-10, C4-12 arilo, heterociclo.	R2: OR R: C1-6, C5-7carbociclo o heterociclo aromático o no, anillo heterociclo, C9-10 anillo biciclo aromático. o una carbociclo no aromático.	Grupo 

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque

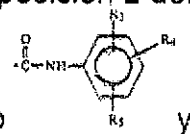
El documento D1 da a conocer un compuesto de fórmula (I), en donde se encuentra sustituido cada nitrógeno del anillo principal con un átomo de hidrógeno, en la

posición 2 del anillo principal se encuentra unido al compuesto de estructura , en donde Y es un átomo de nitrógeno sustituido con R que corresponde a un compuesto aromático C5-7 o un compuesto heterociclo. En posición 3 del anillo se encuentra

enlazado al compuesto de estructura , en donde X corresponde a un átomo de nitrógeno, sustituido con R2, el cual corresponde OR, donde R es seleccionado de un grupo C1-6, C5-7 carbociclo o heterociclo aromático o no, anillo heterociclo, C9-10 anillo biciclo aromático, o una carbociclo no aromático.

El documento D2 da a conocer compuestos de fórmula (II), los cuales son inhibidores del crecimiento tumoral, en donde cada nitrógeno del anillo se encuentra sustituido con un compuesto R1 y R2 que corresponden a un grupo alquilo, en posición 2 del

anillo sustituido con un grupo OH, en posición 3 del anillo con el grupo en la posición 4 del anillo un grupo carbonilo.



La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D1 consiste en los sustituyentes R4 y R5 del anillo cíclico, los cuales corresponden a un grupo alquilo C1-5.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula (II) del documento D2 consiste en la presencia del grupo OR11, en la posición 2 del anillo, la presencia de una grupo carbonilo.

El hecho de incluir un grupo alquilo en R4 y R5 como sustituyentes del átomo de nitrógeno en el anillo cíclico de la estructura de fórmula (I), no evidencia un efecto técnico inesperado asociado a la inhibición de crecimiento tumoral.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto conocido en D1 para obtener compuestos alternativos que presenten actividad inhibitoria de protefna cinasas".

Sin embargo, la utilización de grupo alquilo como sustituyente en átomos de nitrógeno del anillo de la estructura, ya está divulgada en el documento D2.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un grupo alquilo sustituyendo los nitrógenos presentes en el anillo cíclico del documento D2 en el compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art.18).

8. Conclusión

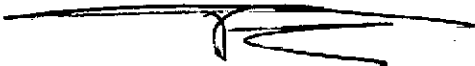
Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US 2003100549	1, 7, 8, 23,27 12,13	Novedad Nivel Inventivo
D2	US 4920126	12, 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.

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 A GO. 2016

Elaborado por: Paola Duarte 
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 
Aprobado por: José Luis Salazar López