

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogado CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	09-54952
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	008

11476

Patente de Invención ☐

Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (Fase Nacional) ☐

Cap. I ☐

Cap. II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/US2007/024772

Fecha de Presentación Internacional 03 Diciembre 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 71 a 128	28/Mayo/2009
Reivindicaciones:	Folios 129 a 132	28/Mayo/2009
	Folios 153 a 155	27/Noviembre/2009
Prioridad:	US 60 873 198	06/Diciembre/2006
	US 60 880 661	16/Enero/2007
	US 60 967 872	06/Septiembre/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.

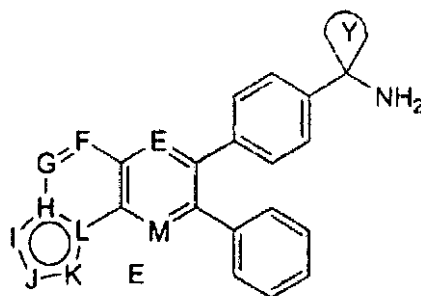
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Inhibidores de la actividad de la Akt".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos novedosos inhibidores de Akt.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de acuerdo con la fórmula (E) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

Expediente 09 054 952 1er Art 45



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 401/14; 401/06; 403/04; 403/06; 407/04; 409/04; 413/04; 417/04; A 61 K 31/4353; A 61 P 35/00.

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

El uso de la reivindicación 9 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

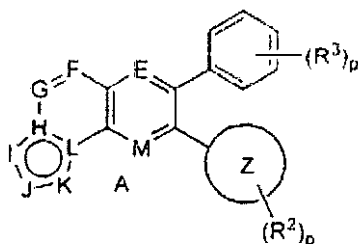
5. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la Solicitud de Prioridad: Diciembre 6 de 2006 y fecha de presentación de la solicitud de Patente Nacional: Mayo 28 de 2009, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	CO07-129906=WO2006/135627*	Inhibidores de Akt	07/Diciembre/2007

*Documento equivalente a WO 2006 135627 y su fecha de prioridad Junio 10 de 2005.

D1 http://docs.sic.gov.co:81/DocumentosRad/NavegacionDocs/VerDocs.php?ano_radi=7&nume_radi=129906&cont_radi=Divulga (Folio 162) un compuesto de la fórmula (A).

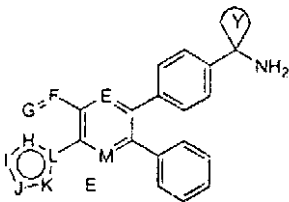
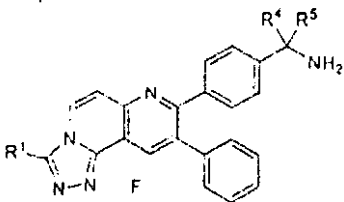
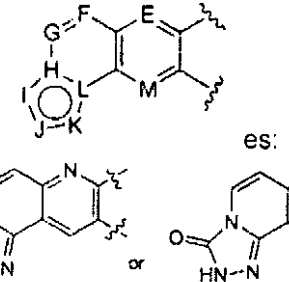
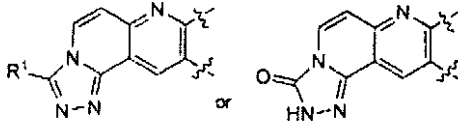
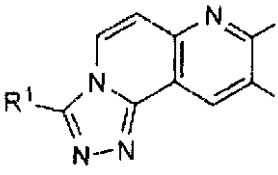


6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de acuerdo con la fórmula E. (Folio 153).

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

Características esenciales	D1
Compuesto de formula E 	Compuesto de Fórmula F 
En la que  es: 	
Y: Ciclobutilo	R4 y R5: Pueden unirse para formar un cicloalquilo C3-C7
R1: H, OH, metilo	R1: H, OH o alquilo C1-6

Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual enseña, compuestos útiles en la inhibición de la actividad de la Akt serina/treonina quinasa, de fórmula general A (Folio 164). Particularmente, el documento D1 divulga en compuesto de formula F (Folio 165), el cual presenta en su estructura un compuesto naftiridina sustituida, en donde, los sustituyentes R4 y R5 pueden unirse para formar un compuesto cicloalquilo de C3-7 y R1 se selecciona de un átomo de hidrógeno, un grupo hidroxilo y un grupo alquilo C1-6.

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

La reivindicación dependiente 8 no menciona alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO07-129906=WO2006/135627*	1 y 8	Novedad

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: Paola Duarte

Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 

Aprobado por: José Luis Salazar López

OLARTERAISBECK

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-129906-00000-0000

Fecha 2007-12-07 16:35:03 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tpo. 11 PATENTEIYII Eje: 379 FASENACIONALI
Tpo. 411 PRESENTACION Fojos. 334

PETITORIO - FORMULARIO

PATENTE PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL 10 ene 2008 P2007/000187

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención.

☐

Patente de Modelo de Utilidad.

☐

Capítulo I.

☒

Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: MERCK & CO., INC.

Dirección: 126 East Lincoln Avenue, Rahway, New Jersey 07065-0907

Nacionalidad o Domicilio: ESTADOS UNIDOS
Lugar de Constitución: ESTADOS UNIDOS

Teléfono: _____ Fax: _____
E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A,
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10

Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799
E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 797827478ta
TP 74.295

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: VER PAGINA ADJUNTA

Dirección: VER PAGINA ADJUNTA

Nacionalidad o Domicilio: VER PAGINA ADJUNTA

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/US2006/022079

Fecha Junio 7, 2006

Publicación Internacional No. WO 2006/135627

Fecha Diciembre 21, 2006

6

Título (54) INHIBIDORES DE LA ACTIVIDAD AKT

7

Clasificación Internacional (51) A61K 31/397

8

Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
US	Junio 10, 2005	60/689.726
US	Noviembre 7, 2005	60/734.188

US

Junio 10, 2005

60/689.726

US

Noviembre 7, 2005

60/734.188

9

Comprobante de pago No. 07-98.627

Fecha Diciembre 4, 2007

La inhibición de activación y actividad de Akt puede lograrse inhibiendo PI3K con inhibidores tales como LY294002 y wortmannina. Sin embargo, la inhibición de PI3K tiene el potencial para afectar indiscriminadamente no solamente a todas las tres isozimas de Akt sino también otras moléculas de señalización que contienen dominio PH que son dependientes de PtdIns(3,4,5)-P3, tales como la familia Tec de tirosina quinasas. Además, se ha descrito que Akt se puede activar mediante señales de crecimiento que son independientes de PI3K.

Alternativamente, la Akt se puede inhibir bloqueando la actividad de la quinasa que actúa antes PDK1. No se han descrito inhibidores de PDK1 específicos. Se nuevo, la inhibición de PDK1 daría como resultado inhibición de múltiples proteínquinas cuyas actividades dependen de PDK1, tales como isoformas de PKC atípicas, SGK, y quinasas S6 (Williams y col. *Curr. Biol.* 10:439-448 (2000).

Es un objetivo de la invención actual proporcionar compuestos novedosos que son inhibidores de Akt.

Es también un objeto de la presente invención proporcionar composiciones farmacéuticas que comprenden los compuestos novedosos que son inhibidores de Akt.

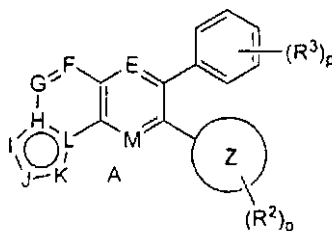
Es también un objeto de la presente invención proporcionar un procedimiento para tratar cáncer que comprende administrar tales inhibidores de actividad Akt.

SUMARIO DE LA INVENCION

La invención actual estipula compuestos de naftiridina sustituidos que inhiben actividad Akt. En particular, los compuestos descritos inhiben selectivamente una o dos de las isoformas de Akt. La invención también estipula composiciones que comprenden tales compuestos inhibidores y procedimientos para inhibir actividad Akt administrando el compuesto a un paciente en necesidad de tratamiento de cáncer.

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

Los compuestos de la invención actual son útiles en la inhibición de la actividad de la Akt serina/treonina quinasa. En una primera realización de esta invención, los inhibidores de actividad de Akt están ilustrados mediante la Fórmula A:



además del nitrógeno, uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados de N, O y S, dicho heterociclo monocíclico o bicíclico opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de R^{6a};

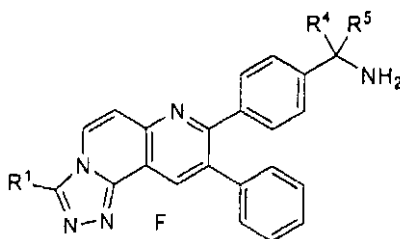
R^a es alquilo(C₁-C₆), cicloalquilo(C₃-C₆), arilo, o heterociclilo; y

R^b es independientemente: H, alquilo(C₁-C₆), arilo, heterociclilo, cicloalquilo(C₃-C₆),

5 alquilo(C=O)_aO_b(C₁-C₆), o S(O)_mR^a;

o una sal farmacéuticamente aceptable o un estereoisómero de los mismos.

En una sexta realización los inhibidores de la presente invención están ilustrados mediante la Fórmula F:



10 en la que:

R⁴ y R⁵ son independientemente: H y alquilo(C₁-C₆), en el que dicho alquilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de: OH y halo; y en el que R⁴ y R⁵ pueden unirse para formar un cicloalquilo(C₃-C₇); y

todos los otros sustituyentes y variables son como se definen en la quinta realización;

15 o una sal farmacéuticamente aceptable o un estereoisómero de los mismos.

En una séptima realización los inhibidores de la presente invención están ilustrados mediante la Fórmula F:

en la que:

R¹ se selecciona de: H, NH₂, OH y alquilo(C₁-C₆);

20 R⁴ y R⁵ son independientemente: H y alquilo(C₁-C₆);

o una sal farmacéuticamente aceptable o un estereoisómero de los mismos.

En una octava realización los inhibidores de la presente invención están ilustrados mediante la Fórmula G:

