

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE
office@olartemoure.com

ASUNTO Radicación 09 081 889
 Trámite 11
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 5

1 5874

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Via Nacional		
Via PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I ☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/IB2008/000297	
Fecha de Presentación Internacional	04/Febrero/2008	

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 121 a 296	05/Agosto/2009
Reivindicaciones:	Folios 297 a 314	05/Agosto/2009
Prioridad:	US 60 888 749	07/Febrero/2007
	US 60 989 086	19/Noviembre/2007
	US 61 020 965	14/Enero/2008

2. Análisis de la Prioridad

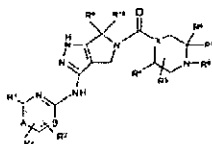
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Nuevos derivados de 3-amino-pirrolo[3,4-c]pirazol-5(1H,4H,6H)carbaldehído".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos que inhiban la proteína quinasa C beta II (PKCβII).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula A:



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D487/04, A61K31/4162, A61P3/00.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 23 - 25 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 22 no es clara cuando emplea el término "una cantidad eficaz", el cual es impreciso, no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere eliminar el término del pliego reivindicatorio.

El capítulo reivindicatorio no está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se han obtenido los compuestos de fórmula A y B. En la descripción se encuentra soporte para los siguientes sustituyentes: para los compuestos de fórmula A Y B, cuando A es N y B es C: R^1 es seleccionado de H, CN, $-OCF_3$, morfolinilo, alquilo C_{1-4} , $-(R^d)_m-OR^a$, donde m es cero y R^a es metilo o etilo, $-(R^d)_mNR^aR^b$, donde m es cero y R^a y R^b son seleccionados de H, alquilo C_{1-4} , opcionalmente sustituido por ciclopropilo o metoxilo; R^2 y R^3 son independientemente seleccionados de H, F o CF_3 ; R^4 es seleccionado de H, CH_3 y $(CH_2)_2OH$; R^5 es seleccionado de H y $-CH_2-(4\text{-tetrahidropirani})$; R^6 y R^7 son independientemente seleccionados de H y CH_3 ; R^8 es seleccionado de H, CH_3 , alquilo C_{1-4} opcionalmente sustituido por OH, metoxilo, CF_3 o tetrahidropirani; R^9 y R^{10} son independientemente seleccionados de H y CH_3 ; y X es N. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 3 grupos inventivos. Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

- 1° Compuestos de fórmula A donde A es N y B es C o A es C y B es N (divulgados en D1).
- 2° Compuestos de fórmula A donde A y B son C.
- 3° Compuestos de fórmula A donde A y B son N.

El problema técnico objetivo a solucionar consiste en la necesidad de suministrar compuestos que inhiban proteína quinasas. La solicitud proporciona diferentes soluciones correspondientes a los anteriores grupos inventivos, los cuales difieren en su estructura química, además, el grupo inventivo 1 ya había sido divulgado en el documento D1, por lo cual no comparten un concepto inventivo común. 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.

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 prioridad 07 de febrero de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

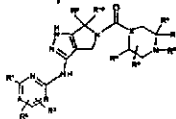
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2006/072831	Pyrrolopyrazoles, potent kinase inhibitors	13/Julio/2006

D1
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006072831A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20060713&DB=&locale=en_EP, divulga (ejemplo 3, pg. 45, ejemplo 82, pg. 82, reivindicaciones) derivados de pirrolo-pirazoles, inhibidores de proteína quinasas y composiciones farmacéuticas que los contienen.

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula A:



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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula A: 	Ejemplo 3 (pg. 45):
A es N	N
B es C	C
R ¹ es (R ^d) _m -haluro, donde m es cero	Cl
R ² y R ³ forman un heterociclo de 3-7 miembros saturado o insaturado	Forman un tiofenilo
R ⁹ y R ¹⁰ son independientemente alquilo C ₁₋₂	Son metilo
X es N	N
R ⁴ es alquilo C ₁₋₈ sustituido por un grupo R ¹² , donde R ¹² es (R ^d) _m -fenilo, donde m es cero	Bencilo
R ⁵ es H	H
R ⁶ y R ⁷ no son los dos H	H
R ⁸ es alquilo C ₁₋₈	Metilo

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de pirrolo-pirazoles, específicamente el compuesto correspondiente al ejemplo 3, un pirrolo –pirazol sustituido con un tieno[3,2-d]pirimidinilo.

Las diferencias entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consisten en que cuando X es N, R⁶ y R⁷ no son los dos H, y el pirrolo-pirazol está sustituido por un grupo pirimidinilo fusionado a un heterociclo de 3-7 miembros saturado o insaturado a través del ligando –NH–.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los

compuestos de fórmula A reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades superiores en comparación con los compuestos del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de compuestos derivados de pirrolo-pirazoles alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

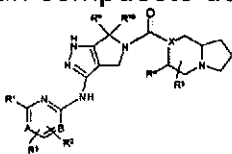
Sin embargo, la D1 divulga que el núcleo pirrol-pirazol puede estar sustituido a través del ligando -NH- por un grupo pirimidinilo fusionado a un heterociclo de 3-7 miembros saturado o insaturado, como tieno[3,2-d]pirimidinilo, o pirimidinilo opcionalmente sustituido (reivindicaciones 1 y 19); además, enseña que las posiciones equivalentes a R⁶ y R⁷ de la invención pueden ser opcionalmente alquilo C₁₋₁₂, entre otros (reivindicación 1, definición de R^f), lo anterior manteniendo la actividad como inhibidores de proteína quinasas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, reemplazaría uno de los H de las posiciones R⁶ o R⁷ por un grupo alquilo C₁₋₈, entre otros, de acuerdo a lo sugerido en D1, en los derivados de pirrolo-pirazoles de D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

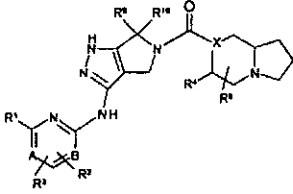
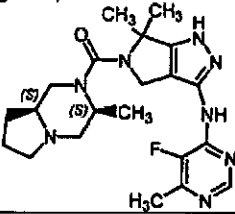
Conclusión: la reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 13, 21 y 22 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 14 consiste en un compuesto de fórmula B:



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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula B: 	Ejemplo 82 (pg. 82): 
A es N	N
B es C	C
R ¹ es alquilo C ₁₋₈ , alquenilo C ₂₋₈ , alquinilo C ₂₋₈ , entre otros	H
R ² y R ³ se seleccionan independientemente de H, alquilo C ₁₋₈ , (R ^d) _m -haluro, donde m es cero	Son independientemente seleccionados de F y metilo.
R ⁹ y R ¹⁰ son independientemente alquilo C ₁₋₂	Son metilo
X es N	N
R ⁴ es H o alquilo C ₁₋₈	Metilo
R ⁵ es H	H

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de pirrolo-pirazoles, específicamente el compuesto correspondiente al ejemplo 82.

Las diferencias entre la invención, definida en la reivindicación 14 y el compuesto de D1 consisten en que el sustituyente R¹ es diferente de H.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de fórmula B reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades superiores en comparación con los compuestos del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de compuestos derivados de pirrolo-pirazoles alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, la D1 divulga que el grupo pirimidinilo puede estar sustituido con 1 – 3 sustituyentes R⁵, donde puede ser H, alquilo C₁₋₈, entre otros (reivindicación 1), lo anterior manteniendo la actividad como inhibidores de proteína quinasas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un grupo alquilo C₁₋₈ en la posición R¹ de la invención, de acuerdo a lo sugerido en D1, en los derivados de pirrolo-pirazoles de D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 14 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión: la reivindicación 14 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 15 - 22 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006/072831	1 - 22	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 _____
27 SET. 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas out
Revisado por: Jacqueline Alfonso Rozo