

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogado
 CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	09 084 454	
	Trámite	11	
	Evento	378	
	Actuación	519	11 2838
	Oficio		
	Folios	5	

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Via Nacional		
Via PCT (Fase Nacional)	☒	☒ Capítulo I ☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/GB2008/000454	
Fecha de Presentación Internacional	11/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 185 a 346	12/Agosto/2009
Reivindicaciones:	Folios 347 a 353	12/Agosto/2009
Prioridad:	US 60 889 336	12/Febrero/2007
	US 60 985 735	06/Noviembre/2007

2. Análisis de la Prioridad

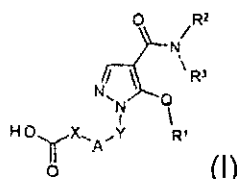
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Derivados pirazólicos como inhibidores de la 11-beta-HSD1".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos con actividad inhibitoria de la enzima 11-β-hidroxiesteroide deshidrogenasa humana tipo 1 (11βHSD1).

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



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/415, A61P3/00, C07D231/14//231/18//403/06//405/12.

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

El uso de la reivindicación 11 - 13 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 14 no son claras por la definición de la invención en términos de radicales "alquilo", "arilo", "heterociclilo" y "heteroarilo", los cuales no permiten distinguir la invención del estado de la técnica porque no se define el número de átomos de carbono que los conforman, y para los "hetero" el número de átomos de carbono o de miembros que los conforman, ni los heteroátomos que los conforman. 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.

Las reivindicaciones 11y 12 no son claras porque indican el uso que puede darse al compuesto reivindicado, lo cual no es una característica técnica que defina la invención o aporte algo adicional al compuesto ya reclamado. Se sugiere eliminar estas reivindicaciones del alcance del pliego reivindicatorio.

El capítulo reivindicatorio no está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se hayan obtenido los compuestos de formula I con los sustituyentes tal como están definidos. En la descripción se encuentra soporte para los siguientes sustituyentes: **X** y **Y** son un enlace directo, opcionalmente son independientemente -CH₂-; **A** es fenilo opcionalmente sustituido por -CH₃, -OCH₃, o -CF₃; **Q** es S o un enlace sencillo; **R¹** es alquilo C₁₋₆ o cicloalquilo C₃₋₇; **R²** es cicloalquilo C₃₋₇ o adamantilo opcionalmente sustituido con grupos -OH, -OCF₂, -S(O)₂CH₃; **R³** es H o -CH₃; o **R²** y **R³** junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo monociclo de 5 miembros saturado opcionalmente sustituido con un grupo fenilo. Se solicita 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. 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 12 de febrero 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2004/089470	Pharmaceutical use of substituted amides	21/Octubre/2004
D2	WO2006/132436	Heterocyclic compound	14/Diciembre/2006

D1
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2004089470A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20041021&DB=&locale=en_EP, divulga

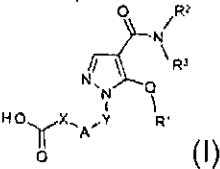
(abstract, pg. 84, ln 5 – pg. 89, ln 31; págs. 107 – 108, 164) pirazoles de fórmula II inhibidores de la enzima 11-β-hidroxiesteroide deshidrogenasa humana tipo 1 11βHSD1 y composiciones farmacéuticas que los contienen.

D2
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2007072908A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070329&DB=&locale=en_EP, divulga (abstract, pg. 99, ejemplo 5; pg. 104, ejemplo 25; pgs. 85 – 87, ejemplos 113 - 116; pg. 147, ejemplo 191) pirazoles inhibidores de la enzima 11βHSD1 y su proceso de obtención.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula I:



Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula I: 	 (pg. 107, ejemplo 1)	
-COOH	No se menciona	-COOH
X es un enlace directo	Enlace directo	Enlace directo
A es fenilo opcionalmente sustituido por halógeno o heteroarilo	Fenilo sustituido con Cl	Fenilo
Y es un enlace directo	Enlace directo	Heterociclilo
Q es un enlace sencillo	Enlace sencillo	Enlace sencillo
R ¹ es alquilo C ₁₋₆ , cicloalquilo C ₃₋₇	Propilo	Ciclopropilo
R ² es cicloalquilo C ₃₋₇	Ciclohexilo	No aplica
R ³ es alquilo C ₁₋₄ , o	Metilo	No aplica
R ² y R ³ junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos forman un anillo monociclo opcionalmente sustituido con fenilo	No aplica	Azolidin sustituido con fenilo

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga pirazoles de fórmula II inhibidores de la enzima 11-β-hidroxiesteroide deshidrogenasa humana tipo 1 (11βHSD1).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que el compuesto de la reivindicación 1 tiene un grupo carboxilo unido a la porción de la molécula –XAY–.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de fórmula I 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 suministrar pirazoles inhibidores de la enzima 11βHSD1 alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, es conocido que con la sustitución en la posición 1 del pirazol con diferentes sustituyentes se mantiene la actividad del compuesto como inhibidor de la enzima 11βHSD1, estando estos sustituyentes opcionalmente sustituidos por el grupo -COOH, tal como está divulgado en el documento D2 que se refiere a pirazoles inhibidores de la enzima 11βHSD1 (pg. 99, ejemplo 5; pg. 104, ejemplo 25; pg. 127-128, ejemplos 113-116; pg. 147, ejemplo 191).

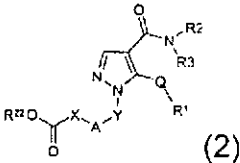
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo -COOH de D2 en el sustituyente de la posición 1 del pirazol del compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

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

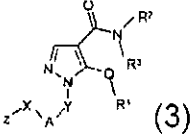
Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 -12 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 14 consiste en un proceso para preparar un compuesto de fórmula I, que comprende uno cualquiera de los procesos a o b:

a) Hidrólisis de un éster de la fórmula 2



b) convertir z en un compuesto de la fórmula 3 en un grupo carboxi



Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:	
Características esenciales	D2
Proceso para preparar un compuesto de fórmula I, que comprende uno cualquiera de los procesos a o b: (I)	Proceso para preparar el compuesto de fórmula que comprende (pg. 87, pár. 1946):
a) Hidrólisis de un éster de la fórmula 2; o 2, donde R ²² es un grupo alquilo	a) Hidrólisis del éster
b) convertir Z en un compuesto de la fórmula 3 en un grupo carboxi	No aplica

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano porque divulga un proceso para preparar un pirazol inhibidor de la enzima 11βHSD1.

El proceso reivindicado difiere del de D2 en que en el compuesto de partida y final el sustituyente Y es un enlace directo.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado al proceso reclamado en esta solicitud ya que no parece presentar ventajas superiores en comparación con el proceso 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 suministrar un proceso para obtener pirazoles inhibidores de la enzima 11 β HSD1 alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, es conocido que la sustitución en la posición 1 del pirazol con diferentes sustituyentes mantiene la actividad del compuesto como inhibidor de la enzima 11 β HSD1. Además, que una manera para obtener pirazoles inhibidores de la enzima 11 β HSD1 donde uno de sus sustituyentes es un grupo carboxílico es la hidrólisis de su respectivo éster, tal como está divulgado en el documento D2 que se refiere a pirazoles inhibidores de la enzima 11 β HSD1 y su proceso de obtención (pgs. 85 – 87 ejemplos 113 - 116, párr. 1937, 1941, 1943 y 1946).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia realizaría la hidrólisis del éster del pirazol inhibidores de la enzima 11 β HSD1 tal como lo enseña D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 14 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

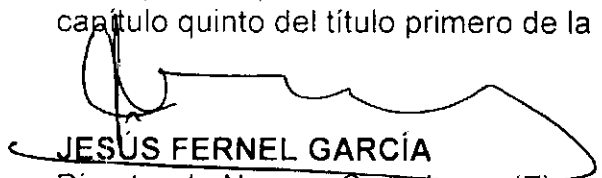
8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2004/089470	1 - 12	Novedad
D2	WO2006/132436	1 - 12 y 14	Nivel Inventivo

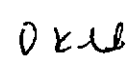
En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

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.


JESÚS FERNEL GARCÍA

Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
25 JUL. 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas 
Revisado por: Jacqueline Alfonso Roza