

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-66898- -4	FECHA: 2015-06-19 10:17:22
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8
ACT: 430 REQUERSOLICITA	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS R. OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 14-66898- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 430
 Oficio: 6840
 Folios: 8

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2012/068803				
Fecha de Presentación Internacional	24/09/2012				

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:	Radicado 14-066898-00000-0000	28/Marzo/2014
Reivindicaciones:	Radicado 14-066898-00000-0000	28/Marzo/2014
Prioridad:	DE 102011083725.6	29/Septiembre/2011

2. Análisis de la Prioridad

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

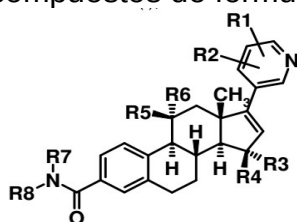
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. Con relación a la presente solicitud se estudiarán las reivindicaciones 1 a 9 de acuerdo con el radicado 14-066898-00000-0000.

Título de la solicitud: “Derivados de estra-1,3,5(10),16-tetraen-3carboxamida, procedimientos para su preparación, preparados farmacéuticos que los contienen, así como el uso para la preparación de medicamentos”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos solubles inhibidores de AKR1C3 útiles en el tratamiento de trastornos hemorrágicos y endometriosis ocasionados por leiomiomas uterinos, sangrado uterino, dismenorrea, carcinoma de próstata, hiperplasia de próstata, acné, seborrea, alopecia, madurez sexual precoz, síndrome ovárico poliquístico, cáncer de mama, cáncer de pulmón, carcinoma de endometrio, carcinoma de células renales, carcinoma de vejiga, linfoma no Hodgkin, EPOC, obesidad o dolor inflamatorio.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I):



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07J 43/00; A61K 31/58; A61P 5/24.

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

El objeto de las reivindicaciones 6 y 8 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

Aunque las cláusulas 6 y 8 están encabezadas como compuesto están reclamando un método de tratamiento.

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

El uso de la reivindicación 7 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Titulo

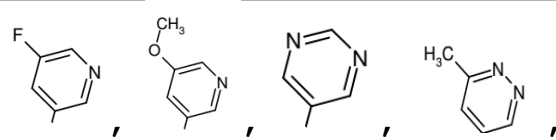
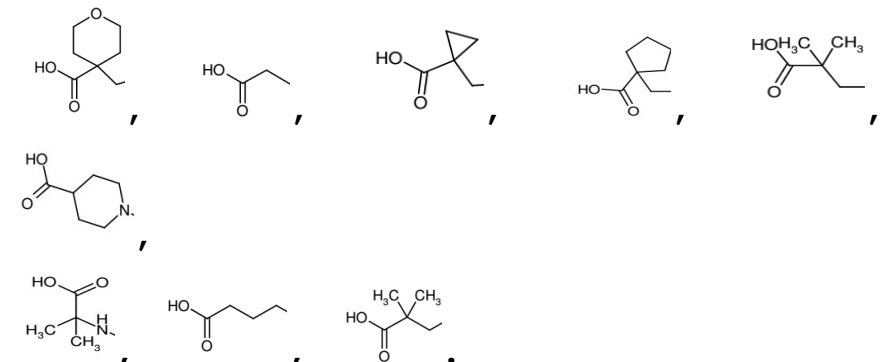
El título incluye el término “Uso” el cual indican el uso que puede darse al producto reivindicado, el cual no es una característica técnica que defina a la invención. Además, los usos no son patentables de acuerdo a lo definido en el artículo 14 de la D. 486. Se sugiere eliminar dicho término.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 9 define un medicamento que comprende una combinación entre alguno de los compuestos reclamados con un segundo agente activo, se recuerda que las composiciones se deben definir en términos de sus ingredientes y proporciones, además dentro del capítulo descriptivo no se sustentan composiciones que comprendan la mencionada combinación, por lo que se sugiere eliminar del capítulo reivindicatorio la presente cláusula.

Las reivindicaciones 1-4 no son concisas porque las definiciones de R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 son generales, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización de los sustituyentes probados, es decir, que se encuentren sustentados de acuerdo con lo presentado en la tabla No 1.

Tabla No 1. Sustituyentes probados

Sustituyentes	Ejemplos probados
R1 y R2	
R3,R4	H, OH
R5, R6	H
R7 y R8	

Descripción (Art 28 D 486)

La descripción no divulga la mejor manera conocida por la solicitante para ejecutar o llevar a cabo la invención comoquiera que no sustenta el desarrollo del medicamento, tan sólo se limita a presentar listas de posibles elementos sin probar así su efecto. En conclusión, la descripción no divulga la invención de manera suficientemente completa para que la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda ejecutarla (ó reproducirla).

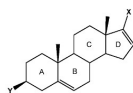
Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

7. Determinación del Estado de la Técnica

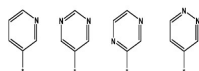
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, septiembre 29 de 2011. Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2010091306	"Novel Prodrugs of steroidal CYP17 inhibitors/antiandrogens"	12/Agosto/2010
D2	WO2009120565	"Novel prodrugs of c-17-heteroaryl steroidal cyp17 inhibitors/antiandrogens: synthesis, in vitro biological activities, pharmacokinetics and antitumor activity"	01/Octubre/2009

El documento D1⁽¹⁾ divulga composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos esteroidales C-17-heterociclos de fórmula I

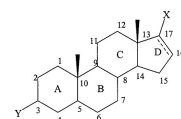


donde X es



. Dichos compuestos son útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno (Resumen; Págs. 33-34, Rvs. 1-3 y Pág. 36, Rvs. 10-12).

El documento D2⁽²⁾ divulga composiciones farmacéuticas que comprenden



compuestos esteroidales C-17 heteroaril sustituidos de fórmula I, útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno (Resumen; Pág. 43, Rv. 1; Pág. 48, Rv. 11 y Pág. 49, Rvs. 14-15).

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

El presente estudio se realizara sobre el grupo inventivo 1.

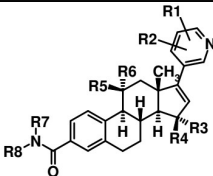
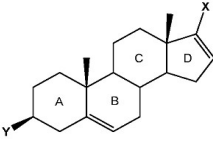
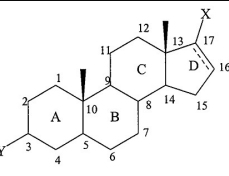
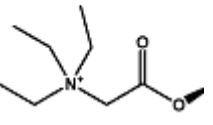
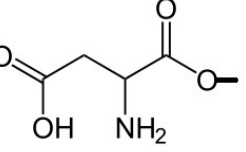
La reivindicación 1 consiste en un "Compuesto de la fórmula (I), en donde R1 y R2 son de modo independiente entre sí, hidrógeno (...)".

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

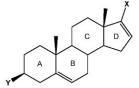
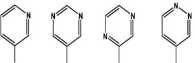
Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I)	Compuesto de fórmula I	Compuesto de fórmula I

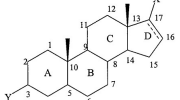
1. [www.google/patents/ WO2010091306](http://www.google/patents/WO2010091306)

2. [www.google/patents/ WO2009120565](http://www.google/patents/WO2009120565)

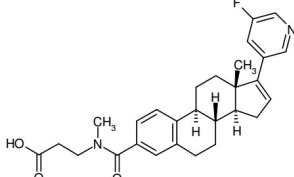
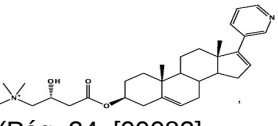
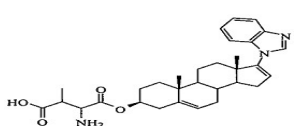
 R1=H R2=H R3=H R4=H R5=H R6=H	 X= (Págs. 32-33, Rvs. 1-3)	 X= (Págs. 43-44, Rvs. 1-3)
R7=H R8=-CR^aR^b-COOH R^a y R^b= juntos -CH₂_{n=2-5}	Y=-O(C=O)-L-Z L=Alquil C₁-C₁₂ Z=(N⁺R₃) R=Alquil C₁-C₇  (Pág. 27, Ej. 1 y Págs. 32-33, Rvs. 1-3)	Y=Grupo aminoácido  (Pág. 43 Rvs. 1 y Pág. 45, Rv. 6)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque en el caso del documento D1 divulga composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos esteroidales C-17-heterociclos de fórmula I

 donde X es  . Dichos compuestos son útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno (Resumen; Págs. 33-34, Rvs. 1-3 y Pág. 36, Rvs. 10-12). Por su parte, el documento D2 divulga composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos esteroidales C-17 heteroaril

sustituidos de fórmula  , útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno (Resumen; Pág. 43, Rv. 1; Pág. 48, Rv. 10 y Pág. 49, Rvs. 14-15).

Los compuestos reclamados en la presente solicitud guardan similitudes estructurales con los compuestos revelados en los documentos D1 y D2 de acuerdo con lo presentado en el siguiente cuadro.

Rv. 5	D1	D2
	 (Pág. 24, [00082])	 (Pág. 48, Rv. 10)

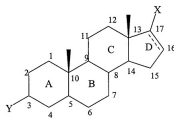
La diferencia entre el compuesto, definido en la reivindicación 1 y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye en

la posición 3 del núcleo tetracíclico un grupo -C(=O)-NH-(CH₂)_{n=2-5}-COOH, mientras que el compuesto divulgado en el documento D1 incluye en la misma posición del núcleo tetracíclico un grupo -O-C(=O)-(CH₂)_(n=1-12)-N⁺(Alquilo C₁-C₇)₃.

El efecto que logra el incluir en la posición 3 del núcleo tetracíclico un grupo -C(=O)-NH-(CH₂)_{n=2-5}-COOH consiste en que la actividad de inhibición AKR1C3 está comprendida entre 0,5mmol/L-46,3mmol/L.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos esteroidales moduladores de la actividad AKR1C3 útiles en el tratamiento del cáncer de próstata o seno”.

Sin embargo, la inclusión de un grupo -CH₂-COOH enlazado al grupo N(C=O) en las estructuras de compuestos esteroidales útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno, está divulgada en el documento D2 que enseña compuestos



esteroidales C-17 heteroaril sustituidos de fórmula en donde la posición 3 incluye un grupo -CH₂-COOH enlazado al grupo N(C=O); dichos compuestos son útiles en el tratamiento del cáncer de próstata y seno (Resumen; Pág. 43, Rv. 1 y Pág. 49, Rvs. 14-15).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo -CH₂-COOH enlazado al grupo N(C=O) en la estructura de los compuestos divulgados en el documento D1 de acuerdo con lo revelado en el documento D2, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-5 y 9 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2010091306	1-5 y 9	Nivel inventivo
D2	WO2009120565	1-5 y 9	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 del día siguiente 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.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2015-06-23

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra

INFORME DE BÚSQUEDA DE PATENTES PARA EL No de Radicación: 14-066898						
CRITERIOS PARA LA BÚSQUEDA (anexar pantallazo o reporte en PDF, junto con los boleanos utilizados)						
Palabras clave utilizadas		-Steroidal - hydroxysteroid -Androgen -Cancer -17beta - heteroaryl steroidal estra-1,3,5(10),16-tetraene-3-carboxamide				
CLASIFICACIONES INTERNACIONALES UTILIZADAS PARA LA BÚSQUEDA		C07J 43/00; A61K 31/58; A61P 5/24.				
BASES DE DATOS CONSULTADAS.						
Google/patents						
INFORMES DE EXÁMENES REALIZADOS EN OTRAS OFICINAS (documentos patentes, literatura no patente etc...)						
Oficina	Fecha del examen o de reporte de búsqueda de documentos	Anterioridades encontradas para el examen o reportados en el examen de búsqueda(relacionarlos todos)	Reiv. afectadas	RELEVANCIA (requisito que afecta)	FUERON TENIDOS EN CUENTA PARA EL EXAMEN EN LA OFICINA COLOMBIANA	
					SI	NO
EUROPEA	07/11/12	US6541463	1-9	Nivel Inventivo		X
		"Inhibitory effect of fluorine-substituted estrogens on the activity of 17-beta-hydroxysteroid dehydrogenases"	1-9	Nivel Inventivo		X
		WO20080635100	1-9	Nivel Inventivo		X
		US5604213	1-9	Nivel Inventivo		X
DOCUMENTOS ADICIONALES ENCONTRADOS POR EL EXAMINADOR DE ACUERDO A LOS CRITERIOS DE BÚSQUEDA.						
WO2010091306						
WO2009120565						
BÚSQUEDA DE SECUENCIAS						
Número de depósito / patente y N° de secuencia % de identidad						
SEQ ID NO (de la solicitud)	NCBI	The Lens	EMBL-EBI	DDJB	Genome Quest	
	No aplica					

CRITERIOS DE BÚSQUEDA / UNIDAD DE INVENCIÓN (Pantallazos)