

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-158010- -6	FECHA: 2015-09-14 14:02:21
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 10
ACT: 430 REQUERSOLICITA	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ANDREA TOBOS MATEUS

Asunto: Radicación: 14-158010- -6
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 430
Oficio: 11066
Folios: 10

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/IN2012/000841				
Fecha de Presentación Internacional	21/12/2012				

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 No 14-158010-00000-0000	22/Julio/2014
Reivindicaciones:	1 – 30 del radicado No. 14-158010-00000-0000	22/Julio/2014
	1 – 26 del radicado No. 14-158010-00001-0000	22/Julio/2014
Prioridad:	IN 4527/CHE/2011	22/Diciembre/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

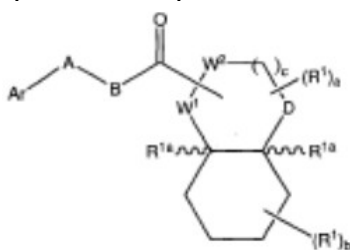
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud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

Dado que en la presente solicitud se evidencia pago por reivindicaciones adicionales, se procede a estudiar todo el capítulo reivindicatorio.

Título de la solicitud: "DERIVADOS DE AMIDA CÍCLICA COMO INHIBIDORES DE 11-BETA-HIDROXIESTEROIDE DESHIDROGENASA Y LOS USOS DE LOS MISMOS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar derivados de amida bicíclica heterocíclica que tienen la capacidad para inhibir la 11-β-hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1 (11β-HSD-1) y los cuales son por lo tanto útiles en el tratamiento de ciertos trastornos que pueden ser tratados o prevenidos mediante la inhibición de esta enzima.

Para resolver este problema la solicitud proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones farmacéuticas que los comprenden.



Fórmula (I)

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/12 // 401/06 // 471/04 // 413/06 // 417/12 // 403/06 // 405/06; A61K 31/437 // 31/4725; A61P 3/10.

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

El objeto de las reivindicaciones 11 a 18, que se refieren a un método de tratamiento, no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de las reivindicaciones 19 a 26 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Título

El título de la invención es ambiguo y no refleja la materia que se pretende proteger en la presente solicitud. Además se debe retirar la alusión al uso de los compuestos. Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara y mucho menos concisa cuando menciona lo siguiente:

- Cuando se emplean los siguientes términos en R⁷:
“opcionalmente sustituido C₁- C₁₂alquilo, opcionalmente sustituido C₁-C₁₂haloalquilo, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂alquenilo, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂alquinilo, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂heteroalquilo, opcionalmente sustituido C₃- C₁₂cicloalquilo, opcionalmente sustituido C₃-C₁₂cicloalquenilo, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂heterocicloalquilo, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂heterocicloalquenilo, opcionalmente sustituido C₆-C₁₈arilo, opcionalmente sustituido C₁-C₁₈heteroarilo, opcionalmente sustituido C₁-C₁₂alquiloxi, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂alquenilooxi, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂alquinilooxi, opcionalmente sustituido C₂-C₁₀heteroalquiloxi, opcionalmente sustituido C₃-C₁₂cicloalquiloxi, opcionalmente sustituido C₃-C₁₂cicloalquenilooxi, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂heterocicloalquiloxi, opcionalmente sustituido C₂-C₁₂ heterocicloalquenilooxi, opcionalmente sustituido C₆-C₁₈arilooxi, opcionalmente sustituido C₁-C₁ heteroarilooxi, opcionalmente sustituido C₁-C₁₂alquiloamino, SR₉, SO₃H, SO₂NR₉R₁₀, SO₂R₉, SONR₉R₁₀, SOR₉, COR₉, COOH, COOR₉, CONR₉R₁₀, NR₉COR₁₀, NR₉COOR₁₀, NR₉SO₂R₁₀, NR₉CONR₉R₁₀, NR₉R₁₀, y acil”, porque con tales definiciones se pueden presentar múltiples opciones de posibles compuestos ya que la expresión “opcionalmente sustituido” puede abarcar un universo de sustituciones que no tienen sustento a la luz del capítulo descriptivo. Además en tales definiciones tampoco se especifica el tipo de heteroátomos que conforman tales sustituyentes, la cantidad de ellos ni el tipo de heteroátomos.

Por tal motivo se obtienen un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

La anterior objeción aplica para las reivindicaciones dependientes que emplean dicha expresión “opcionalmente sustituido”, que se considera, como se mencionó, ambigua e imprecisa.

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, el 22 de diciembre de 2011.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente (s) documento (s) que anticipa (n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de presentación
D1	WO2010139827	"Inhibitor compounds of 11-beta-hydroxysteroid dehydrogenase type 1"	09/Diciembre/2010

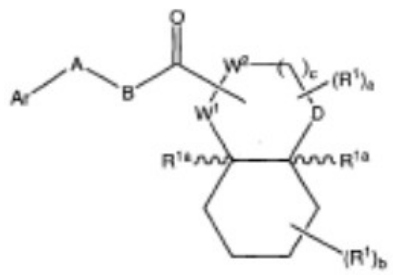
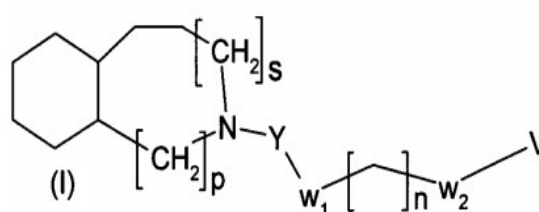
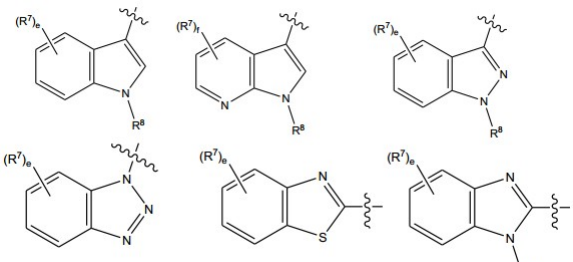
El documento D1 ¹ (resumen) divulga compuestos derivados de perhidroquinolina y perhidroisoquinolina, como inhibidores de 11-β-hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1 (11β-HSD1).

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consisten en "Un compuesto de la fórmula (I)" en donde los sustituyentes son como se encuentran allí definidos y composiciones farmacéuticas que los comprenden (ver pág. 389 (3) del radicado No. 14-158010-00001-0000).

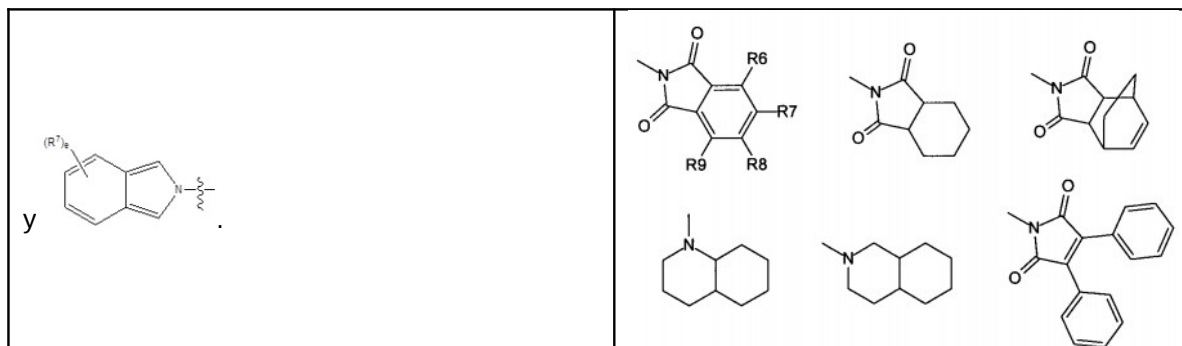
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
 Fórmula (I)	 (I) (reivindicación 1)
W ¹ y W ² están seleccionados de tal forma que uno es N y el otro es (CR ¹) ₂ ; a y b son 0; R ¹ y R ^{1a} son H	p es 0 y s es 1
C=O	Y es C=O
A es -CRArB-; B es un grupo de la fórmula-(CRcRd) _n ; Ar es	n es 0; No menciona los mismos sustituyentes, pero V es:
	

¹URL:<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

CC=WO&NR=2010139827&KC=&locale=en_EP&FT=E
Expediente 14-158010--6

1er Art 45



El documento D1 es considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga compuestos derivados de perhidroquinolina y perhidroisoquinolina, como inhibidores de 11- β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1 (11 β -HSD1) y por tanto adecuados contra patologías tales como trastornos metabólicos, obesidad e inflamación, entre otras.

La diferencia entre los compuestos de la invención y los revelados en D1 consiste en el enlazador del anillo principal y en el sustituyente Ar que se selecciona de 7 diferentes anillos heteroarilos, opcionalmente sustituidos, diferentes a los que se observan en la posición del sustituyente V de D1.

Sin embargo, esta diferencia no concede un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de la presente invención, ya que no existe soporte comparativo que permita reconocer una mejoría técnica o superior de los compuestos de la presente invención con los que ya se revelan en el estado del arte, que además también actúan como inhibidores de 11- β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1. Al revisar los ensayos que demuestran actividad de la presente invención, no se encuentra un efecto técnico atribuible a los compuestos de la presente invención, porque la solicitante no comparó tales compuestos con los estructuralmente cercanos de D1, en donde dicho documento del estado del arte ya reportaba datos de porcentaje de inhibición (10 μ M) del orden del 100%, es decir que mostraban ya datos de actividad muy alta de inhibición sobre dicha enzima y por tanto no es posible reconocer que los de la presente invención puedan ser superiores a los ya conocidos en D1. En este punto vale la pena anotar, que las modificaciones en los sustituyentes de compuestos conocidos son posibilidades plenamente conocidas para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con sus conocimientos en química orgánica heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en cualquiera de sus sustituyentes o en los heteroátomos de anillos conocidos, como ocurre con los isómeros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales ², es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los sustituyentes, se pueden lograr cambios en las propiedades del compuesto íntimamente relacionadas con su actividad o con el efecto técnico a esperar como es, por ejemplo, incrementar la potencia o el índice (relación) terapéutica como el LD₅₀, ED₅₀ o el EC₉₀ a partir de algunas modificaciones en la posición de los heteroátomos del anillo principal o en la posición de sus sustituyentes. Lo anterior es importante, porque en la presente invención simplemente se propone una modificación en los sustituyentes de anillos conocidos, pero que como se vio anteriormente, dicha modificación no demostró un efecto técnico inesperado o una ventaja técnica real y

2 Silverman, R. B., "The organic Chemistry of Drugs Design and Drug Action". Elsevier. Northwestern University. Second Edition. Evanston Illinois. 2004. pág. 29, table 2.2.

Expediente 14-158010-6

1er. Art 45

por tanto se consideran variaciones estructurales de rutina que no sustentan el requisito evaluado.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo proporcionar derivados de amida bicíclica heterocíclica que tienen la capacidad para inhibir la 11- β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1, alternativos a los ya revelados en el arte previo?

El documento D1 ya realiza sugerencias adecuadas para llegar a la presente invención, particularmente revela compuestos que son estructuralmente equivalentes a los aquí reclamados, porque señala que el sustituyente V puede ser seleccionados de diferentes tipos de anillos, saturados e insaturados, heterocíclicos o heteroarilos, y tales compuestos también son inhibidores de 11- β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1.

En consecuencia, cualquier persona normalmente versada en la materia al observar los compuestos de la anterioridad D1, y con sus conocimientos básicos y simples en química heterocíclica, habría podido modificar las sustituciones del anillo principal, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la presente solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 10 no mencionan alguna característica inventiva adicional, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

1. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2010139827	1 – 10	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 2015-09-22

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez
Revisó: Rubiela Pacanchique Vargas