

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

Señor(a)
PFIZER INC.
patents@olartemoure.com

Asunto: PATENTE DE INVENCION - PCT

Patente de Invención	PT	Patente de Modelo de Utilidad			
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	PCT	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/IB2014/062217				
Fecha de Presentación Internacional	13 de junio de 2014				

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	15288420	3 de diciembre de 2015
Reivindicaciones:	15288420	3 de diciembre de 2015
	15288420(3)	14 de marzo de 2016
Prioridad(es):	País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Número: 61/840,144 Fecha: 27 de junio de 2013	

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido y el contenido técnico de esta solicitud corresponde con el de la prioridad reivindicada.

Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

3. Modificaciones presentadas (Art. 34 D 486 y Art. 19, 22 y 34 PCT)

Se aceptan las modificaciones presentadas comoquiera que se ajustan a las prescripciones contenidas en el reglamento del PCT y en el Art 34 de la Decisión 486

4. 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. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 30 del capítulo reivindicatorio (Bajo el No. 15288420(3), del 14 de marzo de 2016).

Título de la solicitud: “COMPUESTOS HETEROAROMÁTICOS Y SU USO COMO LIGANDOS D1 DE DOPAMINA.”

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos heteroaromáticos, que son ligandos D1 de dopamina, por ejemplo agonistas D1 de dopamina o agonistas parciales.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula I o IA-1 y composiciones farmacéuticas que los comprenden

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/513, A61P 25/00, C07D 401/14.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art. 30 D 486, Art. 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa, cuando:

- Se emplean términos tales como: “heterocicloalquilo de 4 a 10 (o 7) miembros, heteroarilo de 5 o 6 (o 10) miembros”, sin mencionar el tipo y la cantidad de heteroátomos que hacen parte de la definición o del sustituyente.
- Se presentan 5 anillos distintos para la definición de Q (incluyendo la que se encuentra en la fórmula I-A1) que modifican la estructura principal y por tanto no es posible saber cuál es la materia que realmente se pretende proteger.
- cada uno de R₁, R₂, R₃, y R₄ se selecciona independientemente del grupo que consiste de H, halógeno, -OH, -NO₂, -CN, -SF₅, alquilo de C₁₋₆, haloalquilo de C₁₋₆, haloalcoxi de C₁₋₆, alquenoilo de C₂₋₆, alquinoilo de C₂₋₆, cicloalquilo de C₃₋₇, heterocicloalquilo de 4 a 10 miembros, -N(R₅)(R₆), -N(R₇)(C(=O)R₈), -C(=O)-N(R₅)(R₆), -C(=O)-R₈, -C(=O)-OR₈, -N(R₇)(S(=O)₂R₈), -S(=O)₂-N(R₅)(R₆), -SR₈, y -OR₈, en donde cada uno del alquilo de C₁₋₆, cicloalquilo de C₃₋₇, y heterocicloalquilo se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste de halógeno, -CN, oxo, -OH, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, haloalcoxi de

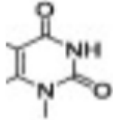
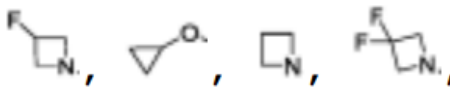
Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

C₁₋₄, cicloalquilo de C₃₋₆, -N(R₅)(R₆), -N(R₇)(C(=O)R₈), -C(=O)-OR₈, -C(=O)H, -C(=O)R₈, -C(=O)N(R₅)(R₆), -N(R₇)(S(=O)₂R₈), -S(=O)₂-N(R₅)(R₆), -SR₈, y -OR₈, pues se pueden presentar múltiples opciones de posibles sustituciones que no encuentran sustento en la descripción.

- R₂ y R₄ junto con los dos átomos al cual se unen forman un heteroarilo fusionado de 5 ó 6 miembros, un anillo heterocicloalquilo fusionado de 5 ó 6 miembros, un anillo cicloalquilo fusionado de 5 ó 6 miembros, o un anillo benceno fusionado, en donde cada uno de los anillos fusionados se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 sustituyentes cada uno seleccionado independientemente del grupo que consiste de halo, -CN, -OH, alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, y haloalcoxi de C₁₋₄, y en donde el anillo heterocicloalquilo fusionado o anillo cicloalquilo fusionado además se sustituye opcionalmente con 1, 2, o 3 oxo, pues se pueden presentar múltiples opciones de posibles sustituciones que no encuentran sustento en la descripción.
- También para las definiciones de R⁷ a R¹⁵, que se consideran carentes de concisión.

Se requiere realizar las limitaciones necesarias, por ejemplo, como se observa en el capítulo descriptivo, donde:

Sustituyente	Descripción
Q1	
L1	O, S
R1	H
R2	H
R3	H, CH ₃ , CN
R4	H
T1	H, OH, CH ₂ CH ₃ , Cl, Br, CN, CH ₃ , CHF ₂ , O CHF ₂ , F,  , CH(CH ₃) ₂
T2	H, CH ₃ , OCH ₃
T3	H, Cl, F, CH ₃
T4	H

La anterior objeción por falta de concisión aplica plenamente para las reivindicaciones 3 a 5, 8, 11 y 14, en las cuales se requiere realizar las aclaraciones necesarias.

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 patente, de la cual se invoca prioridad: 27 de junio de 2013, y se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2013030665	"Pyrimidines as sodium channel blockers"	07/Marzo/2013

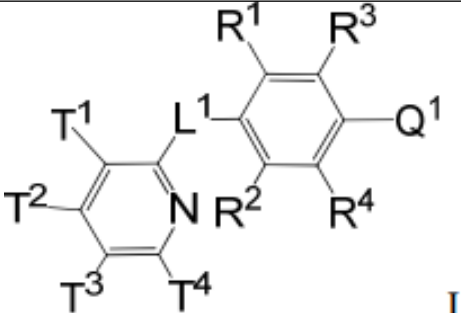
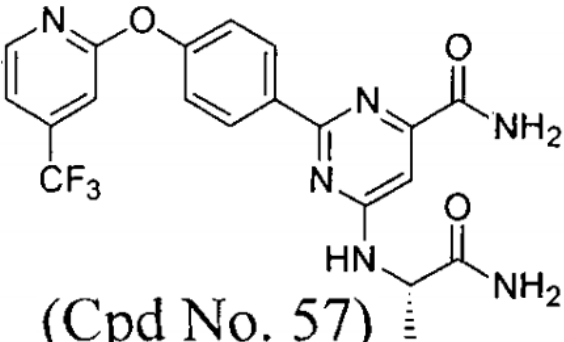
El documento D1 ¹ divulga derivados de pirimidina sustituidos de fórmula (I), que presentan actividad contra patologías neurodegenerativas, tales como Parkinson.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en “*Un compuesto de la Fórmula I o IA-1.*” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (Bajo el No. 1515288420(3), del 14 de marzo de 2016).

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

Características esenciales	D1
 I	 (Cpd No. 57) (reivindicación 1) (ver además compuestos 13, 37, 58, 59, 61 y 63 y reivindicaciones)
T2 es haloalquilo de C-1-6	CF3
T1, T3 y T4 son H	H
R1 – R4 son H	H
Q1 es:	

Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de pirimidina sustituidos de fórmula (I), que presentan actividad contra patologías neurodegenerativas, tales como Parkinson.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en la posición del enlace entre el anillo fenilo y el heteroanillo Q^{1b} a Q^{1e} y en la presencia de X¹.

El efecto que logra esta característica es que se obtienen compuestos de fórmula I o IA-1 adecuados contra discapacidades cognitivas tales como por ejemplo Parkinson.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo proporcionar compuestos heteroaromáticos derivados de piridin/arilo/heteroarilo, alternativos a los ya revelados en el arte previo?

Por su parte el documento D1 ya realizaba sugerencias adecuadas para llegar a los compuestos de la presente invención, como se observa en los compuestos 13, 37, 57, 58, 59, 61 y 63 y el pliego reivindicatorio, en donde se sugiere un anillo tipo pirimidina, similar a como se propone en la presente invención.

Lo anterior es importante porque las modificaciones de los sustituyentes de compuestos conocidos por su actividad o mecanismo de acción, 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 los sustituyentes, 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, en anillos o en la posición de éstos 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. En la presente invención se propone una modificación estructural que simplemente consiste en modificar algunos sustituyentes que contienen nitrógeno, pero que, como se mencionó anteriormente, al no existir una comparación entre el estado del arte y la presente invención se consideran variaciones estructurales de rutina y no se cumple el requisito de nivel inventivo.

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 o en las sustituciones reveladas en D1, habría podido “proponer” cualquier modificación en dichos sustituyentes, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 30 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

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.

Oficio N° 8477

Ref. Expediente N° 15288420

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2013030665	1 a 30	Nivel Inventivo

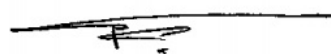
En cumplimiento del artículo 45, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si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

Si como respuesta a este requerimiento el solicitante llegara a modificar: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presente un nuevo capítulo reivindicatorio, y desee que se realice un nuevo examen de patentabilidad a esta modificación, no deberá pagar la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente a la tasa de examen de patentabilidad. En todo caso, el número de requerimientos por no patentabilidad estará supeditado a que el término del estudio de patentabilidad no sea superior a 18 meses, contados desde la publicación de la solicitud de patente de invención. Adicionalmente, 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 deberá pagar la tasa por reivindicación adicional.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante para los sesenta (60) días.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el Título I, Actuaciones ante la Superintendencia de Industria y Comercio; Capítulo sexto, publicación, comunicación, notificación y ejecutoria de las decisiones de la Superintendencia de Industria y Comercio, informándoles que contra el mismo no procede el recurso de la vía gubernativa.

Atentamente,



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES (C)

Elaborado: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ

Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ