

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

Señor(a)
ORION CORPORATION
notificaciones@clarkemodet.com.co

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/FI2016/050220		
Fecha de Presentación Internacional	8 de abril de 2016		

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	NC2017/0010052	3 de octubre de 2017
Reivindicaciones:	NC2017/0010052	3 de octubre de 2017
	NC2017/0010052	20 de noviembre de 2017
Oposición(es):	NC2018/0003676	5 de abril de 2018
Prioridad(es):	País: FI, FINLANDIA Número: 20150111 Fecha: 9 de abril de 2015.	

2. Análisis de la Prioridad

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

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.

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 31 del capítulo reivindicatorio (Radicado No. NC2017/0010052, del 20 de noviembre de 2017).

Título de la solicitud: “PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR ANDRÓGENO E INTERMEDIARIOS DE LOS MISMOS”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de un proceso para la preparación de un compuesto antagonista del receptor de andrógeno e intermediarios de los mismos.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un proceso para la preparación de 2-cloro-4-(1Hpirazol-3-il)benzonitrilo de la fórmula (V) y un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula IA.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 403/12, C07D 207/32, C07D 207/34.

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

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

El uso de las reivindicaciones 27 y 30 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque es demasiado general y no menciona el compuesto del producto de síntesis que se quiere proteger, ni los intermediarios relacionados. Se requiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

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

El pliego reivindicatorio no es claro, porque presenta seis diferentes métodos de preparación de compuestos diferentes, que varían el objeto de protección de la invención y no permiten cuál es la materia de interés. De acuerdo con lo anterior, el solicitante debe replantear el capítulo reivindicatorio, de manera que en la reivindicación independiente se incluyan las características esenciales de la invención que el solicitante desea proteger, y en las reivindicaciones dependientes se describan características particulares de algún elemento de la reivindicación independiente.

La reivindicación 1 no es concisa cuando emplea los siguientes términos: “a una temperatura elevada”, “una base”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de diferentes reactivos que no tienen sustento en la descripción. Además, la reivindicación 1 tampoco es concisa ya que al ser una reivindicación de proceso, debería incluir, condiciones, cantidades de cada uno de los reactivos, etapas discriminadas una a una y las operaciones unitarias que se llevan a cabo en cada etapa junto a sus condiciones. Se requiere realizar las correcciones necesarias.

Lo anterior aplica para las reivindicaciones 2, 25, 28, 29, 30 y 31.

Las reivindicaciones 27 y 30, no son claras porque se encuentran encabezadas como el uso de los compuestos intermediarios, lo cual no es un producto tangible o susceptible de reproducción industrial. Se requiere eliminar cualquier referencia al uso, en el pliego reivindicatorio.

La reivindicación independiente 25, reclama en esencia la misma materia de la reivindicación principal 1, razón por la cual se requiere eliminar dicha reivindicación.

Página 3 de 9

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

Las reivindicaciones 28 y 31 no son claras ni concisas porque no mencionan todas y cada una de las etapas, condiciones de operación y reactivos intervinientes que hacen parte de los procesos de preparación. Además tampoco menciona las cantidades de cada uno de los reactivos intervinientes. Finalmente, dichas reivindicaciones al parecer pretenden abarcar un objeto diferente de la invención reclamado en la reivindicación principal 1 y por tanto se requiere replantear el capítulo reivindicatorio, de acuerdo al objeto de la invención.

7. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Laboratorio Franco Colombiano Lafrancol S.A.S.

El Opositor señala que la presente solicitud no cumple los requisitos de patentabilidad, tales como Novedad, Nivel Inventivo y Aplicación Industrial. El Opositor manifiesta que existen algunos documentos que anteceden la presente invención y que deben tomarse en cuenta como el estado del arte previo relevante:

- **Gniado K et al (2016):** Según el Opositor, dicho documento plantea la posibilidad de utilizar mezclas estequiométricas co-amorfas, que consisten en un API y un excipiente de bajo peso molecular o dos sustancias activas, es una estrategia prometedora para estabilizar la forma amorfa de un fármaco. La Opositora concluye que dicho documento afecta los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud.
- **Chavan R. (2016):** Dicha publicación, según el Opositor, plantea la posibilidad de emplear moléculas pequeñas como azúcares, aminoácidos, ácidos carboxílicos en un sistema co-amorfo tipo CAM, que se define como “un sistema sólido amorfo de fase única multicomponente que carece de periodicidad en la red y está asociado a interacciones intermoleculares débiles y discretas entre los componentes. El Opositor concluye que dicho documento también le resta nivel inventivo a la presente solicitud.

Por lo anterior el Opositor solicita que se deniegue la protección de patente de invención de la presente solicitud, ya que considera que no cumple los requisitos de patentabilidad, particularmente el Nivel Inventivo.

Respuesta del Solicitante

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

El solicitante no dio respuesta a la Oposición presentada por Lafrancol S.A.S.

Respuesta del Examinador Técnico

Luego de revisar los argumentos mencionados por el Opositor y los documentos Gniado K et al (2016) y Chavan R. (2016), se puede afirmar que dichos documentos no tienen nada que ver con el proceso de preparación de un compuesto de fórmula (V) o de fórmula (IA), tal como se reclama en la presente solicitud. Al parecer la Opositora trasladó documentos que se refieren a materia diferente a la reclamada en la presente invención, y por tanto dicha Oposición se considera Infundada.

8. 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: 9 de abril de 2015, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2012143599	“ANDROGEN RECEPTOR MODULATING CARBOXAMIDES”	26/Octubre/2012

D1¹ enseña (resumen) compuestos de fórmula (I), composiciones y procesos para su preparación, los cuales poseen utilidad como moduladores selectivos del receptor de andrógenos (SARM) y son particularmente útiles como medicamentos en el tratamiento del cáncer de próstata y otras afecciones y enfermedades dependientes de AR en las que se desea el antagonismo de AR.

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 31 reclama “*Un proceso para la preparación del compuesto de la fórmula (1A)*” (Radicado No. NC2017/0010052, del 20 de noviembre de 2017)

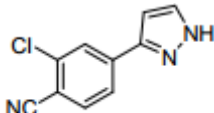
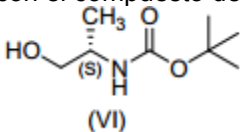
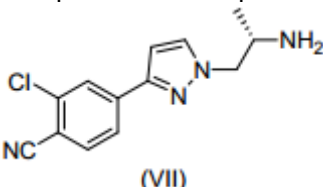
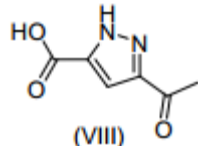
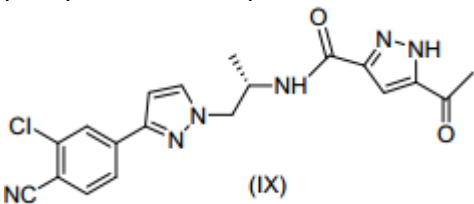
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

1URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2012143599&KC=&locale=en_EP&FT=E

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 15303

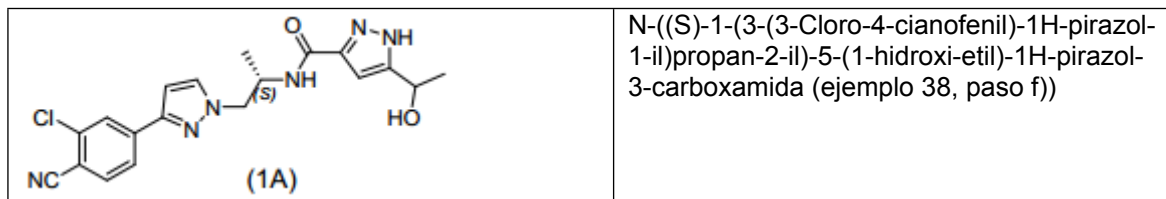
Ref. Expediente N° NC2017/0010052

Características esenciales	D1
Un proceso para la preparación del compuesto de la fórmula (1A):	Proceso de preparación de N-((S)-1-(3-(3-Cloro-4-cianofenil)-1H-pirazol-1-yl)propan-2-il)-5-(1-hidroxi-etil)-1H-pirazol-3-carboxamida (ejemplo 38)
caracterizado porque comprende los pasos de i) hacer reaccionar el compuesto de la fórmula  (V):	Paso d) Reacción de 2-cloro-4-(1H-pirazol-3-il)benzonitrilo con
con el compuesto de la fórmula (VI):  (VI)	(S)-tert-butil-1-hidroxipropan-2-il-carbamato en presencia de trifenilfosfina y EtOAc, agua acidificada y diclorometano
para producir el compuesto de la fórmula (VII):  (VII)	(S)-4-(1-(2-Aminopropil)-1H-pirazol-3-il)-2-clorobenzonitrilo (ejemplo 38, paso d)), el cual reacciona con el siguiente compuesto
hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (VII) con el compuesto de la fórmula (VIII):  (VIII)	Ácido 3-acetil-1H-pirazol-5-carboxílico (ejemplo 38, paso e)
para producir el compuesto de la fórmula (IX):  (IX)	para producir: (S)-5-acetil-N-(1-(3-(3-cloro-4-cianofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-1H-pirazol-3-carboxamida
k) reducir el compuesto de la fórmula (IX) para producir el compuesto de la fórmula (1A):	Sometido a reducción, para producir el compuesto:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052



D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 31, porque divulga compuestos de fórmula (I), composiciones y procesos para su preparación, los cuales poseen utilidad como moduladores selectivos del receptor de andrógenos (SARM) y son particularmente útiles como medicamentos en el tratamiento del cáncer de próstata y otras afecciones y enfermedades dependientes de AR en las que se desea el antagonismo de AR.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 31 y lo revelado en D1, consiste en que en el paso a) se emplea el acetato de paladio y trifenílfosfina en un sistema solvente acetonitrilo/agua; y en el paso b) se emplea HCl en metanol en cantidades catalíticas.

No obstante dicha diferencia no parece conceder una efecto técnico a la presente invención.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los procesos de preparación revelados en D1, para proveer procesos alternativos a los conocidos en el estado del arte?

Sin embargo, D1 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. En dicho documento se enseña un proceso de preparación de N-((S)-1-(3-(3-Cloro-4-cianofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-(1-hidroxi-etil)-1H-pirazol-3-carboxamida (ejemplo 38, paso f)), que contempla exactamente todas las etapas de la presente invención. Es decir, que lo que el solicitante está proponiendo simplemente corresponde a la variación de condiciones de operación y reactivos, lo cual es una labor de rutina para la persona del oficio normalmente versado en la materia. Además, cuando se revisa la descripción, se encuentran datos de rendimiento de cada uno de los pasos pero en ningún momento se encuentra una comparación con el estado del arte, que permita reconocer una mejoría o ventaja técnica asociada a dicho proceso de síntesis.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los procesos de preparación del compuesto (IA) de D1, habría podido

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

Ref. Expediente N° NC2017/0010052

modificar alguno de los reactivos intervinientes o solventes, de manera alternativa, para llegar así al objeto de la reivindicación 31 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

En cuando a las reivindicaciones 1 a 26, 28 y 29, que hacen referencia a procesos de preparación de compuestos de fórmula (III) y (V), y teniendo en cuenta que en la reivindicación 31 se hace referencia al proceso para preparar el compuesto (V), es importante señala que en el mismo documento D1 (ejemplo 38 y pasos a – c), se encuentran las sugerencias para realizar el mismo proceso de síntesis de la presente invención, cuya diferencia también radica en que en el paso a) se emplea el acetato de paladio y trifenilfosfina en un sistema solvente acetonitrilo/agua; y en el paso b) se emplea HCl en metanol en cantidades catalíticas, pero como se mencionó anteriormente, dicha diferencia no le está aportando ningún efecto técnico a la presente invención.

Dado que las reivindicaciones 1 a 26, 28 y 29 no contemplan características que haga inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2012143599	1 a 26, 28, 29 y 31	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

Página 8 de 9

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 15303

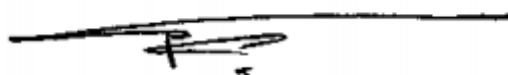
Ref. Expediente N° NC2017/0010052

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 numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede el recurso de la vía gubernativa.

Atentamente,



**JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES**

Elaborado: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ
Revisado: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ