

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

Señor(a)
KYOWA HAKKO KIRIN CO. LTD.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“MÉTODO DE PRODUCCIÓN DE DERIVADOS DE (2-AMINO-1,3-TIAZOL-5-IL) CETONAS Y FORMAS CRISTALINAS DE LOS MISMOS”**
NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/JP2016/051197
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 8 de enero de 2016.
PRIORIDAD: 09/01/2015, JP (JAPON), 2015-002964

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Documentos estudiados

Descripción	NC2017/0006204	22 de junio de 2017
Reivindicaciones:	NC2017/0006204	22 de junio de 2017
	NC2017/0006204	20 de octubre de 2017
	NC2017/0006204	18 de febrero de 2019
	NC2017/0006204	18 de febrero de 2019
Dibujos:	NC2017/0006204	22 de junio de 2017
Respuesta del solicitante:	NC2017/0006204	18 de febrero de 2019

2. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 18 de febrero de 2019, bajo el número NC2017/0006204, por ajustarse a los requisitos legales.

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, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 22 del radicado N° NC2017/0006204 del 18 de febrero de 2019.

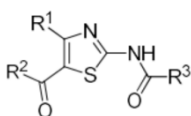


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de métodos de preparación de derivados de tiazol de fórmula I, así como la necesidad de nuevas formas farmacéuticas de dicha fórmula I.



Fórmula I

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un método de síntesis de compuestos de la fórmula I y una forma cristalina de dicho compuesto.

4. De la solicitud de patente

4.1. Título

El nombre de la invención de que se trata en el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

De acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2017/0006204 del 18 de febrero de 2019 y teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, se acepta el título siguiente: “MÉTODO DE PRODUCCIÓN DE DERIVADOS DE (2-AMINO-1,3-TIAZOL-5-IL)CETONAS Y FORMAS CRISTALINAS DE LOS MISMOS”.

4.2. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 1 no es clara porque define los solventes de manera general, de modo que comprende solventes los cuales no se encuentran debidamente sustentados en la descripción. Se sugiere limitar la invención a lo que se encuentra enteramente sustentado.

La reivindicación 1 no es clara porque en el paso (iv) menciona acoplar el compuesto C desprotegido para formar un enlace peptídico pero no menciona con que tipo de reactivo se realiza el acoplamiento. Se sugiere incorporar el reactivo con el que se forma el enlace peptídico.



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

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

Las reivindicaciones 1, 4 a 7, 10 y 13 a 17 no son claras porque definen un método por características estructurales de un compuesto. Se sugiere caracterizar el método por la secuencia de pasos lógicos y las condiciones en las que se lleva a cabo.

5. Unidad de invención (Art. 25 Decisión 486)

La solicitud carece de unidad de invención, debido a que reclama más de un grupo inventivo sin la presencia de características o elementos técnicos nuevos e inventivos que son comunes a todas las invenciones, lo anterior, teniendo en cuenta que el concepto común es compuestos derivados de tiazol, y se encuentra divulgado en el estado de la técnica, específicamente en los documentos WO2012027965 y US20070105919. Este último documento divulga el compuesto N-[4-(2-Furil)-5-(tetrahidropiran-4-ilcarbonil)tiazol-2-il]-2-metilpiridina-5-carboxamida (página 73 compuesto 504).

Por lo tanto, esta invención presenta diferentes conceptos técnicos inventivos así:

Grupo inventivo 1: método de síntesis de compuestos derivados de tiazol (reivindicaciones 1 a 20).

Grupo inventivo 2: Forma cristalina del compuestos derivados de tiazol de fórmula IA (reivindicaciones 21 y 22).

Se sugiere restringir la materia a patentar en un solo concepto común inventivo especificando el avance tecnológico sobre el estado de la técnica. Esto se logra, entre otras formas, definiendo las características esenciales de la invención y mostrando las otras características particulares como dependientes, pero sin perjuicio de la concisión de las nuevas reivindicaciones tanto independientes como dependientes.

El solicitante también puede solicitar una o más divisionales de acuerdo con los grupos inventivos, esto claro, sin ampliar el objeto inicial de la invención.

En caso de seleccionar un grupo inventivo diferente al estudiado por esta Oficina, se le aclara al solicitante que debe realizar el pago del examen de patentabilidad, siempre y cuando, no se exceda el número máximo de estudios permitidos y/o el plazo máximo establecido para solicitarlos.

Por consiguiente, la búsqueda del estado de la técnica y el examen de patentabilidad serán realizados para el grupo inventivo 1.



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 9 de enero de 2015 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Estado de la técnica				Estado de la técnica en trámite ante la SIC	
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación	Fecha de presentación	Fecha de prioridad
D1	WO2012027965	"Novel Compounds"	8 de marzo de 2012	N/A	N/A
D2	US20070105919	"Thiazole Derivates"	10 de mayo de 2007	N/A	N/A

El documento D1¹ divulga un compuesto derivados de tiazol y los métodos de síntesis mediante la reacción entre □-bromo cetonas y derivados de tiourea (esquema 1).

El documento D2² divulga compuestos derivados de tiazol y los métodos de síntesis (resumen).

7. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

7.1. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: *"Un método de producción de un compuesto representado por la fórmula (C), caracterizado porque comprende las etapas de..."* (Radicado N° NC2017/0006204 del 18 de febrero de 2019)

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
----------------------------	----	----

¹<https://patents.google.com/patent/WO2012027965A1/en?q=wo2012027965>

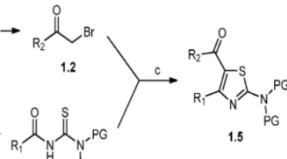
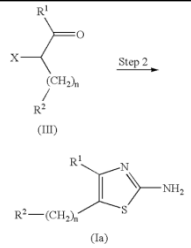
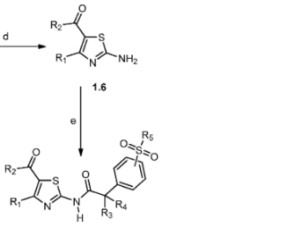
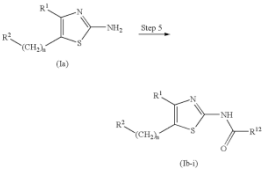
²<https://patents.google.com/patent/US20070105919>



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

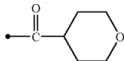
Ref. Expediente N° NC2017/0006204

Un método de producción de un compuesto representado por la fórmula (C), caracterizado porque comprende las etapas de:  (A)  (B)  (C)	Reacción entre el compuesto 1.2 y 1.4 para obtener el compuesto 1.4 en DMF a 85° C.  1.2 1.5 (esquema 1, pág. 10)	 (III) (Ia) Compuesto Ia se obtiene por reacción del compuesto III con tiourea (Pág. 14 columna izquierda)
(i) disolver los compuestos (A) y (B) en un disolvente seleccionado del grupo que comprende hidrocarburos aromáticos, hidrocarburos halogenados, solventes polares, éteres, ésteres, alcoholes, agua y similares; usados solos o como una mezcla de estos;	Se disuelven los compuestos 1.2 y 1.4 en dimetilformamida (esquema 1, pág. 10)	Disolver compuesto III y tiourea en solvente inerte tal como tolueno, hexano, THF, DMF, etanol o acetonitrilo (Pág. 13 párr. [0339] a [0343])
(ii) calentar la mezcla del compuesto (A) y el compuesto (B) entre 10°C y 70°C;	Se calientan la mezcla a 85° C (esquema 1, pág. 10)	Calentar la mezcla entre temperatura ambiente a 100° C (Pág. 13 párr. [0339] a [0343])
(iii) desproteger el grupo amino del compuesto (C) con un ácido;	 1.5 1.6 Se desprotege el grupo amino por hidrólisis, usando ácido trifluoroacético a 80° C (esquema 1, pág. 10)	No menciona
(iv) acoplar el compuesto (C) desprotegido para generar un enlace peptídico;	 1.6 1.8 (esquema 1, pág. 10)	 (Ia) (Ib-1) el compuesto Ib-1 se obtiene por reacción entre el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

		compuesto la y ($R^{12}CO$) ₂ ^o pág. 14 párr. [0352] a [0355])
(v) purificar y cristalizar el compuesto obtenido en el paso (iv); en donde el compuesto de fórmula (B) se encuentra entre 0.1 y 5 equivalentes en relación con el compuesto de fórmula (A), y; en donde R1 representa furilo, R4, R5 y R6 son los mismos o diferentes y cada uno representa alquilo inferior o arilo, R2 representa piridilo o tetrahidropiranilo, y X1 representa halógeno.	Purificación directa de los compuestos por cromatografía (ejemplos 1 en adelante) R ₂ -C(=O)- donde R2 es 1,3-benzodioxol (corresponde a R1 de la solicitud), PG grupos protectores de amino (corresponden a R4, R5 y R6 de la solicitud), -Br (corresponde a X1)	Los compuestos deseados son purificados por métodos convencionalmente usados los cuales incluyen cristalización (pág. 19 párr. [0427] ejemplo 504). Donde R1 es furanilo, R2 es 

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un método de síntesis de derivados de tiazol a partir de una □-bromo cetona y un derivado de tiourea. Adicionalmente el documento D1 enseña que el compuesto 1.5 se puede hidrolizar para eliminar los grupos PG y exponer el grupo amino dando el producto 1.6 usando ácido trifluoroacético (esquema 1 pág. 10 y pág. 13 ejemplo 1 preparación del intermediario 1C). El compuesto 1.6 se condensa con el ácido apropiado en presencia de hidroxibenzotriazol y N-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida hidroclicato (pág. 11).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el procedimiento divulgado en D1 consiste en los patrones de sustitución de R1 que es furanilo, R2, R3, R4 que son cada uno alquil inferior y es R2 tetrahidropiranilo y el intervalo de temperatura de 10°C y 70°C.

No se evidencia efecto técnico por el hecho de incluir las sustituciones donde R1 es furanilo, R2, R3, R4 son cada uno alquil inferior y es R2 tetrahidropiranilo el intervalo de temperatura de 10°C y 70°C.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el método conocido en D1 para obtener compuestos alternativos derivados de tiazol”.

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

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

Sin embargo, la utilización de sustituciones donde R1 es furanilo, R2, R3, R4 son cada uno alquil inferior y es R2 tetrahidropiranilo y el intervalo de el intervalo de temperatura de 10°C y 70°C, ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a compuestos derivados de tiazol que comprende el mismo patrón de sustitución (pág. 86 y 190 ejemplo 627) y la temperatura de reacción entre ambiente hasta 100° C (pág. 14 columna izquierda).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría las sustituciones donde R1 es furanilo, R2, R3, R4 son cada uno alquil inferior y es R2 tetrahidropiranilo y la temperatura de reacción desde ambiente hasta 100° C del documento D2 en el procedimiento divulgado en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 15 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al proceso de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

8. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2012027965	1 a 20	Nivel Inventivo
D2	US20070105919	1 a 20	Nivel Inventivo

9. Respuesta a los argumentos del señor solicitante

Argumentos respecto a D1

El solicitante argumenta que el documento D1 divulga un método para producir un derivado de tiazol donde R1 y R2 no comprenden los sustituyentes mismos reclamados en la solicitud, donde R1 comprende un grupo furanilo. Afirma el solicitante que por no estar divulgado el sustituyente furanilo en el documento D1, la persona versada en la materia no usaría el método de dicha anterioridad para obtener los compuestos de la solicitud. El solicitante menciona que al intentar preparar el compuesto de la invención mediante el método enseñado en D1, no logró utilizando el método de desprotección de aminos doblemente protegidos la reacción de desprotección no fue posible. Por lo anterior, el método descrito en la solicitud, donde el grupo amino es protegido solo por un grupo protector, permite



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

obtener los compuestos de fórmula D.

Se aclara que los grupos sustituyentes de los compuestos no corresponden a características técnicas esenciales de un método. Es necesario resaltar que las características técnicas de un método son las etapas lógicas y condiciones en las cuales se lleva a cabo dicho método y no lo son la definición de sustituyentes de un compuesto. Se llama la atención al solicitante sobre el hecho de que el documento D1 divulga el método un método de síntesis para obtener derivados de tiazol que no comprenden los sustituyentes de la solicitud pero estos son divulgados en el documento complementario D2.

Argumentos respecto a D2

El solicitante afirma que el documento D2 dista del método de la solicitud varios aspectos tales como producción de tiazol, bromación en la posición 5 del núcleo de tiazol, protección de una posición del grupo amino, reacción de acoplamiento en la posición libre del amino para formar una amida sustituida y reemplazo del bromo por un grupo acetilo y desprotección de la amida. Dice el solicitante que el método de la solicitud comprende un numero menor de pasos involucrados.

Se aclara al solicitante que el documento D2 es complementario, lo que quiere decir que de este documento divulga el elemento diferenciador que no esta divulgado en D1, es decir, los grupos sustituyentes de los derivados de tiazol de la solicitud. Por lo anterior, el documento D2 si divulga los grupos sustituyentes de la solicitud y la persona versada en la materia estaría motivada a introducir los grupos sustituyentes del documento D2 en el los compuestos y métodos divulgados en D1.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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 modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

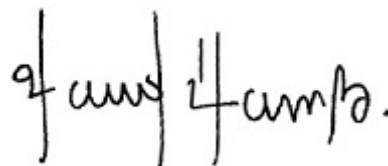


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

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.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad					
NC2017/0006204		1°		2°	X	3°	Revoca
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)					
(PCT/JP2016/051197		8 de enero de 2016					
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación	
9 de enero de 2015				X			
Solicitante							
KYOWA HAKKO KIRIN CO. LTD.							
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:							
Art. 14		Art. 15		Art. 20		Art. 25 (Falta de unidad de invención)	21 y 22
CRITERIOS DE BÚSQUEDA							
Reivindicaciones objeto de búsqueda		1 a 20					
Palabras clave utilizadas		Thiazol, nervous system, opiod, amino Búsqueda estructural: <chem>C2=C(C(=O)C1CCOCC1)SC(=N2)NC(=O)C3=CN=CC=C3)C4CCCC4</chem>					
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda		CIP:	C07D 417/14, A61K 31/4439, A61P 25/04, A61P 25/06, A61P 25/14, A61P 25/16, A61P 25/20, A61P 25/22, A61P 25/24				
		CPC:					
DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)							
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾		
SIPI							
ISA	WO2012027965 US20070105919	08/03/2012 10/05/2007	1-20 1-20	esquema 1 pág. 10 ejemplo 504 pág. 73	Y Y		
EPO							
USPTO							
Patbase							
Orbit							
Epoquenet							

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2340 de 9 de abril de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0006204

Espacente					
Googlepatent					
Invenes					
(1) Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen</i> (Número), pp-pp.					
O					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx .					
(2) Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada. “T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.					
Fecha del reporte de búsqueda: 15 de marzo de 2019					
Examinador JUAN NICOLAS TARQUINO CHIA					