

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

Señor(a)  
INCEPTION 2, INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“COMPUESTOS DE PIRAZOLONA Y USOS DE LOS MISMOS”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2015/015000

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 9 de febrero de 2015.

PRIORIDAD: 14/02/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 61/939,955

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. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

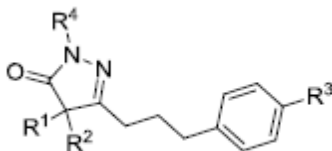
Se aceptan las modificaciones radicadas el 10 de enero de 2017, bajo el número NC2016/0001019, por ajustarse a los requisitos legales.

### 2. 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 13 del radicado N° NC2016/0001019 del 10 de enero de 2017.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proveer agentes activos en el tratamiento de diversos tipos de cáncer mediante la modulación del receptor PPAR-alfa.

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



### 3. De la solicitud de patente

#### 3.1. 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.

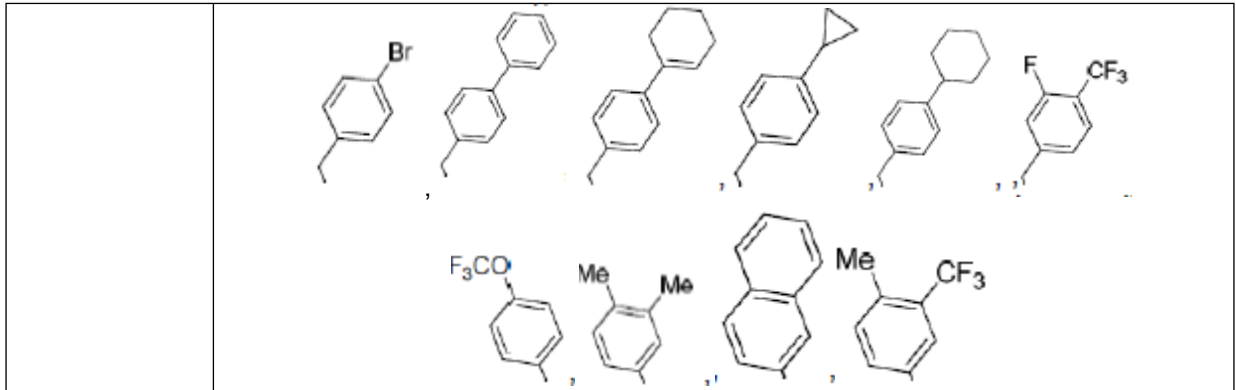




**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019



En consecuencia, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizados y probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

**4. Determinación del Estado de la Técnica**

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 14 de febrero de 2014 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 |               |                                                                                                                                                                   |                          |
|----------------------|---------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| Ítem                 | Documento     | Título                                                                                                                                                            | Fecha de Publicación     |
| D1                   | WO2013/134562 | “Triazolone compounds and uses thereof”                                                                                                                           | 12 de septiembre de 2013 |
| D2                   | EP0121856     | “Application de dérivés de pyrazolone à la lutte contre la croissance des tumeurs, et leurs métastases, médicaments les contenant et leur procédé de préparation” | 17 de octubre de 1984    |

La anterioridad D1<sup>1</sup> divulga compuestos útiles en el tratamiento de diferentes tipos de cáncer los cuales son compuestos derivados de triazolona sustituidos con fenil (Resumen, Reiv. 1).

La anterioridad D2<sup>2</sup> divulga agentes derivados de pirazolona útiles como antineoplásicos y antimetastásicos derivados de pirazolona (Resumen, Reiv. 1).

**5. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)**

**5.1. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)**

La reivindicación 1 consiste en: “*Un compuesto de fórmula (I) ...*” (Radicado N°. NC2016/0001019 del 10 de enero de 2017).

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

| Características esenciales | DX | DY |
|----------------------------|----|----|
|----------------------------|----|----|

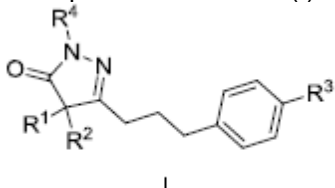
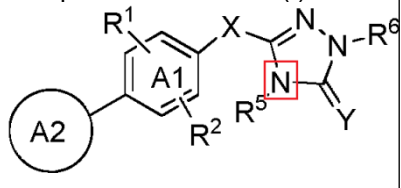
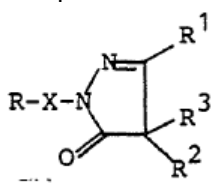
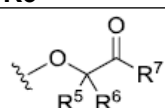
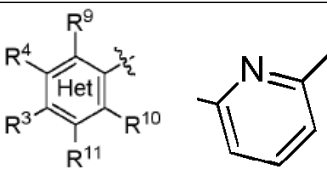
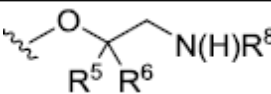
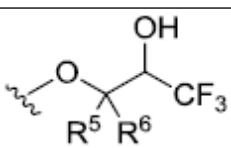
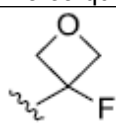
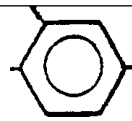
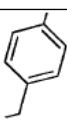
<sup>1</sup><https://patents.google.com/patent/WO2013134562A1/en>

<sup>2</sup><https://encrypted.google.com/patents/EP0121856A2?cl=de&hl=es>

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

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

|                                                                                                                   |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Un compuesto de fórmula (I):<br> | Compuesto de fórmula (I):<br> | Compuesto de fórmula (I):<br> |
|                                                                                                                   | X es -(CH2)3-<br>Y = O                                                                                          | R1 = Residuo hidrocarbonado C1-18                                                                                |
| <b>R1 y R2</b>                                                                                                    | <b>R5</b>                                                                                                       | <b>R2 y R3</b>                                                                                                   |
| Alquilo                                                                                                           | Alquilo                                                                                                         | Alquilo, -CH3                                                                                                    |
| <b>R1 y R2 juntos</b>                                                                                             | <b>No lo divulga</b>                                                                                            | <b>No lo divulga</b>                                                                                             |
| Cicloalquilo                                                                                                      |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
| <b>R3</b>                                                                                                         | <b>A2</b>                                                                                                       | <b>No lo divulga</b>                                                                                             |
|                                |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
| Fenilo                                                                                                            | Fenilo                                                                                                          |                                                                                                                  |
| Piridilo                                                                                                          |                              |                                                                                                                  |
|                                |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
|                                |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
| <b>Sustituciones del Fenilo y Piridilo de R3</b>                                                                  | <b>Sustituciones de Fenilo y Piridilo de A2</b>                                                                 | <b>No lo divulga</b>                                                                                             |
| -N(H)R8                                                                                                           | -N(H)(R8)                                                                                                       |                                                                                                                  |
| -Alquilo-C(=O)OH                                                                                                  | -Alquilo-C(=O)OH                                                                                                |                                                                                                                  |
| -Alcoxi                                                                                                           | -Alcoxi                                                                                                         |                                                                                                                  |
| -haloalquilo                                                                                                      | -CF3                                                                                                            |                                                                                                                  |
|                                |                              |                                                                                                                  |
| <b>R4</b>                                                                                                         | <b>R6</b>                                                                                                       | <b>X-R</b>                                                                                                       |
| Fenilo                                                                                                            |                                                                                                                 |                             |
| Alquil-fenilo                                                                                                     |                              | Arilo:<br>Alquil-arilo                                                                                           |
| Naftilo                                                                                                           |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
| Piridilo no sustituido                                                                                            | Heteroarilo                                                                                                     |                                                                                                                  |
| Piridilo sustituido con -CF3                                                                                      |                                                                                                                 |                                                                                                                  |
| <b>Sustituyentes de Fenilo de R4</b>                                                                              | <b>Sustituyentes de alquilarilo de R6</b>                                                                       | <b>Sustituyente de arilo de X-R</b>                                                                              |
| Halógeno                                                                                                          | Halógeno                                                                                                        | Halógeno                                                                                                         |
| Alquilo                                                                                                           | Alquilo                                                                                                         | Alquilo                                                                                                          |
| -CF3                                                                                                              | -CF3                                                                                                            | -CF3                                                                                                             |
| -OCF3                                                                                                             |                                                                                                                 | -Alcoxi, (-OCH3)                                                                                                 |

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

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

|                          |                                                |                           |
|--------------------------|------------------------------------------------|---------------------------|
| Fenilo                   | Arilo                                          |                           |
| Cicloalquilo             | Cicloalquilo                                   |                           |
| Cicloalquenilo           |                                                |                           |
| <b>R5 y R6</b>           | <b>No lo divulga</b>                           | <b>No lo divulga</b>      |
| Hidrógeno                |                                                |                           |
| -CF3                     |                                                |                           |
| -N(H)S(=O)2fenilo        |                                                |                           |
| -N(H)-C3-6cicloalquilo   |                                                |                           |
| -N(H)-C1-6alquilo        |                                                |                           |
| Sustituciones de alquilo |                                                |                           |
| Piridilo                 |                                                |                           |
| Fenilo                   |                                                |                           |
| Cicloalquilo             |                                                |                           |
| CF3                      |                                                |                           |
| <b>R7</b>                | <b>No lo divulga</b>                           | <b>No lo divulga</b>      |
| Hidroxilo                |                                                |                           |
| -N(H)S(=O)2fenilo        |                                                |                           |
| -N(H)-C3-6cicloalquilo   |                                                |                           |
| -N(H)-C1-6alquilo        |                                                |                           |
| <b>R8</b>                | <b>R8</b>                                      | <b>No lo divulga</b>      |
| Hidrógeno                | Hidrógeno                                      |                           |
| -S(=O)2fenilo            |                                                |                           |
| -C(=O)fenilo             |                                                |                           |
|                          | Pág. 59, ejem. 3; Pág. 128, ejem. 143; Reiv. 1 | Pág. 25, comp. E; Reiv. 1 |

La anterioridad D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos donde el grupo farmacofórico está representado por una triazolona sustituida, donde dichos agentes se consideran activos en el tratamiento del cáncer particularmente como antagonistas de PPAR-alfa (Resumen, Reiv. 1).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en que los compuestos de la presente solicitud son derivados de pirazolona, mientras que en D1 se trata de una triazolona.

No se evidencia un efecto asociado al incluir el grupo pirazolona en los compuestos de la presente solicitud.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos conocidos a través de D1 para conseguir agentes alternativos?

Sin embargo, la utilidad de los anillos de pirazolona como grupos farmacofóricos activos como anticancerígenos ya había sido divulgada en el documento D2. Dicha anterioridad también enseña un sustituyente fenilo en la misma posición del radical R4 de la presente solicitud (Resumen; Reiv. 1; Pág. 25, comp. E).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia se encuentra en capacidad de sustituir el grupo triazolona de D1 por una pirazolona como lo sugiere el documento D2 toda vez que estos anillos guardan una gran similitud estructural y porque el intercambio de C por N dentro de un anillo es una práctica común en el desarrollo de bioisómeros con la expectativa razonable de conservar la actividad terapéutica<sup>3</sup>. No existe información en la descripción de la presente solicitud que permita evidenciar un efecto

<sup>3</sup> Patani, G. A. and La Voie, E. J. (2006). Bioisosterism: A rational approach in drug design. Chem. Rev. 96, 3158-3159.

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

técnico sorprendente o inesperado de los compuestos divulgados frente a la materia contenida en D1 que da solución al mismo problema técnico. Por lo tanto, la invención reivindicada se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2, 3, 5 y 12 tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

Las reivindicaciones dependientes 2, 3, 5 y 12 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al producto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

**6. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo**

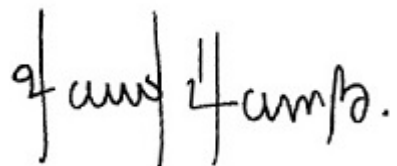
Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

| Ítem | Documento     | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|---------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | WO2013/134562 | 1, 2, 3, 5 y 12            | Nivel inventivo      |
| D2   | EP0121856     | 1, 2, 3, 5 y 12            | Nivel inventivo      |

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.

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 recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA  
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

INFORME DE BÚSQUEDA  
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

|                                                            |   |                                            |   |           |   |                                        |  |        |  |
|------------------------------------------------------------|---|--------------------------------------------|---|-----------|---|----------------------------------------|--|--------|--|
| Solicitud No.                                              |   | Examen de patentabilidad                   |   |           |   |                                        |  |        |  |
| NC2016/0001019                                             |   | 1°                                         | X | 2°        |   | 3°                                     |  | Revoca |  |
| Solicitud Internacional No.                                |   | Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO) |   |           |   |                                        |  |        |  |
| PCT/US2015/015000                                          |   | 9 de febrero de 2015                       |   |           |   |                                        |  |        |  |
| Fecha de determinación estado de la técnica<br>(DD/MM/AÑO) |   |                                            |   | Prioridad |   | Presentación                           |  |        |  |
| 14/02/2014                                                 |   |                                            |   | X         |   |                                        |  |        |  |
| Solicitante                                                |   |                                            |   |           |   |                                        |  |        |  |
| INCEPTION 2, INC.                                          |   |                                            |   |           |   |                                        |  |        |  |
| Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:        |   |                                            |   |           |   |                                        |  |        |  |
| Art. 14                                                    | - | Art. 15                                    | - | Art. 20   | - | Art. 25 (Falta de unidad de invención) |  | -      |  |

|                                             |                                                               |
|---------------------------------------------|---------------------------------------------------------------|
| CRITERIOS DE BÚSQUEDA                       |                                                               |
| Reivindicaciones objeto de búsqueda         | 1-3                                                           |
| Palabras clave utilizadas                   | Pirazonol* AND cancer AND "INCEPTION 2" AND (PPAR W5 recept*) |
| Clasificaciones utilizadas para la búsqueda | CIP: C07D 231/06, A61K 31/4152, C07D 231/10                   |
|                                             | CPC:                                                          |

|                                                                                                                            |                                                                       |                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                |                                               |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------|-----------------------------------------------|
| DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES<br>(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 <sup>(1)</sup> | Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)                                                                       | Reivindicaciones /Secuencias afectadas                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | Citas relevantes del estado de la técnica      | Categoría del documento citado <sup>(2)</sup> |
| SIPI                                                                                                                       | ----                                                                  | ----                                                                                                                  | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | ----                                          |
| EPO                                                                                                                        | WO2013/134562                                                         | 12/09/2013                                                                                                            | 1, 2, 3, 5 y 12                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | Pág. 59, ejem. 3; Pág. 128, ejem. 143; Reiv. 1 | Y                                             |
| USPTO                                                                                                                      | US6746989                                                             | 08/06/2004                                                                                                            | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | A                                             |
| Patbase                                                                                                                    | US6455525                                                             | 24/09/2002                                                                                                            | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | A                                             |
|                                                                                                                            | JP59196870                                                            | 08/11/1984                                                                                                            | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | A                                             |
| Orbit                                                                                                                      | JP200351309                                                           | 08/04/2003                                                                                                            | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | A                                             |
|                                                                                                                            | EP0491218                                                             | 24/06/1992                                                                                                            | ----                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | ----                                           | A                                             |
| Espacenet                                                                                                                  | EP0121856                                                             | 17/10/1984                                                                                                            | 1, 2, 3, 5 y 12                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | Pág. 25, comp. E; Reiv. 1                      | Y                                             |
| (1) Cita completa literatura no patente (LNP)                                                                              |                                                                       | Patani, G. A. and La Voie, E. J. (2006). Bioisosterism: A rational approach in drug design. Chem. Rev. 96, 3158-3159. |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                |                                               |
| Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(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.                    |                                                                       |                                                                                                                       | "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. |                                                |                                               |
| "E" Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. |                                                                       |                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |                                                |                                               |

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

Oficio N° 1947 de 3 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2016/0001019

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>“<b>L</b>” 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.</p> <p>“<b>O</b>” 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> <p>“<b>P</b>” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.</p> | <p>“<b>X</b>” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.</p> <p>“<b>Y</b>” 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.</p> |
| <b>Fecha del reporte de búsqueda:</b> 14/09/2017                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
| <b>Examinador:</b> LEONARDO FERNÁNDEZ RODRÍGUEZ                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |

