

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 6697 de 25 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

Señor(a)
INNOVATIVE MOLECULES GMBH

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“DERIVADOS DE AMINOTIAZOL ÚTILES COMO AGENTES ANTIVÍRICOS”.**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2017/058077

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 5 de abril de 2017.

PRIORIDAD: EP16000787.8 del 06 de Abril de 2016.

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. 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 15 del radicado N° NC2018/0010689 del 03 de octubre de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos antivirales con actividad contra infecciones por VHS.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona derivados de tiazolil amida de la fórmula general (I).

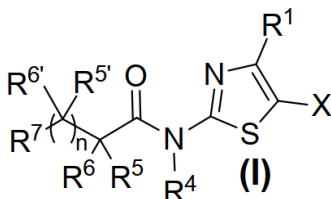
2. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 10 a 14 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 1 no es concisa, porque presenta una gran cantidad de sustituyentes que no encuentran sustento en el capítulo descriptivo y en los compuestos que fueron ensayados en la descripción. En el capítulo descriptivo se observa que los únicos compuestos que muestran actividad son los que tienen los siguientes sustituyentes (tabla 1):

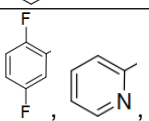
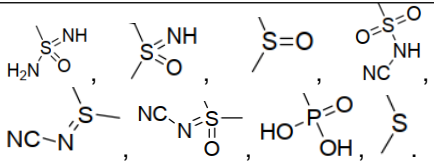


R ¹ es	CH ₃
R ⁴ es	CH ₃
R ⁵ es	H

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 6697 de 25 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

R ⁶ es	H
n es	0
R ⁷ es	
R ⁷ es sustituido con:	
X es	

Se requiere delimitar correctamente la invención, de conformidad con lo sustentado en el capítulo descriptivo.

Adicionalmente, la reivindicación 1 tampoco es concisa cuando presenta los siguientes términos que no mencionan el tipo de heteroátomos que los conforman: “heterocicloalquilo”, “O-heterocicloalquilo”, “heteroarilo”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de diferentes sustituciones que no encuentran sustento en la descripción. Se requiere realizar las delimitaciones correctas.

La anterior objeción aplica para las reivindicaciones 3 y 7.

La reivindicación 15 no es clara cuando menciona: “y/o al menos un principio activo adicional que sea eficaz para tratar una enfermedad o un trastorno asociados a infecciones víricas (compuestos activos antivíricos)”, puesto que se podrían formar múltiples opciones de diferentes composiciones que no encuentran sustento en la descripción, más aun cuando se señalan compuestos definidos de manera general por su función. Se requiere ajustar la materia reclamada a lo sustentado en la descripción.

4. 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: 06 de Abril de 2016, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2004006076	“Thiazolyl amide derivatives”	08/Enero/2004

D1¹ enseña (resumen) compuestos derivados de tiazolil amida con actividad antiviral, tal como actividad contra VHS y composiciones que los comprenden.

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

4.1. Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 reclama “Un compuesto que tiene la fórmula (I)”... (Radicado No. NC2018/0010689 del 03 de octubre de 2018)

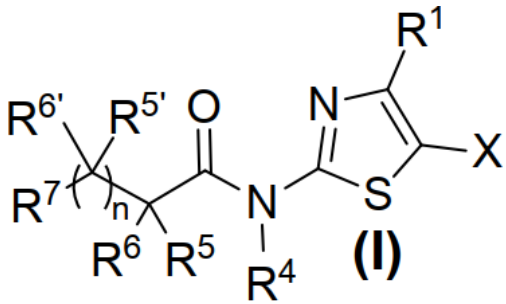
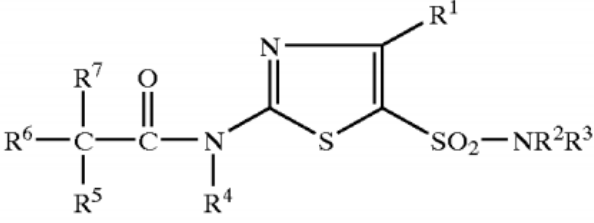
1URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2004006076A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20040108&DB=&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 6697 de 25 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

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

Características esenciales	D1
 (I)	 (reivindicación 1) (ver también ejemplos 8, 14, 23, 38, 57, 87 y 126)
R ¹ es alquilo C ₁	R ¹ es alquilo C ₁
R ⁴ es alquilo C ₁	R ⁴ es alquilo C ₁
R ⁵ es H	R ⁵ es H
R ⁶ es H	R ⁷ es H
n es 0	0
R ⁷ es arilo de 6 miembros	R ⁶ es fenilo opcionalmente sustituido
R ⁷ es sustituido con heteroarilo de 5 o 10 miembros	Sustitución de fenilo es anillo de 6 miembros monocíclico que tiene hasta tres de N, O y S.
 X es  , entre otros.	
H	donde R ² es H
Extremo Ciano	R ³ es H, alcoxi o bifenilocarbonil

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulga compuestos derivados de tiazolil amida con actividad antiviral, tal como actividad contra VHS y composiciones que los comprenden.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y lo revelado en D1, consiste en el sustituyente ciano que se encuentra unido al aminosulfonil.

No obstante dicha diferencia no parece conceder un efecto técnico a la presente invención porque a partir de la información de la descripción no es posible determinarlo.

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

Sin embargo, D1 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. D1 revela compuestos con actividad antiviral relacionados con VHS, los cuales presentan una estructura farmacofórica de un arilo sustituido con arilo o heteroarilo - tiazol aminosulfonil, muy similar a los compuestos de la presente invención, cuya única diferencia se encuentra en el grupo ciano extremo en la fracción de aminosulfonil, que se encuentra en D1, pero que a partir de los ensayos presentados en el presente capítulo descriptivo, no puede comprobarse que dicha diferencia aporte un efecto técnico sorprendente o inesperado.

Adicionalmente, las modificaciones en los sustituyentes bioequivalentes de anillos de compuestos conocidos, son posibilidades plenamente conocidas para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con sus conocimientos en química orgánica heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 6697 de 25 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

cualquiera de sus sustituyentes, como lo es un grupo ciano por un grupo alcoxi, como ocurre con los isósteros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes o bivalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales ², es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los extremos terminales bioisostéricos, 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 o el tipo de sustitución del anillo principal. Lo anterior es importante, porque en la presente invención simplemente se propone una modificación en un grupo ciano que reemplaza a la amina del grupo aminosulfonil, pero que como se vio anteriormente, dicha modificación no demostró un efecto técnico inesperado o una ventaja técnica real y por tanto se consideran variaciones estructurales de rutina que no sustentan el requisito evaluado.

Existen dos hechos que llaman la atención en la presente invención. Primero, que solamente puede comprobarse actividad para los compuestos que se encuentran en la tabla 1 del pliego descriptivo. Segundo, que el solicitante realizó una comparación entre el ejemplo 3 de la presente invención y el compuesto 87 de D1, para demostrar una mejoría en la actividad de los compuestos de la presente invención por sobre los del arte previo. No obstante lo anterior, los compuestos de la tabla 1 de D1 también podrían demostrar una superioridad de los compuestos del estado del arte por sobre los de la presente invención, porque cuando revisamos, por ejemplo el compuestos 57, 87 y 126, entre otros, de D1, notamos un IC₅₀ sobre HSV-1 y HSV-2, superior a algunos de los compuestos ensayados en la presente invención en la tabla 1.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los compuestos de D1, habría podido modificar alguno de sus sustituyentes, de manera alternativa, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 2 a 9 y 15 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

6. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2004006076	1 a 9 y 15	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

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

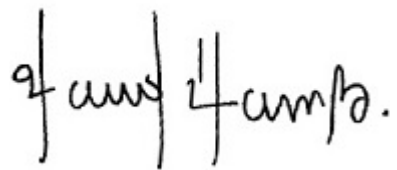
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **6697** de **25 de julio de 2019**

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

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° 6697 de 25 de julio de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0010689		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2017/058077		5 de abril de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
6 de abril de 2016				X					
Solicitante									
INNOVATIVE MOLECULES GMBH									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	10 a 14	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 15
Palabras clave utilizadas	thiazolyl amide derivatives; antiviral medicaments; Herpes Simple Virus; HVS Infections
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 277/54, C07F 9/38, C07F 9/40, C07F 9/44, A61K 31/662, A61K 31/426, A61P 31/22
	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⁾
EPO STN	US2004006076	08/Enero/2004	1 a 11	(reivindicación 1) (ver también ejemplos 8, 14, 23, 38, 57, 87 y 126)	X,Y
PATBASE	WO0212211	14/Febrero/2002	N/A	N/A	A
ORBIT	WO2004/04609 5	17/Noviembre/2003	N/A	N/A	A
	WO2004/04609 5	15/Mayo/2005	N/A	N/A	A
SIPI	00097414	22/Diciembre/2000	1 a 11	(reivindicación 1) (ver también ejemplos 8, 14, 23, 38, 57, 87 y 126)	X,Y
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
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		
“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° **6697** de **25 de julio de 2019**

Ref. Expediente N° NC2018/0010689

“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.	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: 21/Junio/2019	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ	