

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

Señor(a)
BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“DERIVADOS DE 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2 PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO”.**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2016/079973.

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 7 de diciembre de 2016.

PRIORIDAD(ES): EP15199270.8 del 10 de Diciembre de 2015.

EP16196836.7 del 02 de Noviembre 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. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 13 de Junio de 2018, bajo el número NC2018/0006047, 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 6 del radicado N° NC2018/0006047 del 13 de Junio de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA como bloqueadores de los canales TASK-1 Y TASK-2 para el tratamiento de trastornos respiratorios relacionados con el sueño.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I), proceso para su preparación y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

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



Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

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.

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2018/0005905 el 8 de junio de 2018, tituló la invención como: “DERIVADOS DE 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2 PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO”. Este título no se relaciona con el objeto de la solicitud contenido en la descripción y las reivindicaciones, por lo cual se sugiere el título siguiente: “DERIVADOS DE 2-FENIL-3-(PIPERAZINOMETIL)IMIDAZO[1,2-A]PIRIDINA COMO BLOQUEADORES DE LOS CANALES TASK-1 Y TASK-2, ADECUADOS CONTRA TRASTORNOS RESPIRATORIOS RELACIONADOS CON EL SUEÑO, PROCESO PARA SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”.

3.2. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 4 no es concisa cuando menciona los siguientes términos: “*un agente de reducción*”, “*un grupo amino protector*”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de diferentes agentes intervinientes que no tienen sustento en la descripción. Adicionalmente, el proceso de la reivindicación 4 no enseña las condiciones ni proporciones bajo las cuales se lleva a cabo dicho proceso. Se requiere delimitar correctamente la invención.

La reivindicación 6 no es concisa cuando menciona: “*en combinación con uno o más compuestos activos adicionales seleccionados del grupo formado por estimulantes respiratorios, compuestos psicoestimulantes, inhibidores de la reabsorción de serotonina, antidepresivos noradrenérgicos, serotoninérgicos y tricíclicos, estimulantes de sGC, antagonistas de receptores mineralcorticoides, fármacos antiinflamatorios, inmunomoduladores, inmunosupresores y fármacos citotóxicos*”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de diferentes composiciones que no tienen sustento en el capítulo descriptivo. Se requiere eliminar dicha referencia o mencionar los compuestos específicos y no todo un conjunto de familias farmacológicas posibles.

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 prioridad: 10 de diciembre de 2015, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2013037914	“SUBSTITUTED 4,5,6,7-TETRAHYDRO-1H-PYRAZOLO[4,3-C]PYRIDINES, THEIR USE AS MEDICAMENT, AND PHARMACEUTICAL PREPARATIONS COMPRISING THEM”	21/Marzo /2013

Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

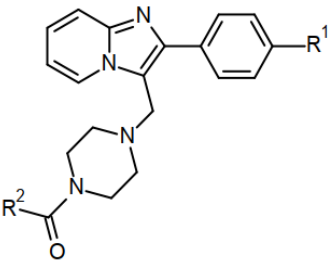
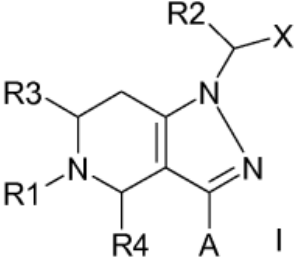
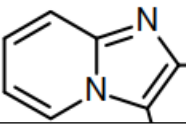
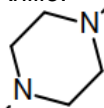
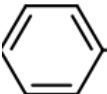
El documento D1¹ enseña (resumen) compuestos derivados de 4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo [4,3-c] piridinas sustituidas de fórmula (I), que presentan actividad sobre el canal de potasio TASK-1. Los compuestos son adecuados para el tratamiento o prevención de arritmias auriculares, por ejemplo, fibrilación auricular (FA) o aleteo auricular.

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

5.1. Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 reclama: un “Compuesto de la fórmula (I)...” (Radicado No. NC2018/0006047 del 13 de Junio de 2018)

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

Características esenciales	D1
	 (reivindicación 1)
Anillo: 	---
H	R ³ es H R ⁴ es H
CH ₂	R ² es H
Anillo: 	X es heteroarilo de 6 miembros que contiene 1-3 átomos de nitrógeno
-C(O)-	-C(O)-; en la posibilidad de sustitución del anterior anillo, que es alquiloC ₁₋₆ -O-C(O)-
R ² es cicloalquilo que contiene un -O- reemplazando -CH ₂ -	---
Anillo: 	A es arilo de 6 miembros;
R ¹ es halógeno, ciano, alquilo-(C1-C4), ciclopropilo o ciclobutilo	A es sustituido con F, Cl, Br, CN y alquilo C ₁₋₆

El documento D1 (resumen) se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulga compuestos derivados de 4,5,6,7-tetrahidro-1H-pirazolo [4,3-c] piridinas sustituidas de fórmula (I), que presentan

¹URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2013037914A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20130321&DB=&locale=en_EP

Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

actividad sobre el canal de potasio TASK-1. Los compuestos son adecuados para el tratamiento o prevención de arritmias auriculares, por ejemplo, fibrilación auricular (FA), aleteo auricular y relacionados con el sueño (página 3, línea 18).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y lo revelado en el documento D1, consiste en la ubicación de los nitrógenos en el anillo central y en las posibles sustituciones de la piperazina.

No obstante dichas diferencias no parece conceder un efecto técnico a la presente invención, porque a partir de la información del capítulo descriptivo no es posible determinarlo.

Cuando revisamos el capítulo descriptivo, no se observa evidencia de superioridad de los compuestos de la presente invención, frente a los del documento D1, en el bloqueo de los canales TASK.

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

No obstante lo anterior, el documento D1 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. En el documento D1 se enseñan compuestos estructuralmente cercanos a la presente invención, que también tienen actividad sobre el canal de potasio TASK-1. Los compuestos son adecuados para el tratamiento o prevención de arritmias auriculares, por ejemplo, fibrilación auricular (FA), aleteo auricular y relacionados con el sueño (página 3, línea 18). En este punto vale la pena anotar, que dichas modificaciones en los anillos conocidos, son variaciones de rutina para cualquier persona medianamente versada en la materia, quien reconoce las variaciones relacionadas con isómeros clásicos y los bioisómeros, en donde una fracción $-CH=$ de un anillo se puede reemplazar por un $-N=$, en un sistema de anillo, como se puede comprobar en la bibliografía básica ².

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia con sus conocimientos en química orgánica, habría podido variar los heteroátomos del anillo principal de los compuestos del documento D1, para llegar de manera alternativa al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 2 a 6 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	WO2013037914	1 a 6	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

² URL: <https://www.fbioyf.unr.edu.ar/evirtual/pluginfile.../Isosterismo%20Alumnos.pdf>

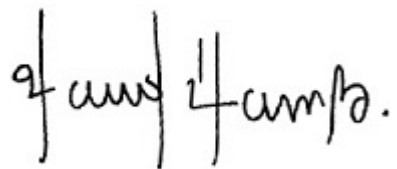
Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

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



Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0005905		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2016/079973		7 de diciembre de 2016							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
10 de Diciembre de 2015				X					
Solicitante									
BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT									
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 a 6
Palabras clave utilizadas	TASK-1 and TASK-3; 2-PHENYL-3-(PIPERAZINOMETHYL)IMIDAZO[1,2-A]PYRIDINE; IMIDAZO; PYRIDINE; PIPERAZINOMETHYL; BLOCKERS OF TASK-1 AND TASK-2 CHANNELS; SLEEP-RELATED BREATHING DISORDERS.
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 11/00
	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	WO2013037914	21/Marzo/2013	1 a 6	(resumen, reivindicación 1, tabla 1)	Y
PATBASE	WO2012130322	04/Octubre/2012	N/A	N/A	A
	US2009149496	11/Junio/2009	N/A	N/A	A
	WO18015196	25/Enero/2018	N/A	N/A	A,P
	US2018089385	29/Marzo/2018	N/A	N/A	A,P
	US2015018342	15/Enero/2015	N/A	N/A	A
ORBIT	US2014330009	06/Noviembre/2014	N/A	N/A	A
	US2008188520	07/Agosto/2008	N/A	N/A	A
	WO13037736	21/Marzo/2013	N/A	N/A	A
	US2006235315	19/Octubre/2006	N/A	N/A	A
STN y USPTO	WO2014187922	01/Noviembre/2014	N/A	N/A	A
	US20020022624	21/Febrero/2002	N/A	N/A	A
⁽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 “T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o					

Oficio N° 9170 de 29 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0005905

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.	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: 26/Agosto/2019	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ	