

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

Señores

THE UNIVERSITY OF TEXAS SYSTEM BOARD OF REGENTS.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: ***“INHIBIDORES DE CINASA DE CREMALLERA DE LEUCINA DUAL (DLK) PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES”***

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2017/048941.

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 28 de agosto de 2017.

PRIORIDAD: US 62/380,822 29 de agosto 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 54 del radicado N° NC2019/0002839 el 27 de marzo de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos inhibidores de cinasa de cremallera de leucina dual (DLK) (pág. 1, párr. [002] y [004]).

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de heterociclo imidazo piridin aminas de fórmula (I) y composiciones farmacéuticas que los comprenden (pág. 1, párr. [005] y [006]).

2. Excepción de Patentabilidad (Art. 20 Decisión 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 41 a 54 no es patentable de acuerdo con el artículo 20 de la Decisión 486, toda vez que se refieren a métodos de tratamiento de diferentes enfermedades mediadas por DLK, lo cual no es patentable a la luz de la normatividad vigente.

3. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 Decisión 486)

El uso de las reivindicaciones 28 a 38 y 40 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14, teniendo en cuenta que aunque en las reivindicaciones 28 a 38, en el preámbulo, se hace referencia a un compuesto, en todas ellas (incluyendo la reivindicación 40), se está caracterizando únicamente por el posible uso que se le daría a los compuestos, lo cual no es patentable a la luz de la normatividad vigente.

4. De la solicitud de patente



Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

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.

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0002839 el 27 de marzo de 2019, tituló la invención como: “INHIBIDORES DE CINASA DE CREMALLERA DE LEUCINA DUAL (DLK) PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES”. Este título no se relaciona con el objeto completo de la solicitud, contenido en la descripción y las reivindicaciones, por lo cual se sugiere el título siguiente: “COMPUESTOS DERIVADOS DE HETEROCICLO IMIDAZO PIRIDIN AMINAS, COMO INHIBIDORES DE CINASA DE CREMALLERA DE LEUCINA DUAL (DLK) Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS COMPRENDEN”.

4.2. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 1 no es concisa cuando se reclaman los siguientes términos: “*alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, halocicloalquilo, alcoxi, cicloalcoxi, haloalcoxi y halocicloalcoxi, heteroalquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, sulfonilalquilo, sulfonamidoalquilo, arilo, arilalquilo y heteroarilo*”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de distintas sustituciones que no tienen sustento en el capítulo descriptivo. Adicionalmente, se observa que los compuestos ejemplificados tienen la característica mencionada en la reivindicación 6, la cual menciona: “*en donde R³ se selecciona de entre biciclo[3.1.0]hexan-6-ilo y 3-azabiciclo[3.1.0]hexan-6-ilo, y se sustituye opcionalmente con uno o más grupos R⁷*”. Se sugiere: 1) mencionar la cantidad de átomos y heteroátomos que hacen parte de cada uno de ellos y en el caso de los heteroátomos indicar el tipo de los mismos; y 2) delimitar la invención de conformidad con los compuestos sustentados en el capítulo descriptivo.

La anterior objeción, por emplear algunos de los términos anteriormente señalados, aplica para las reivindicaciones 2, 8, 14, 15, 17, 22 y 23. Se sugiere delimitar correctamente la invención.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 29 de agosto de 2016, 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	US2012322795	“Biarylamine inhibitors of leukotriene production”	20 de diciembre de 2012
D2	US2005153905	“Novel ketolide derivatives”	14 de julio de 2005
D3	US2011065727	“Polysubstituted derivatives of 2-heteroaryl-6-phenylimidazo[1,2-a]pyridines, and preparation and therapeutic use thereof”	17 de marzo de 2011
D4	US2016002228	“3-Substituted pyrazoles and use as DLK	07 de enero de 2016

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

		inhibitors"	
--	--	-------------	--

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de biarilamidas, como inhibidores de la proteína activadora de cinco lipoxigenasas (FLAP), métodos de uso y composiciones farmacéuticas que los comprenden (resumen y pág. 1, párr. [0001]).

El documento D2² divulga compuestos cetólidos antimicrobianos que tienen la fórmula (A) y composiciones farmacéuticas que comprenden dichos compuestos, métodos para tratar infecciones bacterianas mediante la administración de dichos compuestos y procesos para la preparación de los mismos (resumen).

El documento D3³ divulga compuestos derivados de 2-heteroaril-6-fenilimidazo[1,2-a]piridinas polisustituidas, que presentan actividad en el tratamiento o prevención de enfermedades que involucran los receptores nucleares Nurr-1, también conocidos como NR4A2, NOT, TINUR, RNR-1 y HZF3 (resumen, pág. 1, párr. [0002]).

El documento D4⁴ divulga compuestos derivados de pirazol 3-sustituidos, como inhibidores de DLK y por tanto adecuados contra patologías neurodegenerativas (resumen).

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

6.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de la Fórmula estructural I:..” (Radicado N° NC2019/0002839 el 27 de marzo de 2019).

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

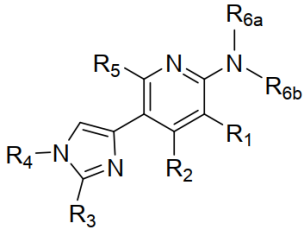
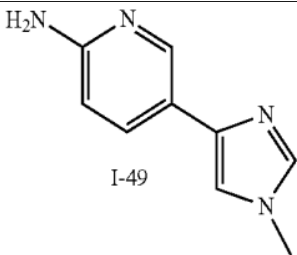
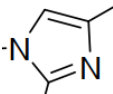
Características esenciales	D1
	 (pág. 74, compuesto I-49)
R ¹ , R ² y R ⁵ son H	H en la piridina
R ^{6a} y R ^{6b} son H	NH ₂ en la amina
Anillo : 	Anillo: 
R ³ es H	H en el anillo imidazol
R ⁴ es alquilo	CH ₃ en el anillo imidazol

Tabla 2. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

¹<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/045478495/publication/US2012322795A1?q=pn%3DUS2012322795>

²https://lp.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2005153905A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20050714&DB=EPODOC&locale=es_LP

³https://lp.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2011065727A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20110317&DB=EPODOC&locale=es_LP

⁴<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/050031308/publication/US2016002228A1?q=pn%3DUS2016002228>

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

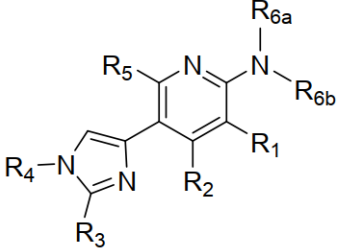
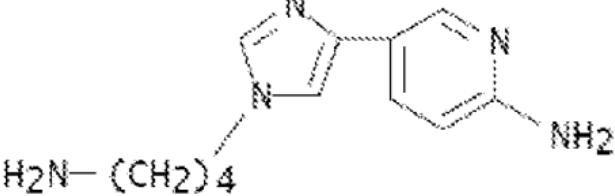
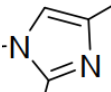
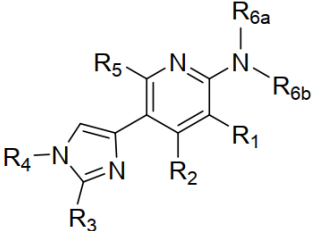
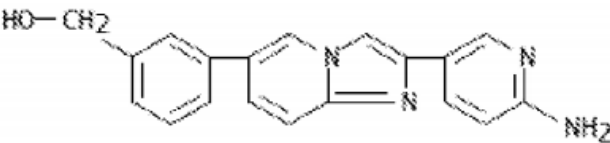
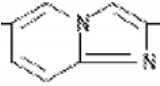
Características esenciales	D2
	 5-[1-(4-aminobutyl)-1H-imidazol-4-yl]-2-piridinamina (pág. 30, párr. [0509])
R ¹ , R ² y R ⁵ son H	H en la piridina
R ^{6a} y R ^{6b} son H	NH ₂ sustituyendo la piridina
Anillo : 	Anillo: 
R ³ es H	H en el anillo imidazol
R ⁴ es alquilo sustituido con R ⁷ ; donde R ⁷ es amino	H ₂ N-(CH ₂) ₄

Tabla 3. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

Características esenciales	D3
	 (pág. 21, comp. 17)
R ¹ , R ² y R ⁵ son H	H en la piridina
R ^{6a} y R ^{6b} son H	NH ₂ sustituyendo la piridina
R ³ y R ⁴ en conjunto, en combinación con los átomos intermedios, forman un anillo que contiene átomos seleccionados de entre C, opcionalmente sustituido con R ⁷	
R ⁷ es arilo sustituido con R ⁸	fenilo
R ⁸ es hidroxialquilo	-CH ₂ -OH

De acuerdo con las tablas anteriores, las características técnicas esenciales de los compuestos de fórmula estructural I, de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en los documentos D1, D2 y D3, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

Dadas las características técnicas esenciales reclamadas en las reivindicaciones 2, 4, 5, se considera que también están anticipadas a partir de los documentos D1 y D2.

Es decir que las reivindicaciones 1, 2, 4 y 5, no cumplen el requisito de novedad.

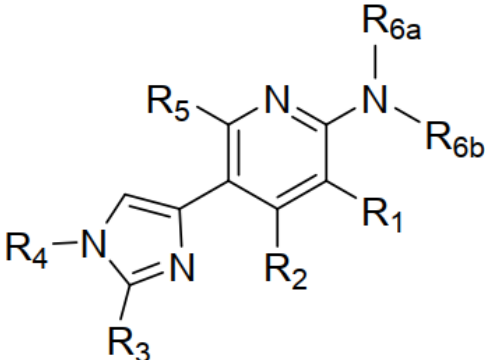
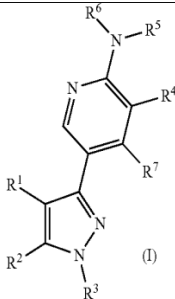
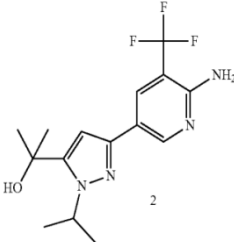
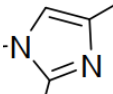
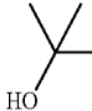
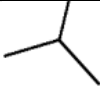
6.2. Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 3 reclama “El compuesto de conformidad con la reivindicación 2, en donde R₁ es trifluorometilo” ver definiciones en el pliego reivindicatorio (Radicado No. NC2019/0002839 el 27 de marzo de 2019)

Tabla 4. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

Características esenciales	D4
	 (reivindicación 1)  (Compuesto No. 2)
R ¹ es haloalquilo	R ⁴ es CF ₃
R ² es H	R ⁷ es H
R ⁵ es H	H
R ^{6a} y R ^{6b} son H	R ⁵ y R ⁶ son H
Anillo : 	No menciona
R ³ es alquilo sustituido con R ⁷ ; donde R ⁷ es hidroxilo	
R ⁴ es alquilo	

El documento D4 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 3, porque divulga compuestos derivados de pirazol 3-sustituídos, como inhibidores de DLK y por tanto adecuados contra patologías neurodegenerativas (resumen).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 3 y lo revelado en el documento D4, consiste en que los compuestos de la presente invención contienen un anillo imidazol en su núcleo central, mientras que los compuestos del documento D4 en la misma posición contienen un anillo pirazol.

No obstante, no hay efecto técnico asociado a esta diferencia, ya que después de revisar el capítulo descriptivo de la presente invención, analizar los ensayos allí presentados y compararlos con los que se encuentran en el documento D4, no se evidencia alguna ventaja técnica superior o sorprendente con la modificación de la posición del heteroátomo de nitrógeno en el anillo de imidazol, porque cuando se comparan los datos Kd de DLK y el Ensayo celular Phospho-cJun, de las tablas 3 y 4 del capítulo descriptivo, no se puede establecer cuál es la mejoría técnica, superior o sorprendente, frente a los datos de Ki (DLK) que se observan en la tabla 2 del documento D4.

Oficio N° **3266** de **10 de marzo de 2021**

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar compuestos inhibidores de DLK revelados en el documento D4, para proveer derivados de imidazo-piridinas alternativos a los conocidos en el estado del arte?

Sin embargo, el documento D4 ya realizaba sugerencias en el tipo de anillos heteroarilos que contienen dos átomos de nitrógeno en el mismo anillo, como parte de la estructura principal. Cabe recordar, que los compuestos del documento D4 también son inhibidores de DLK y por tanto adecuados contra patologías neurodegenerativas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los compuestos del documento D4, y con sus conocimientos generales en química orgánica, habría podido modificar los sustituyentes de los compuestos conocidos, y así llegar al objeto de la reivindicación 3 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 6 a 27 y 39 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

7. 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	US2012322795	1, 2, 4 y 5	Novedad
D2	US2005153905	1, 2, 4 y 5	Novedad
D3	US2011065727	1	Novedad
D4	US2016002228	3, 6 a 27 y 39	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.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0002839		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2017/048941		28 de agosto de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
29 de agosto de 2016				X					
Solicitante									
THE UNIVERSITY OF TEXAS SYSTEM BOARD OF REGENTS									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	28 a 38 y 40	Art. 15	-	Art. 20	41 a 54	Art. 25 (Falta de unidad de invención)			-

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 27 y 39
Palabras clave utilizadas	SUBSTITUTED IMIDAZOLE; SUBSTITUTED AMINOPYRIDINES; INHIBITION OF THE KINASE ACTIVITY OF DUAL LEUCINE ZIPPER; NEUROLOGICAL DISEASES; CENTRAL NERVOUS SYSTEM; PERIPHERAL NERVOUS SYSTEM NEURONS; NEURODEGENERATIVE CONDITIONS; DUAL LEUCINE ZIPPER KINASE (DLK); MIXED LINEAGE KINASE (MLK); ACTIVATION OF C-JUN N-TERMINAL KINASES (JNK); NEURODEGENERATION.
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A61K 31/44, A61K 31/4178, C07D 401/04
	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(?)
SIPI	NC20190006785	26/06/2019	N/A	N/A	A,P
EPO	US2012322795	20/12/2012	1, 2, 4 y 5	(resumen y pág. 1, párr. [0001]).	X
	US2009203705	13/08/2009	N/A	N/A	A
	US2015080367	19/03/2015	N/A	N/A	A
	US2016052940	25/02/2016	N/A	N/A	A
	US2016002228	01/01/2016	3, 6 a 27 y 39	(resumen, tabla 2, reivindicación 1 y compuesto No. 2)	X
USPTO	US2005153905	14/07/2005	1, 2, 4 y 5	(resumen)	X
	US2011065727	17/03/2011	1	(resumen, pág. 1, párr. [0002]).	X
PATBASE	US7163924	13/Agosto/2009	N/A	N/A	A
	US2005009764	13/Enero/2005	N/A	N/A	A
ORBIT	US2015080367	19/03/2015	N/A	N/A	A
(1) Cita completa literatura no patente					

Oficio N° 3266 de 10 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0002839

(LNP)	
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.</i>	
O	
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.</i>	
(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: (10/08/2020)	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZÁLEZ	