

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

Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

Señores
FAES FARMA, S.A.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “PROCEDIMIENTO Y PRODUCTOS INTERMEDIOS PARA LA PREPARACIÓN DE BILASTINA”

NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2019/069772

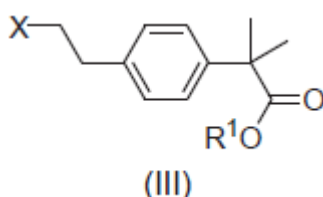
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 23 de julio de 2019.

PRIORIDAD: 24/07/2018, EP (EUROP PATENT ORGANIZATION(EPO)), 18382556.1

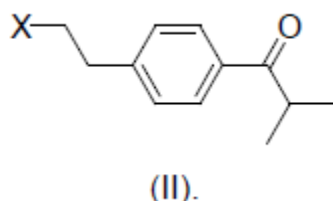
Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en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

1. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de proporcionar un nuevo procedimiento para la preparación de la fórmula (III) y productos intermedios de la misma.



Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (III). Que comprende la transposición oxidativa de un compuesto de fórmula (II) o un solvato de este. El compuesto de fórmula (II) es empleado como producto intermedio en la preparación de la bilastina.



2. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 28 de enero de 2021.

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones

Teniendo en cuenta lo establecido en el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina:

Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. (...) "

Esta oficina informa que, la reivindicación 8 no es concisa porque las definiciones de "ácido prótico", "ácido de Lewis" comprenden un número muy extenso de alternativas, lo que impide establecer claramente el alcance de la protección. Se sugiere agrupar dichas alternativas teniendo en cuenta que exista una razonable generalización y que cada una de dichas alternativas tenga soporte en la descripción.

Las siguientes siglas no se encuentran definidas en el capítulo descriptivo: OMs, OTs y OTf. (Reiv. 3), PhI(OAc)₂, PhI(OCOCF₃)₂, PhI(OTf)₂, PhI(OH)OTs, PhIO, NIS, IBX o DMP (Reiv. 5). Por lo que se sugieren definir.

En consecuencia, es necesario que allegue las aclaraciones o modificaciones correspondientes para dar cumplimiento a lo establecido en el citado artículo.

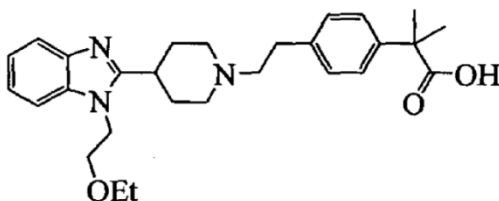
4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 24 de julio de 2018, 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:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2014188453	"NOVEL PROCESS FOR THE PREPARATION OF 2-[4-(2-[4-[1-(2-ETHOXY ETHYL)-1H-BENZIMIDAZOL-2-YL]-1-PIPERIDINYL}ETHYL) PHENYL]-2-METHYLPROPANOIC ACID"	27 de noviembre de 2014

D1¹ divulga un nuevo proceso para la preparación de 2-[4-(2-[4-[1-(2-etoxietil)-1H-benzimidazol-2-il]-1-piperidinil}etil)fenil]-2- ácido metilpropanoico representado por la siguiente fórmula estructural: 1 (Resumen).



Formula-1

5. Examen de Patentabilidad

De acuerdo con lo establecido en el artículo 14 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, en el cual se establecen los requisitos de patentabilidad objeto de la solicitud en estudio, esta Oficina presenta a continuación el análisis de los requisitos de patentabilidad.

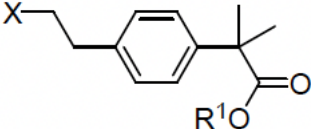
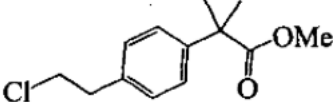
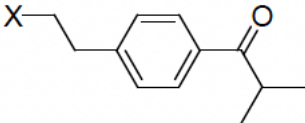
5.1. Nivel Inventivo

¹<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/051934282/publication/WO2014188453A2?q=WO2014188453A2>

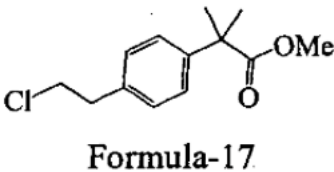
Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

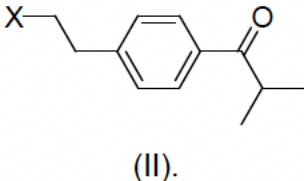
Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 1 (NC2021/0000940 del 28 de enero de 2021) refiere a: “Procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (III), que comprende (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Procedimiento para preparar un compuesto de fórmula (III), que comprende  (III) O un solvato del mismo, en la que Oxígeno	Procedimiento para preparar un compuesto de fórmula  Formula-17 Rev. 16
X es un grupo saliente; y	Oxígeno (Rev. 16) X es Cl (Rev.16)
R ¹ es alquilo C ₁ -C ₆ ;	Metil (Rev. 16)
la transposición oxidativa de un compuesto de fórmula (II) o un solvato del mismo  (II).	---
X es un grupo saliente	---

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga un procedimiento para preparar un compuesto de fórmula 17 (Rev. 16)



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el procedimiento divulgado en D1, consiste en incluir la etapa de ltransposición oxidativa de un compuesto de fórmula II.

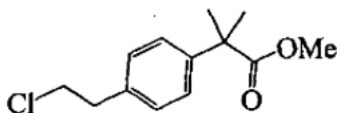


No hay evidencia de que el incluir específicamente la transposición oxidativa de un compuesto de fórmula II proporcione un procedimiento con algún efecto técnico diferente

Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

al que ya proporcionaba el objeto de D1, puesto que obtener un compuesto de fórmula 17 ya había sido previsto en dicho documento (Rev. 16).



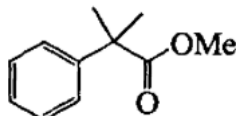
Formula-17

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el procedimiento conocido en D1 con el fin de proporcionar otro método alternativo?

Sin embargo, la transposición oxidativa es conocida para la síntesis de 2-arilalcanoatos² y podría haber sido prevista por un experto para encontrar una alternativa.

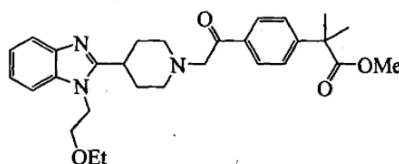
En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir como método alternativo la transposición oxidativa, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Adicionalmente, D1 menciona la reacción de acilación del compuesto de fórmula 2 por medio de cloruro de cloroacetil en presencia de un ácido de Lewis (Pág. 11, Ln. 10-20).



Formula-2

D1 se refiere a la formación del compuesto de fórmula 12 (Pág. 11, Ln. 20-25)



Formula-12

También es importante mencionar que, ajustar las condiciones de la transposición oxidativa para la síntesis de 2-arilalcanoatos², donde se emplea Poli[4-(diacetoxi)yodo]estireno como agente oxidante y ácido sulfúrico como catalizador ácido corresponde a una modificación rutinaria que realiza sin mucho esfuerzo la persona del oficio versada en la materia.

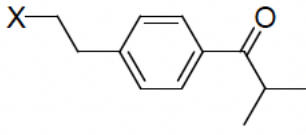
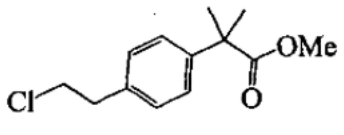
Las reivindicaciones dependientes 2 a 14 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al procedimiento de la reivindicación 1, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 15 (NC2021/0000940 del 28 de enero de 2021) refiere a: “Compuesto de fórmula II(...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

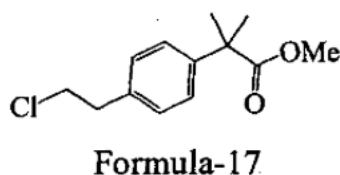
²Shou-Ri. et al., A facile conversion of aryl alkyl ketones into methyl e-arylalcanoates using poly [4-diacetoxiyo] styrene]. *Journal of Chemical Research*, 6, 2004, 392-393, DOI: 10.3184/03082340414223709

Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

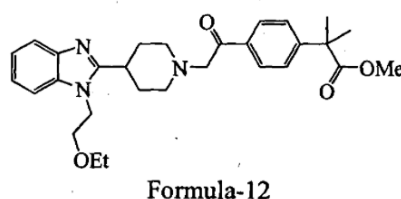
CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Compuesto de fórmula (II')  (II') O un solvato del mismo, X se selecciona de Cl, I, OMS, OTs, OTf	Compuesto de formula 17  Formula-17 (Rev. 16) Cl (Rev. 16)

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 15, ya que divulga un compuesto de fórmula 17 (Rev. 16)



La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 15 y el compuesto divulgado en D1, consiste en cambiar la ubicación del grupo carbonilo.

No hay evidencia de que cambiar la ubicación del grupo carbonilo proporcione un compuesto con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el objeto de D1, puesto que obtener un compuesto de fórmula 12 ya había sido previsto en dicho documento (Pág. 11, Ln. 20-25)



Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar la ubicación del grupo carbonilo en el compuesto conocido en D1 con el fin de proporcionar un compuesto alternativo?

Sin embargo, realizar el cambio de ubicación del grupo carbonilo en compuestos derivados de 2-arilalcanoatos ya es conocido en el estado del arte³ y podría haber sido un cambio previsto por un experto para encontrar una ruta de síntesis alternativa.

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir como compuesto alternativo el cambio de ubicación del grupo carbonilo, para así llegar al objeto de la reivindicación 15. Por lo que se considera obvia.

6. Conclusión

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

³Shou-Ri. et al., A facile conversion of aryl alkyl ketones into methyl e-arylalkanoates using poly [4-diacetoxyiodo] styrene], Journal of Chemical Research, 6, 2004, 392-393, DOI: 10.3184/03082340414223709

Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2014188453	1 a 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 el 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 de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

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° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2021/0000940		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2019/069772		23 de julio de 2019							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
24/07/2018				X					
Solicitante									
FAES FARMA, S.A.									
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 15
Palabras clave utilizadas	oxidative rearrangement, acylation, Bilastine, C12H15ClO, 1-[4-(2-Chloroethyl)phenyl]-2-methylpropan-1-one
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 401/04, C07C 45/46, C07C 49/233, C07C 57/58, C07C 51/09, C07C 67/00
	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⁾
SIPI	-	-	-	-	-
STNext	WO2022256708	08/12/2022	-	-	A
	Liwei S.	06/03/2023	-	-	A
ISA	WO2019102155	20/08/2009	-	-	A
	CN104151160	19/11/2014	-	-	A
	CN102675101	29/01/2014	-	-	A
	WO2014188453	27/11/2014	1 a 15	Revindicaciones Pág. 11	Y
WIPO	EP0028375	07/12/2009	-	-	A
	WO2022120132	09/06/2022	-	-	A
	US20110294668	01/12/2011	-	-	A
EPO	WO2009102155	20/08/2009	-	-	A
	CN103159674	19/06/2013	-	-	A
	JPS52108943	12/09/1977	-	-	A
	CN101952273	19/01/2011	-	-	A
	CN104151160	19/11/2014	-	-	A
Patbase	IN201841035847	27/03/2020	-	-	A
	IN201941045155	07/05/2021	-	-	A
	IN201641038857	18/05/2018	-	-	A
	CN112110893	22/12/2020	-	-	A



Oficio N° 18718 de 14 de noviembre de 2023

Ref. Expediente N° NC2021/0000940

Orbit	US5169853	09/09/1991	-	-	A
	US11370742	24/07/2018	-	-	A
	GB1423576	16/03/1973	-	-	A
	IN201841035847	24/09/2018	-	-	A
	EP0417669	03/09/1990	-	-	A
	WO2022/214921	10/04/2021	-	-	A
Google patent	Collier, S.	30/03/2011	-	-	A
	Shou-Ri, S.	24/01/2016	-	-	A
Collier, S. J., Wu, X., Poh, Z., Rajkumar, G. A., & Yet, L. (2011). Alternative Synthesis of Bilastine. Http://Dx.Doi.Org/10.1080/00397911.2010.486506 , 41(9), 1394–1402. https://doi.org/10.1080/00397911.2010.486506					
Shou-Ri, S., Ming-Hua, Z., Xiai-Ling, L., & Qiu-Yan, L. (2004). a-facile-conversion-of-aryl-alkyl-ketones-into-methyl-2-arylalkanoates-using-poly-4-diacetoxiyodo. Journal of Chemical Research, 2, 392–393.					
Sun, L., Lu, Z., Zhang, P., Wei, H., & Yu, Y. (2023). Photochemically driven one-step triple dynamic network formation in printable tough hydrogel for self-healing tubular sensors. Polymer Chemistry, 14(13), 1536–1542. https://doi.org/10.1039/D3PY00093A					
(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: (07/11/2023)					

