

182
157

Superintendencia de Industria y Comercio
Radicacion : 00067158 00000002 Folios: 2
Fecha (AMB): 2003-01-30 09:32:10
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señores
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Bogotá, D.C.

Re.: Código 02-01-538
Expediente No. 00-67.158
Solicitud de Patente
SMITHKLINE BEECHAM
CORPORATION

En relación con el Expediente de la referencia por medio del presente escrito muy respetuosamente me permito solicitarles se sirvan proceder a efectuar el **EXAMEN DE PATENTABILIDAD** de la solicitud aquí contenida.

Para tal efecto acompaño el comprobante de pago por concepto de \$ 335.000.00, recibo No. 03-6002

De Ustedes Atentamente,

GERMAN CASTILLO GRAU
I.P. # 2.978 del C.S.J.

183 158

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO	
Radicacion : 00067150 00000002	Folios: 2
Fecha (AMD): 2003-01-30 09:32:10	10
Tramite : 002 PATENTES D	1 REGISTRO/ 538 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	A

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 6,002
FECHA : ENERO 30 DE 2003

***** CONSIGNACION *****

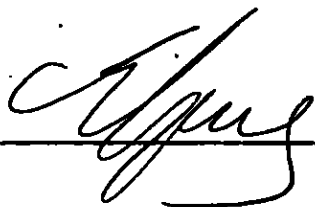
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CASTILLO GRAU Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	8771306	30/01/2003	1,965,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	335,000.00
		TOTAL :	335,000.00

SON: TRESCIENTOS TREINTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :



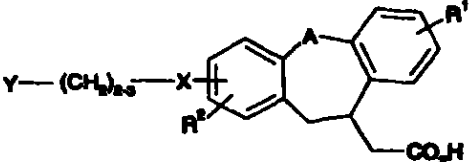
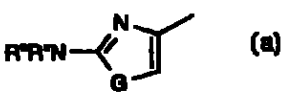
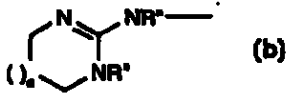
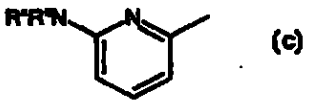
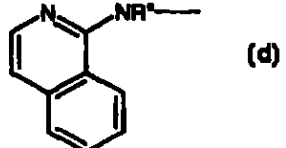
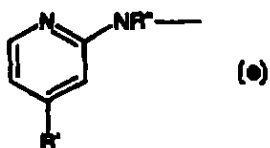
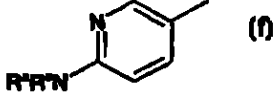
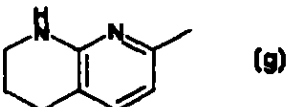
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador 382 0840
Fax 350 5220
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

PCT

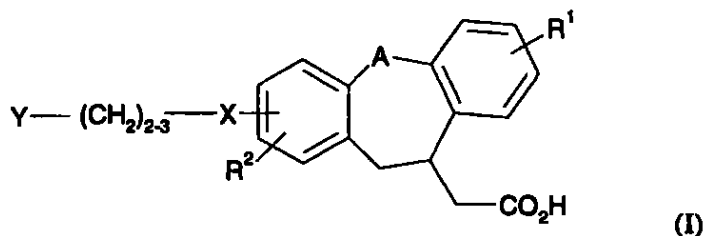
WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 239/02, 217/12, 411/00, 211/80, 277/18, A61K 31/505, 31/47, 31/44, 31/425	A1	(11) International Publication Number: WO 99/15508 (43) International Publication Date: 1 April 1999 (01.04.99)
(21) International Application Number: PCT/US98/19466 (22) International Filing Date: 18 September 1998 (18.09.98) (30) Priority Data: 60/059,342 19 September 1997 (19.09.97) US 60/063,438 29 October 1997 (29.10.97) US (71) Applicant (for all designated States except US): SMITHKLINE BEECHAM CORPORATION [US/US]; One Franklin Plaza, Philadelphia, PA 19103 (US). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): BONDINELL, William, E. [US/US]; 1512 Franklin Lane, Wayne, PA 19087 (US). MILLER, William, H. [US/US]; 333 Fell Lane, Schwenksville, PA 19473 (US). HEERDING, Dirk [NL/US]; 1 Mill Creek Lane, Malvern, PA 19355 (US). SAMANEN, James, Martin [US/US]; 145 Jug Hollow Road, Phoenixville, PA 19460 (US). (74) Agents: MCCARTHY, Mary, E. et al.; SmithKline Beecham Corporation, Corporate Intellectual Property, UW2220, 709 Swedeland Road, P.O. Box 1539, King of Prussia, PA 19406-0939 (US).		(81) Designated States: AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, ID, IL, IS, JP, KP, KR, LC, LK, LR, LT, LV, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, SL, TR, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With international search report.
(54) Title: VITRONECTIN RECEPTOR ANTAGONISTS		
 (I)  (a)  (b)  (c)  (d)  (e)  (f)  (g)		
(57) Abstract Compounds of formula (I) are disclosed which are vitronectin receptor antagonists and are useful in the treatment of osteoporosis wherein: A is CH₂ or O; R¹ is H, halo or C₁₋₆alkyl; R² is H, C₁₋₆alkyl or CH₂NR''R'''; X is O or CH₂; Y is (a), (b), (c), (d), (e), (f) or (g); G is NR'', S or O; R' is H, C₁₋₆alkyl, OC₁₋₆alkyl, SC₁₋₆alkyl, NR''R'' or halo; each R'' independently is H or C₁₋₆alkyl; and s is 0, 1 or 2; or a pharmaceutically acceptable salt thereof.		

What is claimed is:

1. A compound according to formula (I):



wherein:

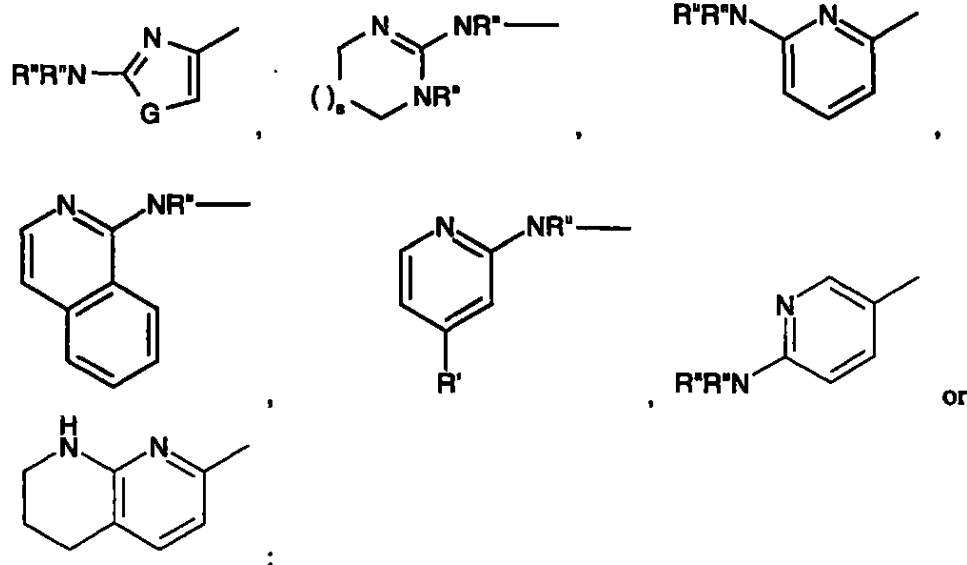
A is CH₂ or O;

R¹ is H, halo or C₁₋₆alkyl;

R² is H, C₁₋₆alkyl or CH₂NR''R''';

X is O or CH₂;

Y is



G is NR'', S or O;

R' is H, C₁₋₆alkyl, OC₁₋₆alkyl, SC₁₋₆alkyl, NR''R'' or halo;

each R'' independently is H or C₁₋₆alkyl; and

s is 0, 1 or 2;

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

2. A compound according to claim 1 in which Y is

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor
GERMÁN CASTILLO GRAU
(Apoderado)

ASUNTO	Radicación	00067158
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	10297
	Folios	007

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados:

Los textos estudiados fueron la descripción (Folios: 5 a 75) y las reivindicaciones 1 a 26 (Folios: 76 a 80).

La presente solicitud reivindica prioridad americana N° US60.152780 de 07 de septiembre de 1999 y cumple con lo establecido en los artículos 9, 10 y 11 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Objeto de invención:

La presente solicitud se titula: "Antagonistas de los receptores de vitronectina".

El objeto de la presente solicitud se refiere a compuestos farmacéuticamente activos que inhiben el receptor de vitronectina y son útiles para el tratamiento de inflamación, cáncer y trastornos cardiovasculares, tales como aterosclerosis y restenosis, y de enfermedades uno de cuyos factores es la resorción ósea tales como osteoporosis.

Según la descripción, las integrinas son una superfamilia de receptores de adhesión celular, que son glicoproteínas transmembranales expresadas sobre una gama de células. Estos receptores de adhesión de superficie celular incluyen gpIIb/IIIa (el receptor de fibrinógeno) y el receptor de vitronectina. El receptor de fibrinógeno gpIIb/IIIa se expresa sobre la superficie de las plaquetas, y media en la agregación plaquetaria y en la formación de un coágulo hemostático en el sitio de una herida sangrante. El receptor de vitronectina se expresa sobre cierto número de células, entre ellas las células endoteliales, de los músculos lisos, osteoclastos y tumorales. Ahora se sabe que el receptor de vitronectina alude a tres integrinas diferentes designadas α v β 1, α v β 3, α v β 5.

De acuerdo con la presente solicitud ahora se ha descubierto que ciertos compuestos son potentes inhibidores de los receptores α v β 3 y α v β 5. Se ha descubierto que tales compuestos son inhibidores más potentes del receptor de

vitronectina que del receptor de fibrinógeno.

Lo que se reivindica como novedoso es lo siguiente: derivados del ácido (metilamino)piridin-2-il-butanoico de fórmula I (ver folio: 76).

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A61K 31/435, 31/295.

Claridad de la solicitud:

El artículo 28 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece "La descripción deberá divulgar la invención de manera suficientemente clara y completa para su comprensión y para que una persona capacitada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla."

De acuerdo con lo anterior, el título debe mencionar el grupo principal del compuesto químico característico de la presente solicitud, y no debe hacerse alusión a su actividad terapéutica.

El artículo 30 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: "Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción."

Las reivindicaciones podrán ser independientes o dependientes. Una reivindicación será independiente cuando defina la materia que se desea proteger sin referencia a otra reivindicación anterior. Una reivindicación será dependiente cuando defina la materia que se desea proteger refiriéndose a una reivindicación anterior. Una reivindicación que se refiera a dos o más reivindicaciones anteriores se considerará una reivindicación dependiente múltiple."

De acuerdo con lo anterior, en la reivindicación 1 (folio: 76) deben especificarse los grupos Het y Ar, porque tal como están son muy generales y son términos subjetivos.

En la reivindicación 5 (folios: 77 y 78) se encuentra una inconsistencia respecto a los ejemplos, es decir, aparece un grupo "3-metiltiazol" y en los ejemplos: "5-metiltiazol", grupo que forma parte de un mismo compuesto químico.

Las reivindicaciones 7 y 9 (folio: 78) mencionan respectivamente: "agente antineoplásico" e "inhibidor de resorción ósea" sin especificarse a cuál se están refiriendo tales reivindicaciones, es decir, debe mencionarse el compuesto químico que está formando parte de la composición a la cual se refieren dichas reivindicaciones.

La reivindicación 8 (folio: 78) depende de la reivindicación 6, mencionando un agente antineoplásico, pero en dicha reivindicación 6 no se nombra tal agente.

Excepciones de Patentabilidad:

El artículo 20 de la Decisión 486 se establece: "No serán patentables: a) las invenciones cuya explotación comercial en el territorio del País Miembro respectivo deba impedirse necesariamente para proteger el orden público o la moral. A estos efectos la explotación comercial de una invención no se considerará contraria al orden público o a la moral solo debido a la existencia de una disposición legal o administrativa que prohíba o que regule dicha explotación; b) las invenciones cuya explotación comercial en el País Miembro respectivo deba impedirse necesariamente para proteger la salud o la vida de las personas o de los animales, o para preservar los vegetales o el medio ambiente. A estos efectos la explotación comercial de una invención no se considerará contraria a la salud o la vida de las personas, de los animales, o para la preservación de los vegetales o del medio ambiente sólo por razón de existir una disposición legal o administrativa que prohíba o que regule dicha explotación; c) las plantas, los animales y los procedimientos esencialmente biológicos para la producción de plantas o animales que no sean procedimientos no biológicos o microbiológicos; d) los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los

seres humanos o a animales."

De acuerdo con lo anterior, la(s) reivindicación(es): 10 a 17 (Folios: 78 y 79), que se refiere(n) a un método de tratamiento de una enfermedad en la que está indicado el antagonismo del receptor alfavbeta3, no es (son) patentable(s).

Reivindicaciones de uso:

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

De acuerdo con lo anterior, la(s) reivindicación (es) 19 a 26 (Folio: 80), que se refiere(n) a uso de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, no se encuentra(n) dentro del campo de la patentabilidad nombrado en el artículo 14.

Determinación del estado de la técnica:

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de Patente o, en su caso, de la prioridad reconocida.

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40".

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 07/09/1999, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Se hizo la búsqueda de documentos relevantes en el estado de la técnica, entendiendo como estado de la técnica la definición provista en el artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y las excepciones fijadas en el artículo 17 de la misma.

Se encontró como anterioridades (documentos cuya fecha de publicación es anterior a la fecha de presentación de la primera solicitud de patente sobre la cual se reivindica prioridad o de la fecha de presentación de esta solicitud) que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
1	WO 99/15508	Vitronectin receptor antagonists	1 de abril de 1999

Evaluación de los requisitos de Patentabilidad:

El Artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina el cual establece: "Los Países Miembros otorgarán Patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento en todos los campos de la tecnología siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Evaluación de Nivel Inventivo:

El artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

El Nivel Inventivo se evaluó por comparación entre lo solicitado y encontrado en el estado de la técnica y que se relaciona con el objeto reivindicado y de acuerdo con la definición de nivel inventivo del Artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

La Solicitud de Patente Colombiana No. 00067158, se refiere a:

Un compuesto según la fórmula I (ver folio: 76) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

La anterioridad: WO 99/15508, se relaciona con: compuestos antagonistas del receptor de vitronectina de fórmula estructural muy semejante a la de los compuestos de la presente solicitud; la diferencia se encuentra en un grupo -CH2- que tienen los compuestos de la actual solicitud de patente y que no tienen los compuestos de la anterioridad citada. Aunque está dicha diferencia estructural, no hay un cambio en la actividad terapéutica, por lo cual no se puede apreciar un salto tecnológico importante con los compuestos de la presente solicitud.

La respuesta al problema técnico que se pretendía resolver, resulta obvia partiendo de la anterioridad WO 99/15508.

Como se observa, el objeto de esta solicitud podría resultar obvio para una persona del oficio normalmente versada en la materia y derivarse de manera evidente del estado de la técnica.

Evaluación de la Aplicación Industrial:

El artículo 19 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que "Se considerará que una invención es susceptible de aplicación industrial, cuando su objeto pueda ser producido o utilizado en cualquier tipo de industria, entendiéndose por industria la referida a cualquier actividad productiva, incluidos los servicios".

El objeto de la presente solicitud cumple con el requisito de Aplicación Industrial.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	WO 99/15508	1 a 9, 18	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de la 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.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 03 NOV 2005

CONCEPTO TÉCNICO Nº: 1681	EXAMINADOR TÉCNICO Código N°: 202005	EXAMINADOR JURÍDICO Código N°:
-------------------------------------	--	--