

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 05 de febrero de 2010, con el N° 10-012804-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Sanofi-Aventis, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE INDOL-2-ONA DISUSTITUIDOS EN 3, SU PREPARACIÓN Y SU APLICACIÓN TERAPÉUTICA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/FR2008/001190 del 14 de agosto de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 625 del 21 de febrero de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 9667, notificado por fijación en lista el 04 de junio de 2013, se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 10-012804-00011-0000 del 09 de octubre de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 14 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: DERIVADOS DE INDOL-2-ONA DISUSTITUIDOS EN LA POSICIÓN 3 POR PIPERIDIN O PIPERAZIN METIL CARBONIL AMINO COMO ANTAGONISTAS DE GRELINA ANTIDIABÉTICOS.

SEXTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina "*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.*"

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 14, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en proveer antagonistas de grelina, que podrían regular la sensación de hambre y el equilibrio entre insulina, para

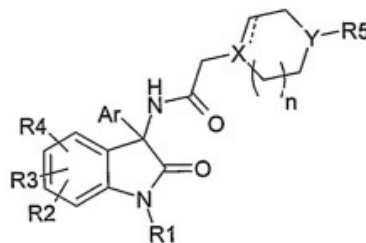
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

controlar la hiperfagia diabética, así como agentes anoréxicos y/o antiobesidad en el tratamiento de la diabetes y sus efectos. Para resolver este problema técnico se proporcionan compuestos de fórmula (I).



7.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 16 de agosto de 2007, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D2	US2004/0180878*	"Phenylsulfonyl-1,3-dihydro-2h-indole-2-one derivatives, their preparation and their therapeutic use"	16/Septiembre/2004
D3	US 5,594,023	"Dihydroindol-one Derivatives Substituted in the 3-Position by a Nitrogen-Containing Group, Their Preparation and the Pharmaceutical Compositions in Which They are Present"	14/Enero/1997

*Equivalente en idioma ingles al documento WO 03/008407.

El documento D2¹ divulga un compuesto de fórmula (I) que tiene afinidad por los receptores arginina-vasopresina y/o oxitocina, útil para el tratamiento de la diabetes y obesidad (Resumen; Pág. 59, Párr. 682).

El documento D3² divulga un compuesto de la fórmula (I) que tiene afinidad por los receptores de vasopresina y/o oxitocina útil para el tratamiento de la diabetes (Col. 1, Líneas 14 y 15; Col. 26, Línea 43; Col. 156 – 160, Reivindicación 1).

7.3. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: *"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"*.

¹URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2004180878A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040916&DB=EPODOC&locale=en_EP)

[CC=US&NR=2004180878A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040916&DB=EPODOC&locale=en_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2004180878A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040916&DB=EPODOC&locale=en_EP)

²[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2011287000A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20111124&DB=EPODOC&locale=en_EP)

[CC=US&NR=2011287000A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20111124&DB=EPODOC&locale=en_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2011287000A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20111124&DB=EPODOC&locale=en_EP)

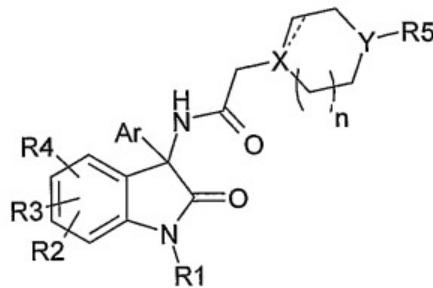
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

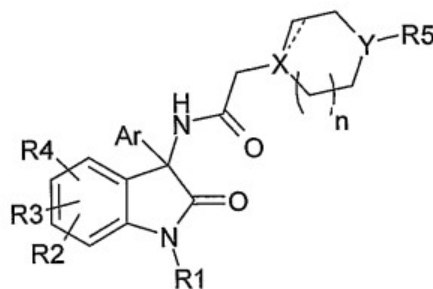
En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “*Un compuesto de fórmula (I)*”



(I)

...” (Pág. 8 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

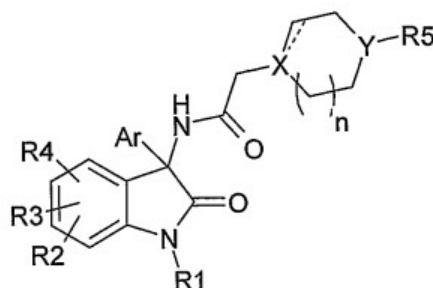
Por su parte, la reivindicación 2 se refiere a: “*Un compuesto de fórmula (I)*”



(I)

...” (Págs. 8 y 9 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

Por otra parte, la reivindicación 3 se refiere a: “*Un compuesto de fórmula (I)*”



(I)

...” (Págs. 9 y 10 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones independientes 1, 2 y 3 y las reveladas en el (los) documento(s) D2 y D3 que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

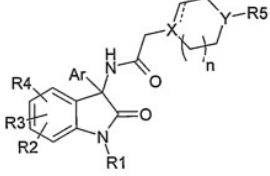
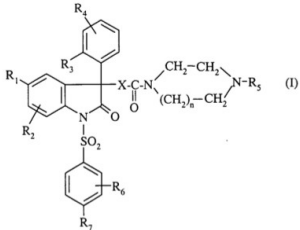
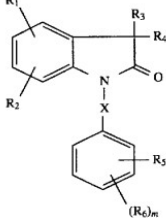
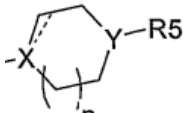
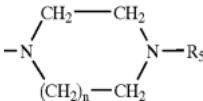
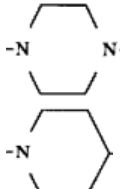
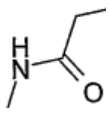
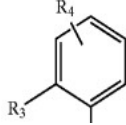
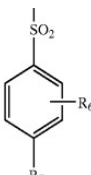
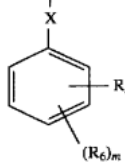
RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

representa(n) el estado de la técnica cercano:

Tabla 1

Características esenciales	D2	D3
Un compuesto de la fórmula 	Compuesto de la fórmula 	Un compuesto de fórmula 
 ----- : una unión sencilla o doble X: -N<, -CH< Ó  Y: N o CH Al menos uno de X, Y es N n: 1 ó 2	 (Pág. 60, reivindicación 1)	 (Col. 119, Tabla 3, Ej. 186; Col. 121, Tabla 3, Ej. 190)
R5 es alquilC₁₋₆, alqueniloC₂₋₆	No se menciona	-CH₃ (Col. 119, Tabla 3, Ej. 186)
	 X: -NH- (Pág. 60, reivindicación 1)	-NH-CO-CH₂ (Col. 119, Tabla 3, Ej. 186)
Ar: un grupo arilC₆₋₁₀ o heteroarilC₂₋₁₂ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes, seleccionados entre fluor, cloro, átomos de bromo y alquilC₁₋₆, perfluoro alquilC₁₋₃, alcoxi C₁₋₆, perfluoro alcoxiC₁₋₆ y grupos fenilo	 R3: halógeno, alquilC₁₋₃, alcoxiC₁₋₃, trifluorometil, trifluorometoxi R4: H, halógeno, alquilC₁₋₃, alcoxiC₁₋₃, trifluorometil, trifluorometoxi (Pág. 60, reivindicación 1)	R3: Fenil sustituido o no sustituido (Col. 157, Reivindicación 1)
R1: H, alquil (C1-6),-C (= O) (C1-6) alquil,-C (= O)-fenilo	 (Pág. 60, reivindicación 1)	 X: SO₂, CH₂ (Col. 160, Reivindicación 1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

Características esenciales	D2	D3
R2, R3, R4: H, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilC ₁₋₆ , perfluoro alquilC ₁₋₃ , alcoxi C ₁₋₆ , aril C ₁₋₆ . Al menos uno de R2, R3, R4 es diferente de H.	R1: halogeno, aquilC ₁₋₄ , alcoxiC ₁₋₄ R2: H, halogeno, aquilC ₁₋₄ , alcoxiC ₁₋₄ , trifluorometilo R1 es diferente de H (Pág. 60, reivindicación 1)	R1, R2: H, halógeno, alquilC ₁₋₇ , alcoxiC ₁₋₇ , trifluorometil (Col. 157, Reivindicación 1)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones independientes 1, 2 y 3 porque revela un compuesto de fórmula (I) que tiene afinidad por los receptores arginina-vasopresina y/o oxitocina, útil para el tratamiento de la diabetes y obesidad, que coincide con la fórmula (I) de la solicitud cuando X y Y son N; n es 1 ó 2; ~~---~~ un enlace simple; Ar es fenilo sustituido; y R2, R3, R4 son H, halógeno, aquilC₁₋₄, alcoxiC₁₋₄ o trifluorometilo (Pág. 60, reivindicación 1).

Por su parte, el documento D3 da a conocer un compuesto que tiene afinidad por los receptores de vasopresina y/o oxitocina, útil para el tratamiento de la diabetes que coincide con el compuesto de fórmula (I) de la solicitud cuando X es -N<; Y es >N- o >CH-; R5 es -CH₃; Ar es fenilo sustituido o no sustituido; y R2, R3, R4 son H, halógeno, aquilC₁₋₇, alcoxiC₁₋₇ o trifluorometilo (Col. 156 – 160, reivindicación 1; Col. 119, Tabla 3, Ej. 186; Col. 121, Tabla 3, Ej. 190).

Las diferencias entre la invención, definida en las reivindicaciones independientes 1, 2 y 3 y el compuesto revelado en el documento D1 son el sustituyente R5, el metileno que se encuentra entre el carboxilo y el heterociclo, y el grupo -C(O)- en lugar del -S(O₂)- como sustituyente en el átomo de nitrógeno del anillo indol.

El efecto que logra el incluir el sustituyente R5, el metileno que se encuentra entre el carboxilo y el heterociclo, y el grupo -C(O)- en lugar del -S(O₂)- como sustituyente en el átomo de nitrógeno del anillo indol es la obtención de compuestos alternativos antagonistas de grelina para el tratamiento de obesidad y diabetes.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los compuestos conocidos en el documento D2 para obtener compuestos alternativos útiles para el tratamiento de la diabetes.

Sin embargo, el documento D3 divulga compuestos que tienen alquilC₁ como sustituyente equivalente a R5 y el metileno entre el carbonilo y el heterociclo (Col. 119, Tabla 3, Ej. 186). El documento D3 también revela un compuesto de fórmula 2 con N sustitución en el anillo oxoindol con alquilo (Col. 2, líneas 25 – 35). Por otra parte el -S(O)₂ es bioisostero de -C(O)-³, por lo tanto su remplazo está dentro de los conocimientos de la persona normalmente versada en la materia.

Respecto a la actividad de los compuestos como antagonistas de grelina, se aclara al

3 LIMA, L. ET AL, “Bioisosterism: A Useful Strategy for Molecular Modification and Drug Design”, Current Medicinal Chemistry, Vol. 12, 2005, Págs. 23 – 49.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

solicitante que la identificación de otro mecanismo de acción de compuestos con un grupo farmacofórico ya conocido, no le otorga nivel inventivo a los compuestos de la solicitud. Adicionalmente, es conocido en el campo técnico que la grelina aumenta la concentración de vasopresina en plasma⁴.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el sustituyente R5, y el metileno entre el carboxilo y el heterociclo según las enseñanzas del documento D3 en los compuestos revelados en el documento D2, y asimismo realizaría el remplazo de -S(O₂)- por -C(O)- según los conocimientos de bioisosterismo para llegar así al objeto de las reivindicaciones 1, 2 y 3 de la solicitud. Por lo cual la materia reclamada se considera obvia.

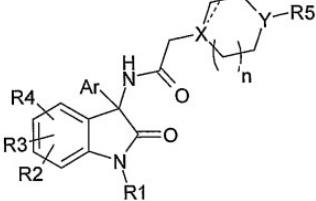
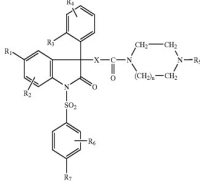
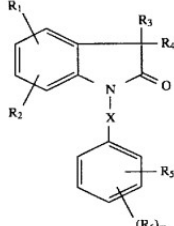
Puesto que las reivindicaciones dependientes 4, 13 y 14 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 5 se refiere a un: “Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque...” (Pág. 11 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La reivindicación 7 se refiere a un “Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque...” (Pág. 13 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 5 y 7, y las reveladas en el (los) documento(s) D2 y D3 que representa(n) el estado de la técnica cercano:

Tabla 2

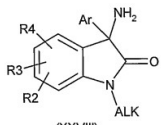
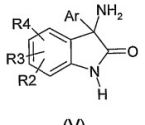
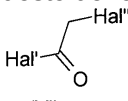
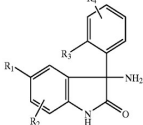
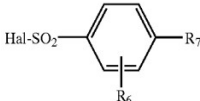
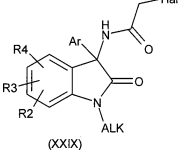
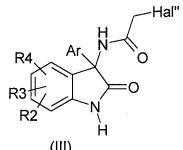
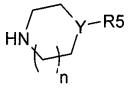
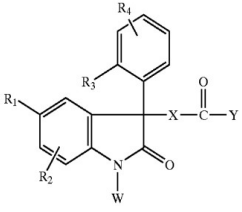
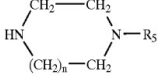
Características esenciales	D2	D3
Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I)  (I) que comprende:	Un procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I)  que comprende:	Un procedimiento para obtener un compuesto de fórmula  que comprende:

4 ISHIZAKI S. ET AL, “Role of Ghrelin in The Regulation of Vasopressin Release in Conscious Rats”, Endocrinology, Vol. 143, No. 5, Págs. 1589 – 1593.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

Características esenciales	D2	D3
Una etapa que consiste en hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V) o (XXVIII)  (V) (XXVIII) (Reivindicación 5) (Reivindicación 7) Con un compuesto de fórmula (VI)  (VI)	Hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XXXII)  Con un compuesto de fórmula (V)  (V) Luego hacer reaccionar el compuesto obtenido con fenilcloroformato para obtener un compuesto de fórmula (II) (Pág. 16, esquema 8)	Haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (I), en el que R4 es R9NH- con un compuesto halógenoalquilC1-4carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13)
Hacer reaccionar el compuesto (III) o (XXIX)  (III) (XXIX) (Reivindicación 5) (Reivindicación 7) Con un compuesto de fórmula (IV)  (IV)	El compuesto de fórmula (II) se hace reaccionar con  Con un compuesto de fórmula (III)  (III) (Pág. 5, Párr. 112 – 119)	El compuesto obtenido se hace reaccionar con un compuesto HR32R33 (Col. 23, líneas 13 – 15) R32 y R33 corresponden a: piperacin, piperidin (Col 8, líneas 11 – 20; Col. 9, líneas)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano porque divulga un procedimiento de obtención de un compuesto de fórmula (I) en el que se hace reaccionar un compuesto de fórmula (XXXII) con un compuesto de fórmula (V), luego el compuesto obtenido se hace reaccionar con un fenilcloroformato para obtener un compuesto de fórmula (II) (Pág. 16, esquema 8), y el intermediario obtenido se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III) (Pág. 5, Párr. 112 – 119).

El documento D3 da a conocer un procedimiento de obtención de un compuesto de fórmula (I) en el que R4 y/o R6 son un grupo ω-R32R33N(C1-4)alquilCO(R9)- en el que se hace reaccionar un compuesto de fórmula (I) en el que R4 es R9NH- con un compuesto halógenoalquilC1-4carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13), el compuesto obtenido se hace reaccionar con un compuesto HR32R33 (Col. 23, líneas 13 – 15).

El procedimiento reivindicado difiere del procedimiento divulgado por el documento D2 en que el compuesto de fórmula (V) ó (XXVIII) se hace reaccionar con un

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

compuesto de fórmula (VI) y en que el compuesto (XXVIII) tiene una N sustitución con alquilo.

No se evidencia ningún efecto técnico inesperado, por el hecho de hacer que reaccionar el compuesto de fórmula (V) o (XXVIII) con un compuesto de fórmula (VI), ni porque el compuesto (XXVIII) tenga una N sustitución con alquilo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en: cómo modificar el procedimiento de síntesis de un compuesto de fórmula (I) divulgado en el documento D2, para proporcionar un procedimiento alternativo para la síntesis de compuestos de fórmula (I) de la solicitud.

Sin embargo, el documento D3 revela que un compuesto compuesto de fórmula (I), en el que R4 es R9NH-, se puede hacer reaccionar con un compuesto halógenoalquilC₁₋₄carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13). Adicionalmente, el documento D3 se revela un compuesto de fórmula 3 derivado de indol con actividad en vasopresina y/o oxitocina con N sustitución con alquil o alquenil (Col. 2, Líneas 25 – 35).

De manera que la persona normalmente versada en la materia utilizaría la etapa de reacción de un compuesto intermediario con un halógenoalquilC₁₋₄carbonilhaluro como lo divulga el documento D3 en el procedimiento revelado en el documento D2 para llegar así al objeto de las reivindicaciones 5 y 7. Por lo cual la materia reclamada se considera obvia.

Puesto que la reivindicación dependiente 9 no menciona características inventivas adicionales tampoco se puede considerar inventiva.

La reivindicación 6 se refiere a un: *“Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque...”* (Pág. 12 y 13 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La reivindicación 8 se refiere a un *“Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque...”* (Pág. 14 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

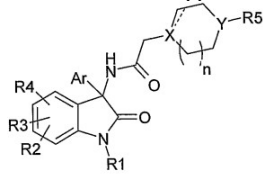
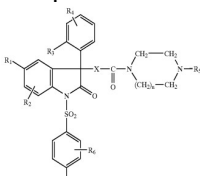
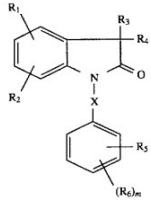
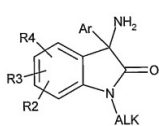
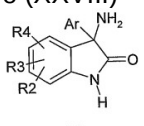
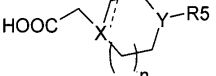
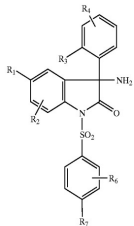
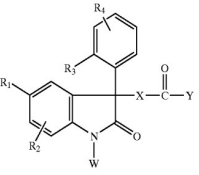
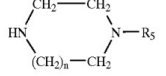
La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 6 y 8, y las reveladas en el (los) documento(s) D2 y D3 que representa(n) el estado de la técnica cercano:

Tabla 3

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

Características esenciales	D2	D3
Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I)  (I) que comprende:	Un procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I)  que comprende:	Un procedimiento para obtener un compuesto de fórmula  que comprende:
Una etapa que consiste en hacer reaccionar un compuesto de fórmula (V) o (XXVIII)  (V) (XXVIII) (Reivindicación 5) (Reivindicación 7) Con un compuesto de fórmula (VIII) 	Hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XXXIII)  con fenilcloroformato para obtener un compuesto de fórmula (II) (Pág. 16, esquema 8) El compuesto de fórmula (II) se hace reaccionar con  con un compuesto de fórmula (III)  (Pág. 5, Párr. 112 – 119)	Haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (I), en el que R4 es R9NH- con un compuesto halógenoalquilC₁₋₄carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13) El compuesto obtenido se hace reaccionar con un compuesto HR32R33 (Col. 23, líneas 13 – 15) R32 y R33 corresponden a: piperazin, piperidin (Col 8, líneas 11 – 20; Col. 9, líneas)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano porque divulga un procedimiento de obtención de un compuesto de fórmula (I) en el que se hace reaccionar un compuesto de fórmula (XXXIII) con fenilcloroformato para obtener un compuesto de fórmula (II) (Pág. 16, esquema 8), y el intermediario obtenido se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III) (Pág. 5, Párr. 112 – 119).

El documento D3 da a conocer un procedimiento de obtención de un compuesto de fórmula (I) en el que R4 y/o R6 son un grupo ω-R32R33N(C₁₋₄)alquilCO(R9)- en el que se hace reaccionar un compuesto de fórmula (I) en el que R4 es R9NH-, con un compuesto halógenoalquilC₁₋₄carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13), el compuesto obtenido se hace reaccionar con un compuesto HR32R33 (Col. 23, líneas 13 – 15).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

El procedimiento reivindicado difiere del procedimiento del documento D2 en que el compuesto de fórmula (V) o (XXVIII) se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (VIII) y en que el compuesto (XXVIII) tiene una N sustitución con alquilo.

No se evidencia ningún efecto técnico inesperado, por el hecho de hacer que reaccionar el compuesto de fórmula (V) o (XXVIII) con un compuesto de fórmula (VIII), ni porque el compuesto (XXVIII) tenga una N sustitución con alquilo.

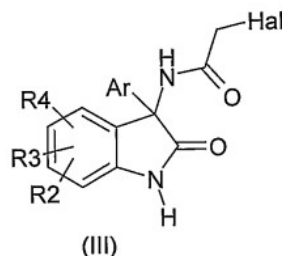
Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en: cómo modificar el procedimiento de síntesis de un compuesto de fórmula (I) divulgado en el documento D2, para proporcionar un procedimiento alternativo para la síntesis de compuestos de fórmula (I) de la solicitud.

Sin embargo, el documento D2 se revela que un compuesto de fórmula (XXXIII) se hace reaccionar con fenilcloroformato para obtener un compuesto de fórmula (II) y el intermediario obtenido se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (III) (Pág. 5, Párr. 112 – 119) y en el documento D2 (Pág. 5, Párr. 112 – 119) y el documento D3 (Col. 23, líneas 13 – 15; Col 8, líneas 11 – 20; Col. 9, líneas) se revela que el anillo puede ser de piperazina en lugar de un anillo de fenilo. Adicionalmente, el documento D3 da a conocer un compuesto de fórmula 3 derivado de indol con actividad sobre la vasopresina y/o oxitocina con N sustitución con alquil o alquenil (Col. 2, Líneas 25 – 35).

De manera que la persona normalmente versada en la materia utilizaría la etapa de reacción de un compuesto piperidin o piperazin metilcarboxilato según las enseñanzas de los documentos D2 y D3 para llegar así al objeto de las reivindicaciones 6 y 8. Por lo cual la materia reclamada se considera obvia.

Puesto que la reivindicación dependiente 9 no menciona características inventivas adicionales tampoco se puede considerar inventiva.

La reivindicación 10 consiste en: *“Un compuesto de fórmula (III)*



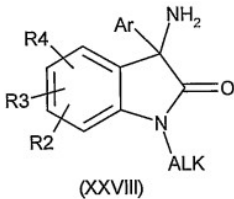
en la que R²...” (Pág. 15 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La reivindicación 11 consiste en: *“Un compuesto de fórmula (XXVIII)*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

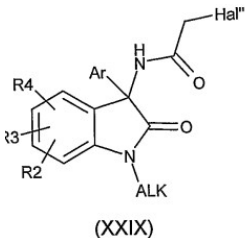
RESOLUCIÓN No:66656
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804



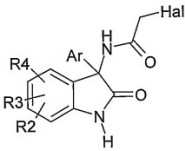
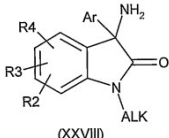
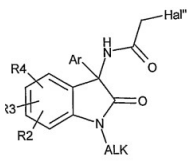
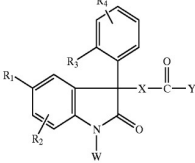
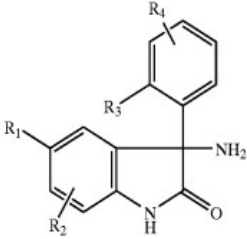
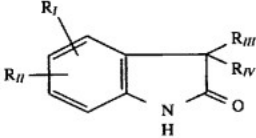
en la que $R^2 \dots$ ” (Págs. 15 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

La reivindicación 12 consiste en: “Un compuesto de fórmula (XXIX)



en la que $R^2 \dots$ ” (Pág. 15 del radicado N° 10-012804-00011-0000).

Tabla 4

Características esenciales	D2	D3
Un compuesto de fórmula:	Compuesto de fórmula	Compuesto de fórmula
 (III) (Reivindicación 14)  (XXVIII) (Reivindicación 16)  (XXIX) (Reivindicación 17)	Compuesto de fórmula (II)  (Pág. 5, Párr. 112) Un compuesto de fórmula (XXXII)  (Pág. 16, esquema 8)	 R_{III}: fenil monosustituido o polisustituido R_{IV}: amino (Col. 18, líneas 56 – 63) Compuesto intermediario de fórmula (I), en el que R_4 es R_9NH- se hace reaccionar con un compuesto halógenoalquilC_1. C_1carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano porque divulga compuestos de fórmula (II) (Pág. 5, Párr. 112) y de fórmula (XXXII), los cuales se utilizan como intermediarios de síntesis (Pág. 16, esquema 8).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

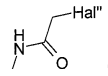
Por su parte, el documento D3 da a conocer compuestos de fórmula (II') (Col. 18, líneas 56 – 63). Esta anterioridad también revela un procedimiento de reacción en el que un compuesto de fórmula (I) donde R4 es R9NH- se hace reaccionar con un compuesto halógenoalquilC1-4carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13), por lo tanto el intermediario obtenido es equivalente al compuesto de fórmula (III) reivindicado.

Los compuestos reivindicados difieren de los compuestos revelados en el documento D2 en la N sustitución con alquilo en el anillo indol o en la sustitución específica en la posición 3 del mismo anillo.

El efecto logrado por el hecho de incluir la N-sustitución o el sustituyente en el grupo amino de la posición 3 del anillo indol en los compuestos de fórmula (III), (XXVIII) y (XXIX) es la obtención de intermediarios para la síntesis de compuestos de fórmula (I).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en cómo modificar los intermediarios de síntesis de los documentos D2 para obtener compuestos alternativos para la síntesis de compuestos de fórmula (I).

Sin embargo, el documento D3 revela un compuesto de fórmula 3 derivado de indol con actividad en vasopresina y/o oxitocina con N sustitución con alquil o alquenil (Col. 2, Líneas 25 – 35), y da a conocer un proceso de síntesis en el que un compuesto intermediario de fórmula (I) en el que R4 es R9NH-, se hace reaccionar con un compuesto halógenoalquilC1-4carbonilhaluro como el bromoacetilbromuro (Col. 23, líneas 7 – 13), por lo tanto el compuesto obtenido va a tener la sustitución

en la posición 3 del anillo de tipo carbamoil-alquil-halógeno .

De manera que la persona normalmente versada en la materia realizaría modificaciones menores en intermediarios de síntesis según las enseñanzas del documento D3 en los intermediarios divulgados en el documento D2 para llegar así a la materia reclamada en las reivindicaciones 10, 11 y 12. Por lo cual se considera obvia

Es oportuno aclarar que, contrario a lo afirmado por la solicitante, el documento D3 si menciona la utilidad de los compuestos en el tratamiento de la obesidad (Col. 26, línea 43). Por otra parte los documentos D2 y D3 revelan compuestos afines a los receptores de vasopresina u oxitocina y el documento D2 también revela la utilidad de estos compuestos en el tratamiento de la diabetes (Pág. 50, Párr. 682).

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual los compuestos revelados en los documentos D2 y D3 tienen en la posición 1 del indol un sulfonilo unido a un fenilo y que por lo tanto no existía ninguna motivación para modificar este sustituyente, se reitera, que es de conocimiento del campo técnico que el grupo carbonilo es un bioisostero del grupo sulfonilo, por lo tanto su remplazo está dentro de los conocimientos de conjunto de la persona normalmente versada en la materia, y por otra parte en el documento D3 se revela un compuesto de fórmula 3 derivado de indol con actividad en vasopresina y/o oxitocina con N sustitución con alquil o

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:66656

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-012804

alquenil (Col. 2, Líneas 25 – 35).

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “DERIVADOS DE INDOL-2-ONA DISUSTITUIDOS EN LA POSICIÓN 3 POR PIPERIDIN O PIPERAZIN METIL CARBONIL AMINO COMO ANTAGONISTAS DE GRELINA ANTIDIABÉTICOS”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Sanofi-Aventis, entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 18 Nov 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
LUZ CLEMENCIA SUAREZ DE PAEZ
cavelier@cavelier.com

Elaboró: Jeny Paola Villate Becerra
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez