

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 10-35482- -6	FECHA: 2012-11-16 15:40:45
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA
office@olartemoure.com

Asunto: Radicación: 10-35482- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 21359
 Folios: 9

Patente de invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2008/075145				
Fecha de Presentación Internacional	03/09/2007				

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 235 a	25 de marzo de 2010 473
Reivindicaciones:	Folios 474 a	25 de marzo de 2010 496
	Folios 540 a	14 de julio de 2010 554
Prioridad:	US 60/974.064,	20 de septiembre de 2007
	US 61/045.0263	15 de abril de 2008

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

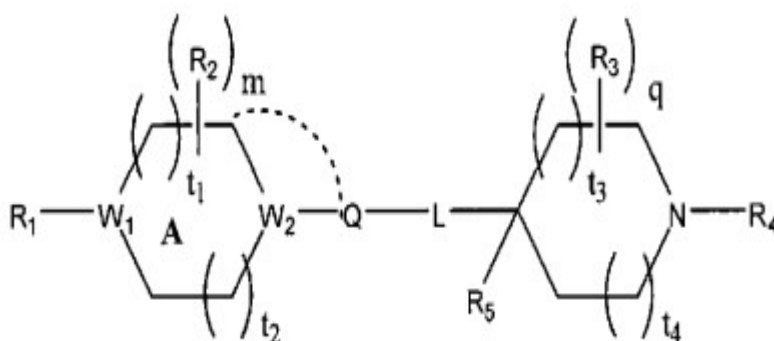
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que 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. En el presente caso el solicitante canceló la tasa correspondiente a la modificación del capítulo reivindicatorio y la tasa de las reivindicaciones adicionales (Fls 538 a 539 y 555) por tanto se procede al examen del capítulo reivindicatorio de los folios 540 a 554.

Título de la solicitud: “Compuestos y composiciones como moduladores de la actividad de GRP119”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad suministrar compuestos útiles como moduladores de la actividad de GRP119.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto derivado de piperidin alquil o alquiloxi-arilo o heteroarilo la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/10, C07D 401/14, C07D 413/06, C07D 413/14, C07D 417/14, C07D 487/04, C07D 491/048, A61K 31/44, A61K 31/496, A61K 31/4965, A61P 3/10.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literales (a) – (d))

El objeto de las reivindicaciones 9 – 13 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Título

El título es muy general y no permite comprender cuál es el ovejo de la solicitud: por lo tanto se sugiere al solicitante cambiarlo por: derivados de piperidin alquil o alquiloxi-arilo o heteroarilo como moduladores de la actividad de GRP119.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 a 5 no son claras ni concisas cuanto utiliza términos tales como:

- Arilo C₆₋₁₀, Cicloalquilo C₆₋₁₀
- Heteroarilo C₁₋₁₀, Heterocicloalquilo C₃₋₈

- Alquilo C₁₋₆, Alcoxi C₁₋₆, Alquilenos C₁₋₆, Alquilenos C₂₋₆, Alquilenos C₁₋₄
- M, q son enteros entre 0 y 4.
- T1, t2, t3, y t4 son enteros entre 0, y 2,
- “optativamente”,
-

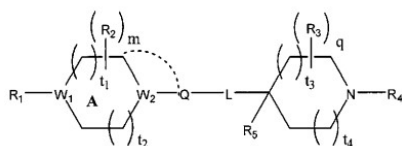
Dado lo anterior, se obtiene una innumerable combinación de compuestos que no encuentran soporte en la descripción, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

Para tal efecto, esta Oficina manifiesta que en la descripción se encuentran soportados los siguientes compuestos a los cuales el solicitante puede tener en cuenta para la respectiva restricción

Q	Fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina, 1,2,4-oxadiazol, tiazol, 6-formil-pirazin, 6-cloro-pirazin,
L	-OCH ₂ -, -OCH ₂ CH ₂ -, -OCH ₂ CH ₂ CH ₂ -, -OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -, -CH ₂ CH ₂ -, CH ₂ CH ₂ CH ₂ -
W1, W2	Piperidin, 1,4-diazepan, pirrolidin, piperazin, 1,2,3,6-tetrahidropiridin
R1	Metanosulfonil, metilsulfoniloxi, isobutilsulfonil, cloropropilsulfonil, propilsulfonil, isopropil sulfonil, 2-butilsulfonil, hidroxipropilsulfonil, cianopropilsulfonil, aminopropilsulfonil, acetoxipropilsulfonil
R2	H
R3	H, OH, Metoxi,
R4	Propan-2-il-1-carboxilato, tercetbut-2-il-1-carboxilato, 3-ciclopropil-1,2,4-oxadiazol, 5-trifluorometil-piridin, isopropil-1,2,4-oxadiazol, tetra-2H-piran-4-il-1-carboxilato, tetrafuran-3-il-1-carboxilato, 2-isopropil-tiazol, 2-metil-2H-tetrazol, oxetan-3-il-1-carboxilato, 5-etil-pirimidina, 1-metilciclopropil-1-carboxilato, 5-fluoro-piridin, 6-cloro-piridazin, 6-tertbutil-pirazin
R5	H, metoxi, OH
T3,t4	Piperidin,
-----	No presente,

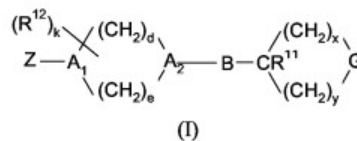
6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I)



como concepto inventivo único de la presente solicitud.

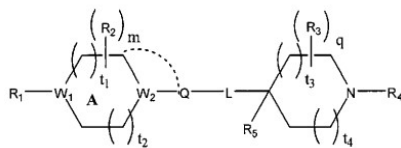
La búsqueda ha revelado que el concepto inventivo único no es inventivo, ya que los



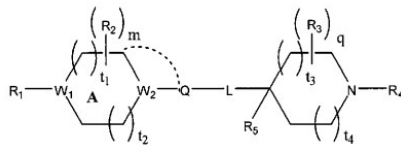
documento D1 divulga un compuesto de fórmula (I) (páginas 1 a 3) y los documentos D2 y D3 divulgan la característica esencial faltante.

Como dicho concepto inventivo único no es inventivo por ello, no se cumple el requisito de unidad invención.

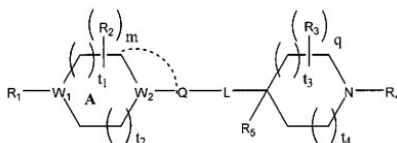
Debido a que tampoco se encuentran otras características que puedan considerarse como elementos técnicos particulares, no hay unidad de invención.



1. compuestos de fórmula (I) (reivindicaciones 1 a 8) , donde Q es fenilo



2. compuestos de fórmula (I) (reivindicaciones 1 a 8) , donde Q es heteroarilo



3. compuestos de fórmula (I) , donde el radical R20 de Q se une con el carbono adyacente de W2 para formar un anillo fusionado de 5 miembros con los anillos A y Q (reivindicaciones 1, 7 y 8)

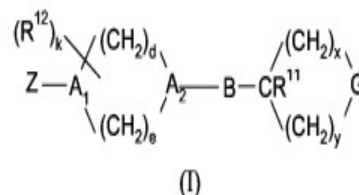
Se le sugiere al solicitante restringir la materia a patentar en un solo concepto común inventivo especificando el avance tecnológico sobre el estado de la técnica. Esto se logra entre otras formas definiendo las características esenciales de la invención y mostrando las otras características particulares como dependientes, pero sin perjuicio de la concisión de las nuevas reivindicaciones tanto independientes como dependientes.

El solicitante también puede realizar una o más de las divisionales de acuerdo a los grupos de conceptos técnicos inventivos presentados en esta solicitud, esto claro, sin ampliar el objeto inicial de la invención.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 20 de septiembre de 2007, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

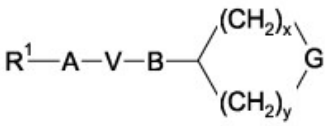
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2009038974	"G-Protein Coupled Receptor Agonists"	11 de enero de 2007
D2	WO2007003960	"GPCR Agonists"	11 de enero de 2007
D3	WO2007003962	"GPCR Agonists"	11 de enero de 2007



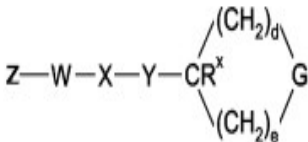
El documento D1^[1] proporciona compuestos de fórmula (I) , o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, son agonistas de GPCR y son útiles como para el tratamiento de la obesidad y la diabetes.

[1] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090326&CC=WO&NR=2009038974A1&KC=A1

El documento D2^[2] proporciona compuestos de fórmula (I) , o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, son agonistas de GPCR y son útiles como para el tratamiento de la obesidad y la diabetes.



El documento D3^[3] proporciona compuestos de fórmula (I) , o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, son agonistas de GPCR y son útiles como para el tratamiento de la obesidad y la diabetes.

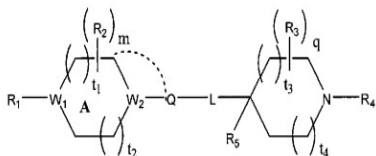
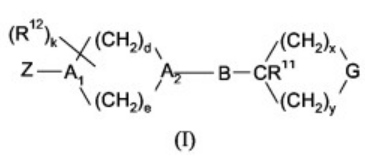
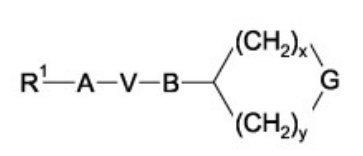
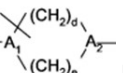
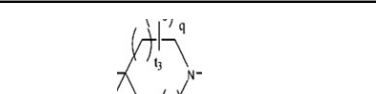
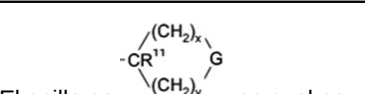
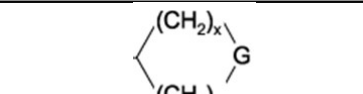


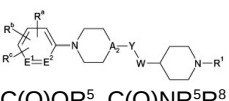
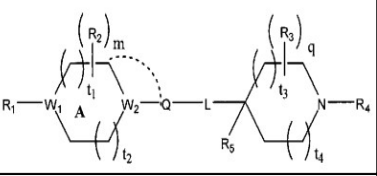
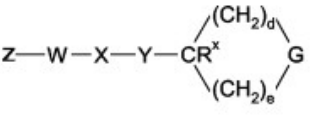
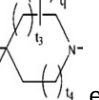
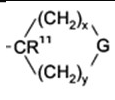
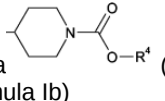
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

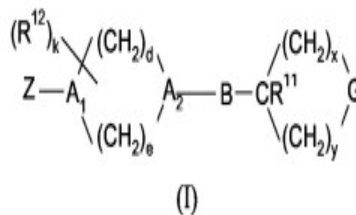
La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I)

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (I)
		
Anillo con W1 y W2 es Piperidin, 1,4-diazepan, pirrolidin, piperazin, 1,2,3,6-tetrahidropiridin.	Su equivalente es un anillo es  los cuales se seleccionan de piperazina (ejemplo 87), piperidina (ejemplo 79), 1,4-diazepan (ejemplos 60 y 61)	No se menciona la característica
Q es Fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina	No menciona la característica	Presenta un anillo V que se selecciona de oxadiazol, oxazol, isoxazol, tiadiazol, tiazol, imidazole y pyrazole. (página 3)
L es -OCH2-, -OCH2CH2-, -OCH2CH2CH2-, -OCH2CH2CH2CH2-, -CH2CH2-, CH2CH2CH2-	El equivalente de L es B y este consiste en un alquileno C1-4	El equivalente de L es B y consiste en un (CH2)n donde n es un entero de 0 a 3. (página 2)
		
El anillo es es cual es seleccionado de piperidina	El anillo es seleccionado de piperidina (ejemplo 1)	El anillo es es cual es seleccionado de piperidina (ejemplo 3)
R4 es seleccionado entre R8 y C(O)OR8; donde R8 es	Divulga un compuesto de fórmula (Ib)	El equivalente de R4 es tercbut-2-il-1-carboxilato (ejemplos 55-59),

seleccionado entre alquilo C₁₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₁₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₈ y heterocicloalquilo C₃₋₈.	 donde R₁ es C(O)OR⁵, C(O)NR⁵R⁸ o un heteroarilo de 5 a 6 miembros	1-metilciclopropil-1-carboxilato (ejemplo 113), Propan-2-il-1-carboxilato (ejemplo 150), 2-piridin (ejemplo 211), metil-piridin (ejemplo 217),
R₁ es seleccionado entre – X₁S(O)₀₋₂X₂R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂OR_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂C(O)R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂C(O)OR_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂OC(O)R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂NR_{6a}R_{6b}, donde X₁, es seleccionado entre un enlace, O, NR_{7a}R_{7b} y alquilenos C₁₋₄, X₂ es seleccionado entre un enlace y alquilenos C₁₋₄; R_{6a} es seleccionado entre H, halo, alquilo C₁₋₆, alquilenilo C₂₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₁₋₁₀, heterocicloalquilo C₃₋₈ cicloalquilo C₃₋₈.	Divulga equivalentes de R₁ tales como: metilsulfonilo (ejemplos 2 y 4), acetilamino (ejemplo 10), etanosulfonil (ejemplo 54)	R₁ se selecciona de 2-metiloxazol (ejemplo 7), Metanosulfonil (ejemplo 19), etilsulfanil (ejemplo 26 (ejemplo 37), ciclopropilsulfonil (ejemplo 103)
Características esenciales	D3	
Un compuesto de fórmula (I)	Un compuesto de fórmula (I)	
		
Anillo con W₁ y W₂ es Piperidin, 1,4-diazepan, pirrolidin, piperazin, 1,2,3,6-tetrahidropiridin.		
Q es Fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina	Presenta un anillo Z el cual se selecciona de fenilo o un heteroarilo de 5 ó 6 miembros (página 2)	
L es -OCH₂-, -OCH₂CH₂-, -OCH₂CH₂CH₂-, -OCH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂-, CH₂CH₂CH₂-	El equivalente de L es X-Y donde X es Oxígeno o CH₂ (página 2), e Y alquilenos C₁₋₄, específicamente OCH₂CH₂CH₂, OCH₂CH₂ (ejemplos 143 a 145), -(CH₂)₄ (ejemplo 3)	
El anillo es  es cual es seleccionado de piperidina	El anillo equivalente es  es cual es seleccionado de piperidina  (compuesto de fórmula Ib)	
R₄ es seleccionado entre R₈ y C(O)OR₈; donde R₈ es seleccionado entre alquilo C₁₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₁₋₁₀, cicloalquilo C₃₋₈ y heterocicloalquilo C₃₋₈.	El equivalente de R₄ se selecciona de terc-but-2-il-1-carboxilato (ejemplos 20-23), 1-metilciclopropil-1-carboxilato (ejemplo 72), Propan-2-il-1-carboxilato (ejemplo 63), metil-pirimidin (ejemplo 54-55),	
R₁ es seleccionado entre – X₁S(O)₀₋₂X₂R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂OR_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂C(O)R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂C(O)OR_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂OC(O)R_{6a}, X₁S(O)₀₋₂X₂NR_{6a}R_{6b}, donde X₁, es seleccionado entre un enlace, O, NR_{7a}R_{7b} y alquilenos C₁₋₄, X₂ es seleccionado entre un enlace y alquilenos C₁₋₄; R_{6a} es seleccionado entre H, halo, alquilo C₁₋₆, alquilenilo C₂₋₆, arilo C₆₋₁₀, heteroarilo C₁₋₁₀, heterocicloalquilo C₃₋₈ cicloalquilo C₃₋₈.	No menciona la característica.	

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuesto de fórmula (I) el cual tiene actividad

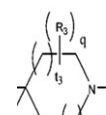
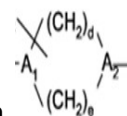


sobre los receptores GPR119, una GPCR identificada.

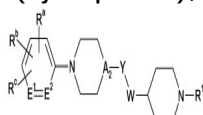
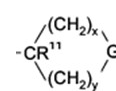
, el



equivalente de anillo de la fórmula es un anillo de fórmula los cuales se seleccionan de piperazina (ejemplo 87), piperidina (ejemplo 79), 1,4-diazepan (ejemplos 60 y 61), El equivalente de L es B y este consiste en un alquileo C1-4, el



equivalente del anillo de fórmula es un anillo de fórmula es cual es seleccionado de piperidina (ejemplo 1), el equivalente de R4 se divulga en un



compuesto de fórmula (Ib) donde R1 es C(O)OR⁵, C(O)NR⁵R⁸ o un heteroarilo de 5 a 6 miembros, divulga equivalentes de R1 tales como: metilsulfonilo (ejemplos 2 y 4), acetilamino (ejemplo 10), etanosulfonil (ejemplo 54)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que en la actual invención incluye en el compuesto de fórmula (I) Q es Fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina

El efecto que logra la diferencia es que se obtienen compuestos de Fórmula (I) que contienen un grupo Q que se selecciona de fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina en lugar de un espaciador de la forma B. sin embargo esta diferencia no logra establecer que los compuestos de la actual invención tengan un efecto técnico mejorado frente a los compuestos de Fórmula (I) de D1 puesto que no hay comparación entre los compuestos del estado del arte y los compuestos de la actual invención.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo presentar compuestos alternativos a los compuestos de Fórmula (I) de D1 y que incluyan un un grupo Q que se selecciona de fenilo, piridina, pirazin, piridazin, pirimidina en su estructura".

D1 con D2

Sin embargo, la utilización de un grupo Presenta un anillo V que se selecciona de oxadiazol, oxazol, isoxazol, tiadiazol, tiazol, imidazol y pirazol fue divulgada con anterioridad en D2 (página 3) que se refiere a compuestos de fórmula (I): o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, que tienen actividad agonistas de GPCR y son útiles como para el tratamiento de la obesidad y la diabetes (resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo V que se selecciona de oxadiazol, oxazol, isoxazol, tiadiazol, tiazol, imidazol y pirazol (habiéndose demostrado que la inclusión de estos grupos tienen efecto benéfico en la actividad agonista sobre los receptores GPCR) conocido con anterioridad en documento D2 en el compuesto del documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no incluyen características que hagan nueva o inventiva la reivindicación 1 por lo tanto, también se consideran obvias a la luz de los documentos D1 y D2.

D1 con D3

Sin embargo, la utilización de un grupo Presenta un grupo Z el cual se selecciona de fenilo o un heteroarilo de 5 ó 6 miembros con anterioridad en D3 (página 2) que se refiere a compuestos de fórmula (I): o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos, que tienen actividad agonistas de GPCR y son útiles como para el tratamiento de la obesidad y la diabetes (resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el un grupo Z el cual se selecciona de fenilo o un heteroarilo de 5 ó 6 miembros (habiéndose demostrado que la inclusión de estos grupos tienen efecto benéfico en la actividad agonista sobre los receptores GPCR) conocido con anterioridad en documento D3 en el compuesto del documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no incluyen características que hagan nueva o inventiva la reivindicación 1 por lo tanto, también se consideran obvias a la luz de los documentos D1 y D3.

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009038974	1 a 8	Nivel inventivo
D2	WO2007003960	1 a 8	Nivel inventivo
D3	WO2007003962	1 a 8	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 (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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2012-11-27

Elaboró: Harvey Alonso Jaramillo
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo