

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
clientes@cavelier.com; cavelier@cavelier.com

ASUNTO	Radicación	10 022 864
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	- - - 18573
	Folios	8

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	☒ Capítulo I ☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/US2008/070250	
Fecha de Presentación Internacional	17/Julio/2008	

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 61 a 104	25/Febrero/2010
Reivindicaciones:	Folios 105 a 124	25/Febrero/2010
Dibujos:	Folios 125 a 128	25/Febrero/2010
Prioridad:	US 60 952 122	26/Julio/2007

2. Análisis de la Prioridad

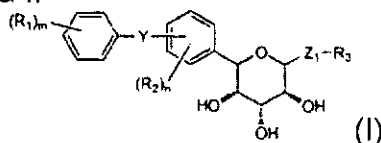
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Inhibidores del co-transportador 2 sodio glucosa y métodos para la preparación de los mismos y sus intermediarios" (modificado en el folio 141).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos inhibidores del co-transportador 2 sodio glucosa.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un co-cristal de un compuesto de fórmula I:



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07H5/04, C07H7/04, C07H9/04, C07H15/04.

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara porque no definen los radicales R_1 , R_2 , R_3 , Y , Z_1 , ni m y n . se sugiere incluir la definición de los radicales en la reivindicación de acuerdo a lo que esté debidamente soportado en la descripción.

Las reivindicaciones 1, 2, 24 y 25 no están soportadas en la descripción porque tratan de co-cristales, pero en ninguna parte de esta se encuentra la manera en que la persona del oficio versada en la materia pueda elaborarlos, así como tampoco se encuentra que dichos co-cristales hayan sido obtenidos. Se solicita eliminar estas reivindicaciones del pliego reivindicatorio.

Las reivindicaciones 1, 2, 71, 83, 88 y 97 no son claras porque se refieren a formas cristalinas pero estas no se caracterizan apropiadamente debido a que no presentan el patrón de difracción de rayos X en mono cristal, el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP) con por lo menos los 20 picos correspondientes a las intensidades de los haces difractados o a los espacios interplanares d_{hkl} según los índices de Miller (hkl) medidos de acuerdo con el ángulo de difracción de Bragg 2θ en el intervalo más representativo comprendido entre 5° hasta 90° , las espectroscopías Raman e IR, la espectroscopía RMN- C^{13} , o, los métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC. Se solicita caracterizar las formas cristalinas de acuerdo a lo que se encuentre debidamente soportado en la descripción o eliminar las reivindicaciones del pliego reivindicatorio.

Las reivindicaciones 3, 6, 9, 19, 26, 31, 34, 36, 45, 47, 51 y 54 no son claras, ni concisas, por la definición de la invención en términos de radicales "alquilo", "alquilo inferior", "arilo", "heterociclo", "alquilarilo", "arilalquilo", "heteroarilo", "ariloxilo", "alcóxido", "alcanosulfoxi", "alcoxisulfoxi", "opcionalmente sustituido", entre otros, los cuales, no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Para todos los radicales no se definen los átomos de carbono que los conforman; para los grupos arilo, arilalquilo, heterociclo, no se define el número de miembros que los conforman; y para los "hetero" no se definen los heteroátomos que los conforman. Por otra parte, el término "alquilo inferior" no es de uso común por lo cual la persona del oficio versada en la materia no lograría distinguir el número de átomos de carbono que conforman dicha cadena alifática. En cuanto al término "opcionalmente sustituido" no se menciona cuales son los sustituyentes con los cuales es posible reproducir la invención. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

Las reivindicaciones 3, 26, 43, 45, 54, 60, 68, 69, 70 no son claras cuando emplean la expresión "en condiciones suficientes para proporcionar un compuesto de fórmula...", la cual no es clara, porque primero, tratan de un procedimiento pero este no se define mediante características como alguna etapa o alguna condición específica en que debiera realizarse; segundo, no permite que la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda llevar a cabo la invención porque no se mencionan cuales son las "condiciones suficientes" que permiten desarrollarla. Se

sugiere, entonces, definir la invención por sus características esenciales, estructurales o funcionales, eliminando esta expresión del capítulo reivindicatorio.

Las reivindicaciones 73, 84, 89 y 98 no son claras porque el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP) no se presenta con por lo menos los 20 picos correspondientes a las intensidades de los haces difractados o a los espacios interplanares d_{hkl} según los índices de Miller (hkl) medidos de acuerdo con el ángulo de difracción de Bragg 2θ en el intervalo más representativo comprendido entre 5° hasta 90°. Se solicita caracterizar las formas cristalinas de acuerdo a lo soportado en la descripción, o eliminar las reivindicaciones del pliego reivindicatorio.

Las reivindicaciones 73, 74, 84, 85, 89, 90 y 98 y 99 no son claras cuando emplean los términos “alrededor de”, “uno o más”, “y/o”, que son imprecisos, lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlos por términos precisos o rangos concretos.

5. 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 26 de julio de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	CO 09-31839	Inhibidores del co-transportador 2 de sodio y glucosa y métodos para su uso	20/Mayo/2010*
D2	US20030060622	Process for the preparation of 2'-halo-beta-L-arabinofuranosyl nucleosides	27/Marzo/2003
D3	US20050187384	Process for the preparation of 2'-halo-beta-L-arabinofuranosyl nucleosides	25/Agosto/2005
D4	Artículo ¹	Selective oxidation of monosaccharide derivatives to uronic acids	12/Febrero/1993
D5	US2002137903	C-aryl glucoside SGLT2 inhibitors and method	26/Septiembre/2002

* Publicado el 20 de mayo de 2010 en la Gaceta de Propiedad Industrial No. 616. Corresponde al documento WO2008/109591, con fecha de prioridad 08 de marzo de 2007.

D1
<http://argos.sic.gov.co/Sic2/Tramites/Radicacion/Radicacion/Consultas/ConsultaRadicacion.php>, divulga (pg. 54, ejemplo 14; pg. 38, ejemplo 5, paso A; pg. 32, ejemplo 1, paso D) los compuestos (2R,3S,4R,5S, 6S)-4, 5-diacetoxi-6-[4-cloro-3-(4-etoxi-bencil)-fenil]-2-metilsulfanil-tetrahidro-piran-3-iléster de ácido acético, (3S,4R,5S,6S)-2,4,5-triacetoxi-6-[4-cloro-3-(4-etoxi-bencil)-fenil]-tetrahidro-piran-3-iléster de ácido acético y 4-cloro-3-(4-etoxibencil)fenil)litio.

D2
<http://www.google.com/patents/US20030060622?dq=us20030060622&hl=en&sa=X&ei=4qNpUNXIEoye8QTF7oHADg&ved=0CC4Q6AEwAA>, divulga (pg. 2, esquema A) el compuesto 5-(hidroximetil)-2,2-dimetil-3a,5,6,6a-tetrahidrofuro[2,3-d][1,3]dioxol-6-ol.

¹ Davis N, et al; Selective oxidation of monosaccharide derivatives to uronic acids; Tetrahedron Letters; Vol. 34, No. 7; pgs. 1181-1184. Referenciado en el Informe Preliminar de Patentabilidad de 10 de Febrero de 2010, folios 177-178.

D3
<http://www.google.com/patents/US20050187384?dq=us20050187384&hl=en&sa=X&ei=QKppUNzgG4aw8ASuiYGQCw&ved=0CDEQ6AEwAA>, divulga (pg. 2, esquema A) el compuesto 5-(hidroximetil)-2,2-dimetil-3a,5,6,6a-tetrahidrofuro[2,3-d][1,3]dioxol-6-ol.

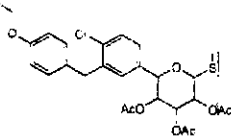
D4 (folios 177 - 178) da a conocer los compuestos de fórmula 5 y 11.

D5
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument;jsessionid=4CE0839A8CF491B98077894F46ED4020.espacenet_levelx_prod_2?CC=US&NR=2002137903A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20020926&DB=&locale=en_EP, divulga (pg. 5, pár. 0037, compuesto V) el compuesto 4-cloro-3-(4-etoxibencil)fenil)litio.

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 71 consiste en un compuesto de fórmula:



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

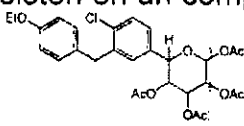
Características esenciales	D1
Compuesto de la fórmula: 	Compuesto (pg. 54, ejemplo 14):

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 71 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer el compuesto (2R,3S,4R,5S, 6S)-4,5-diacetoxy-6-[4-cloro-3-(4-etoxi-bencil)-fenil]-2-metilsulfanil-tetrahidro-piran-3-iléster de ácido acético (pg. 54, ejemplo 14).

En consecuencia, la reivindicación 71 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 72 y 74 no mencionan alguna característica que haga nueva al compuesto de la reivindicación 71, por lo cual se considera que no son nuevas.

Las reivindicaciones 77 y 78 consisten en un compuesto de fórmula:



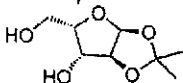
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
Compuesto de la fórmula: 	Compuesto (3S,4R,5S,6S)-2,4,5-triacetoxy-6-[4-cloro-3-(4-etoxi-bencil)-fenil]-tetrahidro-piran-3-iléster de ácido acético (pg. 38, ejemplo 5, paso A):

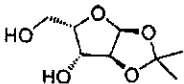
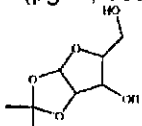
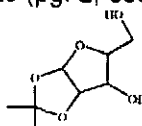
Las características esenciales del compuesto de las reivindicaciones 77 y 78 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer el compuesto (3S,4R,5S,6S)-2,4,5-triacetoxi-6-[4-cloro-3-(4-etoxi-bencil)-fenil]-tetrahidro-piran-3-iléster de ácido acético (pg. 38, ejemplo 5, paso A).

En consecuencia, las reivindicaciones 77 y 78 no son nuevas, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación 91 consiste en un compuesto de la fórmula:



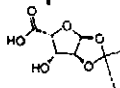
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2	D3
Compuesto de la fórmula: 	Compuesto (pg. 2, esquema A): 	Compuesto (pg. 2, esquema A): 

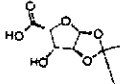
Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 91 habían sido divulgadas previamente en D2 y D3, los cuales enseñan el compuesto 5-(hidroximetil)-2,2-dimetil-3a,5,6,6a-tetrahidrofuro[2,3-d][1,3]dioxol-6-ol (D2: pg. 2, esquema A; D3: pg. 2, esquema A). Si bien es cierto, estos documentos no determinan la configuración respecto de los carbonos quirales, en los mismos se encuentra la divulgación implícita del compuesto en comento porque la persona del oficio normalmente versada en la materia puede derivar directamente el isómero óptico reivindicado.

En consecuencia, la reivindicación 91 no es nueva, según lo divulgado en el documento D2 y D3.

La reivindicación 92 consiste en un compuesto de la fórmula:



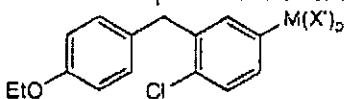
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D4
Compuesto de la fórmula: 	Compuesto de fórmula 11 (fl 178)

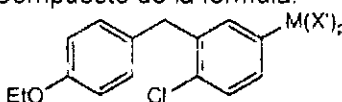
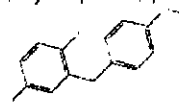
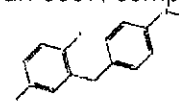
Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 92 habían sido divulgadas previamente en D4, el cual da a conocer el compuesto de fórmula 11 (folio 178)

En consecuencia, la reivindicación 92 no es nueva, según lo divulgado en el documento D4.

La reivindicación 93 consiste en un compuesto de la fórmula:



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

Características esenciales	D1	D5
Compuesto de la fórmula: 	(pg. 32, ejemplo 1, paso D): 	(pg. 5, pár. 0037, compuesto V): 
M es Li	Li	Li
p es cero	cero	cero

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 93 habían sido divulgadas previamente en D1 y D5, el cual da a conocer el compuesto 4-cloro-3-(4-etoxibencil)fenil)litio (D1: pg. 32, ejemplo 1, paso D; D5: pg. 5, pár. 0037, compuesto V).

En consecuencia, la reivindicación 93 no es nueva, según lo divulgado en los documentos D1 y D5.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO 09-31839	71, 72, 74, 77, 78 y 93	Novedad
D2	US20030060622	91	Novedad
D3	US20050187384	91	Novedad
D4	Artículo	92	Novedad
D5	US2002137903	93	Novedad

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.

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
23 OCT. 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas
 Revisado por: Jacqueline Alfonso Roza

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/US2008/070250

Box No. V Reasoned statement under Rule 43bis.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	<u>3-23,26-90,94-99</u>
	No: Claims	<u>91-93</u>
Inventive step (IS)	Yes: Claims	<u>3-23,26-90,94-99</u>
	No: Claims	<u>91-93</u>
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	<u>3-23,26-99</u>
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Box No. VI Certain documents cited

1. Certain published documents (Rules 43bis.1 and 70.10)

and / or

2. Non-written disclosures (Rules 43bis.1 and 70.9)

see form 210

Box No. VIII Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

see separate sheet

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)

International application No.

PCT/US2008/070250

Re Item III

Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

Claims 1 and 2 relate to co-crystals of compound I. Claims 24 and 25 relate to the preparation of co-crystals of compound I. However, the description as filed neither discloses said co-crystals nor describes a method for the preparation of said co-crystals.

Claims 1, 2, 24 and 25 therefore lack support and disclosure under Art. 5 and 5 PCT to such an extent that no opinion with respect to novelty, inventive step and industrial applicability will be given.

Re Item V

Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

Reference is made to the following documents:

- D1: US 2002/137903 A1 (ELLSWORTH BRUCE [US] ET AL) 26 September 2002
- D2: NICOLA J. DAVIES, SABINE L. FLITSCH: "Selective Oxidation of Monosaccharide Derivatives to Uronic Acids" TETRAHEDRON LETTERS, vol. 34, no. 7, 1993, pages 1181-1184
- D3: WO 2008/109591 A (LEXICON PHARMACEUTICALS INC [US]; GOODWIN NICOLE [US]; HARRISON BRYCE) 12 September 2008
- D4: WO 2008/042688 A (LEXICON PHARMACEUTICALS INC [US]; HARRISON BRYCE A [US]; KIMBALL S DAV) 10 April 2008

1. Novelty (Art. 33(1) and 33(2) PCT)

D1, column 22, lines 60-65 discloses a lithium reagent falling within **claim 93**.

D2, compounds 5 and 11, fall within **claims 91 and 92**.

Claims 91-93 are therefore considered to be not novel.

D1 and D2 do not disclose the subject matter according to claims 3-23, 26-90, 94-99.

Claims 3-23, 26-90, 94-99 are therefore considered to be novel.

2. Inventive Step (Art. 33(1) and 33(3) PCT)

D2 relates to the preparation of a C-aryl glucoside of formula (I) (cf. col. 4/8, scheme 1).

D1 neither discloses compounds of formula (I), present claim 3, nor the synthesis of said compounds.