

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
cavelier@cavelier.com

ASUNTO	Radicación	10 122 832
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	9 - 20142
	Folios	9

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I	☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/JP2009/054095		
Fecha de Presentación Internacional	04/Marzo/2009		

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 800 a 1751	04/Octubre/2010
	Folios 1776 a 1779	29/Diciembre/2010
	Folios 1796 a 2750	16/Agosto/2012
Reivindicaciones:	Folios 1753 a 1758	04/Octubre/2010
	Folios 1780 a 1786	29/Diciembre/2010
	Folios 2751 a 2757	16/Agosto/2012
Prioridad:	JP 2008-055250	05/Marzo/2008
	JP 2009-025511	06/Febrero/2009

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.

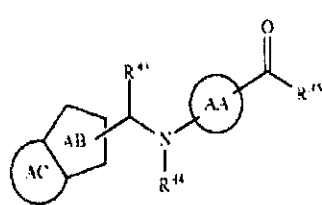
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Compuesto Heterocíclico con Acción Antagonista del Glucagón" (modificado en el folio 1772).

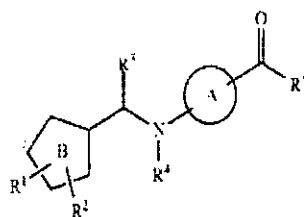
El problema planteado en esta solicitud consiste en el desarrollo de un compuesto con una eficacia superior y que fuese de utilidad para la prevención o el tratamiento de diabetes y similares.

Expediente 10 122 832 1er Art 45

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmulas (IA) y (I).



(IA)



(I)

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/437; A61P 3/10, 43/00; C07D 209/14, 491/48, 495/04.

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

El objeto de las reivindicaciones 20 y 21 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 22 y 23 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

No obstante, las reivindicaciones 17 a 19 se encabezan como medicamento, este se encuentra definido en términos de su uso como antagonista de glucagón, agente supresor de la producción de azúcar y agente para la terapia o el tratamiento de diabetes y por lo tanto no son patentables, de acuerdo con el Art. 14.

6. De la Solicitud de Patente

Título

Se sugiere hacer el título más concreto según las características estructurales del objeto de la solicitud.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

En la reivindicación 9 la definición de R^1 y R^2 incluye "un grupo hidroxilo opcionalmente sustituido", no es claro como el grupo hidroxilo puede estar sustituido y por lo tanto se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

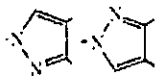
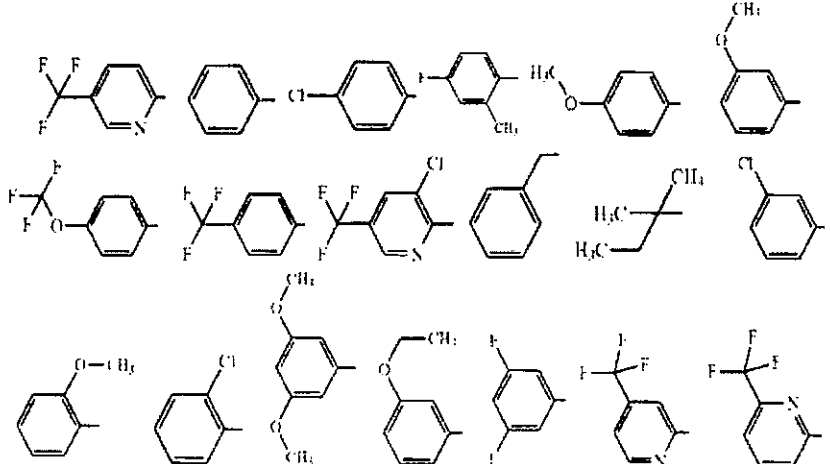
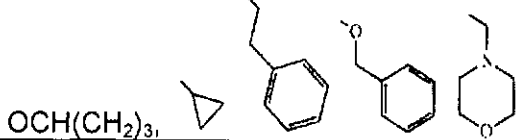
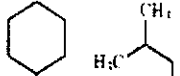
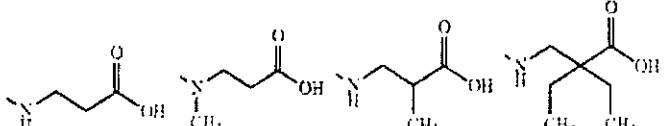
La reivindicación 15 se refiere a un profármaco de acuerdo con la reivindicación 1 o 9, sin definirlo por características técnicas esenciales. Esta forma de reivindicar no es adecuada porque corresponde a un resultado a alcanzar. Adicionalmente, no se encuentra soporte descriptivo ni divulgación suficiente para reclamar un profármaco y por lo tanto se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio y la referencia a profármaco de la reivindicación 16.

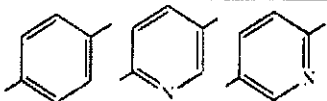
La reivindicación 16 se refiere a un medicamento, que se está definiendo únicamente por que comprende un compuesto de la solicitud, sin definir que clase de medicamento, sus ingredientes ni las proporciones de los mismos. Se sugiere realizar su caracterización incluyendo todos los elementos esenciales.

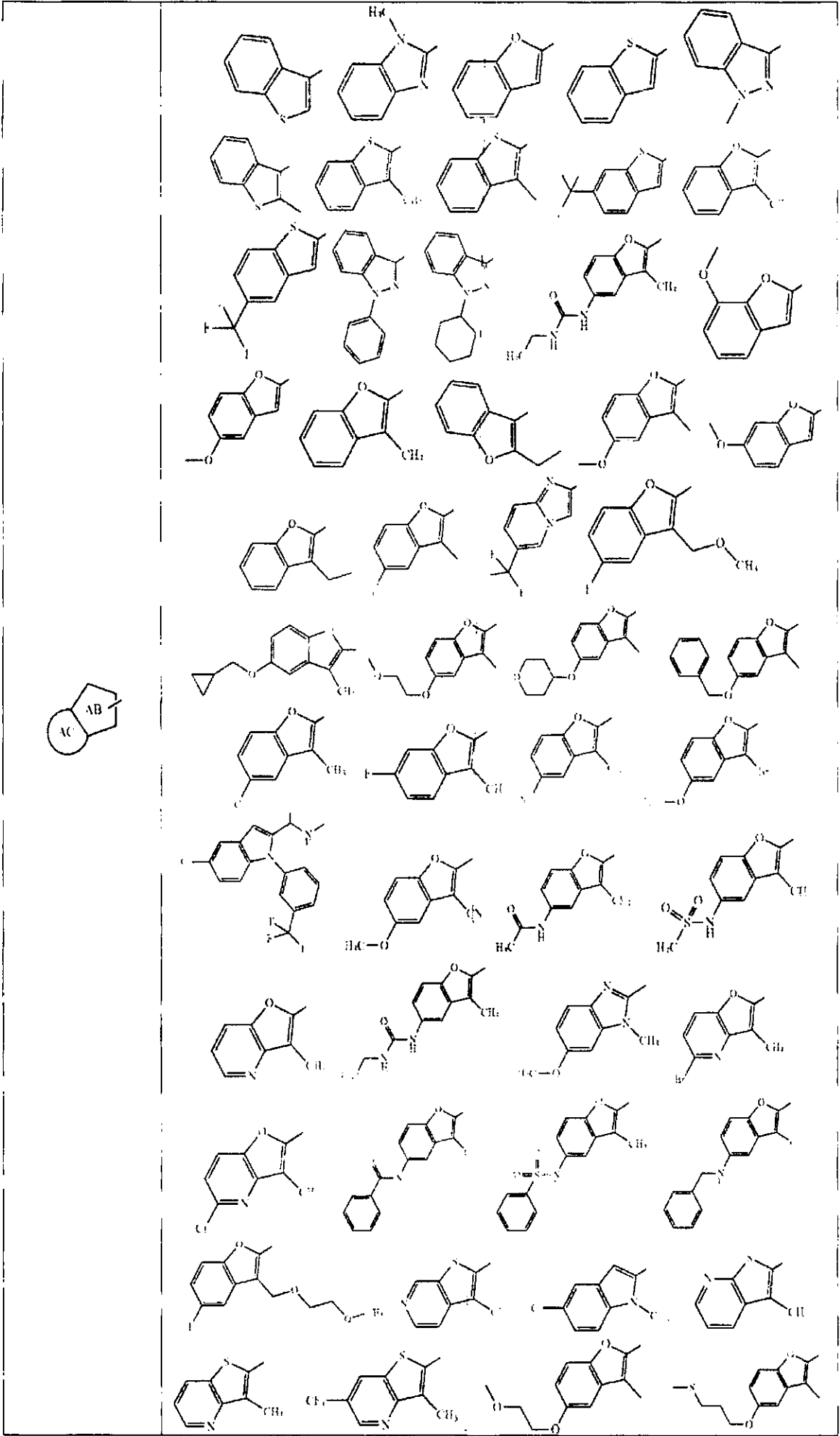
El capítulo reivindicatorio no es conciso porque contiene un excesivo número de reivindicaciones independientes, lo cual hace difícil definir cuál es el objeto que se

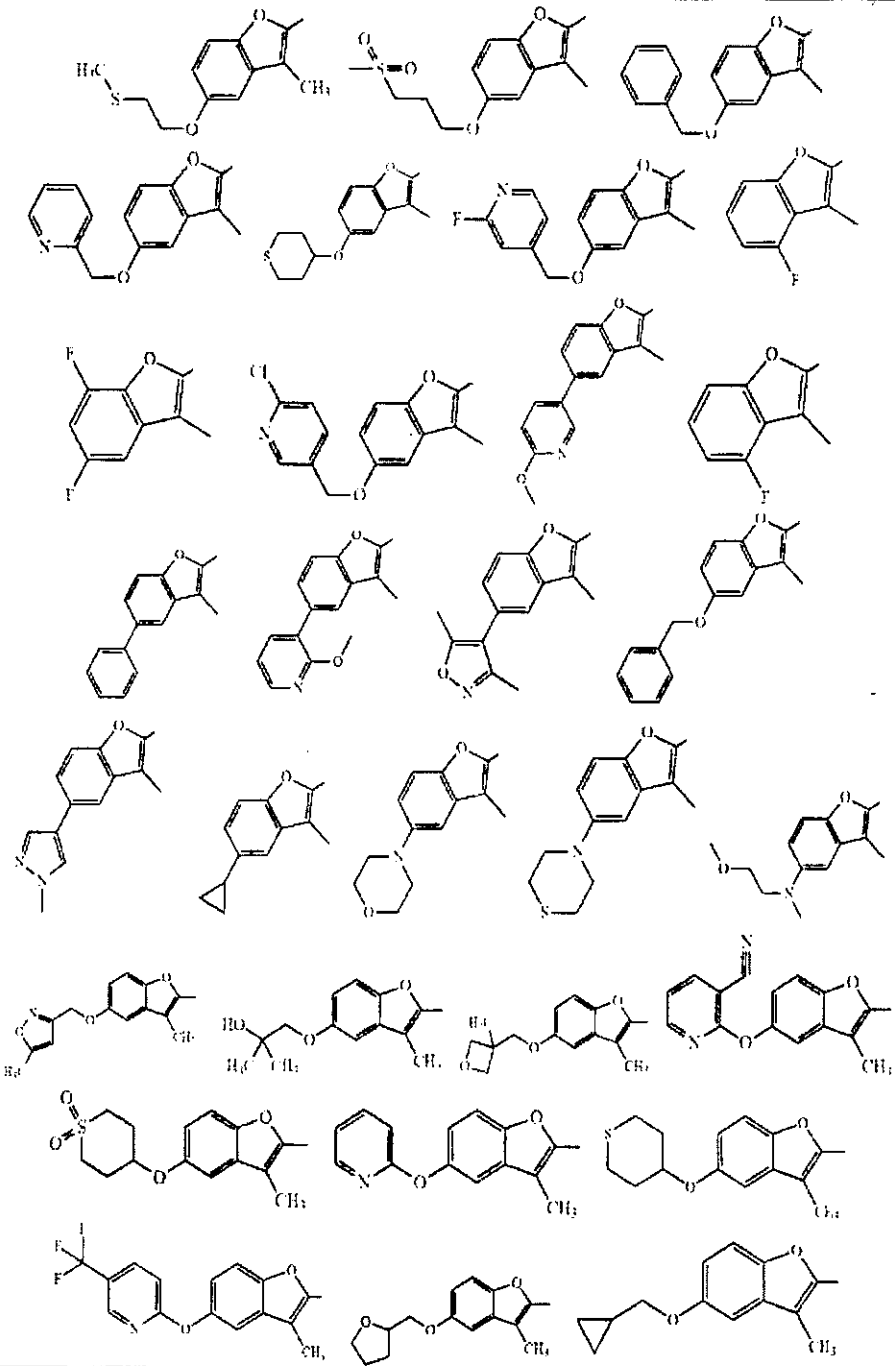
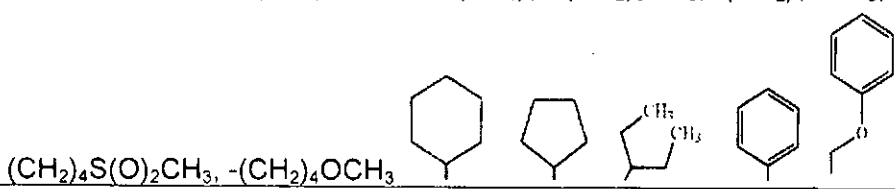
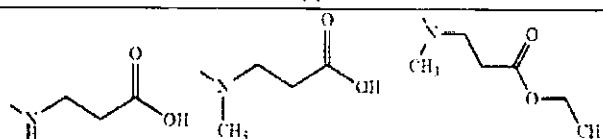
busca proteger. Las reivindicaciones 4 – 8, 12 – 14, 24 y 25 se encuentran como independientes, sin embargo estas no hacen referencia a materia diferente de la reclamada en las reivindicaciones 1 y 9, por lo tanto se sugiere hacerlas dependientes.

Las reivindicaciones 1, 2, 3, 9, 10 y 11 no son concisas porque las definiciones de AA, AB, AC, R^{A3}, A, R¹, R² y R³ incluyen géneros funcionales como heterociclo aromático, grupo heterocíclico e hidrocarburo, sin definir a cuales heterociclos o hidrocarburos se refiere el solicitante, además se nombran posibles sustituciones sin definir cuales son los sustituyentes. Esta forma de definir no es adecuada porque da lugar a un sinnúmero de posibilidades que no encuentran soporte en la descripción y por lo tanto se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados. En la descripción se encuentra:

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados Fórmula (I)
A	
B	
R ¹	
R ²	-CH₃, -CH₂CH₃, -(CH₂)₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₃, -CH₂OCH₃, -OCH₃, - 
R ³	
R ⁴	H
R ⁵	

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados Fórmula (IA)
AA	



	
R ^{A3}	-CH ₃ , -CH ₂ CH ₃ , -C(CH ₃) ₂ , -CH ₂ CH(CH ₃) ₂ , -(CH ₂) ₅ CH ₃ , -(CH ₂) ₄ SCH ₃ , - 
R ^{A4}	H
R ^{A5}	

Descripción (Art 28 D 486)

Dado que esta solicitud se refiere a secuencias de nucleótidos, deben presentarse las listas en forma separada de la descripción, bajo el título: "Listado de secuencias" y anexarlas en formato digital.

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: Marzo 05 de 2008 y se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

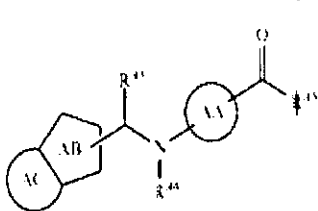
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 03/048109	Novel Glucagon Antagonists	12/Junio/2003

D1 <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=03048109A1&K=C=A1&FT=D&ND=&date=20030612&DB=&locale=en> EP divulga (Pág. 1, líneas 3 – 5; Págs. 192 – 196, reivindicación 1) un compuesto de la fórmula (I) antagonista del glucagón.

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto caracterizado por la siguiente fórmula:



o una de sus sales.

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula (IA) o sus sales	Compuesto de fórmula (I) o sus sales
AA: benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido	X: arileno o heteroarileno, opcionalmente sustituido
AB: heterociclo aromático de 5 miembros opcionalmente sustituido	D: aril o heteroaril opcionalmente sustituido
AC: anillo benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituidos	
 R ^{A3} : alquilC ₁₋₆ , cicloalquilC ₃₋₁₀ , arilC ₆₋₁₄ , grupo heterocíclico opcionalmente sustituidos	 E: cicloalquilC ₃₋₈ , aril, heteroarilo opcionalmente sustituidos Z: -(CR ¹³ R ¹⁴) _p - p: 0
R ^{A4} : H, alquilC ₁₋₆	Y: -NR ¹⁰ R ¹⁰ : H, alquilC ₁₋₆
R ^{A5} : -NR ^{A6} -CR ^{A7} R ^{A8} -CR ^{A9} R ^{A10} -COOR ^{A11} R ^{A6} , R ^{A7} , R ^{A8} , R ^{A9} , R ^{A10} y R ^{A11} : H, alquilC ₁₋₆	 A: m: 1 n: 1

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de fórmula (I) antagonista del glucagón que coincide con la fórmula (IA) de la solicitud cuando AA es benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros; AB es heterociclo aromático de 5 miembros opcionalmente sustituido; AC es anillo benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituidos; R^3 es Alquil C_{1-6} , cicloalquil C_{3-10} , aril C_{6-14} o un grupo heterocíclico, opcionalmente sustituidos; R^4 es H o alquil C_{1-6} ; R^5 es $-NR^{A6}-CR^{A7}R^{A8}-CR^{A9}R^{A10}-COOR^{A11}$; y $R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}$ y R^{11} son H o alquil C_{1-6} (Págs. 192 – 196, reivindicación 1; Pág. 204 y 205, reivindicación 36).

El documento D1 también revela composiciones de los compuestos (Pág. 208, reivindicación 25).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula (I) es la eliminación del $-CR^2R^3$ del compuesto de fórmula (I) de la anterioridad.

El efecto que logra el eliminar un carbono con sus sustituyentes es la obtención de compuestos antagonistas de glucagón.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto conocido en el documento D1 para obtener compuestos alternativos antagonistas del glucagón".

Sin embargo, el documento D1 ya divulgaba la actividad antagonista de glucagón del compuesto de fórmula (I) (Pág. 1, líneas 3 – 5; Pág. 188, línea 3 – Pág. 191; línea 29).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, realizaría pequeñas modificaciones a los compuestos del documento D1 como la eliminación de un átomo de carbono con sus sustituyentes con una amplia expectativa de mantener la actividad antagonista de glucagón para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual en ausencia de algún efecto técnico inesperado o la solución a algún problema técnico la reivindicación 1 se considera obvia.

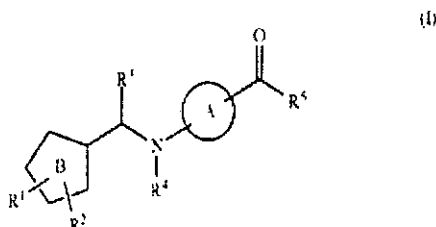
Puesto que las reivindicaciones 2 – 8, 15, 16, 24 y 25 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Conclusión:

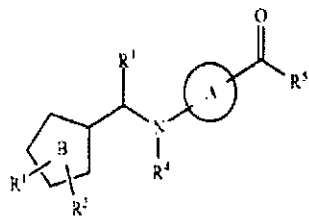
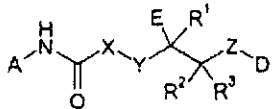
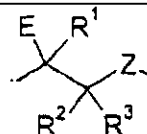
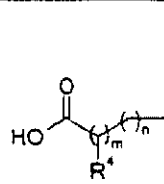
Las reivindicaciones 1 – 8, 15, 16, 24 y 25 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 8 consiste en:

Una compuesto caracterizado por la siguiente fórmula:



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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula (I): 	Compuesto de fórmula (I) 
A: benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido	X: arileno o heteroarileno, opcionalmente sustituido
B: pirazol	D: aril o heteroaril opcionalmente sustituido con R ¹⁶ , R ¹⁷ , R ¹⁸ , R ¹⁹ , R ²⁰ y R ²¹
R ¹ y R ² : grupo hidrocarburo o grupo heterocíclico opcionalmente sustituidos, hidroxilo o acilo	R ¹⁶ , R ¹⁷ , R ¹⁸ y R ¹⁹ : H, alquilC ₁₋₆ , alquenilC ₂₋₆ , alquinilC ₂₋₆ , OH, -COR ²²
 R³: alquilC₁₋₆, cicloalquilC₃₋₁₀, arilC₆₋₁₄, grupo heterocíclico opcionalmente sustituidos	 E: cicloalquilC₃₋₈, aril, heteroarilo opcionalmente sustituidos Z: -(CR¹³R¹⁴)_p p: 0
R ⁴ : H, alquilC ₁₋₆	Y: -NR ¹⁰ R ¹⁰ : H, alquilC ₁₋₆
R⁵: -NR⁶-CR⁷R⁸-CR⁹R¹⁰-COOR¹¹ R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹: H, alquilC₁₋₆, hidroxilo	 A: m: 1 n: 1

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de fórmula (I) o sus sales con actividad antagonista del glucagón, que coincide con la fórmula (I) de la solicitud cuando A es benceno o heterociclo aromático de 5 o 6 miembros; R¹ y R² son un grupo hidrocarburo o grupo heterocíclico opcionalmente sustituidos, hidroxilo o acilo; R³ es alquilC₁₋₆, cicloalquilC₃₋₁₀, arilC₆₋₁₄ o un grupo heterocíclico, opcionalmente sustituidos; R⁴ es H o alquilC₁₋₆; R⁵ es -NR^{A6}-CR^{A7}R^{A8}-CR^{A9}R^{A10}-COOR^{A11}; y R^{A6}, R^{A7}, R^{A8}, R^{A9}, R^{A10} y R^{A11} son H o alquilC₁₋₆ (Págs. 192 – 196, reivindicación 1)

El documento D1 también revela composiciones de los compuestos (Pág. 208, reivindicación 25).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula (I) es que no se encuentra un radical equivalente a -CR²R³ y que B es pirazol.

El hecho de eliminar un átomo de carbono con sus sustituyentes y utilizar como heteroarileno el pirazol es la obtención de compuestos antagonistas de glucagón.

Por tanto, el problema técnico objetivo consiste en "cómo modificar el compuesto conocido en D1 para obtener compuestos antagonistas de glucagón alternativos".

Sin embargo, el documento D1 ya divulgaba que el radical D puede ser un heteroarilo (Pág. 193, reivindicación 1) y que los compuestos representados por la fórmula (I) tienen actividad antagonista de glucagón (Pág. 1, líneas 3 – 5; Pág. 188, línea 3 – Pág. 191; línea 29).

La reivindicación es obvia, porque la persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de obtener compuestos antagonistas de glucagón alternativos a los del documento D1 realizaría pequeñas modificaciones como la eliminación de un carbono y la selección del anillo pirazol con una amplia expectativa de obtener compuestos que presentan la actividad, logrando de esta forma el compuesto de esta solicitud sin generar ningún efecto técnico inesperado ni la solución a algún problema técnico.

Por lo cual el compuesto de la Reivindicación 9 carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones 10 – 16 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Conclusión:

Las reivindicaciones 9 – 16 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

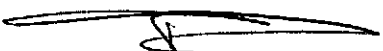
9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03/048109	1 – 16, 24 y 25	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.

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
06 NOV. 2012

Elaborado por: Jeny Paola Villate Becerra *P. Villate*
 Revisado por: Consuelo Leguizamón *CL*