

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado

DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN
notificaciones@clarkemodet.com.co
info@clarkemodet.com.co

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-003214- -00006-0000

Fecha: 2012-11-08 15:35:59 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 6

ASUNTO	Radicación	11 – 3214
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	- - - 20672
	Folios	6

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I ☒ Capítulo II

No. Solicitud Internacional: PCT/JP2009062331
Fecha de Presentación Internacional: Julio 7 de 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 15 a 266	Enero 13 de 2011
Reivindicaciones	Folios 267 a 280	Enero 13 de 2011
	Folios 307 a 321	Marzo 16 de 2001
Prioridad:	JP 2008178377	Julio 8 de 2008

2. Análisis de la Prioridad

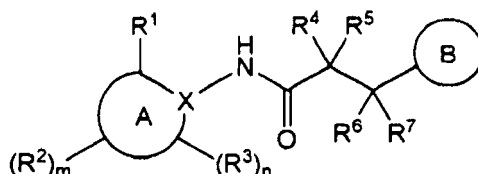
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Compuesto heterocíclico aromático que contiene nitrógeno"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos para el tratamiento de enfermedades relacionadas con dislipidemia.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos heterocíclicos con heteroátomos de nitrógeno, útiles para el tratamiento de enfermedades relacionadas con dislipidemia..

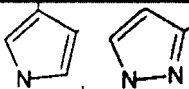
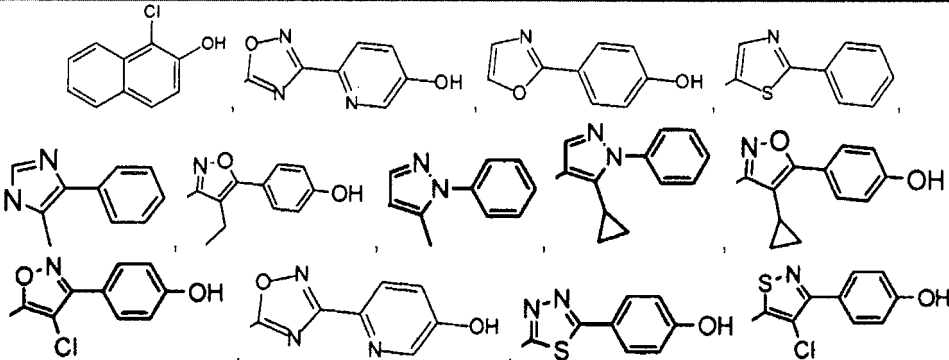
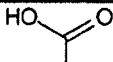


El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D207/34, C07D403/12, C07D413/12, C07D413/14, C07D417/12, A61K31/40, A61K31/4155, A61K31/4178, A61K31/422, A61K31/4245, A61K31/427, A61K31/4439, A61P3/06, A61P3/10, A61P9/10

4. De la Solicitud de la Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa porque los ciclos A y B se definen de manera muy general (A se define como "un heterociclo de 5 miembros que contiene nitrógeno y X puede ser C o N; B se define como un naftilo, heteroarilo de 9 o 10 miembros o B es B1 – B2, donde cada uno de ellos es fenil o heterociclo de 5 a 6 miembros. Tanto A como B sustituidos por α). Además, se defina α como "alquilo C₁₋₆", "hidroxialquilo C₁₋₆", "alcoxialquilo C₁₋₆", "haloalquilo C₁₋₆", "alcoxialquilo C₁₋₆", "cicloalquilalquilo C₃₋₈", "alquiltio C₁₋₆", "alquilsulfonilo C₁₋₆", entre otras, que a pesar de ser limitativas a partir de una generalidad, a partir de estos mismos se pueden generar muchos compuestos, dificultando la fijación del alcance de lo que se desea proteger en esta solicitud. Se sugiere limitar las opciones para dichos sustituyentes de acuerdo a lo soportado dentro del capítulo descriptivo y que se sustenta en la siguiente tabla:

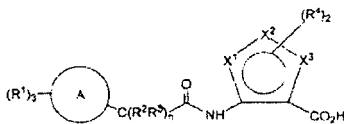
Sustituyente	Soportado en la descripción
A	
B	
R ¹	
R ²	Metil, propil, fluoropropil, 2,4-difluorobencil, metoxipropil, isopropil, bencil
R ³ , R ⁴ , R ⁵ , R ⁶ , R ⁷	H, F, metil
α	OH, F, Cl, Br, CN, metil, etil, propil, isopropil, trifluorometil, metilcarbonil

5. Determinación del Estado de la Técnica

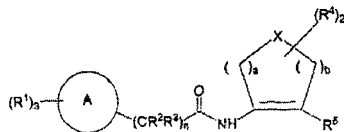
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: Julio 8 de 2008 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2007120575	Niacin receptor agonist, compositions contain such compounds and methods of treatment	Octubre 25 de 2007
D2	WO2007002557	Niacin receptor agonist, compositions contain such compounds and methods of treatment	Enero 4 de 2007
D3	WO2006057922	Niacin receptor agonist, compositions contain such compounds and methods of treatment	Junio 1 de 2006

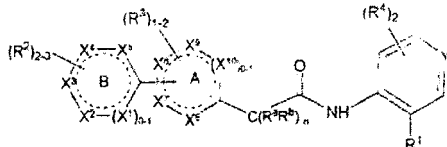
D1: Divulga compuestos derivados de heterociclos para el tratamiento de dislipidemias.
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2007120575A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20071025&DB=&locale=en> EP



D2: Divulga compuestos derivados de cicloalquenos para el tratamiento de dislipidemias.
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2007002557A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20070104&DB=&locale=en_EP



D3: Divulga compuestos biarilos para el tratamiento de dislipidemias.
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006057922A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20060601&DB=&locale=en_EP



6. Examen de Patentabilidad.

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

La reivindicación 1 divulga un compuesto representado por la siguiente fórmula general (I) o una sal del mismo farmacéuticamente aceptable caracterizado porque... (Folios 307 a 309)

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

Solicitud	D1	D2
Compuesto de la Fórmula I 	Compuesto de la Fórmula I 	Compuesto de la Fórmula I
A es un anillo heterociclo de 5 miembros que contienen N y X es C, de manera preferible, A es 	Donde de X ¹ , X ² y X ³ solamente uno de ellos es S y los otros dos son C.	Donde X puede ser NH o NR ⁶ , a y b son 1
R ¹ es COOH o un tetrazolil		R ⁵ es COOH o tetrazolil
(R ²) _m donde es α, donde α es alquilo de 1 a 6 carbonos, halógeno, CN, alcoxilquilo de 1 a 6 carbonos, haloalquilo de 1 a 6 carbonos, tioalquilo de 1 a 6 carbonos, alquilamino 1 a 6 carbonos, haloalcoxilquilo de 1 a 6 carbonos y m es 1 ó 2. (R ³) _m donde R3 es, fenil alquilo sustituido por α o un heterocicilil alquilo sustituido por α y n es 0 ó 1.	R ⁴ es H, halógeno, CN, alquilo de 1 a 4 carbonos, alcoxido de 1 a 4 carbonos, tioalquilo de 1 a 4 carbonos, haloalquilo de 1 a 4 carbonos o haloalcoxido de 1 a 4 carbonos	R ⁴ es H o R ⁶ , donde R ⁶ es alquilo de 1 a 3 carbonos opcionalmente sustituidos por halógeno, alquilamino de 1 a 3 carbonos OH, NH ₂ , arilo, heterociclo heteroarilo
Donde R ⁴ , R ⁵ , R ⁶ y R ⁷ son H, halógeno, OH, alquilo de 1 a 6 carbonos, haloalquilo de 1 a 6 carbonos, alcoxido de 1 a 6 carbonos	C(R ² R ³) _n ; n es 2 Donde R ² y R ³ son H, F, OH, alquilo de 1 a 3 carbonos, haloalquilo de 1 a 3 carbonos, alcoxido de 1 a 3 carbonos.	C(R ² R ³) _n ; n es 2 Donde R ² y R ³ son H, F, OH, alquilo de 1 a 3 carbonos, haloalquilo de 1 a 3 carbonos, alcoxido de 1 a 3 carbonos.
B es naftilo sustituido 1 a 4 veces por α o heteroarilo de 9 o 10 miembros	A es un arilo de 6 a 10 miembros o un heterociclo de	A es un arilo de 6 a 10 miembros o un heterociclo de

sustituido 1 a 4 veces por α . Donde α es alquilo de 1 a 6 carbonos, halógeno, hidroxialquilo de 1 a 6 carbonos, haloalquilo de 1 a 6 carbonos, cicloalquilalquilo de 3 a 8 carbonos, cicloalquilo de 3 a 8 carbonos, alcóxido de 1 a 6 carbonos, alquiltio de 1 a 6 carbonos, alquilsulfonilo de 1 a 6 carbonos, alquilamino de 1 a 6 carbonos, dialquilamino de 1 a 6 carbonos, carbonilamino, CN, NO ₂ OH, NH ₂ , carbonilalquilo de 1 a 6 carbonos, carbonilaminoalquilo de 1 a 6 carbonos,	5 a 13 miembros trisustituido por R ¹ . Donde R ¹ es halógeno, OH, CN, NH ₂ , NO ₂ , sulfonilalquilo de 1 a 6 carbonos, carbonilalquilo de 1 a 6 carbonos, alquilo de 1 a 6 carbonos, alcóxido de 1 a 6 carbonos alquilamino de 1 a 6 carbonos, dialquilamino de 1 a 6 carbonos, carbonilamino, carbonilalquilo de 1 a 6 carbonos, carbonilaminoalquilo de 1 a 6 carbonos, tioalquilo de 1 a 6 carbonos	5 a 13 miembros trisustituido por R ¹ . Donde R ¹ es halógeno, OH, CN, NH ₂ , NO ₂ , sulfonilalquilo de 1 a 6 carbonos, carbonilalquilo de 1 a 6 carbonos, alquilo de 1 a 6 carbonos, alcóxido de 1 a 6 carbonos alquilamino de 1 a 6 carbonos, dialquilamino de 1 a 6 carbonos, carbonilamino, carbonilalquilo de 1 a 6 carbonos, carbonilaminoalquilo de 1 a 6 carbonos, tioalquilo de 1 a 6 carbonos
--	---	---

D1 y D2 se consideran los Estados de la Técnica más cercanos a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulgan compuestos derivados de heterociclos útiles en el tratamiento de dislipidemias. (D1: Páginas 2 y 3; D2: Páginas 2 a 4).

La diferencia entre la invención y D1 consiste en que en para la invención el heterociclo unido al N del grupo carboxamido conocido como A es un pirrol, mientras que para D1, el heterociclo unido al N del grupo carboxamido conocido como B es un tiofeno.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o ventajoso a los compuestos de esta solicitud con respecto a lo divulgado en D1 debido a que en un heterociclo aromático plano de 5 miembros donde hay un heteroátomo con un par de electrones libres (en estos casos S o N) la actividad no debe cambiar de manera significativa porque esta porción de la molécula debe interactuar de manera similar con un receptor determinado.

El Problema Técnico Objetivo que se plantea en esta solicitud es: ¿Cómo modificar los compuestos del Estado de la Técnica D1 para obtener compuestos heterocíclicos nuevos con utilidad para el tratamiento de dislipidemias?

D2 divulga compuestos derivados de heterociclos donde un anillo heterocíclico de 5 miembros unido al N de un grupo carboxamido, posee un heteroátomo X el cual puede ser N opcionalmente sustituido para formar un pirrol y cuyo sustituyente en posición 4 aparte de ser COOH, puede ser un tetrazolil (Página 2, líneas 6 a 12 y página 3, línea 1)

Por lo tanto, para una persona versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D1 y D2, sin mayor esfuerzo puede cambiar el anillo de tiofeno que se muestra en D1 por un anillo de pirrol sugerido en D2 con el sustituyente faltante en D1 para la posición 4 de dicho anillo, para obtener de esta manera los compuestos de esta invención de manera obvia o evidente

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D1 y en D2, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 2 a 17, 22 y 23, dependientes de la reivindicación 1, no muestran características inventivas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

La reivindicación 1 divulga un compuesto representado por la siguiente fórmula general (I) o una sal del mismo farmacéuticamente aceptable caracterizado porque... (Folios 307 a 309)

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o ventajoso a los compuestos de esta solicitud con respecto a lo divulgado en D2.

El Problema Técnico Objetivo que se plantea en esta solicitud es: ¿Cómo modificar los compuestos del Estado de la Técnica D2 para obtener compuestos heterocíclicos nuevos con utilidad para el tratamiento de dislipidemias?

D3 divulga compuestos derivados de heterociclos donde un sistema de dos anillos, los cuales pueden ser fenilo o heterociclo de 5 o 6 miembros, se unen que se une al carbono β del grupo carboxamido (Página 2, líneas 5 a 7 y 16 a 25)

Por lo tanto, para una persona versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D2 y D3, sin mayor esfuerzo puede cambiar los anillos carbociclos de 6 a 10 miembros o heterociclos de 5 a 13 miembros que se muestran en D2 por un sistema de dos anillos los cuales son fenilo o heterociclo de 5 o 6 miembros sugerido en D3 con sus respectivos sustituyentes, para obtener de esta manera los compuestos de esta invención de manera obvia o evidente

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D2 y en D3, carece de Nivel Inventivo.

Las reivindicaciones 2 a 23, dependientes de la reivindicación 1, no muestran características inventivas adicionales a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2007120575	1 a 17, 22 y 23	Nivel Inventivo
D2	WO2007002557	1 a 23	Nivel Inventivo
D3	WO2006057922	1 a 23	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.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

Elaborado por: Alexander Ramírez Reyes *OK*
Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso