

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

202075
Bogotá, D.C., (11 de Septiembre de 2007)

Abogado
HECTOR GOMEZ MEJIA
Solicitante: TANABE SEIYAKU CO.,LTD.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-028249- -00005-0000

Fecha: 2007-09-20 14:14:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03028249
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	11647
	Folios	015

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

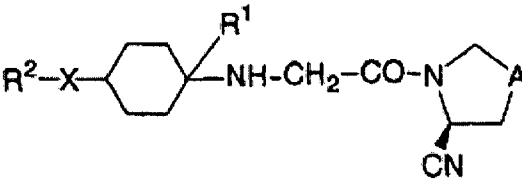
- 1.1. Descripción: Folios: 226 a 417 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 418 a 434 como se radicó inicialmente
- 1.3. Prioridad: Folios: 1 a 1 (06 de Octubre del 2000 ,JP308528/2000)
(12 de Octubre del 2000 ,JP312562/2000)
(30 de Marzo del 2001,JP099251/2000)

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: Compuesto alifático de anillo de 5 miembros que contiene nitrógeno.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:
Anillo de 5 miembros que contiene nitrógeno.

Reivindicaciones 1-17 : Compuesto de la fórmula (I):



Reivindicaciones 18-19	: Método para prepararlo.
Reivindicaciones 20-24	: Método terapéutico
Reivindicaciones 25-30	: Uso.
Reivindicaciones 31-32	: Composición farmacéutica.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos que tengan una actividad inhibidora superior de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV), útiles entre otras para el tratamiento de la diabetes y la obesidad.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I), procedimientos para su preparación y composiciones farmacéuticas que emplean dichos compuestos.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC) : A61P43/00 ,C07D207/16, C07D401/12, C07D403/12, C07D409/12, A61K31/4439, A61K31/501, A61K31/497,

3. De la solicitud de Patente

3.1. Título:

- El título de la solicitud no debería incluir el término "alifático " . Se solicita realizar la corrección respectiva.

3.2. Descripción (artículo 28 D. 486)

- Para la descripción en los folios (226 y 229) se encuentra el término **Nitrógeno alifático** el cual no es claro. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Para la descripción en el folio 232 el término "grupos cíclicos parcialmente o completamente saturados de los mismos , etc", no es claro ni conciso. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- En la descripción, el método de preparación para los compuestos de fórmula I (Folio 260) se habla de la reacción entre un compuesto de fórmula II : f.1/25 con un compuesto de fórmula III : f2/25. no es claro ya que no se ven cuales son los compuestos de fórmula II y cuales los de fórmula III . Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Teniendo en cuenta la definición de materia que realiza el interesado en los folios (418 a 434) acerca de los compuestos de la fórmula general (I), esta Dependencia se permite señalar que la invención, no se encuentra sustentada en el aparte descriptivo de la solicitud. Lo único que se encuentra son cuadros con propiedades físicas de algunos de los compuestos sintetizados (Folios 335 – 417) , pero no se observan datos en los que se observen una actividad inhibidora superior de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV) que es el problema técnico a solucionar, ni mucho menos la ventaja sobre los compuestos del estado de la técnica.

En consecuencia, las reivindicaciones 1–17, 18-19 y 31-32 no encuentran sustento dentro de los ejemplos que ilustran la invención. Se requiere

al solicitante ajustar su capítulo descriptivo basado en la reivindicaciones formuladas y para aquellas modalidades que son objeto de la invención.

3.3. Reivindicaciones (artículo 30 D 486).

- Las reivindicaciones 1,2,3,8,10,18 y 19 no son claras ni concisas, ya que se observan términos como “grupo alquilo inferior , alcoxialquilo inferior, hidroxialquilo inferior, grupo hidrocarburo monocíclico, bicíclico o tricíclico, grupo heterocíclico monocíclico, bicíclico o tricíclico , alcoxycarbonilo inferior, dialquilamino inferior, grupo cicloalquilo inferior etc...” (no se especifica el número de carbonos) y por este motivo la característica esencial de las moléculas que corresponden a la estructura de la fórmula (I) no es representativa, ni define todas las posibilidades de los compuestos que se pueden obtener una vez se procede a realizar las sustituciones respectivas en dicha estructura. Se le requiere al interesado definir o especificar las sustituciones (si es por ejemplo pirrol, pirrolidina etc) y los números de carbono a los que hace referencia y que son relevantes para la invención.
- Las reivindicaciones 1,9,10 ,14 , 15,18 y 19 no son claras ni concisas ya que se observan términos como “un grupo cíclico que puede ser sustituido” “grupo amino que puede ser sustituido” etc. , (no se especifica los sustituyentes que lo conforman) y por este motivo la característica esencial de las moléculas que corresponden a la estructura de la fórmula (I) no es representativa, ni define todas las posibilidades de los compuestos que se pueden obtener una vez se procede a realizar las sustituciones respectivas en dicha estructura para R^2 . Se le requiere al interesado definir o especificar las sustituciones de estos grupos (si es por ejemplo ciano , halógeno ,etc..) que son relevantes para la invención.
- La reivindicación 2 no es clara ni concisa para los sustituyentes de los grupos A y B ya que se observan términos como “ un grupo amino mono o disustituido, un grupo cicloalquilo inferior sustituido o no sustituido, fenilo sustituido o no sustituido , fenilsulfonilo sustituido o no sustituido etc...” , (no se especifican los sustituyentes que lo conforman) y por este motivo la característica esencial de las moléculas que corresponden a la estructura de la fórmula (I) no es representativa, ni define todas las posibilidades de los compuestos que se pueden obtener una vez se procede a realizar las sustituciones respectivas en dicha estructura para los sustituyentes A y B. Se le requiere al interesado definir o especificar las sustituciones de estos grupos (si es por ejemplo ciano , halógeno , etc...) que son relevantes para la invención.
- Para la reivindicación 2 el término un grupo amino mono o disustituido se repite en la misma línea (16). Se solicita hacer la corrección respectiva.
- La reivindicación 3 no es clara ni concisa para los sustituyentes del grupo C ya que se observan términos como fenilo sustituido o no sustituido , fenilsulfonilo heterociclo monocíclico sustituido o no sustituido etc.. , (no se especifican los sustituyentes que lo conforman) y por este motivo la característica esencial de las moléculas que corresponden a la estructura de la fórmula (I) no es representativa, ni define todas las posibilidades de los compuestos que se pueden obtener una vez se procede a realizar las sustituciones respectivas en dicha estructura para el sustituyente C . Se le

requiere al interesado definir o especificar las sustituciones de estos grupos (si es por ejemplo ciano , halógeno , y que son relevantes para la invención.

- Para las reivindicaciones 5 , 6 y 7, el término grupos cíclicos parcialmente o completamente saturados de los mismos , etc, no es claro ni conciso. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Para las reivindicaciones 4 ,5, 6 y 7 el término un grupo amino **sustituido** no es claro ni conciso. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Para la reivindicación 7 el término un grupo cíclico que puede ser **sustituido** no es claro ni conciso. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- La reivindicación 18 no es clara ni concisa ya que no detalla los pasos , condiciones, reactivos, etc. que conforman la preparación del compuesto de fórmula I. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Para las reivindicación 18 y 19 se encuentra el término **Nitrógeno alifático** el cual no es claro. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- La reivindicación 19 no es clara ni concisa ya que no detalla los pasos , condiciones, reactivos, etc. que conforman la preparación del compuesto de fórmula I-a. Se solicita hacer la corrección o aclaración respectiva.
- Las reivindicaciones 31-32 que hablan sobre composiciones farmacéuticas en general. Es necesario que el solicitante concrete de forma clara e inequívoca el objeto de la protección. Si es una forma farmacéutica o formulación farmacéutica en particular, las reivindicaciones también deben ser encabezadas acorde a tal decisión y caracterizada únicamente por los elementos técnicos que la conforman como principios activos, excipientes y proporciones si es necesario.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Se aclara que, de acuerdo al Art 25 , las reivindicaciones 1–19,31-32 carecen de unidad de invención por lo siguiente:

Se distinguen los siguientes grupos de invención (no limitantes):

- Grupo I : Cuando ($A = CH_2$). Derivados de cianopirrolidonas
- Grupo II : Cuando ($A = S$) Derivados de cianotiazolidinas.
- Grupo III: Método de preparación entre el compuesto de fórmula II y el compuesto de fórmula III para obtener los compuestos de fórmula I.
- Grupo IV: Método de preparación entre el compuesto de fórmula IV y el compuesto de fórmula V para obtener los compuestos de fórmula I-a

Cada una de estas invenciones , es una invención distinta caracterizada por su propia característica técnica y no se encuentran tan unidas como para formar un

concepto general inventivo único.

En consecuencia, dado que las realizaciones preferidas de la invención reivindicada, manifiestan una falta evidente de un concepto inventivo común a todas ellas, toda vez que en el desarrollo y caracterización de la fórmula I se identifican núcleos estructuralmente diferentes , esta Dependencia recomienda realizar las modificaciones correspondientes o proporcionar cada uno de los grupos de invención por separado para su correspondiente evaluación.

5. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

Se aclara que, de acuerdo al Art 20 literal d) el método terapéutico de las reivindicaciones 20-24 no son patentables.

6. Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

Se aclara que, de acuerdo con el Art 14, no se puede otorgar patente al uso de las reivindicaciones 25-30 , porque no son un producto ni un procedimiento tecnológico.

7. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 6 de Octubre de 2000, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud :

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US6110949	N-(glicil sustituidas)-4-cianotiazolidinas ,composiciones farmacéuticas que las contienen y su uso como inhibidores de la dipeptidilpeptidasa IV .	29 de Agosto del 2000
D2	WO98/19998	2-cianopirrolidinas N-sustituidas	14 de Mayo de 1998
D3	Quimica organica Grupo Editorial Iberoamérica	Sección 13.9 B. Preparación de las amidas	Año 1981

8. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

8.1. Nivel inventivo (artículo18 D486)

Los documentos del estado de la técnica más cercano son:

D1 (Folios 468-470) que enseña compuestos N-(glicil sustituidos)-4-cianotiazolidinas ,composiciones farmacéuticas que las contienen **y principalmente que se caracterizan por una actividad inhibidora de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV)**

D2 (Folios 471-474) que enseña compuestos de 2- cianopirrolidonas N-sustituidas ,composiciones farmacéuticas que las contienen **y principalmente que se caracterizan por una actividad inhibidora de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV).**

La diferencia con D1 (Folio 470)y D2 (Folio 473) es que en esta solicitud los **Compuestos son** cianotiazolidinas y cianopirrolidonas sustituidos en el anillo ciclohexilo en su **cuarta posición por el grupo (R2-X-)** y en la anterioridad son **Compuestos derivados de cianotiazolidinas y cianopirrolidonas , sin tener en el anillo ciclohexilo en su cuarta posición el grupo (R2-X-)**

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado ò una ventaja a los compuestos reivindicados en comparación con los compuestos del Estado de la Técnica más cercano; porque estos compuestos siguen teniendo **actividad inhibidora de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV).**

Así que el Problema Técnico planteado en esta solicitud : la necesidad de compuestos que tengan una actividad inhibidora de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV) útiles para el tratamiento y/o profilaxis de útiles para el tratamiento de la diabetes y la obesidad, se había solucionado previamente mediante compuestos muy similares de derivados de **cianotiazolidinas y cianopirrolidonas , sin tener el grupo (R2-X-)** como reemplazo en la cuarta posición del anillo ciclohexilo. De manera que los nuevos compuestos **son una alternativa a los compuestos conocidos** porque no presentan un mayor efecto **inhibidor de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV).**

El experto en la materia, en vista del Estado de la Técnica en su totalidad, es decir en vista de D1 y D2, hubiera sugerido sin mucho esfuerzo de su parte, modificar los grupos de D1 mediante la sustitución en el anillo ciclohexilo en su cuarta posición de un grupo H por **el grupo R2-X- , para lograr los compuestos de cianotiazolidinas y cianopirrolidonas** reivindicados que no parecen tener un mayor efecto **inhibidor de la dipeptidilpeptidasa IV (DPPIV).**

Por lo cual se consideran obvios para el experto en la materia. En consecuencia, carecen de nivel inventivo.

El método de preparación de la reivindicación 18 que consiste en partir de un compuesto de fórmula II (que se divulgaba previamente en D2 (Folio 474) y hacerlo reaccionar con un compuesto de la fórmula III para la formación de los compuestos reivindicados en 1-17 , no está conformado por pasos sorprendentes para el Experto en la Materia; ni tampoco el producto obtenido es sorprendente, como ya se explicó. De manera que carece de Nivel Inventivo.

El método de preparación de la reivindicación 19 que consiste en partir de un compuesto de fórmula IV (**ácido carboxílico**) (que se divulgaba previamente en D3 (Folio 475) y hacerlo reaccionar con un compuesto de la fórmula V (**amina cíclica**) para la formación de los compuestos reivindicados I-a, no está conformado por pasos sorprendentes para el Experto en la Materia; ni tampoco el producto obtenido es sorprendente, como ya se explicó. De manera que carece de Nivel Inventivo.

Las composiciones farmacéuticas que contienen el compuesto reivindicado (Reivindicaciones 31-32), no tiene nivel inventivo porque el componente que lo caracteriza no es inventivo.

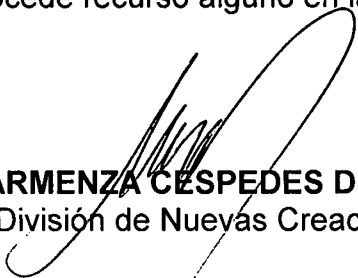
9. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	US6110949	1-17 , 31-32	Nivel inventivo
D2	WO98/19998	1-17 , 18, 31-32	Nivel inventivo
D3	Quimica organica Grupo Editorial Iberoamérica	19	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 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 artículo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001, advirtiéndole que contra él no procede recurso alguno en la vía gubernativa.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 21 SET. 2001

CONCEPTO TECNICO No. 1596	EXAMINADOR TECNICO Código No.202075
-------------------------------------	---

no ORG