

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
ALICIA LLOREDA RICAURTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-027152- -00007-0000

Fecha: 2009-04-16 12:49:18 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03027152
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	411
	Oficio	Nº 4 4 5 3
	Folios	011

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☐

No. Sol. Internacional PCT/EP01/09926

Fecha de Presentación Internal. Agosto 27 de 2001

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: 47 a 163 como se radicó inicialmente.
Folios: 239 a 241 radicado fecha 2008/08/19.

1.2. Reivindicaciones: Folios: 164 a 177 como se radicó inicialmente
Folios: 242 a 251 radicado fecha 2008/08/19.

1.3. Prioridad: Abril/09/2000,EP, 00203067.4

1.4 Respuesta del solicitante Folios: 222 a 251

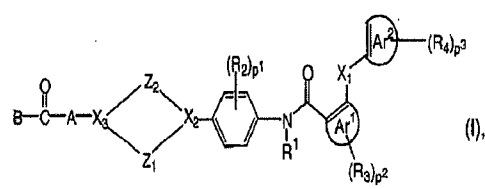
2. Objeto de la invención

Título de la invención: POLIARILCARBOXAMIDAS UTILES COMO AGENTES REDUCTORES DE LIPIDOS.

Problema Técnico Planteado: Es la necesidad de nuevos agentes reductores de

lípidos con mejorada eficiencia.

Solución: Reivindicaciones 1-5,15-16, proporcionan novedosos compuestos de poliarilcarboxamida de fórmula (I), inhibidores selectivos de MTP (proteína de transferencia de triglicéridos microsómica). Reivindicaciones 15-16 composiciones que los contienen, y las reivindicaciones 6-13, proveen los procesos de obtención de los compuestos de formula (I) reclamados.



IPC: C07D243/08; A61K31/4409; A61K31/445; A61K31/4545; A61K31/495.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

En la descripción (folios 158-163 pgs 112-117) se describen ensayos para compuestos de fórmula (I) los cuales arrojaron valores de pIC50 entre 5 y 9 mostrándose actividad terapéutica de los compuestos evaluados, los cuales corresponden a valores de IC50 entre 1.84nM y 3000nM.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En la reivindicación 1, se menciona que cuando X_3 es CH, A puede ser un átomo de N sustituido con fenilo, lo cual no esta sustentado con ejemplos en la descripción; igualmente se menciona: "...entonces B no puede representar metilo, fenilo..." lo cual no es conciso ya que en los significados de B mencionados en la misma reivindicación no aparece Fenilo.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: Abril/09/2000.

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	WO0032582	Benzamide derivatives and their use as apob-100 secretion inhibitors	Junio /08/2000

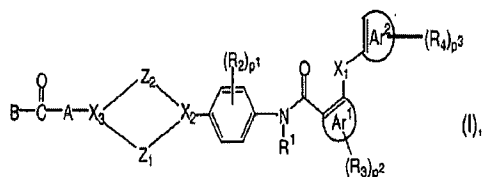
D1(folios 199-209,254-256)

5. Análisis de patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)

5.1 Nivel inventivo (artículo18 D486)

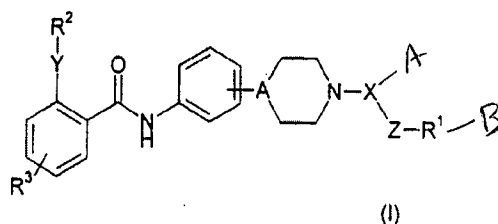
Respecto a la solicitud en estudio:

La reivindicación 1 se refiere a: Los compuestos de poliarilcarboxamida de fórmula (I)



A continuación se procede a comparar las características técnicas de la solicitud con la de la anterioridad D1.

Estado de la Técnica más cercano: El documento del Estado de la Técnica más próximo es D1, que enseña compuestos útiles para inhibir la producción hepática de apoproteína B-100 (apoB-100), por lo tanto son utilizados en el tratamiento de condiciones (obesidad o aterosclerosis, especialmente aterosclerosis coronaria, enfermedad cardíaca isquémica, enfermedad vascular periférica y enfermedad vascular cerebral) que provienen de elevados niveles de apoB-100 en la circulación (folio 200, pg 1, renglones 1-5 y folio 203, pg 18, renglones 20-25), representados por la fórmula general (I):



La solicitud se diferencia de D1, es que dicha solicitud menciona para A el significado de un alcanodiilo C1-6 sustituido con un arilo o un heteroarilo y para B los significados de: alquilo C₁₋₁₀, NR6R7 ó OR8.

El Efecto Técnico que logra la diferencia es obtener compuestos de poliarilcarboxamida de fórmula (I), inhibidores de MTP (proteína de transferencia de triglicéridos microsómica). Con los datos allegados en la descripción (folios 158-163 pgs 112-117), es posible evidenciar, que los compuestos reclamados no presentan una eficiencia mejorada (que sean mas selectivos como inhibidores de MTP); dado que los valores de IC₅₀ arrojados por dichos compuestos, están entre 3000nM y 1.84nM siendo mayores que los de los compuestos de D1, los cuales presentan valores de IC₅₀ entre 10 y 20 nM (ejemplos 1,3,63,4, 62, 2,6,64,5, folios 255-256, pgs 67-68).

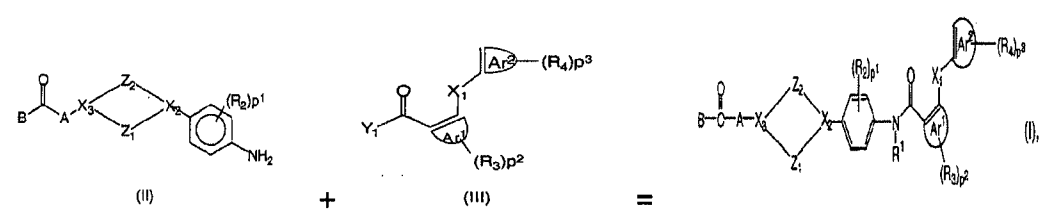
El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud es: la necesidad de compuestos alternativos de poliarilcarboxamida de fórmula (I), inhibidores de MTP (proteína de transferencia de triglicéridos microsómica), ya se había resuelto previamente mediante los compuestos divulgados en D1.

Se considera que los cambios de sustituyentes en A y B (corresponden en la anterioridad a X y R1) para obtener los compuestos de la solicitud, no muestran una ventaja técnica.

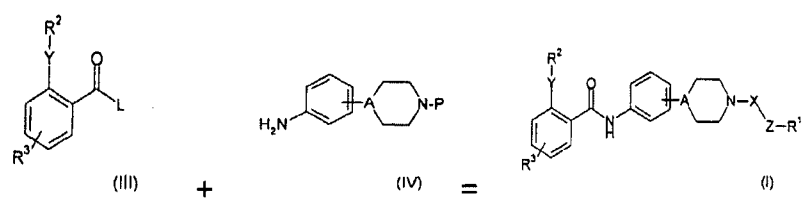
Como resultado del análisis anterior, se concluye que las reivindicaciones de 1-5 y 15-16, así como las reivindicaciones 14 y 17 que se refieren a las composiciones que los contienen, **no tienen Nivel Inventivo**.

Las reivindicaciones 6-13 se refieren a procesos para obtener los compuestos de la reivindicación 1.

Reivindicación 6: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (II) con uno de formula (III).

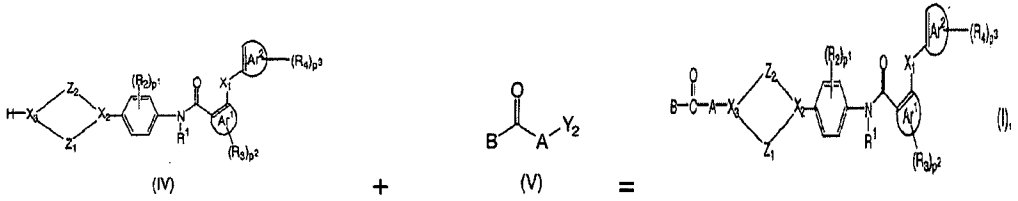


Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: **D1**, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (III) con uno de formula (IV), (folio 204, pg 23, renglones 4-25 y folio 205, pg 24, renglones 1-17):

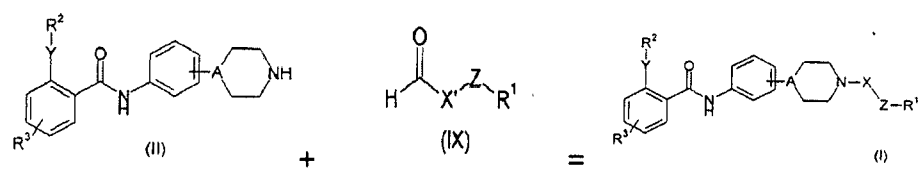


para obtener un compuesto de formula (I) . El anterior procedimiento sugiere al reclamado en esta reivindicación, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica **D1**, (folio 204, pg 23, renglones 4-25 y folio 205 pg 24, renglones 1-17) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Reivindicación 7: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (IV) con un compuesto de formula (V).

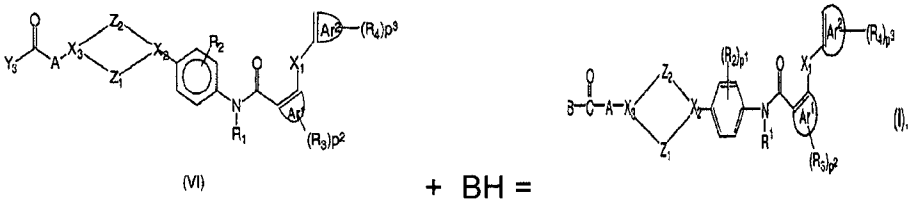


Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: **D1**, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (II) y compuesto de formula (IX) , (folio 206, pg 25, renglones 15-25):



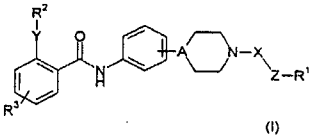
para obtener un compuesto de formula (I). El anterior procedimiento sugiere al reclamado en esta reivindicación, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica (D1) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Reivindicación 8: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (VI) con un compuesto de formula BH.

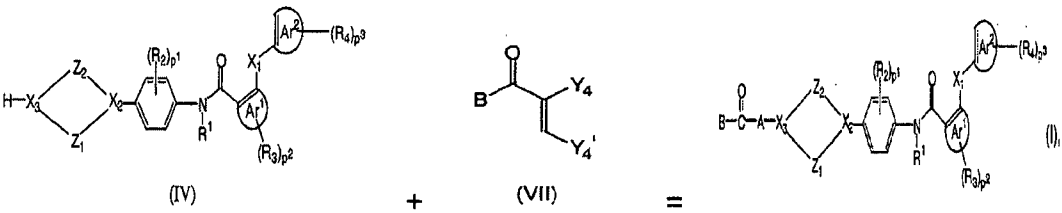


siendo B(B is NR₆R₇ or OR₈), y Y₃ puede ser halo ó hidroxí.

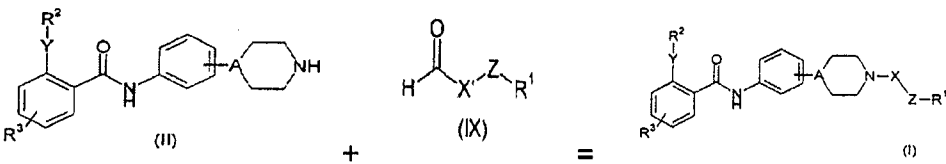
Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: **D1**, que enseña un procedimiento para



Reivindicación 9: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (IV) con un compuesto de formula (VII).

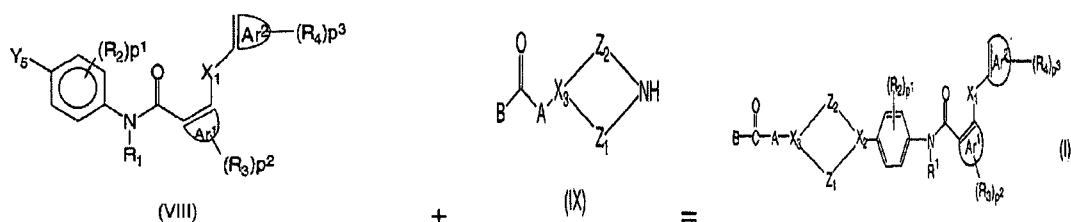


Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: **D1**, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (II) y compuesto de formula (IX), (folio 206, pg 25, renglones 15-25):

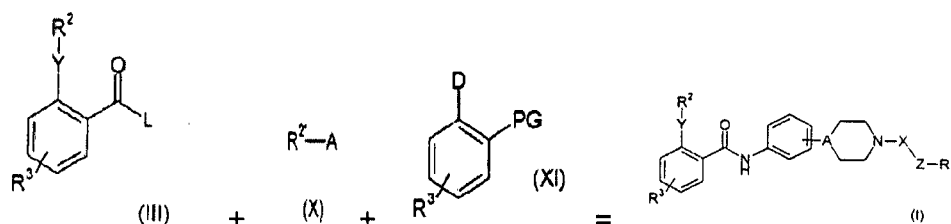


para obtener un compuesto de fórmula (I) . El anterior procedimiento sugiere al reclamado por esta reivindicación, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica (D1) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Reivindicación 10: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (VIII) con uno de fórmula (IX).

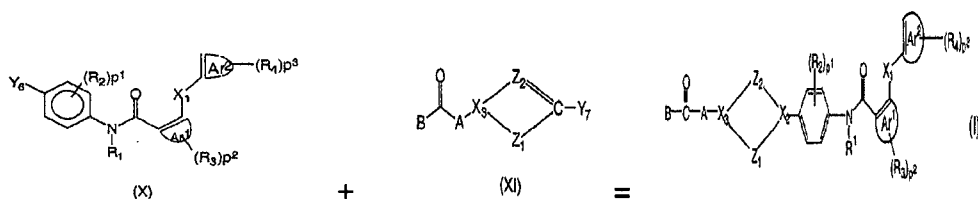


Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: D1, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de fórmula (III), donde Y es un enlace directo, R² es un fenilo o un heterocicliil aromático y L es un grupo hidroxil; puede ser preparado primeramente acoplando el ácido borónico con un grupo saliente disponible representado por el compuesto de la fórmula (X) y un compuesto de fórmula (XI), (folio 207, pg 26, renglones 11-30):



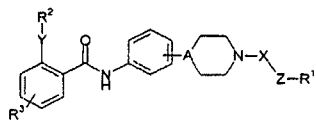
para obtener un compuesto de fórmula. El anterior procedimiento sugiere al reclamado en la presente solicitud en la reivindicación 9, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica (D1) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Reivindicación 11: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (X) con uno de fórmula (XI).



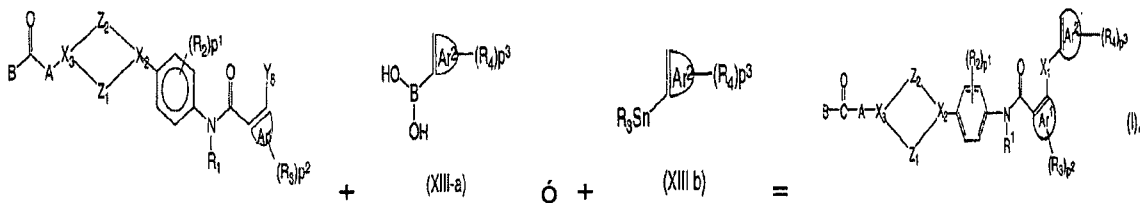
Dicho procedimiento se ve afectado por el siguiente documento más cercano encontrado en el Estado de la Técnica: D1, ya que como se menciona en dicho documento: " los métodos descritos en él, son útiles para introducir grupos deseados en cualquier etapa de la obtención, del compuesto requerido, de manera gradual y se aprecia que estos métodos generales se pueden combinar de maneras diferentes en tales procesos; considerando que la secuencia de las reacciones en los procesos de varias etapas debe por supuesto ser elegida de modo que las condiciones de las reacciones

usadas no afecten a los grupos en la molécula que se desea obtener, como producto final, (folio 208 , pg 27, rengloners 1-7); en este caso compuestos



de fórmula (I) . El anterior procedimiento sugiere al reclamado en esta reivindicación, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica (D1) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Reivindicación 12: proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (XII) con uno de fórmula (XIII-a) o con (XIII-b)



reivindicación, ya que como se puede observar estas reacciones son similares a las conocidas en el estado de la técnica (D1) y además el proceso reivindicado no muestra ninguna ventaja sobre el divulgado.

Por lo tanto los anteriores procedimientos de preparación que se pretenden reclamar, en las reivindicaciones 6-13, **no presentan Nivel Inventivo**.

6. Conclusión:

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

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO0032582	1-17	Nivel inventivo

7. Respuesta a los argumentos del solicitante:

El solicitante en su repuesta allega corregidas las paginas 27,65 y 67 de la descripción, adicionalmente allega un nuevo capítulo reivindicatorio con 17 reivindicaciones, el cual se acepta para realizar el correspondiente análisis de patentabilidad.

Después de analizada la respuesta se reconoce que los compuestos reclamados muestran diferencias con los D1 concretamente en A y B, pero no en que el nitrógeno de la piperazina este unido directamente al fenilo. Así, los compuestos son nuevos pero no inventivos al igual que los procesos de obtención reclamados, lo cual esta sustentado en el numeral 5 de este concepto.

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 numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
17 ABR. 2009

CONCEPTO TÉCNICO No.205	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202078
-------------------------	--

265

2020
Bogotá, D.C.,

Doctora:
Alicia Lloreda Ricaurte
Apoderada

Oficio N°: **Nº** 4 5 2 2

ASUNTO:	Radicación PCT N°	03-27152
	Trámite	011
	Evento	344
	Actuación	330
	Folios	002

Atendiendo la solicitud contenida en el escrito de fecha 21 de agosto del 2008 radicado bajo el número 03-027152-00006-0002, ordenase el desglose del recibo de caja N° 63,590 por valor de quinientos un mil pesos mcte (\$501.000.00) el cual obra a folio 238 del expediente administrativo, dejando copia dentro del mismo, previa entrega del original al solicitante para su aplicación a otro trámite ante esta Superintendencia.

Envíese copia del presente oficio a la División Financiera, para lo de su competencia.

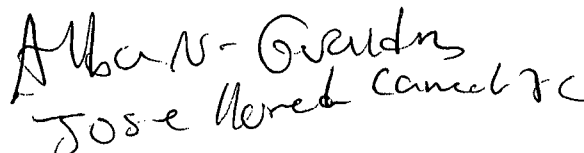
Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe División de Nuevas Creaciones.

D E S G L O S A D O	
D	M A
del Expediente No. <u>03-027152</u>	
Auto No. <u>4522</u>	Fecha <u>Abril 17/09</u>

El anterior oficio fue notificado por fijación en lista de fecha, 17 ABR. 2009.

202021


Jose Lloreda Camacho

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 3820840
Fax: 382 26 95. Línea 9800-910 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia