

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

2020
Bogotá, D.C., 24/09/2007

Abogado
CARLOS R. OLARTE
Apoderado
Solicitante: ELI LILLY AND COMPANY.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-039013- -00004-0000

Fecha: 2007-10-11 12:25:18 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03/39013
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	13057
	Folios	960

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:

• **Documentos estudiados**

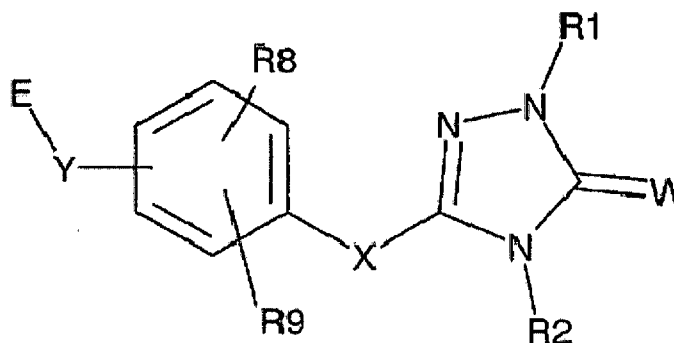
- .1. Descripción: Folios: 401 a 829
- .2. Reivindicaciones: Folios 830 a 869
- .3. Prioridad: Folios: 10/11/2000, País: US, Número: 60/247.317

• **Objeto de la invención**

La solicitud hace referencia a:

- compuestos representados por la siguiente fórmula estructural:

FÓRMULA I

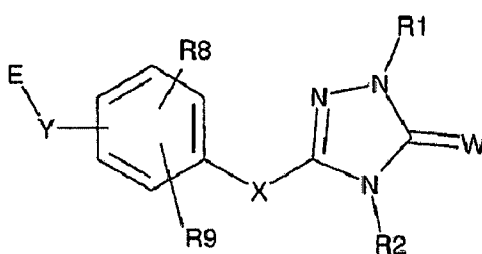


Y otros compuestos derivados de la misma

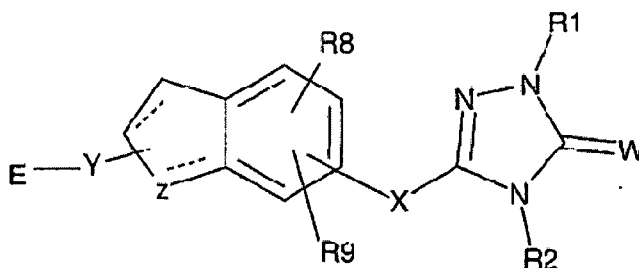
- Procedimiento de preparación de un trizolona a partir de una semicarbazida de acilo que comprende poner en contacto dicha semicarbazida de acilo con un ácido.

- Composiciones farmacéuticas que comprenden, al menos un compuesto de la presente invención, o una sal, solvato, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.
- Procedimiento de modulación de un receptor PPAR alfa poniendo en contacto el receptor con al menos con compuesto representado por la fórmula I y las sales, solvatos e hidratos.
- Procedimiento de fabricación de un compuesto según fórmula I.
- Procedimiento para el tratamiento y/o profilaxis de la hiperglucemia.
- Uso de un compuesto de fórmula I para la fabricación de un medicamento.

Reivindicaciones 1 - 31: Reclama protección para compuestos de la fórmula estructural (I) con sus respectivos sustituyentes y diferentes posibilidades estructurales.



Reivindicación 32 - 43: Reclama protección para compuestos de la fórmula estructural (I) con sus respectivos sustituyentes y diferentes posibilidades estructurales.



Reivindicación 44 - 45: Reclama protección para compuestos de cualquiera de las reivindicaciones 1-44 que están radiomarcados o trititados.

Reivindicación 46: Composiciones farmacéuticas de acuerdo a cualquiera de las reivindicaciones anteriores.

Reivindicaciones 47-48: Procedimientos para modular el receptor activador del proliferador de peroxisoma.

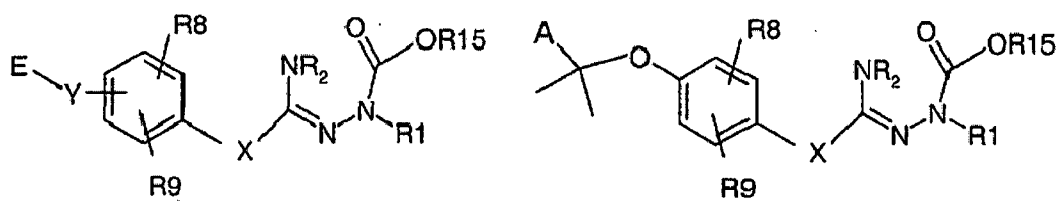
Reivindicaciones 49 - 65: Procedimientos para tratamiento y prevención de la diabetes, enfermedades cardiovasculares, Síndrome X y obesidad.

Reivindicación 66: Compuesto según reivindicaciones 1-43 para usar en terapia de un trastorno modulado por un receptor de peroxisoma activado por un proliferador.

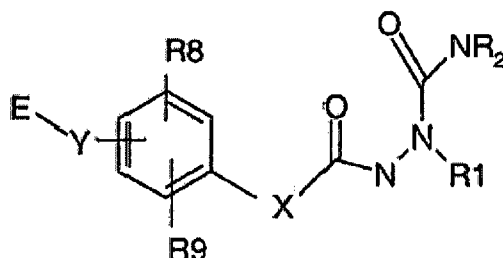
Reivindicación 67: Uso de un compuesto para la fabricación de un medicamento.

Reivindicaciones 68 – 72: Procedimientos para preparar los compuestos.

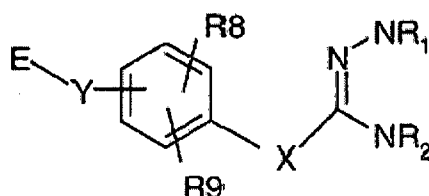
Reivindicación 73 - 80: Compuestos según las estructuras.



Reivindicaciones 81-86: Compuestos según la estructura:



Reivindicaciones 87-92: Compuestos según la estructura:



Reivindicación 93: Compuestos según cualquier reivindicación en donde E se selecciona de un grupo específico.

Reivindicación 94: Compuestos seleccionados de cualquiera de los ejemplos de la memoria descriptiva.

Problema planteado: El tratamiento habitual con agonistas de PPAR para el síndrome X se refiere al uso de tiazolidindionas u otros potenciadores de la sensibilidad a insulina. Las TZD son una clase de agonistas de PPAR gamma que se ha demostrado que aumentan la sensibilidad de las células sensibles a insulina. El aumentar la sensibilidad a insulina en lugar de la cantidad de insulina en sangre reduce la probabilidad de coma hipoglucémico. Sin embargo, las TZD y los ISE ejercen, típicamente, poco efecto a la hora de prevenir la parte cardiovascular del síndrome X pues su administración no da como resultado una disminución de los triglicéridos y las LDL en colesterol mientras que aumenta las HDL en colesterol. Además los efectos secundarios asociados habitualmente con el tratamiento con TZD incluyen una ganancia de peso significativa y, en el caso de troglitazona, provoca toxicidad en el hígado.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona nuevos agentes farmacéuticos para el tratamiento o prevención de enfermedades cardiovasculares, particularmente las asociadas con el síndrome X, que prevengan o minimicen la ganancia de peso y más preferiblemente que mejoren la sensibilidad a insulina.

Clasificación Internacional de Patentes (IPC.): A61K 31/4196, C07D 249/12

• **De la solicitud de Patente** (según el caso)

.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

- Se requiere al solicitante aclarar específicamente a que compuestos se refiere cuando se mencionan en muchos de los folios de la solicitud: una sal, solvato, hidrato o profármaco farmacéuticamente aceptables, ya que son términos amplios y vagos que pueden abarcar gran cantidad de compuestos inespecíficos.
- Folio 421: Este despacho solicita delimitar el tamaño de las moléculas correspondientes a las designadas mediante los términos "alquilo", "cicloalquilo", "arilo", "grupo heterocíclico", "arilalquilo", "alilo", etc, con mayor razón cuando son sustituidos, ya que se están usando rangos tan amplios que no se pueden concretar fácilmente las estructuras de las moléculas que se quiere proteger.

.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

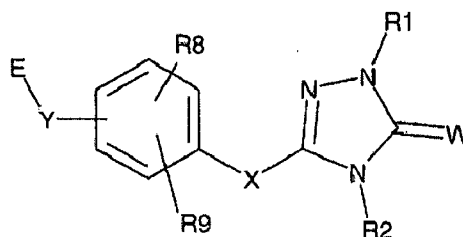
- El listado de posibles sustituyentes y la combinatoria generaría una variedad muy amplia producto del número de opciones en las diferentes posiciones, por lo tanto se requiere al solicitante concretar y delimitar la materia reivindicada tanto para las moléculas que desea proteger como para sus sustituyentes ya que tal cual se presenta se encuentra muy amplia, con múltiples posibilidades no cumpliendo así con los requerimientos de claridad, concisión y unidad de invención.

• **Unidad de invención** (artículo 25 D 486)

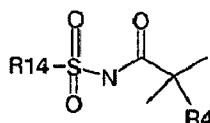
Al analizar la solicitud se pueden extraer varios grupos de compuestos que estructural, química y funcionalmente pueden definirse bajo conceptos inventivos diferentes independientes de la fórmula (I) siendo claro de esta forma que existirá más de una característica esencial faltando así al requisito de unidad de invención. Por lo tanto se requiere al solicitante dividir la solicitud en varias solicitudes según sus diferentes grupos dada la amplitud de la materia que se pretende reivindicar.

Por ejemplo:

1. Compuestos según la estructura de la fórmula I

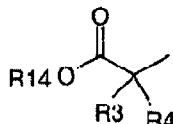


2. Compuestos de fórmula I donde E es:



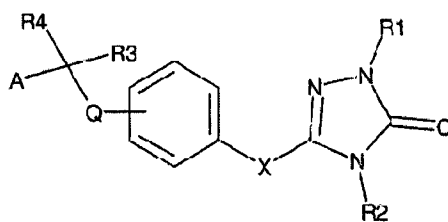
Y R₁₄ es CF₃, fenilo sustituido o insustituido, arilalquilo C₀-C₄ sustituido o insustituido y alquilo C₁-C₆

3. Compuestos de fórmula I donde E es:

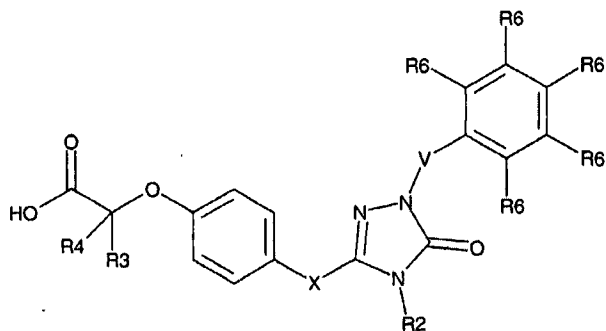


Y R_{14} es CF_3 , fenilo sustituido o insustituido, arilalquilo C_0-C_4 sustituido o insustituido y alquilo C_1-C_6

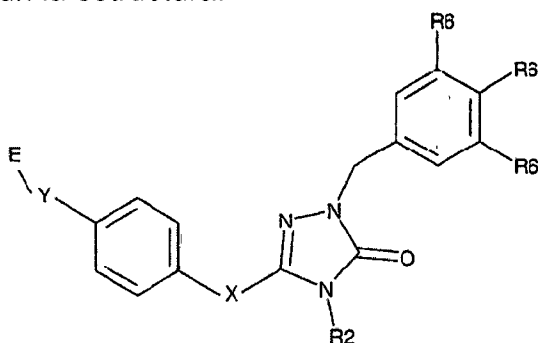
4. Compuestos según la estructura siguiente:



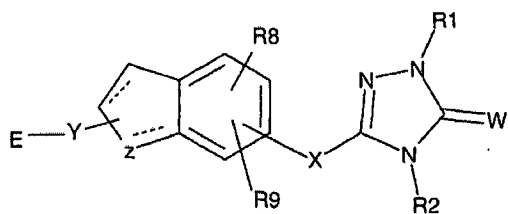
5. Compuestos según la estructura siguiente:



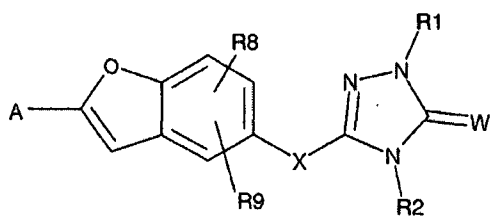
6. Compuestos según la estructura:



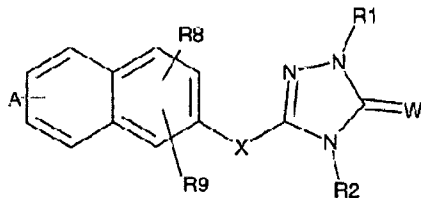
7. Compuestos según la estructura:



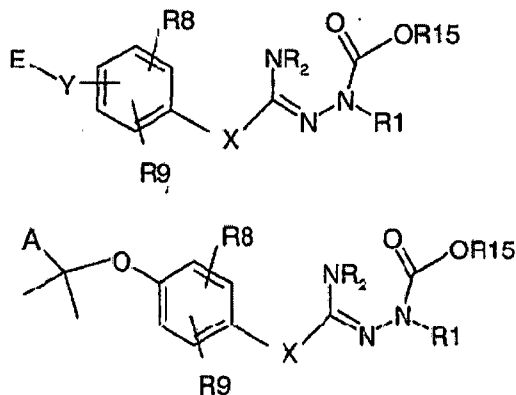
8. Compuestos según la estructura:



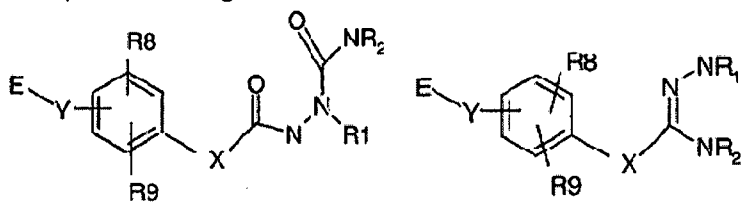
9. Compuestos según la estructura:



10. Compuestos según las estructuras:



11. Compuestos según las estructuras:



Y cualquier otro compuesto que el solicitante considere necesario

- **Excepción a la patentabilidad** (artículo 20 D486 literal a)-d)) (según causal)
Reivindicaciones 47 - 65: Se refieren a métodos de tratamiento y prevención de algunas patologías por lo tanto no se aceptan según la legislación vigente.
- **Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto** (artículos 14 y 21 D 486)
Reivindicación 67: Se refieren a usos de algunos compuestos para la fabricación de medicamentos por lo tanto no se aceptan según la legislación vigente.
- **Determinación del Estado de la Técnica**

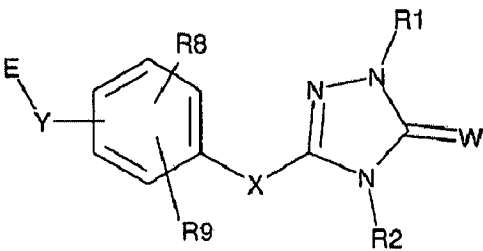
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 10/11/2000, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D ₁	WO 96/35680	SULPHNYLAMINO(THIO)CARBONYLTRIAZOLIN (THIO)ONES WITH ARYLOXY OR ARYLTHIO SUBSTITUENTS	14/11/1996
D ₂	WO 99/08501	NEW HETEROCYCLIC COMPOUNDS AND THEIR USE IN MEDICINE, PROCESS FOR THEIR PREPARATION AND PHARMACUETICAL COMPOSITIONS CONTAINING THEM	25/02/1999

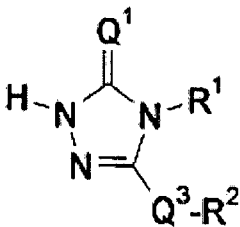
- **Análisis de patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)**

.1. Novedad (artículo 16 D486)

Reivindicación 1: Reclama protección para compuestos de la fórmula estructural (I) con sus respectivos sustituyentes y diferentes posibilidades estructurales.



D₁ enseña (ver folio 872) compuestos sulfonilamino (tio) carboniltriaxolin (tio) de acuerdo a la fórmula I con métodos de preparación, intermediarios para usar en dicha preparación y el uso de los compuestos como herbicidas.



Así las cosas la formula de la reivindicación 1 se superpone con la formula I del documento D₁, por lo tanto no es novedosa, pues había sido divulgada previamente en el estado de la técnica (ver folio 873, compuesto II-8), según el cuadro siguiente:

CARACTERÍSTICAS REIVINDICADAS		ESTADO COMPATIVO DE ELEMENTOS
D1	SOLICITUD	
Q ³ =S	X=S	Equivalente
H	R ⁸ =H	Equivalente
H	R ⁹ =H	Equivalente
Q ¹ =O	W=O	Equivalente
R ² =	R ⁸ =H, R ⁹ =H, Y=enlace sencillo, E=A=carboxilo 	Equivalente

De manera que el objeto de esta solicitud, tal como aparece en las reivindicación 1 no es nueva para la modalidad comparada.

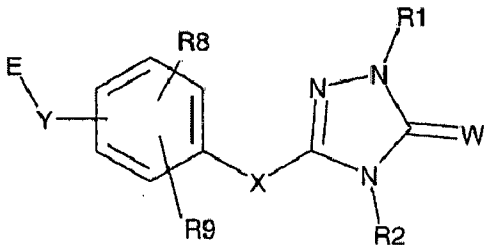
Las composiciones farmacéuticas correspondientes a las reivindicaciones afectadas por D₁ no son nuevas porque dichos compuestos no son nuevos y sus formulaciones son las convencionales para este tipo de composiciones realizadas con un vehículo farmacéuticamente aceptable.

De la misma manera como se realizó este reemplazo a manera de ejemplo resultando en una molécula equivalente podría haber otros que no cumplen con el requisito de novedad.

2. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

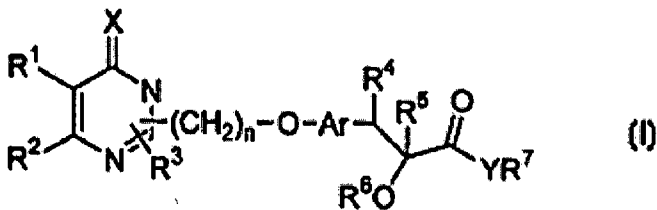
Las reivindicaciones desde la 2 a 31, 46, 66 y 93 por ser estructuralmente dependientes de la 1 la cual se vio afectada por Novedad con D₁ quedan de esta forma afectadas de manera obvia por Nivel inventivo en sus demás modalidades.

- De otro lado la presente solicitud de patente reivindica aproximadamente 11 grupos de invención, sus usos, métodos de tratamiento, composiciones derivadas de las mismas y métodos de preparación según la siguiente fórmula general.



Dichas reivindicaciones se ven afectadas por el siguiente documento más cercano al Estado de la Técnica:

- D₂ que enseña compuestos antiobesidad e hipocolesterolémicos de fórmula I, sus derivados, sus análogos, formas tautoméricas, estereoisómeros, polimorfos, sales aceptables farmacéuticamente, solvatos y composiciones que contienen los compuestos mencionados que corresponden a ácidos alquil carboxílicos β aril α oxisustituídos



Los compuestos reivindicados en la presente solicitud revelan exactamente la misma actividad cualitativa de lo ya sugerido en D₂ (ver folio 875, todo el documento especialmente reivindicación 28). Además molecularmente solamente se diferencian en la naturaleza del heterociclo en D₂ con respecto a la solicitud de invención. Realizar este cambio para compuestos de la misma actividad es una forma obvia para que un experto en la materia llegue a su diseño por lo tanto no implican una contribución inventiva.

Así las cosas el Problema Técnico Objetivo fundamental de la Invención Reivindicada no puede definirse y los compuestos, y composiciones reivindicados se consideran tan solo una alternativa, sin algún efecto que lo haga superior a la materia previamente conocida.

Por lo tanto la materia objeto de las reivindicaciones 1-68 y 72-94 carecen de nivel inventivo.

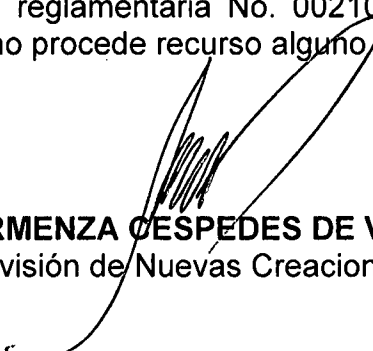
- **Conclusión:**

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 96/35680	1 2-31	Novedad Nivel inventivo
D2	WO 99/08501	1-68 72-94	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
12 OCT. 2007

CONCEPTO TECNICO
No. 1770

EXAMINADOR TECNICO
Código No. 202087

ver