

| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO                 |                                                   |
|----------------------------------------------------------|---------------------------------------------------|
| <b>RAD:</b> 12-36477- -9                                 | <b>FECHA:</b> 2013-06-13 11:17:34                 |
| <b>DEP:</b> 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES          | <b>EVE:</b> 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I |
| <b>TRA:</b> 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II | <b>FOLIOS:</b> 5                                  |
| <b>ACT:</b> 519 PRESENTACION                             |                                                   |

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020  
Bogotá, D.C.,  
  
Abogado(a)/Señor(a)  
DILIA MARIA RODRIGUEZ D ALEMAN

Asunto: Radicación: 12-36477- -9  
Trámite: 11  
Evento: 378  
Actuación: 519  
Oficio: 10375  
Folios: 5

|                                     |                   |            |   |                               |  |
|-------------------------------------|-------------------|------------|---|-------------------------------|--|
| Patente de Invención                | X                 |            |   | Patente de Modelo de Utilidad |  |
| Vía Nacional                        |                   |            |   |                               |  |
| Vía PCT (Fase Nacional)             | X                 | Capítulo I | X | Capítulo II                   |  |
| No. Solicitud Internacional         | PCT/US2010/047262 |            |   |                               |  |
| Fecha de Presentación Internacional | 31/08/2010        |            |   |                               |  |

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:               | Radicado No. 12-036477-00000-0000 | 01/03/2012                 |
| Reivindicaciones:          | Radicado No. 12-036477-00000-0000 | 01/03/2012                 |
|                            | Radicado No. 12-036477-00008-0000 | 01/04/2013                 |
| Oposiciones:               | Radicado No. 12-036477-00006-0000 | Procaps S.A.<br>12/12/2012 |
| Respuesta del solicitante: | Radicado No. 12-036477-00008-0000 | 01/04/2013                 |
| Prioridad:                 | US 61/238.903                     | 01/09/2009                 |
|                            | US 61/308.524                     | 26/02/2010                 |
|                            | US 61/310.952                     | 05/03/2010                 |

2. Análisis de la Prioridad

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

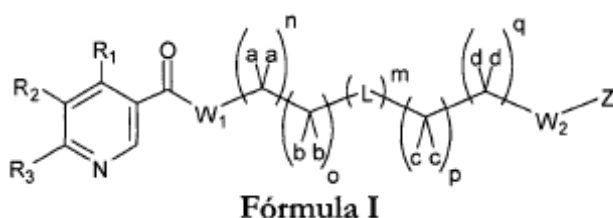
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. Para el caso de la presente solicitud se estudiarán las reivindicaciones 1 a 23 (Radicado No. 12-036477-00008-0000).

Título de la solicitud: “CONJUGADOS DE NIACINA Y ÁCIDOS GRASOS Y SUS USOS”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en proveer una composición que permita modular el metabolismo de lípidos, glucosa e insulina.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un conjugado molecular de niacina y un ácido alfa-linoléico, ácido estearidónico, ácido eicosatrieónico, ácido eicosapentaeónico, ácido docosapentaeónico, ácido docohexaeónico, ácido tetracosapentaeónico y ácido tetracosahexaeónico y donde el conjugado comprende al menos dos amidas, o un compuesto de fórmula (I):



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N43/40; A61K31/44.

#### 4. De la solicitud de patente

##### Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque hace referencia a usos por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

##### Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 2 carece de concisión debido a que abarca un elevado número de sustituyentes que dan lugar a una amplia variabilidad estructural. Los compuestos derivados de la fórmula (I) carecen de sustento descriptivo ya que la solicitud carece de información para que la persona versada en la materia pueda desarrollar el indeterminado número de compuestos reclamados. Igualmente, la solicitud no evidencia que los compuestos reclamados sean todos una solución al problema técnico planteado.

Los términos “cicloalquilo” y “heterociclo” de la reivindicación 2 no limitan el alcance de la solicitud.

##### 5. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 2, grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

1° Conjugado molecular que comprende niacina y un ácido alfa-linoléico, ácido estearidónico, ácido eicosatrieónico, ácido eicosapentaeónico, ácido docosapentaeónico, ácido docohexaeónico, ácido tetracosapentaeónico y ácido tetracosahexaeónico y donde el conjugado comprende al menos dos amidas.

2° Compuestos de la fórmula (I) en donde R1, R2 o R3 son diferentes de H

Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

## **6. Análisis de las Oposiciones**

### **Argumentaciones de Procaps S.A.**

La opositora presenta el documento US 6649633 e indica que este divulga compuestos útiles como inhibidores PDE4 en el tratamiento de enfermedades reguladas por la activación y desgranulación de eosinófilos y da a conocer un conjugado molecular que tiene la función de inhibidor PDE4 que comprende niacina y un ácido graso.

Igualmente indica que el documento US 2006105021 enseña un método en el que la niacina y ácidos grasos omega 3 se pueden utilizar para reducir el colesterol y se refiere en general a una mezcla en seco que reduce el colesterol y su método de fabricación. Concluye el opositor que la presente solicitud carece de nivel inventivo ya que el conjunto de información contenida en las anterioridades mencionadas direcciona a la persona experta en la materia a la invención reivindicada.

### **Respuestas del Solicitante**

Respecto a la oposición el solicitante argumenta que los inhibidores PDE4 de US 6649633 son específicos para enzimas fosfodiesterasa 4, las cuales actúan para regular el nivel de nucleótidos cíclicos dentro de las células y mantener la homeostásis de nucleótidos cíclicos degradándolos y finalizando su función como mensajeros. Es incorrecto describir los anillos que contienen nicotinamida de US 6649633 como derivados de niacina. Los compuestos reclamados en el nuevo capítulo reivindicatorio adjunto son diferentes de los descritos en US 6649633.

Por otra parte, el documento US 2006105021 enseña un líquido reductor del colesterol que puede ser una simple combinación de niacina y ácidos grasos omega-3. Es evidente que la combinación de las enseñanzas de D1 y D2 no pueden de ninguna forma anticipar la materia objeto de las nuevas reivindicaciones adjuntas. La presente solicitud enseña un conjugado molecular en el cual la niacina está enlazada covalentemente con ácidos grasos omega-3 que pueden ser metabolizados in vivo. Agrega el solicitante que el conjugado reclamado comprende al menos dos amidas y el conjugado es capaz de hidrolizarse en las células objetivo para producir niacina libre y ácidos grasos libres. Los datos presentados demuestran que el conjugado presenta una sinergia única.

### **Respuesta del Examinador Técnico**

Esta Superintendencia encuentra que los documentos y argumentos presentados por la sociedad opositora Procaps S.A., se encuentran debidamente sustentados y afectan la patentabilidad de la presente solicitud, por lo cual se considerarán dentro del examen de patentabilidad.

### 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: 1 de septiembre de 2009 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Ítem | Documento      | Título                                                                  | Fecha de Publicación* |
|------|----------------|-------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1   | US2002/0193612 | “NICOTINAMIDE BIARYL DERIVATIVES USEFUL AS INHIBITORS OF PDE4 ISOZYMES” | 19/12/2002            |
| D2   | WO98/45268     | “NICOTINAMIDE DERIVATIVES”                                              | 15/10/98              |

D1<sup>[1]</sup> divulga compuestos útiles como inhibidores PDE4 en el tratamiento de enfermedades por la activación y desgranulación de eosinofilos, especialmente asma, bronquitis crónica y enfermedad pulmonar obstructiva los cuales son derivados de niacina (Resumen).

D2<sup>[2]</sup> enseña derivados de nicotinamida que son inhibidores de fosfodiesterasa 4 (Pág. 1).

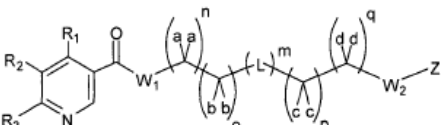
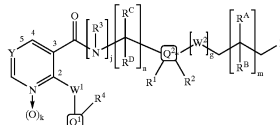
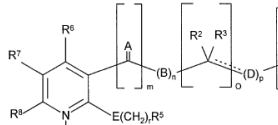
### 8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

#### Nivel inventivo (Art18 D486)

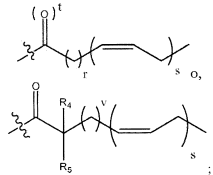
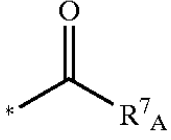
Para efectos de la presente solicitud se estudiará el nivel inventivo del grupo 2.

La reivindicación 2 consiste en un compuesto de fórmula (I)

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

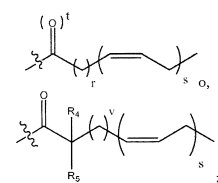
| Características esenciales                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | D1                                                                                                                      | D2                                                                                                                       |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Un compuesto de fórmula (I): <div>  <p><b>Fórmula I</b></p> </div>                                                                                                                                                                                                         | Compuesto de fórmula: <div>  </div> | Compuesto de fórmula: <div>  </div> |
| R1, R2 y R3 se seleccionan independientemente de -H, -D, -Cl, -F, -CN, -NH2, -NH( alquilo C1-C3), -N(alquilo C1-C3) 2, -NH(alquilo C(O)C1-C3), -N(alquiloC(O)C1-C3)z,-C(O)H, alquilo -C(O)C1-C3, alquilo -C(O)OC1-C3, -C(O)NH2, -C(O)NH(alquilo C1-C3), -C(O)N(alquilo C1-C3) 2, alquilo -C1-C3, alquilo -O-C1-C3, alquilo -S(O)-CcC3, y alquilo -S(O)2-C1-C3 | H (ver figura)                                                                                                          | R6, R7 y R8 se seleccionan de H, halógeno, ciano, amino                                                                  |
| W1 y W2 son cada uno por separado O, O, S, NH, NR, o W1 y W2 pueden tomarse juntos para formar un grupo imidazolidina o piperazina, con la salvedad de que W1 y W2 no pueden ser O simultáneamente;                                                                                                                                                           | NR <sup>3</sup> (Ver figura)<br>W <sup>2</sup> es -O-; -S-; o -N(R <sup>3</sup> ), o -CR <sup>29</sup> R <sup>30</sup>  | B es O o NH.<br>D es NR <sup>9</sup> u O.                                                                                |
| Z es -H, o                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | Z es:                                                                                                                   | R1 es H                                                                                                                  |

1[ ]URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2002193612A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20021219&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2002193612A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20021219&DB=EPODOC&locale=en_EP)  
 2[ ]URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=9845268A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19981015&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=9845268A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19981015&DB=EPODOC&locale=en_EP)

|                                                                                   |                                                                                   |  |
|-----------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|--|
|  |  |  |
| $R_{7A}$ es $-(C_2-C_6)$ alquenil                                                 |                                                                                   |  |

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga conjugados moleculares útiles como inhibidores de PDE4 derivados de nicotinamida y donde el conjugado comprende por lo menos una amida (resumen; Págs. 16 a 19)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2 y el producto de D1 consiste en que se selecciona como sustituyente Z específicamente:



El documento D2 enseña derivados de nicotinamida activos como inhibidores PDE4 (resumen).

El efecto que logra seleccionar los sustituyentes del radical Z no se puede determinar ya que la solicitud carece de información que permita establecer un efecto inesperado o sorprendente del indeterminado número de compuestos reclamados mediante esta solicitud.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo seleccionar un conjugado molecular como el divulgado en D1 para conseguir composiciones útiles para el tratamiento de enfermedades metabólicas?.

Igualmente, el documento D2 enseña conjugados moleculares en donde el sustituyente Z también corresponde a H como lo señala la presente solicitud.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría sustituyentes como H del documento D2 o derivados de alqueno como lo divulga el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:  
 La reivindicación 2 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple 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   | US2002/0193612 | 2 a 23                     | Nivel inventivo      |
| D2   | WO98/45268     | 2 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2013-06-18

Elaboró: Emilse Cano Urrego  
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo