

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

410 44
Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 700 4814

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-122256- -00008-0000

Fecha: 2009-08-13 16:48:14 Dep. 2020 NUECRLACIONE
Ira. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 05122256
Asunto : Solicitud de Patente para: **"Derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melano cortina "**.
Solicitante : PALATIN TECHNOLOGIES, INC
Fecha de solicitud: Diciembre 1 de 2005.

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 5696 notificado por fijación en lista del 15 de Mayo de 2009.

2. Mediante el Oficio No. 5696 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la siguiente manera:

3. De la solicitud de patente:

Su Despacho enuncia lo siguiente:

3.1 Título.

- "El título de la solicitud es un título de fantasía que no comprende la materia de que trata la solicitud, ya que son derivados de piperazina y piperazin-2-ona".

3.2 Reivindicaciones.

- "La reivindicación 1, no es clara, ya que se omitió los significados de los sustituyentes R4a, R4b, R5a, R5b por lo tanto no es posible hacer un estudio del nuevo capítulo reivindicatorio".

471
472

- "Tal como se indicó en el primer examen de patentabilidad se reclama un número extremadamente grande de compuestos/composiciones. Toda esa enorme cantidad de compuestos/composiciones no esta soportada enteramente en la descripción. En la descripción solamente existen 68 ejemplos, lo cual no soporta los millones de posibles compuestos que se reclaman, por lo tanto se debe tener en cuenta el soporte técnico real de los compuestos/composiciones reclamados, deben estar fundados completamente en la descripción, sin generalizaciones especulativas".

4. Modificación a una solicitud en tramite.

Su Despacho concluye que el capítulo reivindicatorio no cumple con los requisitos de claridad, concisión o sustento descriptivo de acuerdo con el artículo 30 de la Decisión 486. Con respecto a lo señalado por su Despacho mi representada desea señalar lo siguiente:

Con el fin de atender las anteriores observaciones y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 11 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto quedan superadas respectivamente con las modificaciones realizadas de la siguiente manera:

- La reivindicación 1 ha sido redactada nuevamente limitando las definiciones de los sustituyentes con base en las definiciones encontradas en el capítulo descriptivo y debidamente sustentadas en los ejemplos de la presente solicitud. Para estos efectos, se presenta anexo un documento titulado "Análisis de los ejemplos", donde se demuestra que la materia reclamada se encuentra sustentada en la descripción, tal y como fue inicialmente presentada.
- Adicionalmente, en este nuevo pliego reivindicatorio se incluyen las definiciones de los radicales R4a, R4b, R5a, R5b.

Así entonces, con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio el mismo es claro y conciso y las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas.

Con respecto a la objeción formulada al título de la presente solicitud, se pone de presente que el mismo ha sido modificado de la siguiente manera: **"Derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melano cortina "**. Así entonces, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

A72
473

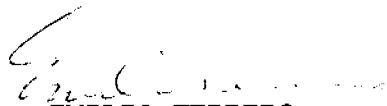
Sin embargo, en el evento que el Despacho considere que una modificación adicional sea necesaria, respetuosamente le solicito hacer uso de la facultad que le otorga el artículo 45 inciso 2. de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

4. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

5. Anexos:

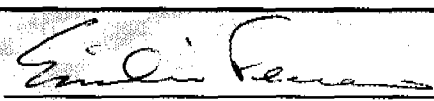
- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.
- Análisis de los ejemplos.

Señora Jefe,


EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO-15121-841-001-8
MGM\MGM\ID-155644\WPC15121
No. M-2009-155644\MGM

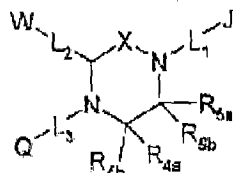
FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: PALATIN TECHNOLOGIES, INC. Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: Cedar Brook Corporate Center, 4-C Cedar Brook Drive, Cranbury, New Jersey 08512, Estados Unidos de América Domicilio: Cranbury, New Jersey, Estados Unidos de América Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 438.019 TP 31.929
4	Número de expediente: <u>05.122.256</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 11 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.	
6	Comprobante de pago No. _____ Fecha: _____	
7	Anexos ☐ Comprobante de pago de la tasa por \$111.000, por concepto de modificaciones. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la decimoquinta reivindicación por ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929	

A74
495

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la fórmula de estructura I:



5 o un enantiómero, estereoisómero o diaestereoisómero del mismo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,

en donde

10 X es CH₂ o C=O;

L₁ es una unidad enlazadora seleccionada del grupo que consiste de:

-(CH₂)₁-,

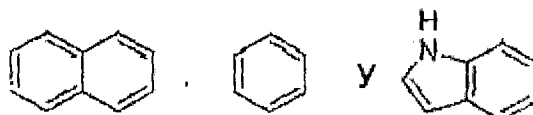
-(CH₂)₂-,

15 -(CH₂)₃, y

-C(=O)-(CH₂)₁₋₃,

J es una estructura en anillo sustituida o no sustituida seleccionada a partir del grupo que consiste de

20



en donde, J cuando es sustituido, está sustituido con uno o más sustituyentes del anillo independientemente seleccionado a partir del grupo que consiste de halógeno y grupos alquilo unidos directamente;

25

L₂ es -(CH₂)₃-;

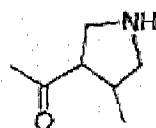
W es -NH-C(=NH)-NH₂,

30

L₃ es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de:

-C(=O)-(CH₂)₁₋₆-,

35 -C(=O)-CH(NR_{6a}, R_{6b})-(CH₂)₁₋₆-, y

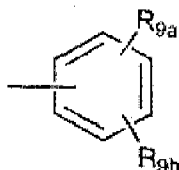


En donde R_{6a} y R_{6b} se selecciona cada uno independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, un residuo histidina, metilo, etilo, isopropilo, acetilo o polietilen glicol con una formula de peso molecular entre 100 y 10000;

40

Q es un anillo naftilo o

475
476

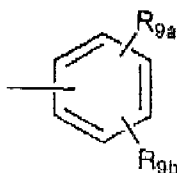


en donde R_{9a} y R_{9b} son sustituyentes opcionales del anillo, y cuando uno o ambos están presentes, son los mismos o son diferentes y son independientemente grupos hidroxilo, halógeno, alquilo, o arilo unidos directamente o a través de un enlace éter; y

Uno o dos de R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} , y R_{5b} son independientemente un grupo metilo o isobutilo y el remanente de R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} , y R_{5b} son hidrogeno.

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque X es CH_2 .

3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2 caracterizado porque Q es



en donde R_{9a} y R_{9b} son sustituyentes opcionales del anillo, y cuando uno o ambos están presentes, son los mismos o son diferentes y son independientemente grupos halógeno o grupos alquilo unidos directamente o a través de un enlace éter.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque al menos uno de los radicales R_{9a} o R_{9b} es un alquilo seleccionado a partir del grupo que consiste de $-CH_3$ y $-OCH_3$.

5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque al menos uno de los radicales R_{9a} o R_{9b} es un halógeno seleccionado del grupo que consiste de $-Cl$ y $-CF_3$.

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque:
X es CH_2 ;

J una estructura en anillo seleccionada a partir del grupo que consiste de naftilo, fenilo, fenilo sustituido, indol e indol sustituido, en donde, J cuando es sustituido, esta sustituido con uno o más sustituyentes del anillo independientemente seleccionado a partir del grupo que consiste de halógeno y grupos alquilo unidos directamente;

L_3 es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de $-C(=O)-CH(NR_{6a}R_{6b})-(CH_2)_{1-6}-$ y $-C(=O)-(CH_2)_{1-6}-$;

Un radical R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} y R_{5b} es metilo o isobutilo, y los restantes son hidrógeno; y

R_{6a} y R_{6b} son seleccionados cada uno independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, acetilo, metilo, etilo, isopropilo y polietilenglicol con formula de peso molecular entre 100 y 10000.

476
477

7. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 y sales farmacéuticamente aceptables del mismo seleccionado a partir del grupo que consiste de:

- 5 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
6(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
10 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(S)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
15 6(S)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2-cloro-4-metil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
20 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(S)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
25 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-
30 propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
35 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2-cloro-4-trifluorometil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
40 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(3,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-
45 5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[4-(4-Cloro-fenil)-pirrolidina-3-carbonil]-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
50 N-{1(R)-(4-cloro-2-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-
propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-
oxo-etil}-acetamida;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
55 guanidina;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(3-fenil-propil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(2-p-tolil-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;

471
448

- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-acetil)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 5 N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-propionil)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-butiril)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 10 N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(2-metil-1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 15 N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1-metil-1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-(2(R)-Amino-(4-cloro-fenil)-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 20 N-(3-{1-(2(R)-Amino-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propionil}-guanidina;
- 25 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-metoxi-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 30 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-dimetilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 35 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-metilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-dietilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 40 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-isopropilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil]-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 45 N-{2-[2(S)-(3-Guanidino-propil)-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-1(R)-naftalen-2-ilmetil-2-oxo-etil}-acetamida;
- 50 N-{1(R)-(2,4-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-acetamida;
- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 55 N-{2-[2(S)-(3-Guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-1(R)-naftalen-2-ilmetil-2-oxo-etil}-acetamida;

47b
479

- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 5 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-dimetil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{1(R)-(2,4-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-acetamida;
- 10 2(S)-Amino-N-{1(R)-(2,4-dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 15 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-3-oxo-4-fenetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-5(R)-metil-3-oxo-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 20 N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 2(S)-Amino-N-{1(R)-(4-cloro-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- 25 2(S)-Amino-N-{1(R)-(2,4-dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- 30 N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 35 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-5(R),6(R)-dimetil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 40 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-fenilacetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 45 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(3-fenil-propionil)-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(4-fenil-butiril)-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 50 N-(3-{1-[3-(2,4-Dicloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-fenilacetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- y N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina.
- 55

8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque uno de los radicales R_{5a} y R_{5b} es (R)-metilo o (R)-isobutilo y los radicales restantes R_{4a}, R_{4b}, y/o R_{5a}, y/o R_{5b} son hidrógeno.

60

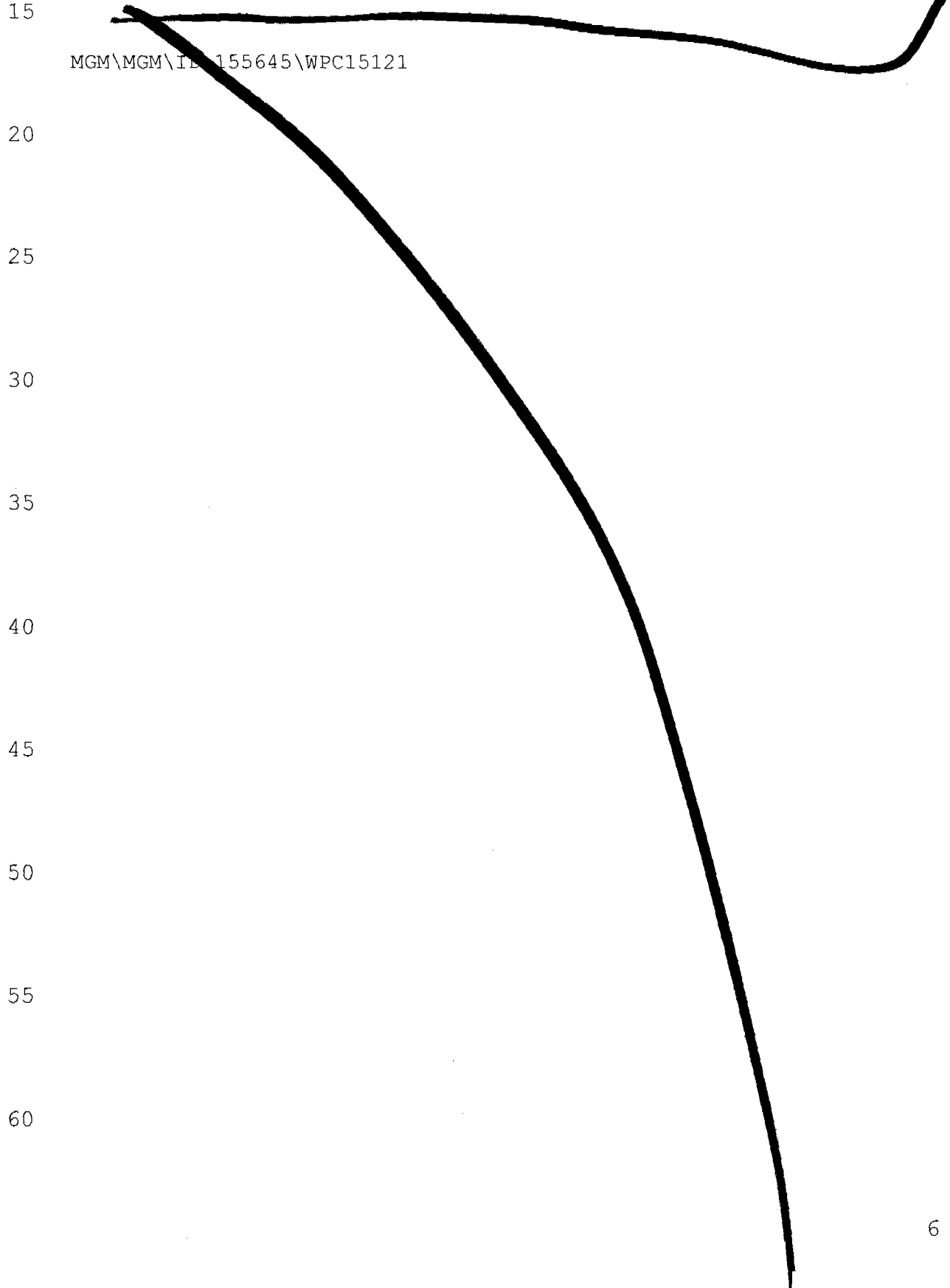
4980

9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque L_1 es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$ y $-(CH_2)_3-$.

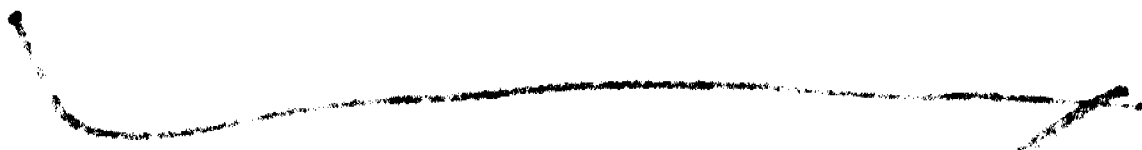
5 10. Una composición farmacéutica, que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 8 o 9 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

10 11. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque uno de los radicales R_{5a} y R_{5b} es (R)-metilo o (R)-isobutilo y los radicales restantes R_{4a} , R_{4b} , y/o R_{5a} , y/o R_{5b} son hidrógeno y en donde L_1 se selecciona a partir del grupo que consiste de $-C(=O)-CH_2-$, $-C(=O)-(CH_2)_2-$ y $-C(=O)-(CH_2)_3-$.

MGM\MGM\ID 155645\WPC15121



1912



Análisis de los ejemplos.

X

- X es CH_2 : Ejemplos 1 hasta 49, 55 y 57 hasta 68.
- X es CO: Ejemplos 50 hasta 54 y 56.

L₁

- L₁ es $-\text{CH}_2-$: Ejemplos 14, 39 y 40
- L₁ es $-(\text{CH}_2)_2-$: Ejemplos 1 hasta 13, 15, 17, 19, 23 hasta 37 y 50 hasta 59.
- L₁ es $-(\text{CH}_2)_3-$: Ejemplo 18.
- L₁ es $-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2)_{1-3}-$: Ejemplos 20 hasta 22, 38, 41, 44 hasta 47 y 63 hasta 68.

J

- J es naftil: Ejemplos 1 hasta 17, 28 hasta 38, 41-47, 53- 59 y 68.
- J es fenil: Ejemplos 18, 19, 40, 48, 49, 60 y 62 hasta 67.
- J es indolil: Ejemplos 20 hasta 27 y 61.
- J es sustituido: Ejemplos 19, 24, 25 y 48 (alquilo).
Ejemplo 49 (halógeno).
- J es no sustituido: Ejemplos 1 hasta 18, 20 hasta 23, 26 hasta 39, 41 hasta 47 y 50 hasta 68.

L₂

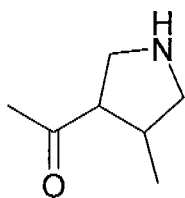
- L₂ es $-(\text{CH}_2)_3-$: Ejemplos 1 hasta 68.

W

- W es $-\text{NH}-\text{C}(=\text{NH})-\text{NH}_2$: Ejemplos 1 hasta 68.

L₃

- L₃ es $-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2)_y-$: Ejemplos 48, 62 y 66.
- L₃ es $-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}(\text{NR}_{6a}, \text{R}_{6b})-(\text{CH}_2)_y-$: Ejemplos 1 hasta 14, 16 hasta 47, 49 hasta 61, 63 hasta 65, 67 y 68.
- L₃ es



- L₃ es : Ejemplo 15

R_{6a} y R_{6b}

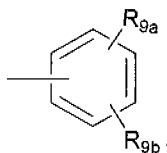
- R_{6a} y R_{6b} son hidrógeno: Ejemplos 1 hasta 14, 17 hasta 30, 35, 38 hasta 40, 42 hasta 45, 50 hasta 53, 58, 60, 61, 63 hasta 65, 67 y 68.
- R_{6a} y/o R_{6b} son R₇: Ejemplos 16, 31 hasta 34, 36, 37, 41, 46, 47, 49, 54 hasta 57 y 59.

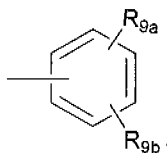
A81
482

- R₇ es un residuo histidina: Ejemplos 47, 54 y 55
- R₇ es metil: Ejemplos 31 y 32
- R₇ es etil: Ejemplo 33.
- R₇ es isopropil: Ejemplo 34.
- R₇ es acetil: Ejemplos 16, 36, 37, 41, 46 y 49.
- R₇ es polietilenglicol: Ejemplos 56, 57 y 59.

Q

- Q es naftil: Ejemplos 17 hasta 25, 35, 36, 38 hasta 43, 48, 53 y 68.



- Q es : Ejemplos 1 hasta 16, 26 hasta 34, 37, 44 hasta 47, 49 hasta 52, 54 hasta 67.

R_{9a} y R_{9b}

- R_{9a} y/o R_{9b} están ausentes: Ejemplos 28 y 67.
- R_{9a} y/o R_{9b} están presentes: Ejemplos 1 hasta 16, 26, 27, 29 hasta 34, 37, 44 hasta 47, 49 hasta 52, 54 hasta 66.
- R_{9a} o R_{9b} es halógeno: Ejemplos 1 hasta 9, 11 hasta 13, 15, 16, 26, 27, 31 hasta 34, 45, 49 hasta 52, 54, 56 hasta 59, 62 hasta 66
- R_{9a} o R_{9b} es alquilo: Ejemplo 5, 6, 10, 11, 14, 16, 27, 29, 30, 37, 44 hasta 47, 55, 60, 61, 63 hasta 65
- R_{9a} o R_{9b} unidos directamente: Ejemplos 1 hasta 16, 25 hasta 29
- R_{9a} o R_{9b} unido a través de un enlace eter: Ejemplo 30

R_{4a}, R_{4b}, R_{5a} y R_{5b}

- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es metilo: Ejemplos 1 hasta 6, 9 hasta 34, 37 hasta 48 y 50 hasta 67.
- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es isobutilo: Ejemplos 7, 8, 35, 36 y 68.
- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es -L₂-W: Ejemplo 49.

482
48

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

Radicación N° 05-122256

Clasificación Internacional (IPC): A61K31/495, 31/496, C07D241/04, 241/08

Concepto Técnico N°

Patente de Invención ☒

Vía PCT fase nacional ☒

Cap. I



Cap. II ☒

No. Sol. Internacional

PCT/US2004/013803

Fecha de Presentación Internal.

03 de mayo de 2004

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

1.1. Descripción: Folios: 171 a 343 Como se radicó inicialmente.

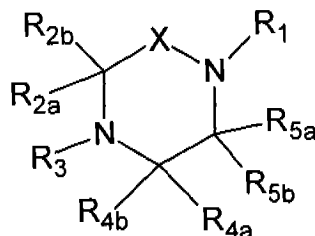
1.2. Reivindicaciones: Folios 344 a 359 Como se radicó inicialmente.
Folios 383 a 394 Modificación.
Folio 458 a 465 Nueva modificación.
Folios 474 a 479 Ultima modificación.

1.3 Prioridad: Folios1, US60/647,442, 01/05/2003;
US60/546,393; 19/02/2004;
US10/837,519

1 Objeto de la invención

Título de la solicitud: (folio 471) DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECÍFICOS AL RECEPTOR DE MELANO CORTINA

La solicitud tiene como objetos los compuestos de la fórmula Markush I:



-Reivindicaciones 1–9 Y 11: Un compuesto de la fórmula (I).

-Reivindicación 10: Composiciones que los contienen

La invención se catalogó, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.):A61K31/495, 31/496, C07D241/04, 241/08,403/04.

2. 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 01 de mayo de2003.

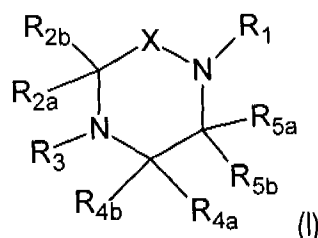
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica, de documentos relacionados con la materia que se reclama en esta solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	US6207665	Piperazine Derivatives and their use as anti-inflammatory agents	27-mar-2001
D2	WO03013571	Peptidomimetics of biologically active metalloptides	20-feb-2003
D3	WO02085925	Melanocortin receptor ligands	31-oct-2002

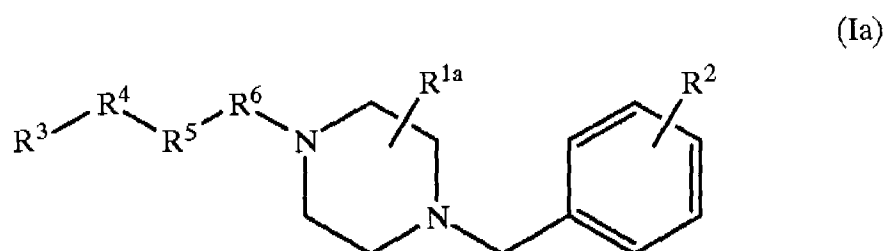
3. Análisis de patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)

3.1Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

La presente solicitud reclama los compuestos de fórmula Markush (I):

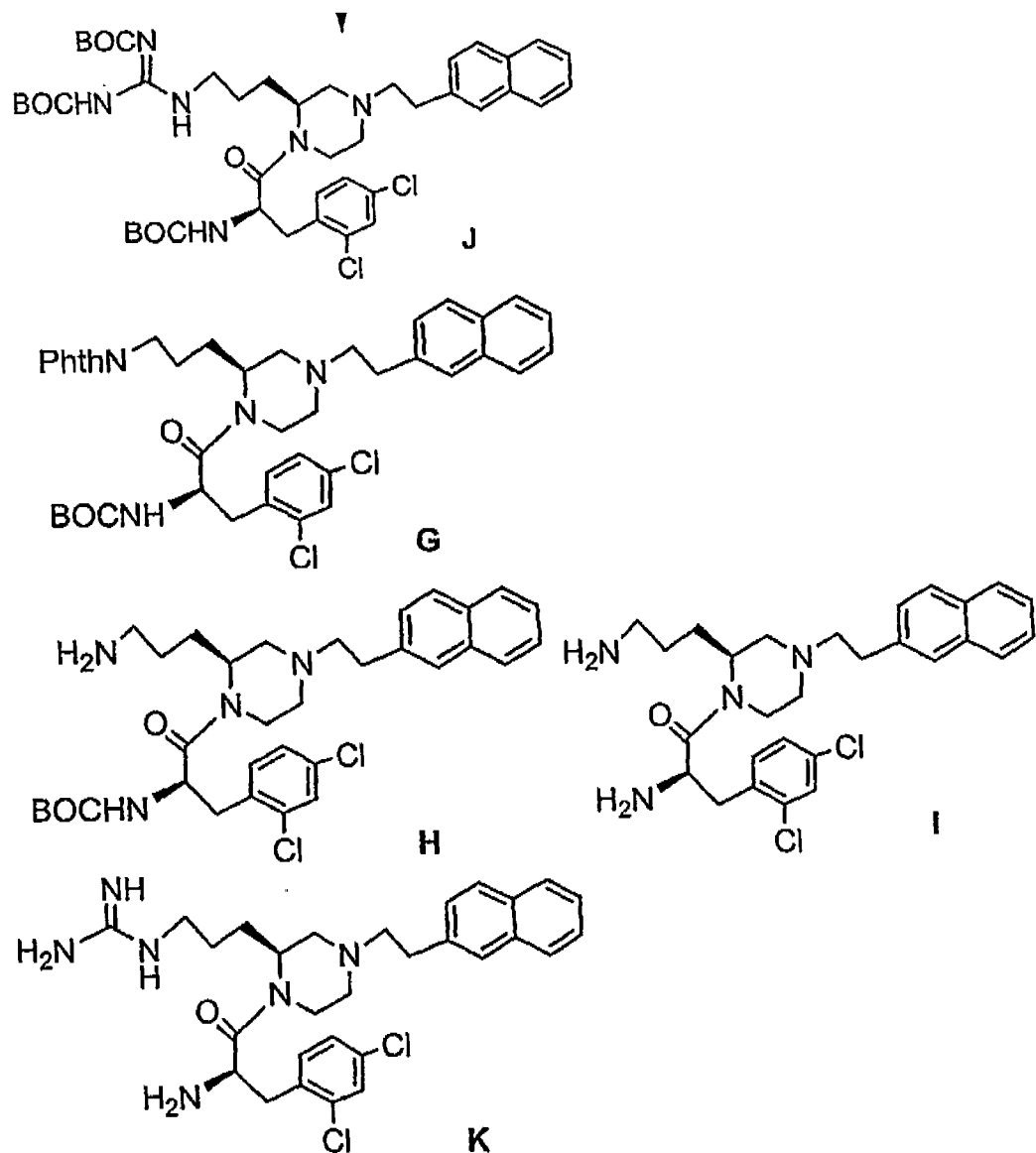


-D1 (US 6207665) enseña los compuestos de fórmula (I):



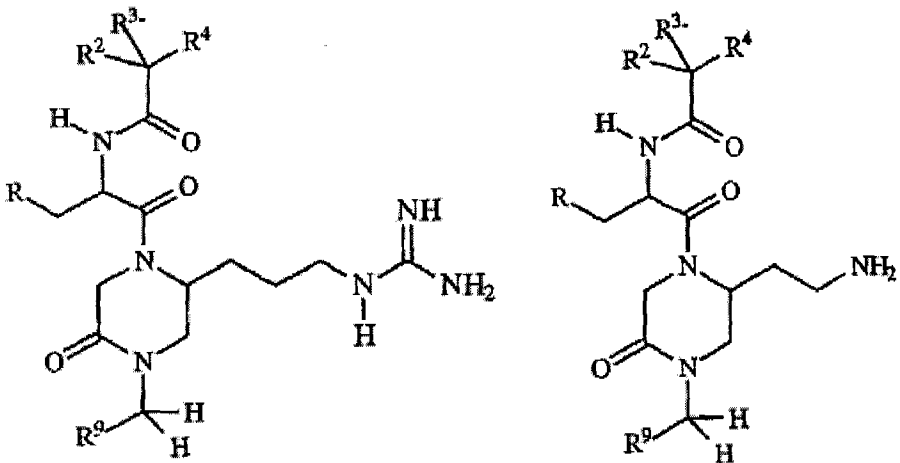
Especialmente las columnas 3-6, 25,26,33-36,139-146, donde se enseñan compuestos específicos y generales que ahora con la modificación de la solicitud en estudio no caen dentro del alcance de la materia reclamada. Entonces la solicitud en estudio ahora tiene novedad, por lo tanto cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

-D2 (WO03013571) enseña compuestos derivados de piperidina especialmente los compuestos específicos, G, H, I, J y K del esquema 8:



Estos compuestos específicos ya no afectan la novedad ahora con la modificación de la solicitud en estudio no caen dentro del alcance de la materia reclamada. Entonces la solicitud en estudio ahora tiene novedad, por lo tanto cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

-La anterioridad D3 describe compuestos derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melanocortina con las fórmulas:



Pags.54-100, tablas II, III y IV, se diferencian en el significado ahora dados a sustituyentes 4a, 4b, 5a, 5b de la solicitud, más bien en la forma como se distribuye su significado, por lo tanto la presente solicitud es nueva cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

3.2 Nivel inventivo (artículo 18 D486 de la C.A.N.)

Teniendo en cuenta que el estado de la técnica enseña las publicaciones D1-D3 que comprenden compuestos relacionados con los derivados de piperazina y piperazin-2-ona de la solicitud, pero no resulta obvio para una persona del nivel medio del arte derivar de manera evidente los compuestos que ahora se reclaman y el efecto farmacológico descrito para esos compuestos así reclamados, por lo tanto la oficina considera que la invención tiene nivel inventivo, cumpliendo con el requisito exigido en el artículo 18 D486 de la C.A.N.

Aplicación industrial (artículo 19 D 486 de la C.A.N.)

Los derivados piperazina y piperazin-2-ona tal como son reclamados ahora en la presente solicitud, son susceptibles de ser sintetizados, por el método descrito, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que tiene aplicación industrial.

4 Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 11 (folios: 474-479).

Bogotá, D.C., 04-dic-2009

CONCEPTO TECNICO No. 4379	EXAMINADOR TECNICO Código N°202012
---------------------------	------------------------------------

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION **Nº 6 8 3 7 8**

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 30 del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECIFICOS AL RECEPTOR DE MELANO CORTINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US 2004/013803 de fecha 03 de mayo del 2004, fue radicada en esta Superintendencia el 01 de diciembre del 2005 bajo el número 05122256 00000000, para que se iniciara la fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 570 del 30 de noviembre del 2006, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 467 a 469 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el número 05-122256-00008-0000 del 13 de agosto del 2009, atendió oportunamente el requerimiento formulado, presentando nuevos folios 474 a 479 con el texto de las reivindicaciones que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. El nuevo capítulo reivindicatorio se acepta, como quiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de La Comunidad Andina se otorgarán patentes "*...para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial*".

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 6 8 3 7 8

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

SEXTO: Que en el presente caso cumplen los requisitos indicados en el numeral anterior las reivindicaciones 1 a 11 contenidas en los folios 474 a 479, razón por la cual este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas el privilegio de patente solicitado.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Otorgar el privilegio de patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación denominada:

**" DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECIFICOS AL RECEPTOR
DE MELANO CORTINA "**

Clasificación IPC: A 61 K 31/495, 31/496, C 07 D 241/04, 241/08.

Reivindicación(es): 1 a 11 **Folio(s):** 474 a 479.

Titular(es): PALATIN TECHNOLOGIES, INC.

Domicilio(s): Cranbury, New Jersey, Estados Unidos de América.

Inventor(es): Shubh D. Sharma, Yi-Qun Shi, Zhijun Wu, Ramesh Rajpurohit, Annette M. Shadiack, Papireddy Purma y Kevin D. Burris.

Prioridad Nº: 60/467,442	Fecha: 01 de mayo del 2003	País: US.
60/546,393	19 de febrero del 2004	US.
10/837,519	30 de abril del 2004	US.

Solicitud Internacional Nº: PCT/US 2004/013803 **Fecha:** 03 de mayo del 2004.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 6 8 3 7 8

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

Vigente desde: 03 de mayo del 2004 **Hasta:** 03 de mayo del 2024

ARTICULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

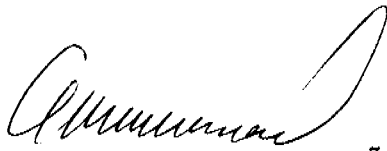
ARTICULO TERCERO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTICULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución al doctor Emilio Ferrero, en su calidad de apoderado de Palatin Technologies, Inc., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición ante el Superintendente de Industria y Comercio, del cual podrá hacer uso al momento de la notificación personal o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los **29** DIC. 2009

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
EMILIO FERRERO
Carrera 4 Nº 72 – 35.
Bogotá D.C.

J.

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 700 4814

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-122256- -00008-0000

Fecha: 2009-08-13 16:48:14 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 05122256
Asunto : Solicitud de Patente para: **"Derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melano cortina "**.
Solicitante : PALATIN TECHNOLOGIES, INC
Fecha de solicitud: Diciembre 1 de 2005.

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 5696 notificado por fijación en lista del 15 de Mayo de 2009.

2. Mediante el Oficio No. 5696 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la siguiente manera:

3. De la solicitud de patente:

Su Despacho enuncia lo siguiente:

3.1 Título.

- "El título de la solicitud es un titulo de fantasía que no comprende la materia de que trata la solicitud, ya que son derivados de piperazina y piperazin-2-ona".

3.2 Reivindicaciones.

- "La reivindicación 1, no es clara, ya que se omitió los significados de los sustituyentes R4a, R4b, R5a, R5b por lo tanto no es posible hacer un estudio del nuevo capítulo reivindicatorio".

471
472

- "Tal como se indicó en el primer examen de patentabilidad se reclama un número extremadamente grande de compuestos/composiciones. Toda esa enorme cantidad de compuestos/composiciones no esta soportada enteramente en la descripción. En la descripción solamente existen 68 ejemplos, lo cual no soporta los millones de posibles compuestos que se reclaman, por lo tanto se debe tener en cuenta el soporte técnico real de os compuestos/composiciones reclamados, deben estar fundados completamente en la descripción, sin generalizaciones especulativas".

4. Modificación a una solicitud en tramite.

Su Despacho concluye que el capítulo reivindicatorio no cumple con los requisitos de claridad, concisión o sustento descriptivo de acuerdo con el artículo 30 de la Decisión 486. Con respecto a lo señalado por su Despacho mi representada desea señalar lo siguiente:

Con el fin de atender las anteriores observaciones y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 11 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto quedan superadas respectivamente con las modificaciones realizadas de la siguiente manera:

- La reivindicación 1 ha sido redactada nuevamente limitando las definiciones de los sustituyentes con base en las definiciones encontradas en el capítulo descriptivo y debidamente sustentadas en los ejemplos de la presente solicitud. Para estos efectos, se presenta anexo un documento titulado "Análisis de los ejemplos", donde se demuestra que la materia reclamada se encuentra sustentada en la descripción, tal y como fue inicialmente presentada.
- Adicionalmente, en este nuevo pliego reivindicatorio se incluyen las definiciones de los radicales R4a, R4b, R5a, R5b.

Así entonces, con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio el mismo es claro y conciso y las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas.

Con respecto a la objeción formulada al título de la presente solicitud, se pone de presente que el mismo ha sido modificado de la siguiente manera: **"Derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melano cortina "**. Así entonces, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

A72
473

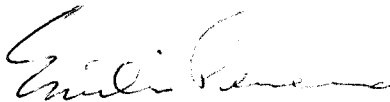
Sin embargo, en el evento que el Despacho considere que una modificación adicional sea necesaria, respetuosamente le solicito hacer uso de la facultad que le otorga el artículo 45 inciso 2. de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

4. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

5. Anexos:

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.
- Análisis de los ejemplos.

Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

COLO-15121-841-001-8

MGM\MGM\ID-155644\WPC15121

No. M-2009-155644\MGM

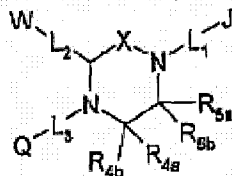
FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: PALATIN TECHNOLOGIES, INC. Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América. Dirección: Cedar Brook Corporate Center, 4-C Cedar Brook Drive, Cranbury, New Jersey 08512, Estados Unidos de América Domicilio: Cranbury, New Jersey, Estados Unidos de América Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: 438.019 TP 31.929
4	Número de expediente: <u>05.122.256</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 11 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.	
6	Comprobante de pago No. _____ Fecha: _____	
7	Anexos ☐ Comprobante de pago de la tasa por \$111.000, por concepto de modificaciones. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la decimoquinta reivindicación por ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO	FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929

474
475

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto que tiene la fórmula de estructura I:



5 o un enantiómero, estereoisómero o diaestereoisómero del mismo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,

en donde

10 X es CH₂ o C=O;

L₁ es una unidad enlazadora seleccionada del grupo que consiste de:

-(CH₂)₁-,

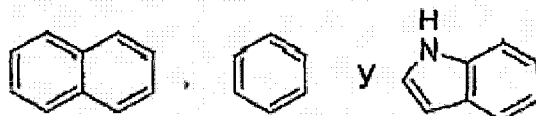
-(CH₂)₂-,

15 -(CH₂)₃, y

-C(=O)-(CH₂)₁₋₃,

J es una estructura en anillo sustituida o no sustituida seleccionada a partir del grupo que consiste de

20



en donde, J cuando es sustituido, está sustituido con uno o más sustituyentes del anillo independientemente seleccionado a partir del grupo que consiste de halógeno y grupos alquilo unidos directamente;

25

L₂ es -(CH₂)₃-;

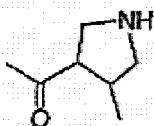
W es -NH-C(=NH)-NH₂,

30

L₃ es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de:

-C(=O)-(CH₂)₁₋₆-,

35 -C(=O)-CH(NR_{6a},R_{6b})-(CH₂)₁₋₆-, y

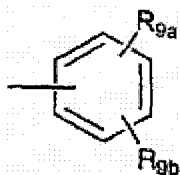


En donde R_{6a} y R_{6b} se selecciona cada uno independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, un residuo histidina, metilo, etilo, isopropilo, acetilo o polietilen glicol con una formula de peso molecular entre 100 y 10000;

40

Q es un anillo naftilo o

475
476

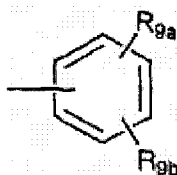


en donde R_{9a} y R_{9b} son sustituyentes opcionales del anillo, y cuando uno o ambos están presentes, son los mismos o son diferentes y son independientemente grupos hidroxilo, halógeno, alquilo, o arilo unidos directamente o a través de un enlace éter; y

Uno o dos de R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} , y R_{5b} son independientemente un grupo metilo o isobutilo y el remanente de R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} , y R_{5b} son hidrogeno.

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque X es CH_2 .

3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 o 2 caracterizado porque Q es



en donde R_{9a} y R_{9b} son sustituyentes opcionales del anillo, y cuando uno o ambos están presentes, son los mismos o son diferentes y son independientemente grupos halógeno o grupos alquilo unidos directamente o a través de un enlace éter.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque al menos uno de los radicales R_{9a} o R_{9b} es un alquilo seleccionado a partir del grupo que consiste de $-CH_3$ y $-OCH_3$.

5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 3, caracterizado porque al menos uno de los radicales R_{9a} o R_{9b} es un halógeno seleccionado del grupo que consiste de $-Cl$ y $-CF_3$.

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque:
X es CH_2 ;

J una estructura en anillo seleccionada a partir del grupo que consiste de naftilo, fenilo, fenilo sustituido, indol e indol sustituido, en donde, J cuando es sustituido, esta sustituido con uno o más sustituyentes del anillo independientemente seleccionado a partir del grupo que consiste de halógeno y grupos alquilo unidos directamente;

L_3 es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de $-C(=O)-CH(NR_{6a}R_{6b})-(CH_2)_{1-6}-$ y $-C(=O)-(CH_2)_{1-6}-$;

Un radical R_{4a} , R_{4b} , R_{5a} y R_{5b} es metilo o isobutilo, y los restantes son hidrógeno; y

R_{6a} y R_{6b} son seleccionados cada uno independientemente a partir del grupo que consiste de hidrógeno, acetilo, metilo, etilo, isopropilo y polietilenglicol con formula de peso molecular entre 100 y 10000.

476
477

7. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 y sales farmacéuticamente aceptables del mismo seleccionado a partir del grupo que consiste de:

- 5 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
6(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
10 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(S)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
15 6(S)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2-cloro-4-metil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
20 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(S)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
25 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-
30 propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
35 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2-cloro-4-trifluorometil-fenil)-
propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-
propil}-guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
40 guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(3,4-dicloro-fenil)-propionil]-
5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-
45 5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
N-{3-[1-[4-(4-Cloro-fenil)-pirrolidina-3-carbonil]-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
guanidina;
50 N-{1(R)-(4-cloro-2-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-
propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-
oxo-etil}-acetamida;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-
55 guanidina;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(3-fenil-propil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-
metil-4-(2-p-tolil-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;

477
478

- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-acetil)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 5 N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-propionil)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-(2-1H-indol-3-il-butiril)-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 10 N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-5(R)-metil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(2-metil-1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 15 N-(3-{1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1-metil-1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-(2(R)-Amino-(4-cloro-fenil)-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 20 N-(3-{1-(2(R)-Amino-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil)-5(R)-metil-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propionil}-guanidina;
- 25 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-metoxi-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 30 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-dimetilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 35 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-metilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-dietilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 40 N-{3-[1-[3-(4-Cloro-fenil)-2(R)-isopropilamino-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil]-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 45 N-{2-[2(S)-(3-Guanidino-propil)-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-1(R)-naftalen-2-ilmetil-2-oxo-etil}-acetamida;
- 50 N-{1(R)-(2,4-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-acetamida;
- N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 55 N-{2-[2(S)-(3-Guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-1(R)-naftalen-2-ilmetil-2-oxo-etil}-acetamida;

478
479

- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dimetil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 5 N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-dimetil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{1(R)-(2,4-Dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-acetamida;
- 10 2(S)-Amino-N-{1(R)-(2,4-dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- N-{3-[1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 15 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-3-oxo-4-fenetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-4-[2-(1H-indol-3-il)-etil]-5(R)-metil-3-oxo-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 20 N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 2(S)-Amino-N-{1(R)-(4-cloro-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- 25 2(S)-Amino-N-{1(R)-(2,4-dimetil-bencil)-2-[2(S)-(3-guanidino-propil)-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-1-il]-2-oxo-etil}-3-(1H-imidazol-4-il)-propionamida;
- 30 N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-oxo-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 35 N-(3-[1-[2(R)-Amino-3-(2,4-dicloro-fenil)-propionil]-5(R),6(R)-dimetil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- N-{3-[1-[2(R)-(PEG-Amino)-3-(4-cloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(2-naftalen-2-il-etil)-3-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina;
- 40 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-fenilacetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 45 N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(3-fenil-propionil)-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- N-(3-{1-[2(R)-Amino-3-(4-cloro-2-metil-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-(4-fenil-butiril)-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- 50 N-(3-{1-[3-(2,4-Dicloro-fenil)-propionil]-5(R)-metil-4-fenilacetil-piperazin-2(S)-il}-propil)-guanidina;
- y N-{3-[1-(2(R)-Amino-3-naftalen-2-il-propionil)-5(R)-isobutil-4-(2-naftalen-2-il-acetil)-piperazin-2(S)-il]-propil}-guanidina.
- 55

8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque uno de los radicales R_{5a} y R_{5b} es (R)-metilo o (R)-isobutilo y los radicales restantes R_{4a}, R_{4b}, y/o R_{5a}, y/o R_{5b} son hidrógeno.

60

479
406

9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque L_1 es una unidad enlazadora seleccionada a partir del grupo que consiste de $-\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2-$ y $-(\text{CH}_2)_3-$.

5 10. Una composición farmacéutica, que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 8 o 9 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

10 11. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6, caracterizado porque uno de los radicales R_{5a} y R_{5b} es (R)-metilo o (R)-isobutilo y los radicales restantes R_{4a} , R_{4b} , y/o R_{5a} , y/o R_{5b} son hidrógeno y en donde L_1 se selecciona a partir del grupo que consiste de $-\text{C}(=\text{O})-\text{CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2)_2-$ y $-\text{C}(=\text{O})-(\text{CH}_2)_3-$.

15

MGM\MGM\ID 155645\WPC15121

20

25

30

35

40

45

50

55

60

18 PTA



Análisis de los ejemplos.

X

- X es CH₂: Ejemplos 1 hasta 49, 55 y 57 hasta 68.
- X es CO: Ejemplos 50 hasta 54 y 56.

L₁

- L₁ es -CH₂-: Ejemplos 14, 39 y 40
- L₁ es -(CH₂)₂-: Ejemplos 1 hasta 13, 15, 17, 19, 23 hasta 37 y 50 hasta 59.
- L₁ es -(CH₂)₃-: Ejemplo 18.
- L₁ es -C(=O)-(CH₂)₁₋₃-: Ejemplos 20 hasta 22, 38, 41, 44 hasta 47 y 63 hasta 68.

J

- J es naftil: Ejemplos 1 hasta 17, 28 hasta 38, 41-47, 53- 59 y 68.
- J es fenil: Ejemplos 18, 19, 40, 48, 49, 60 y 62 hasta 67.
- J es indolil: Ejemplos 20 hasta 27 y 61.
- J es sustituido: Ejemplos 19, 24, 25 y 48 (alquilo).
Ejemplo 49 (halógeno).
- J es no sustituido: Ejemplos 1 hasta 18, 20 hasta 23, 26 hasta 39, 41 hasta 47
y 50 hasta 68.

L₂

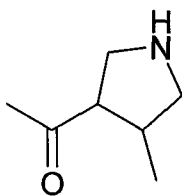
- L₂ es -(CH₂)₃-: Ejemplos 1 hasta 68.

W

- W es -NH-C(=NH)-NH₂: Ejemplos 1 hasta 68.

L₃

- L₃ es -C(=O)-(CH₂)_y-: Ejemplos 48, 62 y 66.
- L₃ es -C(=O)-CH(NR_{6a},R_{6b})-(CH₂)_y-: Ejemplos 1 hasta 14, 16 hasta 47, 49 hasta 61, 63 hasta 65, 67 y 68.
- L₃ es



- L₃ es : Ejemplo 15

R_{6a} y R_{6b}

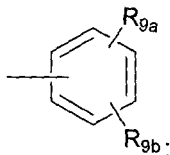
- R_{6a} y R_{6b} son hidrógeno: Ejemplos 1 hasta 14, 17 hasta 30, 35, 38 hasta 40, 42
hasta 45, 50 hasta 53, 58, 60, 61, 63 hasta 65, 67 y 68.
- R_{6a} y/o R_{6b} son R₇: Ejemplos 16, 31 hasta 34, 36, 37, 41, 46, 47, 49, 54 hasta 57 y 59.

481
482

- R₇ es un residuo histidina: Ejemplos 47, 54 y 55
- R₇ es metil: Ejemplos 31 y 32
- R₇ es etil: Ejemplo 33.
- R₇ es isopropil: Ejemplo 34.
- R₇ es acetil: Ejemplos 16, 36, 37, 41, 46 y 49.
- R₇ es polietileneglicol: Ejemplos 56, 57 y 59.

Q

- Q es naftil: Ejemplos 17 hasta 25, 35, 36, 38 hasta 43, 48, 53 y 68.



- Q es Ejemplos 1 hasta 16, 26 hasta 34, 37, 44 hasta 47, 49 hasta 52, 54 hasta 67.

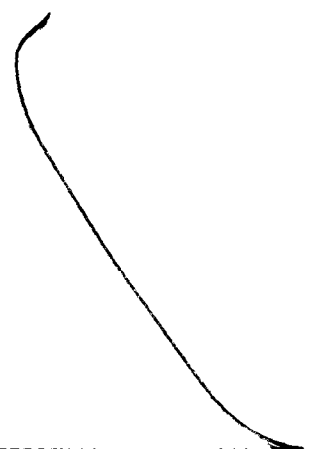
R_{9a} y R_{9b}

- R_{9a} y/o R_{9b} están ausentes: Ejemplos 28 y 67.
- R_{9a} y/o R_{9b} están presentes: Ejemplos 1 hasta 16, 26, 27, 29 hasta 34, 37, 44 hasta 47, 49 hasta 52, 54 hasta 66.
- R_{9a} o R_{9b} es halógeno: Ejemplos 1 hasta 9, 11 hasta 13, 15, 16, 26, 27, 31 hasta 34, 45, 49 hasta 52, 54, 56 hasta 59, 62 hasta 66
- R_{9a} o R_{9b} es alquilo: Ejemplo 5, 6, 10, 11, 14, 16, 27, 29, 30, 37, 44 hasta 47, 55, 60, 61, 63 hasta 65
- R_{9a} o R_{9b} unidos directamente: Ejemplos 1 hasta 16, 25 hasta 29
- R_{9a} o R_{9b} unido a través de un enlace eter: Ejemplo 30

R_{4a}, R_{4b}, R_{5a} y R_{5b}

- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es metilo: Ejemplos 1 hasta 6, 9 hasta 34, 37 hasta 48 y 50 hasta 67.
- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es isobutilo: Ejemplos 7, 8, 35, 36 y 68.
- uno o dos de R_{4a}, R_{4b}, R_{5a}, y R_{5b} es -L₂-W: Ejemplo 49.

1281



1 ~~482~~
483

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

Radicación N° 05-122256

Clasificación Internacional (IPC): A61K31/495, 31/496, C07D241/04, 241/08

Concepto Técnico N°

Patente de Invención ☒

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

No. Sol. Internacional PCT/US2004/013803

Fecha de Presentación Internal. 03 de mayo de 2004

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

1.1. Descripción: Folios: 171 a 343 Como se radicó inicialmente.

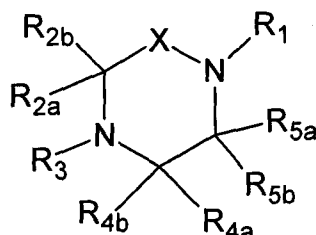
1.2. Reivindicaciones: Folios 344 a 359 Como se radicó inicialmente.
Folios 383 a 394 Modificación.
Folio 458 a 465 Nueva modificación.
Folios 474 a 479 Ultima modificación.

1.3 Prioridad: Folios 1, US60/647,442, 01/05/2003;
US60/546,393; 19/02/2004;
US10/837,519

1 Objeto de la invención

Título de la solicitud: (folio 471) DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECÍFICOS AL RECEPTOR DE MELANO CORTINA

La solicitud tiene como objetos los compuestos de la fórmula Markush I:



- Reivindicaciones 1-9 Y 11: Un compuesto de la fórmula (I).
- Reivindicación 10: Composiciones que los contienen

La invención se catalogó, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.):A61K31/495, 31/496, C07D241/04, 241/08,403/04.

2. 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 01 de mayo de 2003.

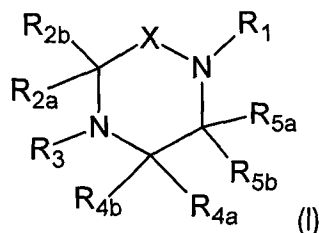
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica, de documentos relacionados con la materia que se reclama en esta solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	US6207665	Piperazine Derivatives and their use as anti-inflammatory agents	27-mar-2001
D2	WO03013571	Peptidomimetics of biologically active metallopeptides	20-feb-2003
D3	WO02085925	Melanocortin receptor ligands	31-oct-2002

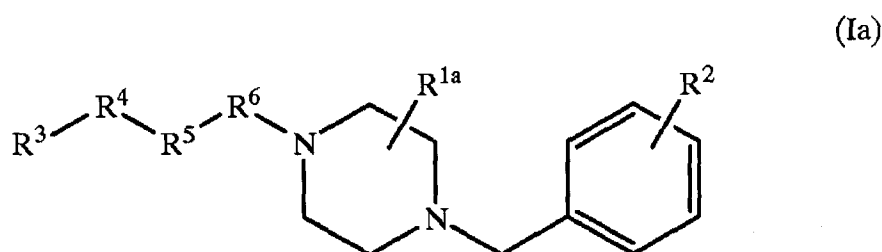
3. Análisis de patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)

3.1 Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

La presente solicitud reclama los compuestos de fórmula Markush (I):

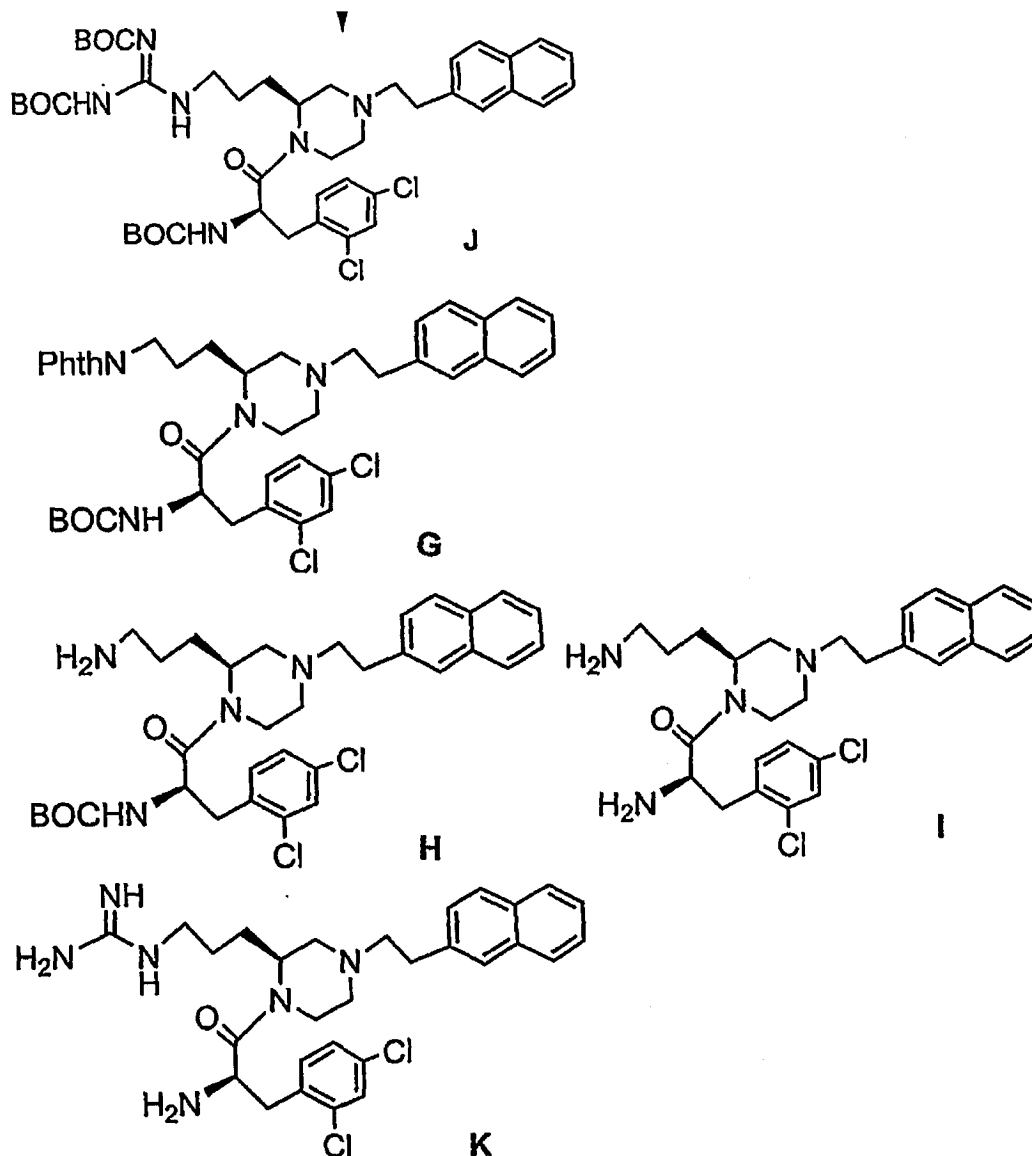


-D1 (US 6207665) enseña los compuestos de fórmula (I):



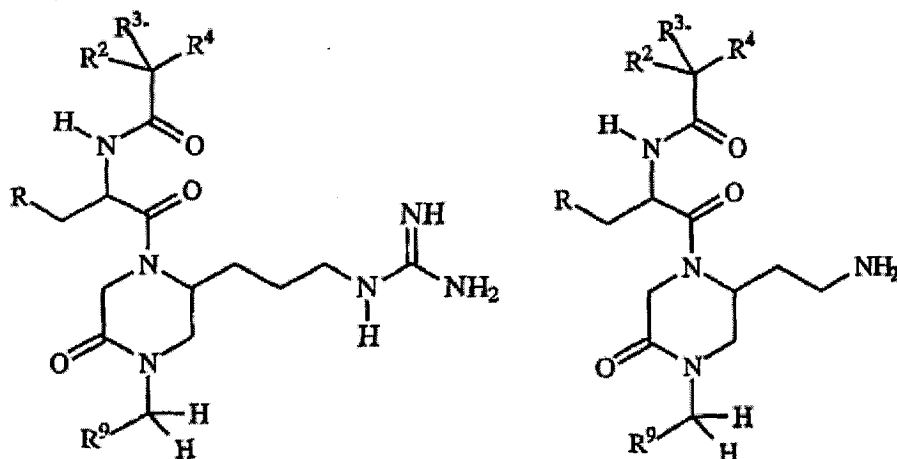
Especialmente las columnas 3-6, 25,26,33-36,139-146, donde se enseñan compuestos específicos y generales que ahora con la modificación de la solicitud en estudio no caen dentro del alcance de la materia reclamada. Entonces la solicitud en estudio ahora tiene novedad, por lo tanto cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

-D2 (WO03013571) enseña compuestos derivados de piperidina especialmente los compuestos específicos, G, H, I, J y K del esquema 8:



Estos compuestos específicos ya no afectan la novedad ahora con la modificación de la solicitud en estudio no caen dentro del alcance de la materia reclamada. Entonces la solicitud en estudio ahora tiene novedad, por lo tanto cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

-La anterioridad D3 describe compuestos derivados de piperazina y piperazin-2-ona específicos al receptor de melanocortina con las fórmulas:



Pags.54-100, tablas II, III y IV, se diferencian en el significado ahora dados a sustituyentes 4a, 4b, 5a, 5b de la solicitud, más bien en la forma como se distribuye su significado, por lo tanto la presente solicitud es nueva cumple con lo dispuesto en el artículo 16 D486 de la C.A.N.

3.2 Nivel inventivo (artículo 18 D486 de la C.A.N.)

Teniendo en cuenta que el estado de la técnica enseña las publicaciones D1-D3 que comprenden compuestos relacionados con los derivados de piperazina y piperazin-2-ona de la solicitud, pero no resulta obvio para una persona del nivel medio del arte derivar de manera evidente los compuestos que ahora se reclaman y el efecto farmacológico descrito para esos compuestos así reclamados, por lo tanto la oficina considera que la invención tiene nivel inventivo, cumpliendo con el requisito exigido en el artículo 18 D486 de la C.A.N.

Aplicación industrial (artículo 19 D 486 de la C.A.N.)

Los derivados piperazina y piperazin-2-ona tal como son reclamados ahora en la presente solicitud, son susceptibles de ser sintetizados, por el método descrito, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que tiene aplicación industrial.

4 Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 11 (folios: 474-479).

Bogotá, D.C., 04-dic-2009

CONCEPTO TECNICO No. 4379	EXAMINADOR TECNICO Código N°202012
---------------------------	------------------------------------

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 6 8 3 7 8

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo
3, numeral 30 del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECIFICOS AL RECEPTOR DE MELANO CORTINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US 2004/013803 de fecha 03 de mayo del 2004, fue radicada en esta Superintendencia el 01 de diciembre del 2005 bajo el número 05122256 00000000, para que se iniciara la fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial Nº 570 del 30 de noviembre del 2006, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 467 a 469 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el número 05-122256-00008-0000 del 13 de agosto del 2009, atendió oportunamente el requerimiento formulado, presentando nuevos folios 474 a 479 con el texto de las reivindicaciones que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. El nuevo capítulo reivindicatorio se acepta, como quiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de La Comunidad Andina se otorgarán patentes "...para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 6 8 3 7 8

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

SEXTO: Que en el presente caso cumplen los requisitos indicados en el numeral anterior las reivindicaciones 1 a 11 contenidas en los folios 474 a 479, razón por la cual este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas el privilegio de patente solicitado.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Otorgar el privilegio de patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación denominada:

**" DERIVADOS DE PIPERAZINA Y PIPERAZIN-2-ONA ESPECIFICOS AL RECEPTOR
DE MELANO CORTINA "**

Clasificación IPC: A 61 K 31/495, 31/496, C 07 D 241/04, 241/08.

Reivindicación(es): 1 a 11 **Folio(s):** 474 a 479.

Titular(es): PALATIN TECHNOLOGIES, INC.

Domicilio(s): Cranbury, New Jersey, Estados Unidos de América.

Inventor(es): Shubh D. Sharma, Yi-Qun Shi, Zhijun Wu, Ramesh Rajpurohit, Annette M. Shadiack, Papireddy Purma y Kevin D. Burris.

Prioridad Nº: 60/467,442	Fecha: 01 de mayo del 2003	País: US.
60/546,393	19 de febrero del 2004	US.
10/837,519	30 de abril del 2004	US.

Solicitud Internacional Nº: PCT/US 2004/013803 **Fecha:** 03 de mayo del 2004.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION Nº 6 8 3 7 8

Por la cual se otorga una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/ 05-122256

Vigente desde: 03 de mayo del 2004 **Hasta:** 03 de mayo del 2024

ARTICULO SEGUNDO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

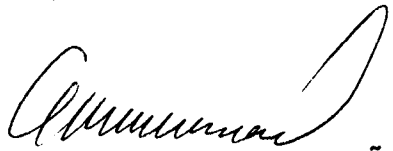
ARTICULO TERCERO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTICULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución al doctor Emilio Ferrero, en su calidad de apoderado de Palatin Technologies, Inc., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición ante el Superintendente de Industria y Comercio, del cual podrá hacer uso al momento de la notificación personal o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los **29** DIC. 2009

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
EMILIO FERRERO
Carrera 4 N° 72 – 35.
Bogotá D.C.

J.

