

159
139

Clarke, Modet & C^o

COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-006399-00003-0000

Fecha: 2007-10-31 15:40:42 Dep. 2020 NUECREACION;
Tipo: 14-15A-15N-15YII Lva: 379 FASENACIONALI;
2-155-15110-0A Folios: 3

SEÑORES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
E.S.D

REF EXPEDIENTE No.: 06006399
PATENTE: DIAMIDAS DE AMINOACIDOS EN POSICIÓN NO α
UTILES COMO ADYUVANTES PARA LA ADMINSTRACIÓN DE
AGENTES BIOLÓGICOS ACTIVOS
SOLICITANTE : LABORATORIOS FARMACÉUTICOS ROVI
S.A.

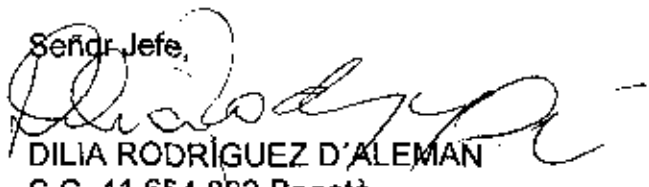
ASUNTO: SOLICITUD ESTUDIO DE FONDO

DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN, en mi condición de apoderada de la Sociedad solicitante, por el presente escrito atentamente solicito a Usted que habiéndose surtido la publicación de la presente solicitud, en la Gaceta de la Propiedad Industrial No.578 de fecha Julio 31 de 2007 y se proceda con el estudio de Fondo.

Para tal fin me permito anexar la tasa correspondiente.

Agradezco continuar con el presente trámite.

Señor Jefe,


DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN
C.C. 41.654.882 Bogotá

p-739 

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-06399

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 578 DE

FECHA 31 DE JULIO DE 2007 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL 26 DE OCTUBRE DE 2007

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO X

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
27 February 2003 (27.02.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/015774 A1(51) International Patent Classification⁷: A61K 31/425,
C07D 417/12, 233/48, 285/12, 213/75, 241/20, 231/40,
237/20, 239/42, 307/66, A61P 03/10

(21) International Application Number: PCT/GB02/03745

(22) International Filing Date: 15 August 2002 (15.08.2002)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0102764-8 17 August 2001 (17.08.2001) SE(71) Applicant (for all designated States except MG, US): AS-
TRAZENECA AB [SE/SE]; Sodertalje, S-151 85 (SE).(71) Applicant (for MG only): ASTRAZENECA UK LIM-
ITED [GB/GB]; 15 Stanhope Gate, London, Greater Lon-
don W1Y 6LN (GB).

(72) Inventors; and

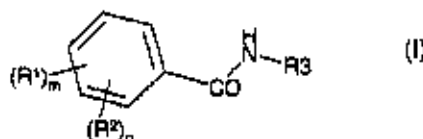
(75) Inventors/Applicants (for US only): BOYD, Scott
[GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10
4TG (GB). CAULKETT, Peter, William, Rodney
[GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10
4TG (GB). HARGREAVES, Rodney, Brian [GB/GB];
Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB).
BOWKER, Suzanne, Saxon [GB/GB]; Alderley Park,
Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB). JAMES, Roger
[GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10
4TG (GB). JOHNSTONE, Craig [GB/GB]; AlderleyPark, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG (GB). JONES,
Clifford, David [GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield,
Cheshire SK10 4TG (GB). MCKERRECHER, Darren
[GB/GB]; Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10
4TG (GB). BLOCK, Michael, Howard [GB/US]; 35
Gatehouse Drive, Waltham, MA 02451 (US).(74) Agent: BRYANT, Tracey, et al; Astrazeneca, Global In-
tellectual Property, Mereside, Alderley Park, Macclesfield,
Cheshire SK10 4TG (GB).(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW).
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM).
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK,
TR). OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

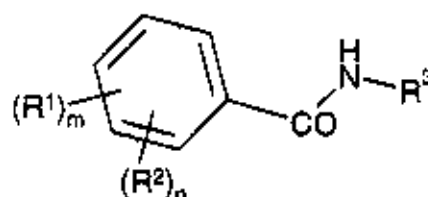
(54) Title: COMPOUNDS EFFECTING GLUCOKINASE

(57) Abstract: The invention relates to the use of a compound of Formula (I) or a salt, solvate or prodrug thereof, wherein R¹, R², R³, n and m are as described in the specification, in the preparation of a medicament for the treatment or prevention of a disease condition mediated through glucokinase (GLK), such as type 2 diabetes. The invention also relates to a novel group of compounds of Formula (I) and to methods for preparing compounds of Formula (I).

164

CLAIMS:

1. The use of a compound of Formula (I) or a salt, solvate or pro-drug thereof, in the preparation of a medicament for use in the treatment or prevention of a disease or
- 5 medical condition mediated through GLK:



Formula (I)

wherein

- m is 0, 1 or 2;
- 10 n is 0, 1, 2, 3 or 4;
- and $n + m > 0$;
- each R^1 is independently selected from OH, $-(CH_2)_{1-4}OH$, $-CH_2F$, $-(CH_2)_{1-4}CH_2F$, $-OCH_2F$, halo, $C_{1-6}alkyl$, $C_{2-6}alkenyl$, $C_{2-6}alkynyl$, NH_2 , $-NH-C_{1-4}alkyl$, $-N-di-(C_{1-4}alkyl)$, CN, formyl, phenyl or heterocyclyl optionally substituted by
- 15 $C_{1-6}alkyl$;
- each R^2 is the group $Y-X$.
- wherein each X is a linker independently selected from:
- $-O-Z-$, $-O-Z-O-Z-$, $-C(O)O-Z-$, $-OC(O)-Z-$, $-S-Z-$, $-SO-Z-$, $-SO_2-Z-$, $-N(R^6)-Z-$, $-N(R^6)SO_2-Z-$, $-SO_2N(R^6)-Z-$, $-(CH_2)_{1-4}-$, $-CH=CH-Z-$, $-C\equiv C-Z-$, $-N(R^6)CO-Z-$,
- 20 $-CON(R^6)-Z-$, $-C(O)N(R^6)S(O)_2-Z-$, $-S(O)_2N(R^6)C(O)-Z-$, $-C(O)-Z-$, $-Z-$, $-C(O)-Z-O-Z-$, $-N(R^6)-C(O)-Z-O-Z-$, $-O-Z-N(R^6)-Z-$, $-O-C(O)-Z-O-Z-$ or a direct bond;
- each Z is independently a direct bond, $C_{2-6}alkenylene$ or a group of the formula $-(CH_2)_p-C(R^{6a})_2-(CH_2)_q-$;
- 25 each Y is independently selected from aryl- Z^1 , heterocyclyl- Z^1 , $C_{3-7}cycloalkyl-Z^1$, $C_{1-6}alkyl$, $C_{2-6}alkenyl$, $C_{2-6}alkynyl$, $-(CH_2)_{1-4}CH_2F$ or $-CH(OH)CH_2F$; wherein each Y is independently optionally substituted by up to 3 R^4 groups;

H65
169

each R^4 is independently selected from halo, $-CH_3-aF_a$, CN, NH_2 , $C_{1-6}alkyl$, $-OC_{1-6}alkyl$, $-COOH$, $-C(O)OC_{1-6}alkyl$, OH or phenyl optionally substituted by $C_{1-6}alkyl$ or $-C(O)OC_{1-6}alkyl$.

or R^5-X^1 , where X^1 is independently as defined in X above and R^5 is selected from hydrogen, $C_{1-6}alkyl$, $-CH_3-aF_a$, phenyl, naphthyl, heterocyclyl or $C_{3-7}cycloalkyl$; and R^5 is optionally substituted by one or more substituents independently selected from: halo, $C_{1-6}alkyl$, $-OC_{1-6}alkyl$, $-CH_3-aF_a$, CN, OH, NH_2 , COOH, or $-C(O)OC_{1-6}alkyl$, each Z^1 is independently a direct bond, $C_{2-6}alkenylene$ or a group of the formula $-(CH_2)_p-C(R^{6a})_2-(CH_2)_q$;

R^3 is selected from phenyl or a heterocyclyl, and R^3 is optionally substituted by one or more R^7 groups;

R^6 is independently selected from hydrogen, $C_{1-6}alkyl$ or $-C_{2-4}alkyl-O-C_{1-4}alkyl$;

R^{6a} is independently selected from hydrogen, halo, $C_{1-6}alkyl$ or $-C_{2-4}alkyl-O-C_{1-4}alkyl$;

each R^7 is independently selected from:

$C_{1-6}alkyl$, $C_{2-6}alkenyl$, $C_{2-6}alkynyl$, $(CH_2)_{0-3}aryl$, $(CH_2)_{0-3}heterocyclyl$, $(CH_2)_{0-3}C_{3-7}cycloalkyl$, OH, $C_{1-6}alkyl-OH$, halo, $C_{1-6}alkyl-halo$, $OC_{1-6}alkyl$, $(CH_2)_{0-3}S(O)_{0-2}R^8$, SH, SO_3 , thioxo, NH_2 , CN, $(CH_2)_{0-3}NHSO_2R^8$, $(CH_2)_{0-3}COOH$, $(CH_2)_{0-3}-O-(CH_2)_{0-3}R^8$, $(CH_2)_{0-3}C(O)(CH_2)_{0-3}R^8$, $(CH_2)_{0-3}C(O)OR^8$, $(CH_2)_{0-3}C(O)NH_2$, $(CH_2)_{0-3}C(O)NH(CH_2)_{0-3}R^8$, $(CH_2)_{0-3}NH(CH_2)_{0-3}R^8$, $(CH_2)_{0-3}NHC(O)(CH_2)_{0-3}R^8$, $(CH_2)_{0-3}C(O)NHSO_2-R^8$ and $(CH_2)_{0-3}SO_2NHC(O)-R^8$ wherein an alkyl chain, cycloalkyl ring or heterocyclyl ring within R^7 is optionally substituted by one of more substituents independently selected from: $C_{1-4}alkyl$, OH, halo, CN, NH_2 , $N-C_{1-4}alkylamino$, N,N -di- $C_{1-4}alkylamino$ and $OC_{1-4}alkyl$;

R^8 is selected from hydrogen, $C_{1-6}alkyl$, aryl, heterocyclyl, $C_{3-7}cycloalkyl$, OH, $C_{1-6}alkyl-OH$, COOH, $C(O)OC_{1-6}alkyl$, $N(R^6)C_{1-6}alkyl$, $OC_{1-6}alkyl$, $C_{0-6}alkylOC(O)C_{1-6}alkyl$, $C(OH)(C_{1-6}alkyl)C_{1-6}alkyl$; wherein an alkyl chain or aryl, heterocyclyl or cycloalkyl ring within R^8 is optionally substituted by one of more substituents independently selected from: $C_{1-4}alkyl$, OH, halo, CN, NH_2 , $-NH-C_{1-4}alkyl$, $-N$ -di- $(C_{1-4}alkyl)$ and $OC_{1-4}alkyl$;

each **a** is independently 1, 2 or 3;

p is an integer between 0 and 3;

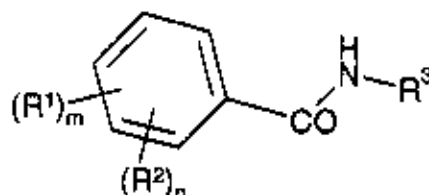
q is an integer between 0 and 3;

and **p + q** < 4.

- 5 provided that when **R**³ is 2-pyridyl and **X** is other than -Z-, -C(O)-Z-O-Z-,
-N((**R**⁶)-C(O)-Z-O-Z- or -O-Z-N(**R**⁶)-Z-, then **R**³ cannot be mono-substituted at the
5-position with an **R**⁷ group selected from COOH or C(O)OC₁₋₆alkyl.

2. A pharmaceutical composition comprising a compound of Formula (I) as claimed in
10 claim 1, or a salt, solvate or pro-drug thereof, together with a pharmaceutically-
acceptable diluent or carrier for use in the preparation of a medicament for use in the
treatment or prevention of a disease or medical condition mediated through GLK.

3. A compound of Formula (Ib) or a salt, solvate or pro-drug thereof



Formula (Ib)

wherein

m is 0, 1 or 2;

n is 1, 2 or 3;

- 20 and **n + m** is 2 or 3;

each **R**¹ is independently selected from OH, -(CH₂)₁₋₄OH, -CH₃₋₃F₃, -(CH₂)₁₋₄CH₃₋₂F₂,
-OCH₃₋₂F₂, halo, OCH₃, C₂H₅O, CH₃C(O)O-, C₁₋₆alkyl, C₂₋₆alkenyl, C₂₋₆
alkynyl, -NH-C₁₋₄alkyl, -N-di-(C₁₋₄alkyl), CN, formyl, phenyl or
heterocyclyl optionally substituted by C₁₋₆alkyl;

- 25 each **R**² is the group **Y-X-**

with the proviso that Y-X- cannot be CH₃O, C₂H₅O or CH₃C(O)O-;

wherein each **X** is a linker independently selected from:

-O-Z-, -O-Z-O-Z-, -C(O)O-Z-, -OC(O)-Z-, -S-Z-, -SO-Z-, -SO₂-Z-, -N(**R**⁶)-Z-,
-N(**R**⁶)SO₂-Z-, -SO₂N(**R**⁶)-Z-, -CH=CH-Z-, -C≡C-Z-, -N(**R**⁶)CO-Z-,

167
~~187~~

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

ASUNTO	Radicación	06-006399
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	5292
	Folios	8

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	PCT/ES2004/000346		
Fecha de Presentación Internal.	Julio 23 de 2004		

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- | | | | | |
|------|-------------------|---------------------------------------|-----------|-----------------------------|
| 1.1. | Descripción: | Folios: | 89 a 128 | como se radicó inicialmente |
| 1.2. | Reivindicaciones: | Folios: | 129 a 132 | como se radicó inicialmente |
| 1.3. | Prioridad: | ES P 00301781 del 28 de Julio de 2003 | | |

2. Objeto de la invención

- Título: "DIAMIDAS DE AMINOACIDOS EN POSICION NO α UTILES COMO ADYUDANTES PARA LA ADMINISTRACION DE AGENTES BIOLOGICOS ACTIVOS"

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

- Reivindicaciones 1 a 4: Diamidas de aminoácidos en posición no α de fórmula (1)
- Reivindicaciones 5 a 12: Composiciones farmacéuticas
- Reivindicaciones 13 a 14: Usos

El problema planteado en la presente solicitud es proveer nuevas Diamidas de aminoácidos en posición no α útiles como adyudantes para la administración de ingredientes activos biológicos.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona Diamidas de aminoácidos en posición no α de fórmula (1) y sus composiciones farmacéuticas.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 47/16 y A61K 47/12

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

Se recomienda no mencionar su uso en el título, ya que los mismos no son patentables; y si ajustarse a lo que se desea proteger.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1, no se encuentra definida de manera inequívoca el compuesto de fórmula (1), y la misma esta caracterizando un compuesto no solo por su estructura química sino por su uso; hacer la aclaración pertinente.
- La Reivindicaciones 5 y sus dependientes; estan reivindicando una combinación del compuesto de fórmula (1) con otros ingredientes activos; las mismas no se aceptan por no encontrarse soportadas de manera suficiente en el capítulo descriptivo.
- La Reivindicación 1: la palabra y/o expresión: "solos o asociados"; no es concisa; por tanto no permite delimitar la materia, allí a proteger.

Por lo anteriormente expuesto, es preciso que señale el alcance de su invención y realice las modificaciones pertinentes para emitir un concepto.

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

Las Reivindicaciones 13 a 14 reclaman Uso, y de acuerdo con la legislación Colombiana, el uso reclamado No se considera para protección por patente.

5. 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: Julio 28 de 2003

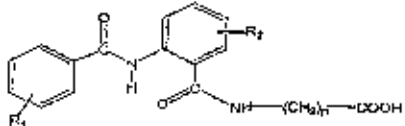
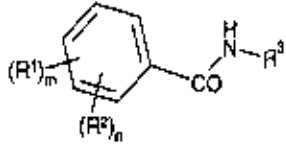
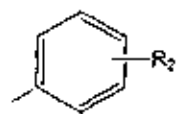
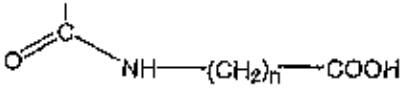
Teniendo en cuenta la fecha indicada se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud; aclarando, que esta búsqueda se realizo únicamente para aquellas partes que parecen ser claras y/o concisas:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 03/015774	COMPOUNDS EFFECTING GLUCOKINASE	Febrero 27 de 2003

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1 Novedad (artículo 16 D486)

- Reivindicación 1: Diamidas de aminoácidos en posición no α de fórmula (1)
- Reivindicación 5: Composiciones farmacéuticas

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 06-006399		D1 = WO 03/015774	
Diamidas de aminoácidos en posición no α de fórmula (1):		Un compuesto de fórmula (I):	
 $n = 2 \text{ a } 8$ (1)		 Formula (I)	
Donde:		Donde:	
R1= Halógeno, OH, solos o asociados		(R1)m= Halógeno, OH, opcionalmente sustituidos; siendo m= 1	
Hidrógeno		(R2)n= cuando n=0 R2 no existe. Por tanto corresponde a Hidrógeno	
		R3= Fenil, opcionalmente sustituido por 1 ó más grupos R7	
R2= Hidrógeno		Hidrógeno	
 $n = 2 \text{ a } 8$		R7= (CH2)0-3C(O)NH(CH2)0-3R8, en donde:	
Donde:		(CH2)0-3= cero (0)	
$n = 2 \text{ a } 8$		C(O)	
		NH	
		(CH2)0-3= dos ó tres (2 ó 3)	
		R8= COOH	
Composiciones Farmacéuticas		Págs. 142 a 144 del Documento	
		Composiciones Farmacéuticas	
		Pág. 144 del Documento	

Teniendo en cuenta el objeto de la invención, D1 ya divulga las Diamidas de aminoácidos bajo la fórmula (I) de la solicitud, tal como se expone en el cuadro comparativo. En consecuencia, los compuestos reclamados así como sus composiciones farmacéuticas que los contienen, no son nuevos.

7. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03/015774	1 a 12	Novedad

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
08 MAYO 2009

ORP

CONCEPTO TÉCNICO No. 841	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202080
--------------------------	---