

Clarke, Modet & C^o
COLOMBIA

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS
Intellectual Property

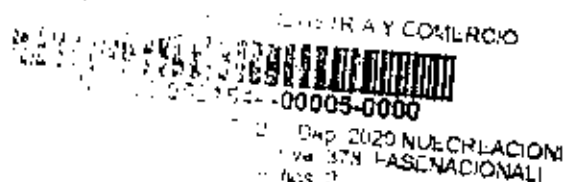
203
203

As. 2967/PCT.

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

E. S. D.

Ref.: Expediente No. 06-052.154
Solicitud de Patente a nombre de
Janssen Pharmaceutica N.V.

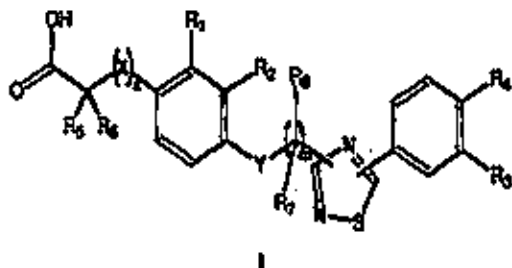
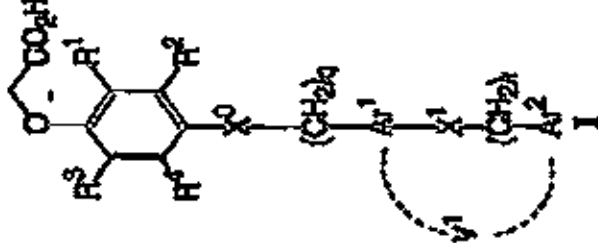
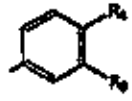


Yo, **JIMENA ESCOBAR URIBE**, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en Bogotá, en la Carrera 11 No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **Janssen Pharmaceutica N.V.**, con domicilio en Beerse, Bélgica, solicitante de la patente de la referencia, pido a usted que se proceda a examinar si la invención, cuya patente se tramita en el expediente de la referencia, es patentable.

Adjunto al presente memorial el recibo No. 08 - 17,590 de 27 de febrero de 2008, por la suma de \$420.000.00, con lo cual queda cubierta la tasa oficial correspondiente a dicho estudio.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C.39.779.452 de Usaquén
T.P. 68.228

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 08-052154	D1 = WO 03/084916
Un compuesto de fórmula (I): 	Un compuesto de fórmula (I): 
Donde:	Donde:
R5= Hidrógeno	Hidrógeno
R6= Hidrógeno	Hidrógeno
X= Oxígeno	Oxígeno
n= 1	
R1= Hidrógeno	R1= Hidrógeno
R2= Hidrógeno	R2= Hidrógeno
Hidrógeno	R3= Hidrógeno
Hidrógeno	R4= Hidrógeno
Y= Azufre (S)	X= Azufre (S)
R7= Hidrógeno	Hidrógeno
R8= Hidrógeno	Hidrógeno
m= 1	q= 1
	Ar1= Heteroarilo
	V1= esta ausente
	X1= esta ausente
	(CH2)r= no existe, cuando r=0
	Ar2= Anillo opcionalmente sustituido
	Págs. 236 y 237 del Documento
Composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I)	Composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I)
	Pág. 242 del Documento

Teniendo en cuenta el objeto de la invención y la materia descrita en la anterioridad D1, esta dependencia se permite señalar que existe afectación al requisito de Novedad para la reivindicación independiente 1 y sus dependientes y la reivindicación 32 y sus dependientes; ya que no son nuevos los compuestos de fórmula (I) de la solicitud ni sus composiciones farmacéuticas.

7. Conclusión:

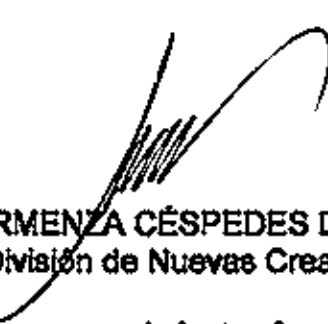
Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03/084916	1 a 40	Novedad

214 214

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 CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
28 AGO. 2009

 **CONCEPTO TÉCNICO No. 2715**

EXAMINADOR TÉCNICO
Código No. 202080

204
204

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-052154-00005-0000

RECIBO DE PAGO DE MULTAS Y PENAS - Dec 2020 NUEVE CLASIFICACIONES
NIVEL 378 PASSE NACIONAL
NIVEL 378 PASSE NACIONAL

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 17,590
FECHA : FEBRERO 27 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PASO	BANCO	CUENTA	No. PASO	FECHA PASO	Vr. PASO
CLARKE MODET Y CO. COLOMBIA	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	662754297	2661312	27/02/2008	25,070,000.00

***** C O N C L U S O *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	420,000.00
	TOTAL :	\$ 420,000.00

SOM: CUATROCIENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 08-52154

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 580 DE

FECHA 28 DE SEPTIEMBRE DE 2007 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL 27 DE DICIEMBRE 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



INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(43) International Publication Date
16 October 2003 (16.10.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/084916 A2

(31) International Patent Classification: C07C 597/20,
317/22, 323/19, C07D 209/10, 213/20, 213/32, 261/08,
311/58, 405/12, 413/12, A61K 31/19, A61P 3/06, 9/10

(21) International Application Number: PCT/IB03/01121

(22) International Filing Date: 24 March 2003 (24.03.2003)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data
60/370,503 5 April 2002 (05.04.2002) US
60/386,026 5 June 2002 (05.06.2002) US

(71) Applicant (for all designated States except US):
WARNER-LAMBERT COMPANY LLC [US/US];
201 Tabor Road, Morris Plains, NJ 07950 (US).

(72) Inventors: and

(75) Inventors/Applicants (for US only): FILZEN, Gary,
Frederick [US/US]; Pfizer Global Research and Development,
Ann Arbor Laboratories, 2800 Plymouth Road,
Ann Arbor, MI 48105 (US). TRIVEDI, Bharat, Kalidas
[US/US]; Pfizer Global Research and Development, Ann
Arbor Laboratories, 2800 Plymouth Road, Ann Arbor,
MI 48105 (US). GEYER, Andrew, George [US/US];
Pfizer Global Research and Development, Ann Arbor
Laboratories, 2800 Plymouth Road, Ann Arbor, MI 48105
(US). UNANGST, Paul, Charles [US/US]; Pfizer Global
Research and Development, Ann Arbor Laboratories, 2800
Plymouth Road, Ann Arbor, MI 48105 (US). BRATTON,

Larry, Don [US/US]; Pfizer Global Research and Development,
Ann Arbor Laboratories, 2800 Plymouth Road,
Ann Arbor, MI 48105 (US). AUERBACH, Bruce, Jeffrey
[US/US]; Pfizer Global Research and Development, Ann
Arbor Laboratories, 2800 Plymouth Road, Ann Arbor, MI
48105 (US).

(74) Agent: LUMB, J., Trevor; Pfizer Inc., 201 Tabor Road,
Morris Plains, NJ 07950 (US).

(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, GR,
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,
SK, SI, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, 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, EG, KZ, MD, RU, TJ, TM).
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR). OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— without international search report and to be republished
upon receipt of that report

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

(84) Title: COMPOUNDS THAT MODULATE PPAR ACTIVITY AND METHODS FOR THEIR PREPARATION

(57) Abstract: This invention discloses compounds that alter PPAR activity. The invention also discloses pharmaceutically acceptable salts of the compounds, pharmaceutically acceptable compositions comprising the compounds or their salts, and methods of using them as therapeutic agents for treating or preventing hyperlipidemia, hypercholesterolemia, obesity, eating disorders, hypoglycemia, atherosclerosis, hypertriglyceridemia, hyperinsulinemia and diabetes in a mammal as well as methods of suppressing appetite and modulating leptin levels in a mammal. The present invention also discloses methods for making the disclosed compounds.

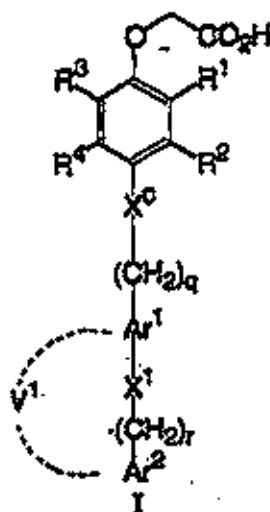
WO 03/084916 A2

207
207

-236-

What is claimed is:

1. A compound of formula (I):



and pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein:

X^0 and X^1 are independently absent, O, S, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{S}(\text{O})_2-$, or $-\text{S}(\text{O})-$;

Ar^1 and Ar^2 are each independently unsubstituted or substituted aryl or heteroaryl, provided that Ar^1 is not thiazolyl or oxazolyl;

$(\text{CH}_2)_q$ is absent; or when present, $(\text{CH}_2)_q$ is a saturated or unsaturated hydrocarbon chain which is substituted or unsubstituted, wherein said chain has from

1 to 4 atoms so that $(\text{CH}_2)_q$, Ar^1 , X^1 , $(\text{CH}_2)_r$ and Ar^2 , together form a five to eight membered ring;

R^1 and R^2 are selected from hydrogen, lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $\text{O}-(\text{CH}_2)_m\text{CF}_3$, halogen, nitro, cyano, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{alkyl}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{aryl}$, $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^3$, $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^6\text{R}^7$, $-\text{COR}^5$, $-\text{CO}_2\text{R}^5$, or $-\text{NR}^6\text{R}^7$, or together with the atoms to which they are attached form a five to eight member ring;

R^3 and R^4 are selected from hydrogen, lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $\text{O}-(\text{CH}_2)_m\text{CF}_3$, halogen, nitro, cyano, $-\text{OH}$, $-\text{SH}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{alkyl}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{aryl}$, $-(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$, $-(\text{CH}_2)_m\text{NR}^6\text{R}^7$, $-\text{COR}^5$, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{CO}_2\text{R}^5$, or $-\text{NR}^6\text{R}^7$;

-237-

provided that at least one of R_1 - R_4 is H, lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $O-(CH_2)_mCF_3$, halogen, nitro, cyano, $-OH$, $-SH$, $-CF_3$, $-S(O)_palkyl$, $S(O)_paryl$, $-(CH_2)_mOR^5$, $-(CH_2)_mNR^6R^7$, or NR^6R^7 ;

R^5 is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, or aryl;

R^6 and R^7 are each independently hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, $-COalkyl$, $-COaryl$, cycloalkyl, $-CO_2alkyl$, $-CO_2aryl$, or R^6 and R^7 together with the atoms to which they are attached form a 4 to 7 membered ring having 1 to 3 heteroatoms;

m is 0 to 5;

p is 0, 1, or 2;

q is 0 to 6; and

r is 0 to 6.

2. The compound of claim 1, wherein

X^0 is S;

X^1 is absent;

Ar^1 and Ar^2 are each independently unsubstituted or substituted aryl;

Ar^3 is absent;

R^1 is hydrogen;

R^2 is lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $O-(CH_2)_mCF_3$, halogen, nitro, cyano, $-OH$, $-SH$, $-CF_3$, $-S(O)_palkyl$, $S(O)_paryl$, $-(CH_2)_mOR^5$, $-(CH_2)_mNR^6R^7$, $-COR^5$, $-CO_2R^5$, or $-NR^6R^7$;

R^3 is lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $O-(CH_2)_mCF_3$, halogen, nitro, cyano, $-OH$, $-SH$, $-CF_3$, $-S(O)_palkyl$, $S(O)_paryl$, $-(CH_2)_mOR^5$, $-(CH_2)_mNR^6R^7$, $-COR^5$, $-CO_2H$, $-CO_2R^5$, or $-NR^6R^7$;

R^4 is hydrogen, lower alkyl, lower alkoxy, haloalkyl, $O-(CH_2)_mCF_3$, halogen, nitro, cyano, $-OH$, $-SH$, $-CF_3$, $-S(O)_palkyl$, $S(O)_paryl$, $-(CH_2)_mOR^5$, $-(CH_2)_mNR^6R^7$, $-COR^5$, $-CO_2H$, $-CO_2R^5$, or $-NR^6R^7$;

R^5 is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, or aryl;

R^6 and R^7 are each independently hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, $-COalkyl$, $-COaryl$, cycloalkyl, $-CO_2alkyl$, $-CO_2aryl$, or R^6 and R^7 together with the atoms to which they are attached form a 4 to 7 membered ring having 1 to 3 heteroatoms;

m is 0 to 5;

p is 0, 1, or 2;

q is 1; and

r is 0.

3. The compound of claim 1, wherein

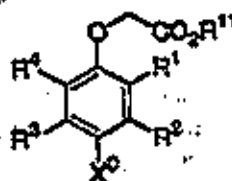
X^0 is S;

X^1 is absent;

209
209

-242-

8. A pharmaceutical composition comprising a compound of Claim 1 admixed with a carrier, diluent, or excipient.
- 5 9. A method of treating, preventing or controlling non-insulin dependent diabetes mellitus in a mammal comprising administering to the mammal in need thereof a therapeutically effective amount of a compound of Claim 1.
- 10 10. A method of treating, preventing or controlling obesity in a mammal comprising administering to the mammal in need thereof a therapeutically effective amount of a compound of Claim 1.
11. A method of modulating leptin levels in a mammal comprising administering to the mammal in need thereof a therapeutically effective amount of a compound of Claim 1.
- 15 12. A method of treating, preventing or controlling dyslipidemia in a mammal comprising administering to the mammal in need thereof a therapeutically effective amount of a compound of Claim 1.
- 20 13. A method of treating, preventing or controlling hypercholesterolemia in a mammal comprising administering to the mammal in need thereof a therapeutically effective amount of a compound of Claim 1.
- 25 14. A method of making a compound of claim 1 or a pharmaceutically acceptable salt thereof, comprising, reacting:



with:



30 wherein:

210 210

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
JIMENA ESCOBAR URIBE

ASUNTO	Radicación	08-052154
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	3956
	Folios	9

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/US2004/036028

Fecha de Presentación Interna. Octubre 28 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: 07 a 168 como se radicó inicialmente

1.2. Reivindicaciones: Folios: 169 a 178 como se radicó inicialmente

1.3. Prioridad: US No. 60/516,561 del 31 de Octubre de 2003

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "DERIVADOS DE ACIDOS FENOXIACETICOS UTILES
COMO AGONISTAS DOBLES DE RECEPTOR
ACTIVADO POR PROLIFERADOR DE PEROXISOMA".

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

- Reivindicaciones 1 a 31: Compuesto de fórmula (I)

- Reivindicaciones 32 a 40: Composición farmacéutica, del Compuesto de fórmula (I)
- Reivindicaciones 41 a 45: Método de tratamiento

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de proveer compuestos de ácidos 4-(-(fenoxialquil)tio)-fenoxiacéticos y análogos; los cuales son agonistas de PPAR delta potentes.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio presenta un compuesto de fórmula (I) y su composición farmacéutica.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasifica de acuerdo con la IPC: A61K 31/433

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

Se recomienda no mencionar el uso en el título, ya que éste no es patentable; ajustar el título a lo que se desea proteger a través del capítulo reivindicatorio.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1; no es concisa, porque los radicales tienen muchos significados y sustituciones; solicitando un número demasiado grande de compuestos posibles reclamados bajo la característica esencial de la fórmula (I); Los radicales que están soportados en los ejemplos son:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R5	Hidrógeno y CH3
R6	Hidrógeno y CH3
R5 y R6	Juntos forman un espiro-cicloalquilo de C5
X	Oxígeno
n	1
R1	Hidrógeno y CH3
R2	Hidrógeno
Y	Azúfre y Oxígeno
R7	Hidrógeno
R8	Hidrógeno
m	1
R3	Hidrógeno, Cloro, CH3 y Flúor
R4	CH3, C4H9 y Cloro

- La Reivindicación 10; esta ampliando materia, ya que dice que R1 puede estar sustituido; lo cual no corresponde a lo definido en la reivindicación independiente 1. La misma no se acepta.