

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 3F
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

214
ZHS

Teléfono: (57-1) 347 3611
Teléfono: (57-1) 347 3611

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-067772-00005-0000

Fecha: 2008-07-16 17:04:27
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 538 PETICION

Dep. 2020 NUECREACIONE
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 2

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

Trámite : 011 Evento : 378 Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 06067772
Asunto : Solicitud de patente para 4 ARIL PIPERIDINAS
Solicitante : H. LUNDBECK A/S
Publicada en : La Gaceta No. 587 del 18 de enero de 2008

SOLICITUD EXAMEN DE PATENTABILIDAD

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado de la sociedad H. LUNDBECK A/S, atentamente solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia presentada de acuerdo con las reglas del Capítulo I del PCT y según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo No. 08-46,132 por valor de \$420.000.00 que corresponde a la tasa legal fijada para el efecto.

2. Por lo anterior, comedidamente solicito se prosiga con el trámite de este asunto.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

04 COLO-03003-841-052-5
SCT\SCT\ID-130629\WPCL3003
No. M-2008-130629\SCT

[illegible]

Fecha: 2008-07-16 17:04:27 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 2

NET : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE EMBA : 08 - 44,132
: JUNIO 9 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	VR. PAGO
CARTELERA	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2670328	09/04/2008	89.445.000.00

***** C O N C E P T D *****

	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	SUJECION DE SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN
		TOTAL :
		\$ 420,000.00
		\$ 420,000.00

SUM: CONTRAVENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSE

RECIBO DE DATA INGRESADO AL EXPEDIENTE No.

020 0203-891-052-5



US 20030144261A1

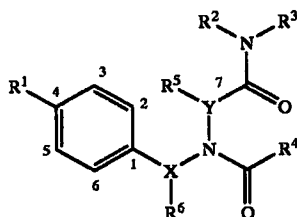
216
216(19) **United States**(12) **Patent Application Publication** (10) **Pub. No.: US 2003/0144261 A1**
Palani et al. (43) **Pub. Date: Jul. 31, 2003**(54) **MCH ANTAGONISTS FOR THE
TREATMENT OF OBESITY****Publication Classification**(75) **Inventors:** Anandan Palani, Bridgewater, NJ
(US); Sherry A. Shapiro, Belford, NJ
(US); Mark D. McBriar, Stewartsville,
NJ (US); Jing Su, Scotch Plains, NJ
(US)(51) **Int. Cl.⁷** A61K 31/397; A61K 31/55;
A61K 31/495; A61K 31/445;
A61K 31/40; A61K 31/165
(52) **U.S. Cl.** 514/210.01; 514/217.12; 514/252.12;
514/317; 514/408; 514/616;
540/609; 544/403; 546/233;
548/567; 564/155; 548/950**Correspondence Address:****SCHERING-PLOUGH CORPORATION
PATENT DEPARTMENT (K-6-1, 1990)
2000 GALLOPING HILL ROAD
KENILWORTH, NJ 07033-0530 (US)**(57) **ABSTRACT**(73) **Assignee:** Schering Corporation(21) **Appl. No.:** 10/278,468(22) **Filed:** Oct. 23, 2002**Related U.S. Application Data**(60) **Provisional application No. 60/343,065, filed on Oct.
25, 2001.**

The present invention discloses compounds, which are novel antagonists for melanin-concentrating hormone (MCH), as well as methods for preparing such compounds. In another embodiment, the invention discloses pharmaceutical compositions comprising such MCH antagonists as well as methods of using them to treat obesity, metabolic disorders, eating disorders such as hyperphagia, and diabetes.

[0265] While the present invention has been described in conjunction with the specific embodiments set forth above, many alternatives, modifications and other variations thereof will be apparent to those of ordinary skill in the art. All such alternatives, modifications and variations are intended to fall with the spirit and scope of the present invention.

What is claimed:

1. A compound of formula I:



formula I

or a pharmaceutically acceptable salt or solvate of said compound, wherein:

X is a single bond, —C—, —CH— or alkylene, and when X is a single bond, R⁶ is absent and the carbon atom marked 1 is directly attached to N of N—Y;

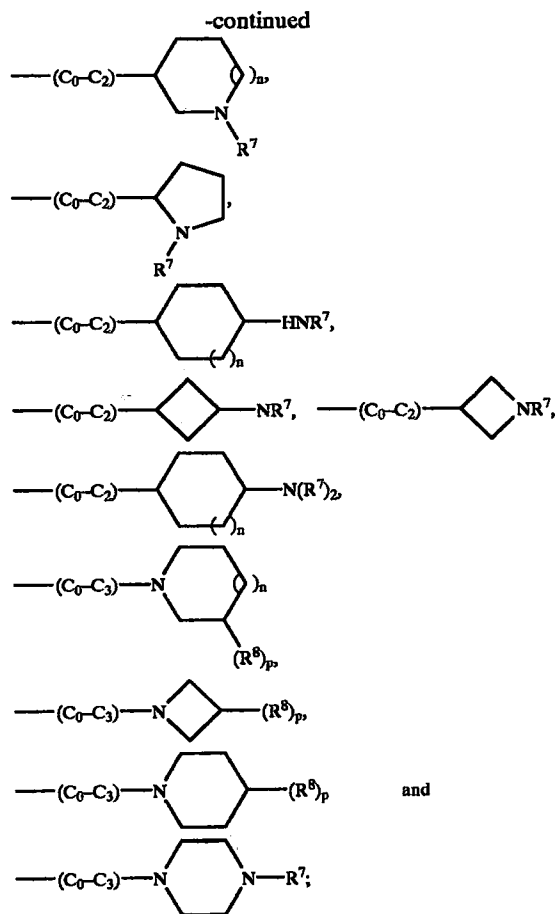
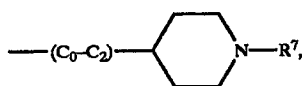
Y is a single bond, —C—, —CH— or alkylene, and when Y is a single bond, R⁵ is absent and the carbon atom marked 7 is directly attached to N of N—X;

R¹ is aryl or heteroaryl, wherein each of said aryl or heteroaryl can be unsubstituted or optionally independently substituted with one or more moieties which can be the same or different, each moiety being independently selected from the group consisting of CN, CF₃, halogen, alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, haloalkyl, haloalkoxy, alkoxy and OH;

R² is H, alkyl, aryl or aralkyl wherein each of said aryl, or aralkyl can be unsubstituted or optionally independently substituted with one or more moieties which can be the same or different, each moiety being independently selected from the group consisting of halogen, alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, haloalkyl, haloalkoxy, alkoxy and OH;

R³ is H, alkyl, aryl or aralkyl wherein each of said aryl or aralkyl can be unsubstituted or optionally independently substituted with one or more moieties which can be the same or different, each moiety being independently selected from the group consisting of CF₃, halogen, alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, haloalkyl, haloalkoxy, alkoxy and OH;

R⁴ is selected from the group consisting of -alkylene-N(R⁷)₂, —N(H)alkylene-N(R⁷)₂, —O-alkylene-N(R⁷)₂,



wherein each R⁷ in said —N(R⁷)₂, can be the same or different each R⁷ is H, alkyl, cycloalkyl or aryl, wherein each of said alkyl, aryl or cycloalkyl can be unsubstituted or optionally independently substituted with one or more moieties which can be the same or different, each moiety being independently selected from the group consisting of halogen, alkyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, haloalkyl, haloalkoxy, alkoxy and OH; or each R⁷ can be joined together and with the nitrogen to which they are attached to form a 3 to 7-membered heterocyclcyl ring;

n is 0 or 1;

p is 0 to 5 and when p is >1, the number of p moieties can be the same or different;

R⁵ is H or 1 or 2 substituents independently selected from alkyl or cycloalkyl;

R⁶ is H or 1 or 2 substituents independently selected from alkyl or cycloalkyl; and

R⁸ is H, OH, alkoxy, alkyl, cycloalkyl, aryl, —N(H)R⁷, —N(H)C(O)alkyl, —N(H)C(O)aryl, —N(H)C(O)N(H)alkyl, —N(H)C(O)N(H)aryl, —N(H)S(O₂)alkyl or —N(H)S(O₂)aryl;

with the proviso that the carbons shown marked 1 and 6 on the aromatic ring, along with X—R⁶, can optionally form a 4 to 8 membered ring system.

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
Emilio Ferrero
Apoderado

ASUNTO

Radicación 06 67772
Trámite 002
Evento 001
Actuación 430
Oficio 10867
Folios 005

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/US2005/01131
Fecha de Presentación Internal. 13/01/2005

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 73 - 145
1.2. Reivindicaciones: Folios 206 - 211
1.3. Prioridad: Presentada en Estados Unidos el 14.01.04, bajo el número 10/757962

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "4-aril piperidinas".

Según las reivindicaciones 1-31 se refiere a derivados de 4-aril piperidinas de fórmula (I), una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, así como

composiciones farmacéuticas que los contienen. Los compuestos son antagonistas MCH-1 y son activos en el tratamiento de la obesidad.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de más compuestos que sean antagonistas MCH

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona los compuestos de la presente solicitud que son antagonistas MCH-1 en el tratamiento de la obesidad.

- Clasificación Internacional de Patentes A 61K31/445

3. Determinación del Estado de la Técnica

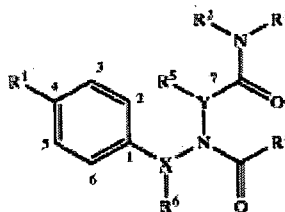
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 14.01.04, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US 20030144261	"Antagonistas MCH para el tratamiento de la obesidad"	31.07.03

4. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

4.1. Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

- La publicación US 20030144261 enseña compuestos antagonistas de



MCH de fórmula (I), y composiciones farmacéuticas que los contienen, se dice que los compuestos son adecuados en el tratamiento de la obesidad y ansiedad.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proporcionar compuestos derivados de aminoácidos que son activos como antagonistas MCH, es una derivación evidente del estado de la técnica, debido a que un técnico medio estaría en capacidad de tomar las enseñanzas de D1 y, a partir de éstas, modificar los compuestos allí revelados para llegar a los compuestos de la presente solicitud con la expectativa de que también fueran antagonistas MCH.

Finalmente, no se evidencia un efecto mejorado o sorprendente de los compuestos de la presente solicitud en comparación con lo conocido en el estado de la técnica.

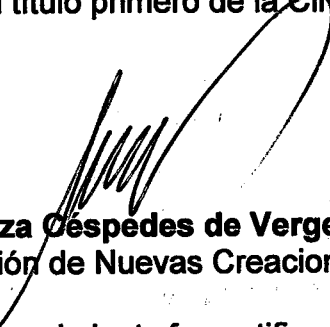
5. Conclusión:

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	US 20030144261	1-31	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

25 SET. 2009

CONCEPTO TECNICO No. 3291	EXAMINADOR TECNICO Código No.202024
-------------------------------------	---