

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI

CARRERA /

BOGOTÁ

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Teléfono: (57-1) 347 3611

Telefax: (57-1) 211 8650

700 4814

75 7743

Señora Directora

DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E.

S.

D.



No. 06-083419- -00010-0000

Fecha: 2010-09-07 17:05:02 Dep. 2020 DIR NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 11

Trámite : 011

Evento : 378

Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 06083419
Asunto : Solicitud de patente para: "DERIVADOS DE
ARIL Y DE HETEROARIL-PIPERIDINCARBOXYLATES,
SU PREPARACION Y SU APLICACION COMO
INHIBIDORES DE LA ENZIMA FAHH".
Solicitante : SANOFI-AVENTIS
Fecha de solicitud: Agosto 23 de 2006.

1. Yo, Luz Clemencia de PAÉZ, mayor de edad, domiciliada en Bogotá, D.C., identificada con la Cédula de ciudadanía N° 35.456.344 de Usaquén, obrando como apoderada del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 5556 notificado por fijación en lista del 30 de Abril de 2010. Mediante memorial radicado el 27 de julio de 2010 solicité un plazo de treinta (30) días para dar respuesta a este oficio.

2. Mediante el Oficio No. 5556 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:

- "Los sustituyentes de las fromulas (I) y (IV) generan una gran cantidad de compuestos que no corresponden a la invención de acuerdo a lo sustentado en la descripción. Los hidratos y solvatos de estos compuestos tampoco están sustentados".
- "Se requiere que el solicitante limite los compuestos de formula (I) y (IV) solicitados acorde con los compuestos que

CAVELIER

ABOGADOS

138
136

evidentemente correspondan a la invención y demuestren tener la actividad mencionada en la descripción. Es importante resaltar, que si bien el solicitante puede solicitar protección para una generalización de las modalidades preferidas y/o ejemplos, esta generalización debe ser razonable y paralela con el objeto de la invención y con lo que se encuentre sustentado en la descripción".

- "Las reivindicaciones 9 y 10 indican el uso de compuestos de formula (I), lo cual no se considera como invención y por lo tanto no es patentable".

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 5 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:

- Se ha revisado nuevamente la redacción del capítulo reivindicatorio, de acuerdo con las sugerencias del Señor Examinador, con el fin de hacer claridad sobre la materia que se solicita proteger y sobre el alcance de la misma.
- En particular, la reivindicación 1 ha sido redactada nuevamente limitando significativamente las definiciones de los sustituyentes R1, [A]p, R2, R3, R4 respectivamente con base en las definiciones encontradas en el capítulo descriptivo, de forma tal que los compuestos resultantes son estructuralmente similares entre si y se encuentran debidamente sustentados en la presente solicitud, tal y como fue inicialmente presentada.
- De otro lado, las reivindicaciones 9-10 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio, de tal manera que las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas.

Así entonces, con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio, es claro que quedan subsanadas las objeciones que por claridad hizo su Despacho, ya que ahora, dicho pliego reivindica compuestos de formula (I) estructuralmente similares entre sí y adicionalmente permite determinar el alcance de la protección reivindicada y compararla frente al estado del arte, de acuerdo con las disposiciones del artículo 30 de la Decisión 486. 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

CAVELIER

ABOGADOS

139
138

la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

De otro lado, mi representada desea presentar anexo al presente memorial datos farmacológicos adicionales en los cuales se observan los valores de IC50 de un compuesto de formula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde $n+m = 3$, es decir, un compuesto de formula (I) con una anillo pirrolidina en su estructura.

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 5 reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.
- Datos farmacológicos.

Señora Directora,

Luz Clemencia Suárez
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

C.C. N° 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. No. 23.555

COLO-14775-841-020-2
MGM\MGM\ID-177835\WPC14775
No. M-2010-177835\MGM

166



Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE:	
	☐ Corrección de Error Material	☒ Modificación a una solicitud
2	SOLICITANTE Nombre: SANOFI-AVENTIS Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Francia. Dirección: 174 Avenue de France, Paris 75013, Francia Domicilio: Paris, Francia Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3	REPONENTANTE O APODERADO Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@cavelier.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual: _____ Número <u>35.456.344</u> T. P. <u>23.555</u>
4	Número de expediente: <u>06.083.419</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 5 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 \$114.000, por concepto de modificaciones. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	

189 141

8

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

FIRMA: *Luz Clemencia Gómez*

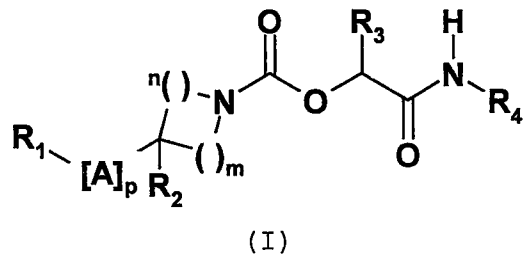
C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P.A. 23.555

MGM

147
140

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



Seleccionado de la siguiente lista de compuestos:

n°	R ₁	[A] _p	R ₂	n	m	R ₃	R ₄
1.	fenilo	enlace	H	2	2	H	H
2.	fenilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
3.	3-CF ₃ -fenilo	enlace	H	2	2	H	H
4.	3-CF ₃ -fenilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
5.	5-iso-butil-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
6.	6-iso-butil-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
7.	6-ciclopentil-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
8.	5-(4-F-fenil)-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
9.	6-(4-F-fenil)-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
10.	6-(4-Cl-fenil)-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
11.	5-(4-CF ₃ -fenil)-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
12.	6-(4-CF ₃ -fenil)-piridin-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
13.	5-(3-CF ₃ -fenil)-1-metil-pirazol-3-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
14.	4-fenil-imidazol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
15.	5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	H
16.	5-fenil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
17.	5-(4-F-fenil)-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	H
18.	5-(4-F-fenil)-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃

143
A1

n°	R_1	$[A]_p$	R_2	n	m	R_3	R_4
19.	5-(3-CF ₃ -fenil)-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	H
20.	5-(3-CF ₃ -fenil)-1,3,4-oxadiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
21.	3-(3-CF ₃ -fenil)-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	enlace	H	2	2	H	H
22.	3-(3-CF ₃ -fenil)-1,2,4-oxadiazol-5-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
23.	benzoxazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
24.	benzotiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	H
25.	benzotiazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
26.	bencimidazol-2-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
27.	bencimidazol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	H
28.	2-fenil-bencimidazol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
29.	benzotriazol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	-CH ₃
30.	5-CF ₃ -benzotriazol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	H
31.	indol-1-ilo	enlace	H	2	2	H	H
32.	4-Br-fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
33.	4-(4-F-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
34.	4-(4-Cl-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
35.	4-(4-CH ₃ -fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
36.	4-(4-n-butil-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
37.	4-(4-CF ₃ -fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
38.	4-(4-CH ₃ O-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
39.	4-(4-C ₂ H ₅ O-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
40.	4-(3-Cl,4-Cl-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
41.	4-(3-F,4-CH ₃ O-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
42.	4-(3-Cl,4-F-fenil) fenilo	enlace	OH	2	2	H	-CH ₃
43.	naftalen-2-ilo	CH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
44.	4-fenil-fenilo	CH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
45.	6-ciclopentil-piridin-2-ilo	CH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
46.	6-(4-F-fenil)-piridin-2-ilo	CH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
47.	indol-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
48.	indolin-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
49.	1,2,3,4-tetrahydroquinolin-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
50.	1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-	CH ₂	H	2	2	H	H

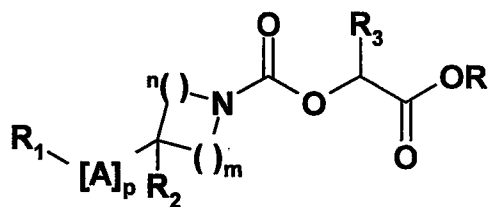
144
142

n°	R ₁	[A] _p	R ₂	n	m	R ₃	R ₄
	2-ilo						
51.	pirrolo[2,3-b]piridin-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
52.	bencimidazol-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
53.	4-fenilimidazol-1-ilo	CH ₂	H	2	2	H	H
54.	fenilo	(CH ₂) ₂	H	1	2	H	-CH ₃
55.	4-F-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
56.	3-Cl-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
57.	4-Cl-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
58.	3-CF ₃ -fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
59.	4-CF ₃ -fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
60.	3-CN-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
61.	4-CH ₃ -fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
62.	4-CH ₃ -fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
63.	4-CH ₃ O-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
64.	4-CH ₃ O-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
65.	2-fenil-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
66.	3-fenil-fenilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
67.	naftalen-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
68.	naftalen-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
69.	pirimidin-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
70.	pirimidin-5-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
71.	6-ciclopentil-piridin-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
72.	6-pirrolidin-1-ilpiridin-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
73.	tiazol-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
74.	isoquinolin-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃
75.	1,2,3,4-tetrahydroquinolin-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
76.	1,2,3,4-tetrahydroisoquinolin-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
77.	indol-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
78.	indolin-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
79.	pirrolo[2,3-b]piridin-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
80.	bencimidazol-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
81.	4-fenilimidazol-1-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	H
82.	3-Cl-fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
83.	4-Cl-fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
84.	3-CF ₃ -fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
85.	4-CF ₃ -fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
86.	3-CN-fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
87.	2-fenil-fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃

145
143

n°	R ₁	[A] _p	R ₂	n	m	R ₃	R ₄
88.	3-fenil-fenilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
89.	naftalen-1-ilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
90.	naftalen-2-ilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
91.	pirimidin-2-ilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
92.	pirimidin-5-ilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
93.	tiazol-2-ilo	(CH ₂) ₃	H	2	2	H	-CH ₃
94.	3-Cl-fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
95.	4-Cl-fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
96.	3-CF ₃ -fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
97.	4-CF ₃ -fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
98.	3-CN-fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
99.	2-fenil-fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
100.	3-fenil-fenilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
101.	naftalen-1-ilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
102.	naftalen-2-ilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
103.	pirimidin-2-ilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
104.	pirimidin-5-ilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
105.	tiazol-2-ilo	C≡C	H	2	2	H	-CH ₃
106.	3-Cl-fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
107.	4-Cl-fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
108.	3-CF ₃ -fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
109.	4-CF ₃ -fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
110.	3-CN-fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
111.	2-fenil-fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
112.	3-fenil-fenilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
113.	naftalen-1-ilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
114.	naftalen-2-ilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
115.	pirimidin-2-ilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
116.	pirimidin-5-ilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
117.	tiazol-2-ilo	C≡CCH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
118.	6-pirrolidin-1-ilpiridin-2-ilo	CH ₂	H	2	2	H	-CH ₃
119.	6-(1-isopropilpiperidin-4-il)piridin-2-ilo	(CH ₂) ₂	H	2	2	H	-CH ₃

2. Proceso de preparación de un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, que comprende la etapa que consiste en transformar el carbamato-éster de fórmula general (IV)

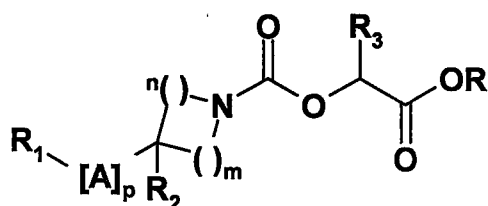


(IV)

en la que R_1 , A, R_2 , R_3 , p, m y n son tales como se han definido en la reivindicación 1 y R representa un grupo metilo o etilo,

por aminolisis mediante una amina de fórmula general $R_4\text{NH}_2$ en la que R_4 es tal como se ha definido en la reivindicación 1.

3. Compuesto que responde a la fórmula general (IV),



(IV)

en la que R_1 , A, R_2 , R_3 , p, m y n son tales como se han definido en la reivindicación 1 y R representa un grupo metilo o etilo.

4. Composición farmacéutica que contiene al menos un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en forma de base, de sal, de hidrato o de solvato aceptable desde un punto de vista farmacéutico y opcionalmente uno o varios excipientes aceptables desde un punto de vista farmacéutico.

5. Compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en forma de base, de sal, de hidrato o de solvato aceptable desde un punto de vista farmacéutico, para su utilización como medicamento.

MGM\MGM\ID-177837\WPC14775

PHARMACOLOGIC DATA

The inhibitory activity has been demonstrated using a radio-enzymatic test based on the measure of the hydrolysis product of the anandamide [ethanolamine 1-³H] by the FAAH (*Life Sciences* (1995), 56, 1999-2005 and *Journal of Biochemical and Biophysical Methods* (2004), 60(2), 171-177). During this test, the brains (except the cerebellum) of mice are removed and kept at a temperature of -80°C. The membranous homogenates are prepared extemporaneously through homogenization of the tissues with a device called Precellys® in the reaction buffer (Tris-HCl 10mM pH=8, NaCl 150mM and ethylenediaminetetraacetic acid (EDTA) 1mM). The enzymatic reaction is carried out in Multiscreen 96-well filter plates in a final volume of 70µl. A reaction buffer supplemented with bovine serum albumin without fatty acids (BSA, 1mg/ml) is used for the enzymatic reaction and the dilution of the compounds and of the anandamide [ethanolamine 1-³H]. The reaction buffer comprising BSA (43µl/well), the diluted compounds tested at various concentrations (7µl/well comprising 1% of DMSO) and the membranous preparation (10µl/well, i.e. 200µg of tissue by trial) are successively added in the wells. After 20 minutes of preincubation of the compounds with the enzyme at a temperature of 25°C, the reaction is started by the addition of anandamide [ethanolamine 1-³H] (specific activity of 15-20Ci/mmol) diluted with cold anandamide (10µl/well, final concentration of 10µM, 0.01µCi by trial). After 20 minutes of incubation at 25°C, the enzymatic reaction is stopped by addition of a solution of activated carbon 5M prepared in a buffer NaCl 1.5M and Hcl 0.5M (50µl/well). The mixture is stirred for 10 minutes, and then the aqueous phase comprising the ethanolamine [1-³H] is collected through vacuum filtration and counted using liquid scintillation.

In these conditions, the compound No. 40 (m+n=4) has a IC₅₀ of 0.098µM and the compound No. 54 (m+n=3) has a IC₅₀ of 3.59µM.

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

Radicación No. 06 83419

Clasificación Internacional (IPC): C07D 471/04, A61K 31/4523, A61P 25/24

Concepto Técnico No. 121

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☐	Cap. I	☒
		Cap. II	☐

No. Sol. Internacional

PCT/FR2005/000453

Fecha de Presentación Internacional

25/02/2005

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

Descripción: Folios 86 a 114 modificado.

Reivindicaciones: Folios 142 a 146 modificado según respuesta del solicitante.

Prioridad: Folio 1 FR 0401950 del 26/02/2004

Respuesta del solicitante: Folios 122 a 147.

2. Objeto de la invención

Título: DERIVADOS DE ARIL Y DE HETEROARIL-PIPERIDINCARBOXILATOS, SU PREPARACION Y SU APLICACIÓN COMO INHIBIDORES DE LA ENZIMA FAAH.

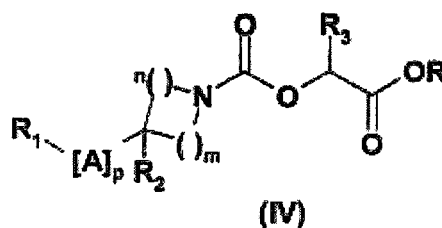
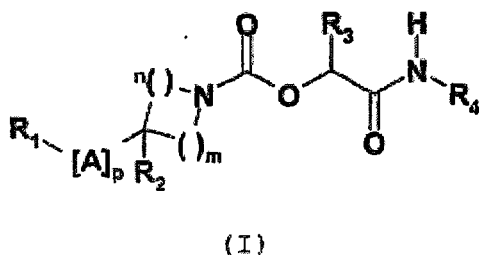
Objeto: La solicitud consiste en nuevos piperidin-1-carboxilato de fórmula general (I) con actividad inhibitoria de la enzima FAAH, sus procesos de obtención y sus composiciones farmacéuticas.

El problema planteado es proveer nuevos compuestos inhibidores de la enzima FAAH con mejores propiedades de potencia y selectividad con respecto a los ya conocidos.

Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona nuevos compuestos derivados de piperidin-1-carboxilato de fórmula general (I), sus procesos de obtención y sus composiciones farmacéuticas.

EXP 2006 083419

Reivindicaciones 1 y 5: Compuestos de fórmula general (I).



Reivindicación 2: Un proceso para obtener compuestos de fórmula (I)

Reivindicación 3: Compuestos de fórmula general (IV)

Reivindicación 4: Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) como ingrediente activo.

Se catalogó la invención según la IPC así: C07D 471/04, A61K 31/4523, A61P 25/24.

3. De la solicitud de patente

Descripción: (artículo 28 D 486)

La descripción divulga de manera clara y completa la invención para que una persona capacitada en la materia técnica pueda ejecutarla, por lo tanto cumple con el requisito de claridad de acuerdo al artículo 28 de la Decisión 486.

Reivindicaciones: (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 son claras, concisas, están enteramente sustentadas en la descripción y cumplen con el requisito de claridad, concisión y sustento en la descripción según el artículo 30 de la Decisión 486.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La solicitud comprende solo una invención y por lo tanto cumple con el requisito de unidad de invención.

5. Es una invención (artículo 15 D 486)

El objeto de la solicitud puede ser considerado como una invención de acuerdo al artículo 15 de la Decisión 486.

6. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D 486)

El contenido de las reivindicaciones 1 a 5 de la solicitud no se encuentra dentro de las excepciones a la patentabilidad consideradas en el artículo 20 de la Decisión 486.

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

El contenido de las reivindicaciones 1 a 5 no comprende usos ni segundos usos de acuerdo a los artículos 14 y 21 de la Decisión 486.

8. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial para establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud

Novedad: (artículo 16 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 de la presente solicitud se refieren a derivados de piperidina-1-carboxilato de fórmula (I) y sus composiciones farmacéuticas.

Se realizó el estudio de novedad comparando elemento por elemento los compuestos, procesos y composiciones reivindicados en la solicitud, con los presentes en el estado de la técnica relacionado.

Como resultado de dicho estudio no se encontraron compuestos idénticos a los de la presente solicitud que presenten los mismos patrones de sustitución en el anillo de piperidina, tales como el grupo 1-carboxilato (2-metilamino-2-oxoetilo), por lo tanto las reivindicaciones 1 a 5 cumplen con el requisito de novedad según el artículo 16 de la Decisión 486.

Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 de la solicitud reclaman derivados de piperidina de fórmula general (I) de la enzima FAAH.

El estado de la técnica revela compuestos derivados de fenilalquilcarbamatos y dioxan-2-alkilcarbamatos inhibidores de la enzima FAAH.

La presente invención describe nuevos compuestos que presentan diferencias estructurales significativas con respecto a los compuestos divulgados en el estado de la técnica relacionado, entre ellas, un grupo piperidina-1-carboxilato conectado con grupos tales como difenil, fenilpiridin, fenilimidazolil sustituidos en la posición 4.

Los compuestos reivindicados demuestran tener una excelente actividad inhibitoria de la enzima FAAH, dada por valores de CI_{50} del orden μM y nM (folio 110 y anexo1), lo cual evidentemente constituye una ventaja y una solución inesperada nada obvia para un técnico medio versado en el estudio de este tipo de compuestos.

Aplicación Industrial: (artículo 19 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 cumplen con el requisito de aplicación industrial, ya que pueden ser producidos en cualquier tipo de industria.

9. Conclusión

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones 1 a 5 (folios 142 a 146) con el título DERIVADOS DE PIPERIDIN-1-CARBOXILATO COMO INHIBIDORES DE LA ENZIMA FAHH.

Bogotá, D.C.,

CONCEPTO TECNICO No. 121

EXAMINADOR TECNICO
Código No. 202077

EXP 2006 083419