

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO S
CARRERA 4 N
BOGOTÁ 8, CC

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-083429- -00006-0000

Fecha: 2010-09-01 16:58:16 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

911
150
114
43

Señora Directora
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comerc
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 06083429
Asunto : Solicitud de patente para: **"Derivados de piperidinalquilcarbamatos, 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, de acuerdo con la sustitución que me ha sido otorgada, me refiero al Oficio No. 7208 notificado por fijación en lista del 4 de Junio de 2010.

2. Mediante el Oficio No. 7208 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 concluye que el capítulo reivindicatorio no cumple con los requisitos de claridad y sustento exigidos en el artículos 30 de la Decisión 486. Su Despacho enuncia:

- "Los sustituyentes de las fórmulas (I) y (IIa) 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 fórmula (I) y (IV) solicitados acorde con los compuestos que

evidentemente correspondan a la invención y demuestren tener la actividad mencionada en la descripción".

- "Las reivindicaciones 13 y 14 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 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 los compuestos reivindicados a aquellos revelados en la tabla 1 del pliego descriptivo de la presente solicitud.
- Asimismo, se ha eliminado la expresión "hidratos y solvatos" del pliego reivindicatorio, de tal manera que la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.
- Las reivindicaciones 2, 6, 13-14 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio. De tal manera que el nuevo pliego reivindicatorio esta constituido por 10 reivindicaciones.
- De otro lado, las reivindicaciones 7 y 8 (nuevas reivindicaciones 5 y 6 respectivamente) han sido redactadas nuevamente de tal forma que ahora se especifican las condiciones del proceso y las bases y los solventes empleados en el mismo.

Así entonces, teniendo en cuenta las modificaciones efectuadas al capítulo reivindicatorio, consideramos que quedarían subsanadas las objeciones que por claridad hizo su Despacho ya que ahora, el nuevo pliego reivindicatorio ha sido limitado a los compuestos de formula (I) que se encuentran debidamente sustentados en el pliego descriptivo, de acuerdo con las sugerencias del Señor Examinador y 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 la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

4. Anexos:

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 10 reivindicaciones.

CAVELIER

ABOGADOS

139
138

- Formulario para modificaciones.
- Copia auténtica la sustitución del poder otorgado por el Doctor EMILIO FERRERO, a mi favor, para lo cual solicito me sea reconocida personería y así continuar con el trámite de este asunto en favor de la sociedad solicitante.

Señora Directora,

Luz Clemencia de Paéz

LUZ CLEMENCIA DE PAÉZ

C.C. N° 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555

COLO-14775-841-022-8

✓ MGM\MGM\ID-177427\WPC14775

No. M-2010-177427\MGM



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: SANOFLI-AVENTIS Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Francia. Dirección: 174 Avenue de France, 75013 Paris, 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	REPRESENTANTE 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>06.090.998</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 10 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 ☒ Copia auténtica de la sustitución del poder otorgada por el doctor EMILIO FERRERO a mi favor, para lo cual solicito me sea reconocida personería y así, continuar con el trámite de la presente solicitud a favor del solicitante.	

141
740

8	NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ	FIRMA: <u>Luz Clemencia Góchez</u>
C.C. <u>35.456.344</u> de Usaquén T.P.A. <u>23.555</u>		
MGM		

CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

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

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Poderdante : **SANOFI-AVENTIS**

Poder conferido el : 20/06/2005

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.

Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

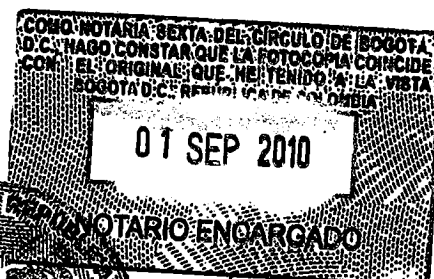
C.C. N° 438.019 de Usaquén

Acepto:


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

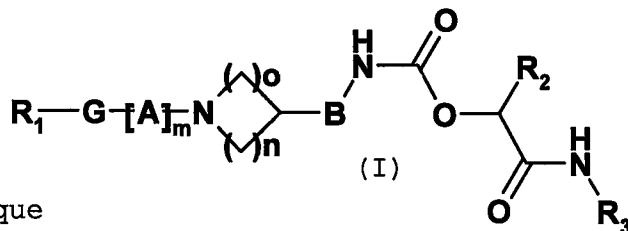
T.P.A. N° 23.555

C.C. N° 35.456.344 de Usaquén



REIVINDICACIONES

1. Compuesto que responde a la fórmula (I)



en la que

m representa un número entero que va de 1 a 3;

n representa un número entero igual a 1, ó 3;

o un número entero igual a 1 ó 2;

A se elige entre uno o varios grupos X y/o Y;

X representa un grupo metileno sustituido opcionalmente con uno o dos grupos alquilo-C₁₋₆, alquinileno-C₂;

B representa un enlace covalente o un grupo alquileno-C₁₋₆;

G representa un enlace covalente, un átomo de oxígeno ;

R₁ representa un grupo R₄ sustituido opcionalmente con uno o varios grupos R₅ y/o R₆;

R₄ representa un grupo elegido entre oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, fenilo, piridinilo, naftalenilo, quinolinilo y isoquinolinilo.

R₅ representa un átomo de halógeno, grupo ciano, alquilo-C₁₋₆, alcoxi-C₁₋₆, fluoroalquilo-C₁₋₆, fluoroalcoxi-C₁₋₆, o NR₇R₈;

R₆ representa un grupo fenilo, feniloxi o pirimidiniloxi; pudiendo estar sustituidos el o los grupos R₆ con uno o varios grupos R₅ idénticos o diferentes el uno del otro;

R₇ y R₈ representan de manera independiente el uno del otro un grupo alquilo-C₁₋₆,

R₂ representa un átomo de hidrógeno;

R₃ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo-C₁₋₆; en forma de base, de sal de adición con un ácido.

2. Compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque:

m representa un número entero igual a 1 ó 2;

en forma de base o de sal de adición con un ácido.

3. Compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizado porque:

n es igual a 2;

o es igual a 2;

en forma de base o de sal de adición con un ácido.

4. Compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque:

R₁ representa un grupo R₄ sustituido opcionalmente con uno o varios grupos R₅ y/o R₆;

R₄ representa un grupo elegido entre oxazolilo, isoxazolilo, fenilo o naftalenilo;

R₅ representa un átomo de halógeno, grupo ciano, NR₇R₈, grupo alquilo-C₁₋₆, alcoxi-C₁₋₆, fluoroalquilo-C₁₋₆ o fluoroalcoxi-C₁₋₆;

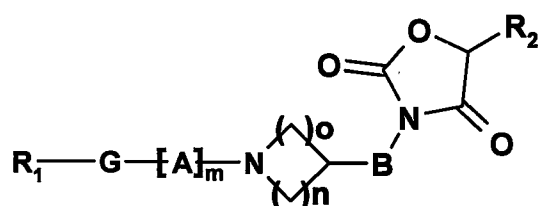
R₆ representa un grupo fenilo, feniloxi o pirimidiniloxi; pudiendo estar sustituidos el o los grupos R₆ con uno o varios grupos R₅ idénticos o diferentes el uno del otro;

R₇ y R₈ representan de manera independiente el uno del otro un grupo alquilo-C₁₋₆;

en forma de base, de sal de adición con un ácido, de hidrato o de solvato.

5. Proceso de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende

- reaccionar la oxazolidin-diona de fórmula general (IIa)



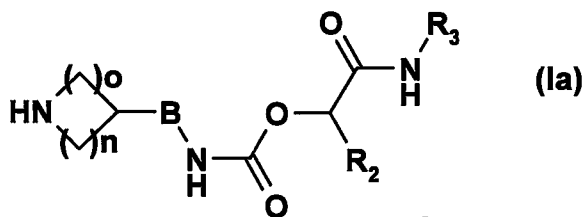
en la que A, B, G, R₁, R₂, ^(IIa) m, n y o son tales como se han definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1,

con una amina de formula general R₃NH₂ en la que R₃ es tal como se ha definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1 por aminolisis en la presencia de un solvente seleccionado entre metanol, etanol, o una mezcla de solventes de metanol y tetrahidrofurano, o metanol y dioxano; y

- recuperar el compuesto de formula (I) obtenido.

6. Proceso de preparación de un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende la etapa que consiste en

- reaccionar el derivado carbamato-amida de fórmula general (Ia)



en la que B, R₂, R₃, n y o son tales como se han definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1,

con un derivado de fórmula general (III)



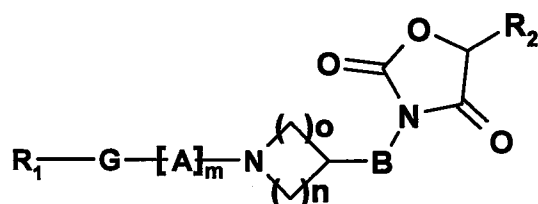
145
7421

en la que W representa un grupo mesilato, tosilato o un átomo de cloro, bromo o yodo y m, G, A y R₁ son tales como se han definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la presencia de una base seleccionada entre trietilamina, hidruro de sodio, terbutoxido de sodio o carbonato de sodio en un solvente seleccionado entre tetrahidrofurano, acetonitrilo, dimetilsulfóxido o dimetilformamida a una temperatura comprendida entre 0°C y la temperatura de reflujo del solvente;

y

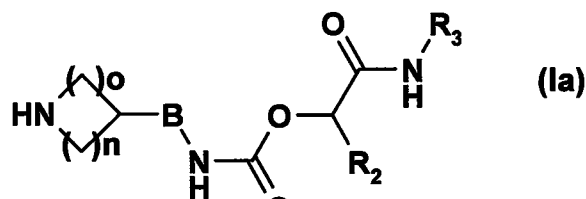
- recuperar el compuesto de formula I obtenido.

7. Compuesto que responde a la fórmula general (IIa),



en la que A, B, G, R₁, R₂ (IIa), n y o son tales como se han definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1, estando excluido 3-[1-(fenilmetil)-4-piperidinil]-2,4-oxazolidindiona.

8. Compuesto que responde a la fórmula general (Ia),



en la que B, R₂, R₃, n y o son tales como se han definido en la fórmula (I) según la reivindicación 1.

9. Composición farmacéutica que contiene al menos un compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en forma de base farmacéuticamente aceptable, de sal, y opcionalmente uno o varios excipientes aceptables desde un punto de vista farmacéutico.

10. Compuesto de fórmula (I) según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en forma de base farmacéuticamente aceptable o en forma de sal, para su utilización como medicamento.

MGM\MGM\ID-177449\WPC14775

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 06 83429
Clasificación Internacional (IPC): C07D 207/09, A61K 31/445 y A61P 25/24
Concepto Técnico No. 3606

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

No. Sol. Internacional PCT/FR2005/000452
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 91 a 124 como se radicó inicialmente.
Reivindicaciones: Folios 143 a 145 modificado según respuesta del solicitante.
Prioridad: Folio 1 FR 0401952 del 26/02/2004
Respuesta del solicitante: Folios 137 a 145.

2. Objeto de la invención

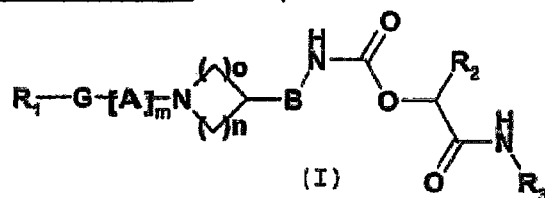
Título: DERIVADOS DE PIPERIDINILALQUILCARBAMATOS, SU PREPARACION Y SU APLICACIÓN COMO INHIBIDORES DE LA ENZIMA FAAH.

Objeto: El objeto de la presente solicitud consiste en nuevos piperidinalquilcarbamatos 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 que sean útiles en el tratamiento de diversas enfermedades, entre ellas el dolor.

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

Reivindicaciones 1 a 4, 7, 8 y 10: Compuestos de fórmula general (I).



Reivindicaciones 5 y 6: Proceso para obtener compuestos de fórmula (I)

Reivindicación 9: Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula general (I) como ingrediente activo.

Se catalogó la invención según la IPC así: C07D 207/09, A61K 31/445, 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 10 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 10 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 10 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

EXP 2006 083429

Novedad: (artículo 16 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 10 de la presente solicitud se refieren a piperidinalquilcarbamatos de fórmula general (I), sus procesos de síntesis y sus composiciones farmacéuticas.

Se realizó el estudio de novedad comparando elemento por elemento los compuestos 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 presente los mismos patrones de sustitución en el anillo de piperidina sustituido conectado con el grupo alquil(C₁₋₂)carbamato, por lo tanto las reivindicaciones 1 a 10 cumplen con el requisito de novedad según el artículo 16 de la Decisión 486.

Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 10 de la presente solicitud se refieren a piperidinalquilcarbamatos inhibidores de la enzima FAAH de fórmula general (I), sus procesos de síntesis y sus composiciones farmacéuticas.

El estado de la técnica revela compuestos derivados de Fenilalquilcarbamato, dioxan-2-alquilcarbamato y piperazinilalquilcarbamato 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 anillo de piperidina central sustituido en el nitrógeno con un grupo fenilalquilo y con un sustituyente alquil (C₁₋₂)carbamato en la posición 4.

Los compuestos reivindicados demuestran tener una buena actividad como inhibidores de la enzima FAAH, dada por valores de CI₅₀ comprendidos entre 0,001 y 1 µM, 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 10 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 10 (folios 143 a 145).

Bogotá, D.C.,

CONCEPTO TECNICO No. 3606	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
---------------------------	---

OR.