

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
ALICIA LLOREDA RICAURTE

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-040337- -00006-0000

Fecha: 2012-03-13 09:03:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO Radicación 07 040 337
 Trámite 011
 Evento 379
 Actuación 523
 Oficio
 Folios 014

07 040 337

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I	☐
		Capítulo II	☒
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2005/010372		
Fecha de Presentación Internacional	13/Abril/2006		

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 comunica:

1.Documentos estudiados

Descripción:	Folios 68 a 164	23/Abril/2007
Reivindicaciones:	Folios 165 a 176	23/ Abril/2007
	Folios 212 a 224	04/Febrero/2011
	Folios 246 a 255	16/Agosto/2011
Respuesta del solicitante:	Folios 209 a 224	04/Febrero/2011
	Folios 231 a 275	16/Agosto/2011
Prioridad:	EP 04 104856.2	04/Octubre/2004

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque: Esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

1. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "ALQUIL PIRIDINAS COMO INHIBIDORES DE 11-BETA PARA LA DIABETES"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos con actividad inhibitoria de la enzima 11-b-HSD1.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un Expediente 07 040 337 3er Art 45

compuesto de la fórmula (I) derivado de piridina y la composición que lo contiene.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 61 K 31/551, A61P035/000, C07D 487/004.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

En las Reivindicaciones 11 y 12 los compuestos, amidas del ácido sulfónico y las acetamidas, no están comprendidas en las markush, de acuerdo al nuevo capítulo reivindicatorio, solo se encuentran comprendidos en la fórmula(I) folio 246, los compuestos derivados, bencenosulfonamidas.

2. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la Solicitud de Prioridad: 2004/10/04 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Presentación internacional
D2	CO2006059282	Inhibidores heterociclil amino de 11-betahidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1.	Diciembre 6 de 2004

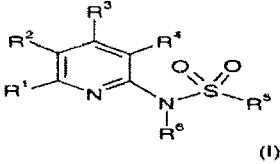
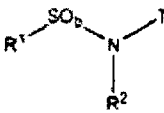
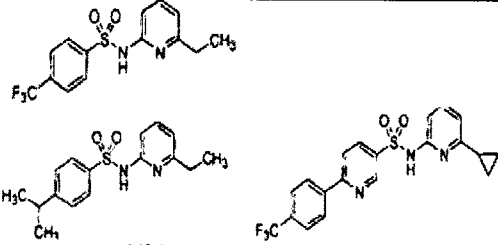
D2 divulga compuestos Inhibidores heterociclil amino de 11-betahidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1. proceso para su obtención y la composición que lo contiene, útiles para tratar enfermedades relacionadas síndromes metabólicos, diabetes, obesidad, hiperglicemia, hiperlipidemia, entre otras.

3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de formula (I), con sus sustituyentes de acuerdo al folio (246).

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
 (I)	
R1: alquilo C1-8, excepto metilo, cicloalquilo C3-8 R2: H R3: H R4: H R5: fenilo sustituido por trifluorometilo R6: H	 Compuestos N° 71, 76, 294

D2 ya divulgaba compuestos reclamados con la fórmula (I), (folios 281-283, pg 63-64,93) como es señalado en el cuadro comparativo anterior, por lo tanto dicho compuestos no son nuevos.

Las reivindicaciones dependientes 2-14 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que tampoco son nuevas.

4. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D2	CO2006059282	1-14	Novedad

5. Respuesta a los argumentos del señor solicitante

El solicitante en su respuesta manifiesta que tuvo en cuenta las objeciones sobre claridad y concesión hechas por esta oficina, en el oficio N° 08304 y al respecto argumenta lo siguiente:

"En primer lugar, el señor Examinador objeta la claridad de la reivindicación 1 dada la presencia del termino "cicloalquilo", y por lo tanto sugiere corregir el termino para la mejor comprensión de la función que se está reclamando...En este sentido, el señor Examinador señala que las definiciones dadas para R1,R2 y R5 tienen una cantidad de opciones alta y esto originaria un cambio significativo en la estructura de la molécula y por consiguiente en la manera en que esta podría estimular el receptor... Además, se ha fijado el termino anilo enseñado en los sustituyentes de la formula Markush (1) a fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de alquilo C1-C8, halógeno, alcoxi C1-C8, trifluorometoxi, nitro y trifluorometilo. Quedando de esta manera la definición del término anilo de conformidad con lo revelado en la página 6 del texto de la descripción, ajustando así los compuestos reclamados a las realizaciones preferidas de la invención...En dicha tabla se observa que tal como se señaló en mi memorial de Febrero 4 de 2011, y como se señala en las páginas 30 y 31 del capítulo descriptivo actualmente presentado, los compuestos de la invención presentan un valor de 1C50 para la inhibición de la enzima Ilbeta-HSD1 humana por debajo de 1000nM...Por otra parte, de conformidad con las modificaciones realizadas a la reivindicación 1, el alcance de sus reivindicaciones dependientes también ha sido limitado... (ii) Finalmente, el señor Examinador indica que las reivindicaciones 5 y 7 reclaman varias funciones que presentan el mismo defecto señalado para la reivindicación 1".

Se observa que el solicitante hace restricción a la reivindicación 1 y sus dependientes, sin embargo persiste falta de concisión en el nuevo capítulo como se mencionó antes, ya que en las Reivindicaciones 11 y 12; los compuestos amidas del ácido sulfónico y las acetamidas, no están comprendidas en las markush, de acuerdo al nuevo capítulo reivindicatorio, solo se encuentran comprendidos en la fórmula(I) folio 246, los compuestos derivados, bencenosulfonamidas.

En cuanto al nivel inventivo el solicitante argumenta lo siguiente:

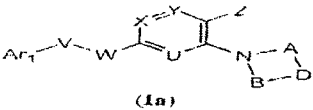
"el señor Examinador considera que el capítulo reivindicatorio en estudio carece de nivel inventivo a la luz de las enseñanzas del documento WO2004076413 (D1)...A este respecto, ese Despacho reitera que varias características esenciales de la presente solicitud ya habían sido anticipadas por las definiciones dadas para los grupos U, y, w, x, Y, Ar1 y R4 de la anterioridad D1 y teniendo en cuenta que estos compuestos eran conocidos por su habilidad para tratar la obesidad y la diabetes, se puede decir que anticipaban una buena parte de los compuestos reclamados por la reivindicación 1 actualmente presentada. En consecuencia, el señor Examinador concluye que la persona versada en la materia incluiría la piridina de D1 y grupos sustituyentes como los allí presentados para llegar así al objetivo de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo que considera obvia la presente solicitud.

En relación con lo anterior, me permito señalar que si bien es cierto que los compuestos derivados de piridina de la presente solicitud exhiben algunas similitudes estructurales con los compuestos revelados en D1, en virtud del nuevo capítulo reivindicatorio presentado, tal como se expuso en el numeral 3 de este mismo memorial, los derivados de piridina de la presente solicitud (como se reclaman en el ya mencionado nuevo capítulo reivindicatorio) no pueden ser de ninguna manera obvios a partir de las enseñanzas del documento citado, así
Expediente 07 040 337 3er Art 45

como tampoco es obvia la manera como esta solicitud soluciona el problema técnico encontrado, en virtud de los argumentos que me permito discutir a continuación:

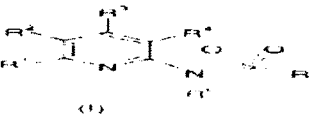
(A) Los compuestos de la presente invención no se encuentran revelados en D1.

En primer lugar, el documento D1 básicamente divulga compuestos derivados de arilo y heteroarilo que presentan la siguiente estructura química general:



Donde los posibles significados de las variables A, B, D, V, W, X, Y, Z, U y Ar1 se encuentran debidamente definidos en las páginas 20 y 21 de dicha anterioridad.

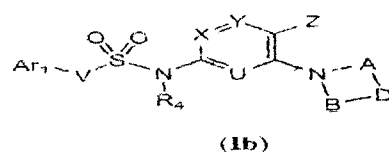
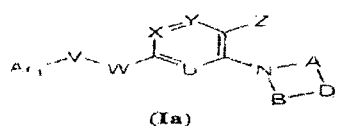
En cambio, en la presente solicitud de patente se revelan compuestos que presentan la siguiente estructura química general:



Donde los posibles significados de las variables R1 a R6 están debidamente definidos en la nueva reivindicación 1. En conexión con lo anterior, me permito señalar que en virtud de las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio, como se expusieron anteriormente, ahora es más evidente que los compuestos de la presente invención no se encuentran revelados en el documento D1. Para mostrar este hecho, me permito hacer una comparación técnica entre las características estructurales esenciales de la Formula Markush (1) de la presente invención y la formula Markush (Ib) de D1 (citada por el señor Examinador en su Concepto Técnico 1086 como aquella que tiene mayor similitud estructural con los compuestos de la presente invención):

SOLICITUD	D1
(I)	(Ib)
R¹	N-ABD
Ausente.	A y B son a su vez C ₁ , C ₂ , C ₃ , C ₄ , C ₅ , C ₆ , C ₇ , C ₈ , C ₉ , C ₁₀ , C ₁₁ , C ₁₂ , C ₁₃ , C ₁₄ , C ₁₅ , C ₁₆ , C ₁₇ , C ₁₈ , C ₁₉ , C ₂₀ , C ₂₁ , C ₂₂ , C ₂₃ , C ₂₄ , C ₂₅ , C ₂₆ , C ₂₇ , C ₂₈ , C ₂₉ , C ₃₀ , C ₃₁ , C ₃₂ , C ₃₃ , C ₃₄ , C ₃₅ , C ₃₆ , C ₃₇ , C ₃₈ , C ₃₉ , C ₄₀ , C ₄₁ , C ₄₂ , C ₄₃ , C ₄₄ , C ₄₅ , C ₄₆ , C ₄₇ , C ₄₈ , C ₄₉ , C ₅₀ , C ₅₁ , C ₅₂ , C ₅₃ , C ₅₄ , C ₅₅ , C ₅₆ , C ₅₇ , C ₅₈ , C ₅₉ , C ₆₀ , C ₆₁ , C ₆₂ , C ₆₃ , C ₆₄ , C ₆₅ , C ₆₆ , C ₆₇ , C ₆₈ , C ₆₉ , C ₇₀ , C ₇₁ , C ₇₂ , C ₇₃ , C ₇₄ , C ₇₅ , C ₇₆ , C ₇₇ , C ₇₈ , C ₇₉ , C ₈₀ , C ₈₁ , C ₈₂ , C ₈₃ , C ₈₄ , C ₈₅ , C ₈₆ , C ₈₇ , C ₈₈ , C ₈₉ , C ₉₀ , C ₉₁ , C ₉₂ , C ₉₃ , C ₉₄ , C ₉₅ , C ₉₆ , C ₉₇ , C ₉₈ , C ₉₉ , C ₁₀₀ , C ₁₀₁ , C ₁₀₂ , C ₁₀₃ , C ₁₀₄ , C ₁₀₅ , C ₁₀₆ , C ₁₀₇ , C ₁₀₈ , C ₁₀₉ , C ₁₁₀ , C ₁₁₁ , C ₁₁₂ , C ₁₁₃ , C ₁₁₄ , C ₁₁₅ , C ₁₁₆ , C ₁₁₇ , C ₁₁₈ , C ₁₁₉ , C ₁₂₀ , C ₁₂₁ , C ₁₂₂ , C ₁₂₃ , C ₁₂₄ , C ₁₂₅ , C ₁₂₆ , C ₁₂₇ , C ₁₂₈ , C ₁₂₉ , C ₁₃₀ , C ₁₃₁ , C ₁₃₂ , C ₁₃₃ , C ₁₃₄ , C ₁₃₅ , C ₁₃₆ , C ₁₃₇ , C ₁₃₈ , C ₁₃₉ , C ₁₄₀ , C ₁₄₁ , C ₁₄₂ , C ₁₄₃ , C ₁₄₄ , C ₁₄₅ , C ₁₄₆ , C ₁₄₇ , C ₁₄₈ , C ₁₄₉ , C ₁₅₀ , C ₁₅₁ , C ₁₅₂ , C ₁₅₃ , C ₁₅₄ , C ₁₅₅ , C ₁₅₆ , C ₁₅₇ , C ₁₅₈ , C ₁₅₉ , C ₁₆₀ , C ₁₆₁ , C ₁₆₂ , C ₁₆₃ , C ₁₆₄ , C ₁₆₅ , C ₁₆₆ , C ₁₆₇ , C ₁₆₈ , C ₁₆₉ , C ₁₇₀ , C ₁₇₁ , C ₁₇₂ , C ₁₇₃ , C ₁₇₄ , C ₁₇₅ , C ₁₇₆ , C ₁₇₇ , C ₁₇₈ , C ₁₇₉ , C ₁₈₀ , C ₁₈₁ , C ₁₈₂ , C ₁₈₃ , C ₁₈₄ , C ₁₈₅ , C ₁₈₆ , C ₁₈₇ , C ₁₈₈ , C ₁₈₉ , C ₁₉₀ , C ₁₉₁ , C ₁₉₂ , C ₁₉₃ , C ₁₉₄ , C ₁₉₅ , C ₁₉₆ , C ₁₉₇ , C ₁₉₈ , C ₁₉₉ , C ₂₀₀ , C ₂₀₁ , C ₂₀₂ , C ₂₀₃ , C ₂₀₄ , C ₂₀₅ , C ₂₀₆ , C ₂₀₇ , C ₂₀₈ , C ₂₀₉ , C ₂₁₀ , C ₂₁₁ , C ₂₁₂ , C ₂₁₃ , C ₂₁₄ , C ₂₁₅ , C ₂₁₆ , C ₂₁₇ , C ₂₁₈ , C ₂₁₉ , C ₂₂₀ , C ₂₂₁ , C ₂₂₂ , C ₂₂₃ , C ₂₂₄ , C ₂₂₅ , C ₂₂₆ , C ₂₂₇ , C ₂₂₈ , C ₂₂₉ , C ₂₃₀ , C ₂₃₁ , C ₂₃₂ , C ₂₃₃ , C ₂₃₄ , C ₂₃₅ , C ₂₃₆ , C ₂₃₇ , C ₂₃₈ , C ₂₃₉ , C ₂₄₀ , C ₂₄₁ , C ₂₄₂ , C ₂₄₃ , C ₂₄₄ , C ₂₄₅ , C ₂₄₆ , C ₂₄₇ , C ₂₄₈ , C ₂₄₉ , C ₂₅₀ , C ₂₅₁ , C ₂₅₂ , C ₂₅₃ , C ₂₅₄ , C ₂₅₅ , C ₂₅₆ , C ₂₅₇ , C ₂₅₈ , C ₂₅₉ , C ₂₆₀ , C ₂₆₁ , C ₂₆₂ , C ₂₆₃ , C ₂₆₄ , C ₂₆₅ , C ₂₆₆ , C ₂₆₇ , C ₂₆₈ , C ₂₆₉ , C ₂₇₀ , C ₂₇₁ , C ₂₇₂ , C ₂₇₃ , C ₂₇₄ , C ₂₇₅ , C ₂₇₆ , C ₂₇₇ , C ₂₇₈ , C ₂₇₉ , C ₂₈₀ , C ₂₈₁ , C ₂₈₂ , C ₂₈₃ , C ₂₈₄ , C ₂₈₅ , C ₂₈₆ , C ₂₈₇ , C ₂₈₈ , C ₂₈₉ , C ₂₉₀ , C ₂₉₁ , C ₂₉₂ , C ₂₉₃ , C ₂₉₄ , C ₂₉₅ , C ₂₉₆ , C ₂₉₇ , C ₂₉₈ , C ₂₉₉ , C ₃₀₀ , C ₃₀₁ , C ₃₀₂ , C ₃₀₃ , C ₃₀₄ , C ₃₀₅ , C ₃₀₆ , C ₃₀₇ , C ₃₀₈ , C ₃₀₉ , C ₃₁₀ , C ₃₁₁ , C ₃₁₂ , C ₃₁₃ , C ₃₁₄ , C ₃₁₅ , C ₃₁₆ , C ₃₁₇ , C ₃₁₈ , C ₃₁₉ , C ₃₂₀ , C ₃₂₁ , C ₃₂₂ , C ₃₂₃ , C ₃₂₄ , C ₃₂₅ , C ₃₂₆ , C ₃₂₇ , C ₃₂₈ , C ₃₂₉ , C ₃₃₀ , C ₃₃₁ , C ₃₃₂ , C ₃₃₃ , C ₃₃₄ , C ₃₃₅ , C ₃₃₆ , C ₃₃₇ , C ₃₃₈ , C ₃₃₉ , C ₃₄₀ , C ₃₄₁ , C ₃₄₂ , C ₃₄₃ , C ₃₄₄ , C ₃₄₅ , C ₃₄₆ , C ₃₄₇ , C ₃₄₈ , C ₃₄₉ , C ₃₅₀ , C ₃₅₁ , C ₃₅₂ , C ₃₅₃ , C ₃₅₄ , C ₃₅₅ , C ₃₅₆ , C ₃₅₇ , C ₃₅₈ , C ₃₅₉ , C ₃₆₀ , C ₃₆₁ , C ₃₆₂ , C ₃₆₃ , C ₃₆₄ , C ₃₆₅ , C ₃₆₆ , C ₃₆₇ , C ₃₆₈ , C ₃₆₉ , C ₃₇₀ , C ₃₇₁ , C ₃₇₂ , C ₃₇₃ , C ₃₇₄ , C ₃₇₅ , C ₃₇₆ , C ₃₇₇ , C ₃₇₈ , C ₃₇₉ , C ₃₈₀ , C ₃₈₁ , C ₃₈₂ , C ₃₈₃ , C ₃₈₄ , C ₃₈₅ , C ₃₈₆ , C ₃₈₇ , C ₃₈₈ , C ₃₈₉ , C ₃₉₀ , C ₃₉₁ , C ₃₉₂ , C ₃₉₃ , C ₃₉₄ , C ₃₉₅ , C ₃₉₆ , C ₃₉₇ , C ₃₉₈ , C ₃₉₉ , C ₄₀₀ , C ₄₀₁ , C ₄₀₂ , C ₄₀₃ , C ₄₀₄ , C ₄₀₅ , C ₄₀₆ , C ₄₀₇ , C ₄₀₈ , C ₄₀₉ , C ₄₁₀ , C ₄₁₁ , C ₄₁₂ , C ₄₁₃ , C ₄₁₄ , C ₄₁₅ , C ₄₁₆ , C ₄₁₇ , C ₄₁₈ , C ₄₁₉ , C ₄₂₀ , C ₄₂₁ , C ₄₂₂ , C ₄₂₃ , C ₄₂₄ , C ₄₂₅ , C ₄₂₆ , C ₄₂₇ , C ₄₂₈ , C ₄₂₉ , C ₄₃₀ , C ₄₃₁ , C ₄₃₂ , C ₄₃₃ , C ₄₃₄ , C ₄₃₅ , C ₄₃₆ , C ₄₃₇ , C ₄₃₈ , C ₄₃₉ , C ₄₄₀ , C ₄₄₁ , C ₄₄₂ , C ₄₄₃ , C ₄₄₄ , C ₄₄₅ , C ₄₄₆ , C ₄₄₇ , C ₄₄₈ , C ₄₄₉ , C ₄₅₀ , C ₄₅₁ , C ₄₅₂ , C ₄₅₃ , C ₄₅₄ , C ₄₅₅ , C ₄₅₆ , C ₄₅₇ , C ₄₅₈ , C ₄₅₉ , C ₄₆₀ , C ₄₆₁ , C ₄₆₂ , C ₄₆₃ , C ₄₆₄ , C ₄₆₅ , C ₄₆₆ , C ₄₆₇ , C ₄₆₈ , C ₄₆₉ , C ₄₇₀ , C ₄₇₁ , C ₄₇₂ , C ₄₇₃ , C ₄₇₄ , C ₄₇₅ , C ₄₇₆ , C ₄₇₇ , C ₄₇₈ , C ₄₇₉ , C ₄₈₀ , C ₄₈₁ , C ₄₈₂ , C ₄₈₃ , C ₄₈₄ , C ₄₈₅ , C ₄₈₆ , C ₄₈₇ , C ₄₈₈ , C ₄₈₉ , C ₄₉₀ , C ₄₉₁ , C ₄₉₂ , C ₄₉₃ , C ₄₉₄ , C ₄₉₅ , C ₄₉₆ , C ₄₉₇ , C ₄₉₈ , C ₄₉₉ , C ₅₀₀ , C ₅₀₁ , C ₅₀₂ , C ₅₀₃ , C ₅₀₄ , C ₅₀₅ , C ₅₀₆ , C ₅₀₇ , C ₅₀₈ , C ₅₀₉ , C ₅₁₀ , C ₅₁₁ , C ₅₁₂ , C ₅₁₃ , C ₅₁₄ , C ₅₁₅ , C ₅₁₆ , C ₅₁₇ , C ₅₁₈ , C ₅₁₉ , C ₅₂₀ , C ₅₂₁ , C ₅₂₂ , C ₅₂₃ , C ₅₂₄ , C ₅₂₅ , C ₅₂₆ , C ₅₂₇ , C ₅₂₈ , C ₅₂₉ , C ₅₃₀ , C ₅₃₁ , C ₅₃₂ , C ₅₃₃ , C ₅₃₄ , C ₅₃₅ , C ₅₃₆ , C ₅₃₇ , C ₅₃₈ , C ₅₃₉ , C ₅₄₀ , C ₅₄₁ , C ₅₄₂ , C ₅₄₃ , C ₅₄₄ , C ₅₄₅ , C ₅₄₆ , C ₅₄₇ , C ₅₄₈ , C ₅₄₉ , C ₅₅₀ , C ₅₅₁ , C ₅₅₂ , C ₅₅₃ , C ₅₅₄ , C ₅₅₅ , C ₅₅₆ , C ₅₅₇ , C ₅₅₈ , C ₅₅₉ , C ₅₆₀ , C ₅₆₁ , C ₅₆₂ , C ₅₆₃ , C ₅₆₄ , C ₅₆₅ , C ₅₆₆ , C ₅₆₇ , C ₅₆₈ , C ₅₆₉ , C ₅₇₀ , C ₅₇₁ , C ₅₇₂ , C ₅₇₃ , C ₅₇₄ , C ₅₇₅ , C ₅₇₆ , C ₅₇₇ , C ₅₇₈ , C ₅₇₉ , C ₅₈₀ , C ₅₈₁ , C ₅₈₂ , C ₅₈₃ , C ₅₈₄ , C ₅₈₅ , C ₅₈₆ , C ₅₈₇ , C ₅₈₈ , C ₅₈₉ , C ₅₉₀ , C ₅₉₁ , C ₅₉₂ , C ₅₉₃ , C ₅₉₄ , C ₅₉₅ , C ₅₉₆ , C ₅₉₇ , C ₅₉₈ , C ₅₉₉ , C ₆₀₀ , C ₆₀₁ , C ₆₀₂ , C ₆₀₃ , C ₆₀₄ , C ₆₀₅ , C ₆₀₆ , C ₆₀₇ , C ₆₀₈ , C ₆₀₉ , C ₆₁₀ , C ₆₁₁ , C ₆₁₂ , C ₆₁₃ , C ₆₁₄ , C ₆₁₅ , C ₆₁₆ , C ₆₁₇ , C ₆₁₈ , C ₆₁₉ , C ₆₂₀ , C ₆₂₁ , C ₆₂₂ , C ₆₂₃ , C ₆₂₄ , C ₆₂₅ , C ₆₂₆ , C ₆₂₇ , C ₆₂₈ , C ₆₂₉ , C ₆₃₀ , C ₆₃₁ , C ₆₃₂ , C ₆₃₃ , C ₆₃₄ , C ₆₃₅ , C ₆₃₆ , C ₆₃₇ , C ₆₃₈ , C ₆₃₉ , C ₆₄₀ , C ₆₄₁ , C ₆₄₂ , C ₆₄₃ , C ₆₄₄ , C ₆₄₅ , C ₆₄₆ , C ₆₄₇ , C ₆₄₈ , C ₆₄₉ , C ₆₅₀ , C ₆₅₁ , C ₆₅₂ , C ₆₅₃ , C ₆₅₄ , C ₆₅₅ , C ₆₅₆ , C ₆₅₇ , C ₆₅₈ , C ₆₅₉ , C ₆₆₀ , C ₆₆₁ , C ₆₆₂ , C ₆₆₃ , C ₆₆₄ , C ₆₆₅ , C ₆₆₆ , C ₆₆₇ , C ₆₆₈ , C ₆₆₉ , C ₆₇₀ , C ₆₇₁ , C ₆₇₂ , C ₆₇₃ , C ₆₇₄ , C ₆₇₅ , C ₆₇₆ , C ₆₇₇ , C ₆₇₈ , C ₆₇₉ , C ₆₈₀ , C ₆₈₁ , C ₆₈₂ , C ₆₈₃ , C ₆₈₄ , C ₆₈₅ , C ₆₈₆ , C ₆₈₇ , C ₆₈₈ , C ₆₈₉ , C ₆₉₀ , C ₆₉₁ , C ₆₉₂ , C ₆₉₃ , C ₆₉₄ , C ₆₉₅ , C ₆₉₆ , C ₆₉₇ , C ₆₉₈ , C ₆₉₉ , C ₇₀₀ , C ₇₀₁ , C ₇₀₂ , C ₇₀₃ , C ₇₀₄ , C ₇₀₅ , C ₇₀₆ , C ₇₀₇ , C ₇₀₈ , C ₇₀₉ , C ₇₁₀ , C ₇₁₁ , C ₇₁₂ , C ₇₁₃ , C ₇₁₄ , C ₇₁₅ , C ₇₁₆ , C ₇₁₇ , C ₇₁₈ , C ₇₁₉ , C ₇₂₀ , C ₇₂₁ , C ₇₂₂ , C ₇₂₃ , C ₇₂₄ , C ₇₂₅ , C ₇₂₆ , C ₇₂₇ , C ₇₂₈ , C ₇₂₉ , C ₇₃₀ , C ₇₃₁ , C ₇₃₂ , C ₇₃₃ , C ₇₃₄ , C ₇₃₅ , C ₇₃₆ , C ₇₃₇ , C ₇₃₈ , C ₇₃₉ , C ₇₄₀ , C ₇₄₁ , C ₇₄₂ , C ₇₄₃ , C ₇₄₄ , C ₇₄₅ , C ₇₄₆ , C ₇₄₇ , C ₇₄₈ , C ₇₄₉ , C ₇₅₀ , C ₇₅₁ , C ₇₅₂ , C ₇₅₃ , C ₇₅₄ , C ₇₅₅ , C ₇₅₆ , C ₇₅₇ , C ₇₅₈ , C ₇₅₉ , C ₇₆₀ , C ₇₆₁ , C ₇₆₂ , C ₇₆₃ , C ₇₆₄ , C ₇₆₅ , C ₇₆₆ , C ₇₆₇ , C ₇₆₈ , C ₇₆₉ , C ₇₇₀ , C ₇₇₁ , C ₇₇₂ , C ₇₇₃ , C ₇₇₄ , C ₇₇₅ , C ₇₇₆ , C ₇₇₇ , C ₇₇₈ , C ₇₇₉ , C ₇₈₀ , C ₇₈₁ , C ₇₈₂ , C ₇₈₃ , C ₇₈₄ , C ₇₈₅ , C ₇₈₆ , C ₇₈₇ , C ₇₈₈ , C ₇₈₉ , C ₇₉₀ , C ₇₉₁ , C ₇₉₂ , C ₇₉₃ , C ₇₉₄ , C ₇₉₅ , C ₇₉₆ , C ₇₉₇ , C ₇₉₈ , C ₇₉₉ , C ₈₀₀ , C ₈₀₁ , C ₈₀₂ , C ₈₀₃ , C ₈₀₄ , C ₈₀₅ , C ₈₀₆ , C ₈₀₇ , C ₈₀₈ , C ₈₀₉ , C ₈₁₀ , C ₈₁₁ , C ₈₁₂ , C ₈₁₃ , C ₈₁₄ , C ₈₁₅ , C ₈₁₆ , C ₈₁₇ , C ₈₁₈ , C ₈₁₉ , C ₈₂₀ , C ₈₂₁ , C ₈₂₂ , C ₈₂₃ , C ₈₂₄ , C ₈₂₅ , C ₈₂₆ , C ₈₂₇ , C ₈₂₈ , C ₈₂₉ , C ₈₃₀ , C ₈₃₁ , C ₈₃₂ , C ₈₃₃ , C ₈₃₄ , C ₈₃₅ , C ₈₃₆ , C ₈₃₇ , C ₈₃₈ , C ₈₃₉ , C ₈₄₀ , C ₈₄₁ , C ₈₄₂ , C ₈₄₃ , C ₈₄₄ , C ₈₄₅ , C ₈₄₆ , C ₈₄₇ , C ₈₄₈ , C ₈₄₉ , C ₈₅₀ , C ₈₅₁ , C ₈₅₂ , C ₈₅₃ , C ₈₅₄ , C ₈₅₅ , C ₈₅₆ , C ₈₅₇ , C ₈₅₈ , C ₈₅₉ , C ₈₆₀ , C ₈₆₁ , C ₈₆₂ , C ₈₆₃ , C ₈₆₄ , C ₈₆₅ , C ₈₆₆ , C ₈₆₇ , C ₈₆₈ , C ₈₆₉ , C ₈₇₀ , C ₈₇₁ , C ₈₇₂ , C ₈₇₃ , C ₈₇₄ , C ₈₇₅ , C ₈₇₆ , C ₈₇₇ , C ₈₇₈ , C ₈₇₉ , C ₈₈₀ , C ₈₈₁ , C ₈₈₂ , C ₈₈₃ , C ₈₈₄ , C ₈₈₅ , C ₈₈₆ , C ₈₈₇ , C ₈₈₈ , C ₈₈₉ , C ₈₉₀ , C ₈₉₁ , C ₈₉₂ , C ₈₉₃ , C ₈₉₄ , C ₈₉₅ , C ₈₉₆ , C ₈₉₇ , C ₈₉₈ , C ₈₉₉ , C ₉₀₀ , C ₉₀₁ , C ₉₀₂ , C ₉₀₃ , C ₉₀₄ , C ₉₀₅ , C ₉₀₆ , C ₉₀₇ , C ₉₀₈ , C ₉₀₉ , C ₉₁₀ , C ₉₁₁ , C ₉₁₂ , C ₉₁₃ , C ₉₁₄ , C ₉₁₅ , C ₉₁₆ , C ₉₁₇ , C ₉₁₈ , C ₉₁₉ , C ₉₂₀ , C ₉₂₁ , C ₉₂₂ , C ₉₂₃ , C ₉₂₄ , C ₉₂₅ , C ₉₂₆ , C ₉₂₇ , C ₉₂₈ , C ₉₂₉ , C ₉₃₀ , C ₉₃₁ , C ₉₃₂ , C ₉₃₃ , C ₉₃₄ , C ₉₃₅ , C ₉₃₆ , C ₉₃₇ , C ₉₃₈ , C ₉₃₉ , C ₉₄₀ , C ₉₄₁ , C ₉₄₂ , C ₉₄₃ , C ₉₄₄ , C ₉₄₅ , C ₉₄₆ , C ₉₄₇ , C ₉₄₈ , C ₉₄₉ , C ₉₅₀ , C ₉₅₁ , C ₉₅₂ , C ₉₅₃ , C ₉₅₄ , C ₉₅₅ , C ₉₅₆ , C ₉₅₇ , C ₉₅₈ , C ₉₅₉ , C ₉₆₀ , C ₉₆₁ , C ₉₆₂ , C ₉₆₃ , C ₉₆₄ , C ₉₆₅ , C ₉₆₆ , C ₉₆₇ , C ₉₆₈ , C ₉₆₉ , C ₉₇₀ , C ₉₇₁ , C ₉₇₂ , C ₉₇₃ , C ₉₇₄ , C ₉₇₅ , C ₉₇₆ , C ₉₇₇ , C ₉₇₈ , C ₉₇₉ , C ₉₈₀ , C ₉₈₁ , C ₉₈₂ , C ₉₈₃ , C ₉₈₄ , C ₉₈₅ , C ₉₈₆ , C ₉₈₇ , C ₉₈₈ , C ₉₈₉ , C ₉₉₀ , C ₉₉₁ , C ₉₉₂ , C ₉₉₃ , C ₉₉₄ , C ₉₉₅ , C ₉₉₆ , C ₉₉₇ , C ₉₉₈ , C ₉₉₉ , C ₁₀₀₀ , C ₁₀₀₁ , C ₁₀₀₂ , C ₁₀₀₃ , C ₁₀₀₄ , C ₁₀₀₅ , C ₁₀₀₆ , C ₁₀₀₇ , C ₁₀₀₈ , C ₁₀₀₉ , C ₁₀₁₀ , C ₁₀₁₁ , C ₁₀₁₂ , C ₁₀₁₃ , C ₁₀₁₄ , C ₁₀₁₅ , C ₁₀₁₆ , C ₁₀₁₇ , C ₁₀₁₈ , C ₁₀₁₉ , C ₁₀₂₀ , C ₁₀₂₁ , C ₁₀₂₂ , C ₁₀₂₃ , C ₁₀₂₄ , C ₁₀₂₅ , C ₁₀₂₆ , C ₁₀₂₇ , C ₁₀₂₈ , C ₁₀₂₉ , C ₁₀₃₀ , C ₁₀₃₁ , C ₁₀₃₂ , C ₁₀₃₃ , C ₁₀₃₄ , C ₁₀₃₅ , C ₁₀₃₆ , C ₁₀₃₇ , C ₁₀₃₈ , C ₁₀₃₉ , C ₁₀₄₀ , C ₁₀₄₁ , C ₁₀₄₂ , C ₁₀₄₃ , C ₁₀₄₄ , C ₁₀₄₅ , C ₁₀₄₆ , C ₁₀₄₇ , C ₁₀₄₈ , C ₁₀₄₉ , C ₁₀₅₀ , C ₁₀₅₁ , C ₁₀₅₂ , C ₁₀₅₃ , C ₁₀₅₄ , C ₁₀₅₅ , C ₁₀₅₆ , C ₁₀₅₇ , C ₁₀₅₈ , C ₁₀₅₉ , C ₁₀₆₀ , C ₁₀₆₁ , C ₁₀₆₂ , C ₁₀₆₃ , C ₁₀₆₄ , C ₁₀₆₅ , C ₁₀₆₆ , C ₁₀₆₇ , C ₁₀₆₈ , C ₁₀₆₉ , C ₁₀₇₀ , C ₁₀₇₁ , C ₁₀₇₂ , C ₁₀₇₃ , C ₁₀₇₄ , C ₁₀₇₅ , C ₁₀₇₆ , C ₁₀₇₇ , C ₁₀₇₈ , C ₁₀₇₉ , C ₁₀₈₀ , C ₁₀₈₁ , C ₁₀₈₂ , C ₁₀₈₃ , C ₁₀₈₄ , C ₁₀₈₅ , C ₁₀₈₆ , C ₁₀₈₇ , C ₁₀₈₈ , C ₁₀₈₉ , C ₁₀₉₀ , C ₁₀₉₁ , C ₁₀₉₂ , C ₁₀₉₃ , C ₁₀₉₄ , C ₁₀₉₅ , C ₁₀₉₆ , C ₁₀₉₇ , C ₁₀₉₈ , C ₁₀₉₉ , C ₁₁₀₀ , C ₁₁₀₁ , C ₁₁₀₂ , C ₁₁₀₃ , C ₁₁₀₄ , C ₁₁₀₅ , C ₁₁₀₆ , C ₁₁₀₇ , C ₁₁₀₈ , C ₁₁₀₉ , C ₁₁₁₀ , C ₁₁₁₁ , C ₁₁₁₂ , C ₁₁₁₃ , C ₁₁₁₄ , C ₁₁₁₅ , C ₁₁₁₆ , C ₁₁₁₇ , C ₁₁₁₈ , C ₁₁₁₉ , C ₁₁₂₀ , C ₁₁₂₁ , C ₁₁₂₂ , C ₁₁₂₃ , C ₁₁₂₄ , C ₁₁₂₅ , C ₁₁₂₆ , C ₁₁₂₇ , C ₁₁₂₈ , C ₁₁₂₉ , C ₁₁₃₀ , C ₁₁₃₁ , C ₁₁₃₂ , C ₁₁₃₃ , C ₁₁₃₄ , C ₁₁₃₅ , C ₁₁₃₆ , C ₁₁₃₇ , C ₁₁₃₈ , C ₁₁₃₉ , C ₁₁₄₀ , C ₁₁₄₁

De la tabla comparativa anterior, es absolutamente claro que existen diferencias estructurales entre los compuestos divulgados en el documento D1 y aquellos revelados en la solicitud de patente en cuestión...



En cambio, como se desprende en la tabla anterior y del nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud, los compuestos de fórmula (1) de la presente solicitud no pueden tener dicho grupo heterocíclico en esa misma posición, toda vez que en esta posición del grupo piridinilo central se encuentra el sustituyente R' , el cual no puede ser un grupo heterocíclico de acuerdo con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio, como se expusieron anteriormente.

"(B) LOS COMPUESTOS DE LA SOLICITUD EN TRAMITE NO PUEDEN DERIVARSE DE FORMA OBVIA DE LOS COMPUESTOS REVELADOS EN D1 TODA VEZ QUE LOS COMPUESTOS DE D1 Y LOS COMPUESTOS DE LA PRESENTE SOLICITUD TIENEN UNA ACTIVIDAD BIOLÓGICA DIFERENTE.

A este respecto, como se mencionó antes, el señor Examinador afirma que "teniendo en cuenta que D1 anticipaba una definición para varias variables de la fórmula 1 (en D1) que se solapan... Respecto a los señalamientos anteriores, en primer lugar me permito señalar que como se demostró antes, aunque los compuestos de ambos documentos comparten algunas características técnicas estructurales, ninguno de los compuestos de la solicitud en trámite se encuentra divulgado en D1... En este sentido, la persona versada en la materia reconocerá que la actividad biológica de los compuestos de la presente solicitud, así como sus sales y ésteres farmacéuticamente aceptables, es inhibir selectivamente la enzima 11beta-hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1 (11beta-HSD1) frente a la enzima 11beta-HSD2, lo que le permite a dichos compuestos disminuir los niveles de glucosa y normalizar los parámetros lipídicos en pacientes diabéticos tipo 2, modulando la concentración local de cortisol glucocorticoide activo en los tejidos objetivo (hígado, tejido adiposo) pero sin producir un aumento indeseado en la presión sanguínea, el cual es un típico efecto secundario de la inhibición de la enzima 11beta-HSD2 (ver páginas 3, 4, 30, 31 y 32 de la presente solicitud).

En cambio, la actividad biológica de los compuestos del documento D1 es ser agonistas o agonistas inversos de los receptores RUP3 de las células beta del páncreas... Además, D1 enseña que los compuestos revelados en ese documento también actúan como agonistas o agonistas inversos de los receptores RUP3 que se encuentran en el hipotálamo... Por lo tanto, dado que D1 no menciona ni da algún indicio a la persona versada en la materia que modificando la estructura química de los compuestos revelados en ese documento se logren obtener compuestos como los de la presente invención, que pueden modular el metabolismo de la glucosa a través de la inhibición selectiva de la enzima 11beta-HSD1 sin inhibir la enzima 11beta-HSD2, evitando así un aumento indeseado en la presión sanguínea, se concluye que los compuestos objeto de la presente solicitud no son anticipados por las enseñanzas de D1 y por lo tanto son inventivos.

(C) LA PERSONA VERSADA EN LA MATERIA NO PODRÍA TENER CERTEZA QUE AL MODIFICAR LOS SUSTITUYENTES DE LOS COMPUESTOS DE D1 EL EFECTO TERAPÉUTICO DE LOS COMPUESTOS SE MANTENDRÍA.

A este respecto, como se mencionó antes, ese Despacho reitera que varias características esenciales de la presente solicitud ya habían sido anticipadas por las definiciones dadas para los grupos U, y, w, x, Y, Ar1 y R4 de la anterioridad D1. Y teniendo en cuenta que estos compuestos eran conocidos por su habilidad para tratar la obesidad y la diabetes, se puede decir que anticipaban una buena parte de los compuestos reclamados por la reivindicación 1 actualmente presentada... Este hecho es claro para la persona versada en la materia, tal como por ejemplo se señala en la farmacia Remington, ... De esta forma, remplazar sobre un anillo central unos sustituyentes por otros no necesariamente mantienen la actividad biológica ni el efecto terapéutico del compuesto resultante, lo que implica que la persona versada en la materia aún conociendo los reemplazos más comunes de sustituyentes no podría tener certeza de que al modificar una molécula de esta forma tendría un compuesto con la misma actividad biológica o el mismo efecto terapéutico que el compuesto original. Tan es así, que reemplazos isostéricos pueden proporcionar compuestos con actividad antagonista del compuesto original... Un ejemplo de esto lo constituye la naloxona, un fármaco antagonista de los receptores opioides, muy usado en el tratamiento de la intoxicación aguda por opiáceos. Tal como se aprecia en la figura, la diferencia estructural entre la naloxona y la morfina (un conocido fármaco opioide) es únicamente el remplazo del grupo metilo por un Propileno.



Naloxona
(Fármaco antagonista de los receptores opioides)



Morfina
(Fármaco opioide)

Es entonces evidente que un reemplazo de un sustituyente por otro sobre un anillo central, por pequeña que fuere la diferencia entre los sustituyentes, puede cambiar la actividad biológica y el efecto terapéutico...

En conexión con lo anterior, para obtener los compuestos ahora reivindicados a partir de las enseñanzas de D1

Expediente 07 040 337 3er Art 45

el primer paso sería cambiar el sustituyente heterocíclico que contiene nitrógeno (N-ABD) por los sustituyentes representados porque son hidrógeno, alquiloCrCe, cicloalquiloC3-C8, hidroxialquiloC1-C8, alcoxiC1-C5alquiloC1-C8, arilo, aminocarbonilalquiloC1-C8, cicloalquilC3-C3alcoxiCrCgalquiloCi- C8, anilalquiloC1-C8alquiloC1-C8 o haloalcoxiC1-C8alquiloC1-C8. Cabe resaltar que ninguno de los sustituyentes representados por R1 es un heterociclo. En consecuencia, es claro que la persona versada en la materia, partiendo de D1 y de sus conocimientos generales no podría tener seguridad de que este cambio drástico no afectaría significativamente la actividad de los compuestos resultantes... Por lo tanto, la conclusión a la que llega el señor Examinador en el referenciado Concepto Técnico donde asegura que la persona versada en la materia incluiría la pindina de D1 y los grupos sustituyentes como los allí presentados para llegar así al objetivo de la reivindicación 1 de la solicitud no es correcta porque D1 ... y para este caso en particular, la persona versada en la materia no podría haber asegurado o predicho el cambio drástico de la actividad biológica de los compuestos manteniendo el efecto terapéutico de modular el metabolismo de la glucosa.

A los anteriores argumentos esta oficina responde que, de acuerdo con el solicitante, D1 no revela el compuesto de fórmula (I) reivindicado, teniendo en cuenta que la afectación hecha con este documento, fue por Nivel Inventivo y no por Novedad; sin embargo con el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, se encuentra que aún hay en la reivindicación 1, compuestos ya conocidos en el estado de la técnica (D2), por lo tanto el solicitante debe mostrar y sustentar, cuales son los compuestos nuevos e inventivos de la presente solicitud; además, cabe mencionar que en la presente descripción solo se realizaron ensayos con dos compuestos 105 y 186 (folio 98, pg 31), lo cual no permite extender esta actividad a la cantidad de compuestos reivindicados, con la variabilidad presentada entre ellos.

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 (60) 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 quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

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

19 MAR. 2012

Elaborado por: Lina del Carmen Mordecay Dunoyer

Revisado Por: Gloria Jacqueline Alfonso Roza

Aprobado por: José Luis Salazar López

OKH