

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

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

Teléfono: (57-1) 347 3811
Telefax: (57-1) 211 8850
(57-1) 700 4814

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-097893-00005-0000

Fecha: 2008-12-29 15:57:03 Dep 2020 NUECREACION
Trib. 11 PATENTE/II Evo: 378 FASENACIONAL
Act 329 CTOINFORMACION Folios: 4

Trámite : 011

Evento : 378

Actuación : 329

Referencia : Expediente No. 07097893
Asunto : COMPLEMENTO DE INFORMACIÓN PARA LA SOLICITUD DE
PATENTE: "UN COMPUESTO DE PIRIDIL ÁCIDO ACÉTICO QUE
TIENE UNA ACTIVIDAD INHIBITORIA DE LA PEPTIDASA"
Solicitante : TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED
Clase : A61K 031/044, A61P 003/008, C07D 213/055
Fecha de solicitud : 20 de Septiembre de 2007

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, atentamente me refiero al capítulo reivindicatorio presentado con el Formulario de Modificaciones radicado el 24 de octubre de 2008. Informo a ese Despacho que el mencionado capítulo reivindicatorio presenta errores de transcripción, por lo que adjunto a este memorial uno nuevo con las correcciones pertinentes.

2. Ruego atentamente a la Señora Jefe se sirva aceptar esta corrección y se continúe con el trámite de la presente solicitud.

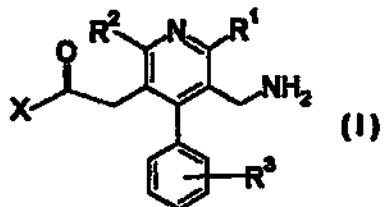
Bogotá,
Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO-14656-841-024-6
LMAILMAID-141170WPC14656
No. M-2008-141170LMA

172
176REIVINDICACIONES

1. Un compuesto caracterizado porque está representado por la fórmula (I):



5

en donde

R^1 es un grupo alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido por un grupo cicloalquilo C_{3-10} ,

R^2 es un grupo alquilo C_{2-6} ,

10 R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_{1-6} o un átomo halógeno, y

X es $-OR^4$ ó $-NR^4R^5$

en donde R^4 y R^5 son cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo hidrocarburo opcionalmente sustituido o un

15 grupo heterocíclico opcionalmente sustituido, R^5 es un grupo hidrocarburo opcionalmente sustituido, un grupo heterocíclico opcionalmente sustituido o un grupo hidroxilo opcionalmente sustituido, o R^4 y R^5 , forman opcionalmente junto con el átomo de nitrógeno adyacente, un heterociclo conteniendo nitrógeno
20 opcionalmente sustituido,
o una sal de los mismos.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque X es $-OH$.

25

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R^1 es un grupo alquilo C_{3-6} .

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R^3 un grupo alquilo C_{1-6} .

30

5. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque es ácido [5-(aminometil)-2-etil-6-isobutil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]acético; ácido [5-(aminometil)-2,6-diisobutil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]acético; ácido [5-(amino metil)-2-etil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilpiridin-3-il]acético; o

35

1-([5-(aminometil)-2-etil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilpiridin-3-il]acetil)-L-prolinamida; o una sal de los mismos.

6. ácido [5-(aminometil)-2-etil-6-isobutil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]acético o una sal del mismo.

7. ácido [5-(aminometil)-2,6-diisobutil-4-(4-metilfenil)piridin-3-il]acético o una sal del mismo.

10 8. ácido [5-(aminometil)-2-etil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilpiridin-3-il]acético o una sal del mismo.

9. 1-([5-(aminometil)-2-etil-4-(4-metilfenil)-6-neopentilpiridin-3-il]acetil)-L-prolinamida o una sal del mismo.

15

10. Una prodroga de caracterizado porque es un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1.

20 11. Un agente farmacéutico caracterizado porque comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo.

25 12. El agente farmacéutico de acuerdo con la reivindicación 11 caracterizado porque es un agente para profilaxis o tratamiento de diabetes, complicaciones diabéticas, tolerancia a glucosa disminuida u obesidad.

30 13. Un inhibidor de peptidasa caracterizado porque comprende un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo.

14. El inhibidor de acuerdo con la reivindicación 13, caracterizado porque la dipeptidil peptidasa es peptidasa-IV.

35 15. La utilización de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo caracterizada porque es para producción de un agente para profilaxis o tratamiento de diabetes, complicaciones diabéticas, tolerancia a glucosa disminuida u obesidad.

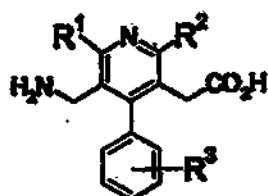
40

16. La utilización de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo caracterizado porque es para producción de un inhibidor de peptidasa.

- 5 17. Un método para prevenir o tratar diabetes, complicaciones diabéticas, tolerancia a glucosa disminuida u obesidad en un mamífero caracterizado porque que comprende administrar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo a dicho mamífero.

- 10 18. Un método para inhibir peptidasa en un mamífero caracterizado porque comprende administrar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una prodroga del mismo a dicho mamífero.

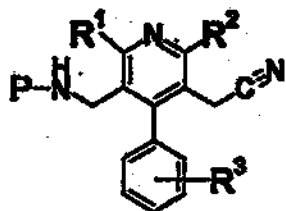
- 15 19. Un método para producir un compuesto caracterizado porque está representado por la fórmula (I-a)



I-a

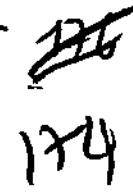
en donde

- 20 R¹ es un grupo alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido por un grupo cicloalquilo C₃₋₁₀,
 R² es un grupo alquilo C₂₋₆, y
 R³ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁₋₆ o un átomo halógeno, o una sal del mismo, que comprende someter un compuesto
 25 representado por la fórmula (1):



1

en donde P es un átomo de hidrógeno o un grupo protector amino, y R¹, R² y R³ son cada uno iguales a los definidos anteriormente, o una sal de los mismos, a hidrólisis y desprotección.



SUPERINTENDENCIA

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-50514

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO COMPUESTOS DE PIRIDINA COMO INHIBIDORES
DE DIPEPTIDIL PPTIDASA IV

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL CO2D 213/80, 401/12, 41405/109/12
CO2D 405/12, CO2F 9/40, A61K 31/4402
A61P 3/10

71. SOLICITANTE TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

DOMICILIO OSAKA, JAPÓN

74. **APODERADO** Emilio Jurelo
cc. 438.019 de US en un

22. BOGOTÁ, D. C.,

Publications

ה'תש"ח

Complemento 10.º

פלו. עזב. יאב

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Red: 08-050514-00000-0000
Fax: 005-05-26 16 51 57 Dep. 2020 NUECREACIONES
TEL 11 PATENTEYS
Bpx: 378 FASENACIONAL
A2411 PRESENTACION FASEC 002

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL 31-05-06

SOLICITUD DE:

- 1 ☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ Capítulo I. ☐ Capítulo II.

2
SOLICITANTE
(71)

Nombre: **TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED**
sociedad constituida y existente bajo las leyes de Japón.

Dirección: 1-1, Doshomachi 4-chome,
Chuo-Ku, Osaka-shi
Osaka 5410048
Japón

Domicilio: Osaka 5410048
Japón

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número _____

3
REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **EMILIO FERRERO**
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 38 11
Fax: 211 88 80
E-mail: clientes@canvya.com
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número **438.019 T.P 31.828**

4
INVENTOR (ES)
(72)

1. **Satoru OI**
c/o Takeda Pharmaceutical company
Limited
17-85, Jusohonmachi-2-chome
Yodogawa-ku, Osaka-shi
Osaka 532-8588
Japón

3. **Nobuhiko SUZUKI**
c/o Takeda Pharmaceutical company
Limited
10, Wadal, Teikuba-shi
Ibaraki 300-4293
Japón

2. **Hironobu MAEZAKI**
c/o Takeda Pharmaceutical company
Limited
17-85, Jusohonmachi-2-chome
Yodogawa-ku, Osaka-shi
Osaka 532-8588
Japón

5
PCT (88)

Solicitud Internacional No. **PCT/JP2004/016457**

Fecha: **28 de octubre de 2004**

Publicación Internacional No. **WO 2005/042488 A1**

Fecha: **12 de mayo de 2005**

6
Título (84)

COMPUESTOS DE PIRIDINA COMO INHIBIDORES DE DIPEPTIDIL PEPTIDASA IV

7

Clasificación Internacional (81) C07D 213/80, 401/12, 413/06, C07F 9/40,
C07D 409/12, 405/12, A61K 31/4402,

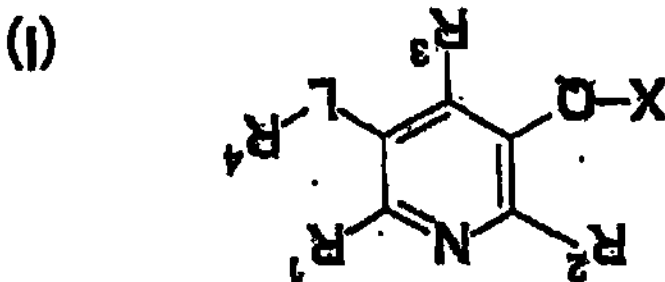
A61P 3/10.

8 Prioridad ☒ SI ☐ NO	(33) País de Origen	JP JP JP	(32) Fecha	31 de octubre de 2003 8 de febrero de 2004 3 de junio de 2004	(31) Número de Solicitud	2003-973776 2004-030491 2004-168877
	Comprobante de pago No.: 08-38,151 Fecha: 15 de mayo de 2008					

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 453.000.00.
- ☒ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, el fuere el caso.
- ☒ Documento de posesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☒ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☒ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☒ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☒ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☒ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Art. final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patentes o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relaciones parciales o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

FIGURA CARACTERÍSTICA



COMPUESTOS DE PIRIDINACampo técnico

La presente invención se refiere a un compuesto de piridina que posea actividad inhibitoria de peptidasa, el cual es útil como agente para profilaxis o tratamiento de diabetes y lo similar.

Técnica anterior

La peptidasa es conocida por que está relacionada con diversas enfermedades. La dipeptidil dipeptidasa-IV (más adelante en la presente a veces abreviado como DPP-IV), es un tipo de peptidasa, la cual es proteasa de serina que enlaza específicamente con un péptido que contiene prolina (o alanina) al segundo N-terminal y segmenta el lado C-terminal de la prolina (o alanina) para producir dipeptido. Se ilustra la DPP-IV por un molécula similar a CD26, y fue informado que también está involucrada en el sistema inmunológico. Mientras el papel de la DPP-IV en mamíferos no ha sido completamente esclarecido, se considera que juega un papel importante en el metabolismo de neuropéptidos, activación de células T, adherencia de células cancerosas a las células endoteliales, invasión del VIH en células y lo similar. Particularmente, desde el aspecto del glucometabolismo, la DPP-IV está involucrada en la inactivation de GLP-1 (péptido-1 similar a glucagón) y GIP (péptido inhibitorio gástrico/péptido insulíntrópico

ácido trifluoroacético (2 mL) fue agregado a la capa orgánica y la mezcla fue agitada por 2 hrs. El solvente fue evaporado bajo presión reducida y el residuo fue purificado por HPLC preparativa para dar ditrifluoroacetato de 5-(aminometil)-N,6-diisobutil-2-metil-4-(4-metilfenil)nicotinamida (22.4 mg, rendimiento 63%) como un aceite amarillo.

EIMS (M+1): 368

Fueron sintetizados los compuestos de Ejemplos 114-168 de los ácidos nicotínicos y amina que corresponden a las Tablas 1-4 siguientes según un método similar al método del Ejemplo 113. Fueron obtenidos los compuestos de los Ejemplos 162-164 en forma libre neutralizando el trifluoroacetato de amida nicotínica resultante con carbonato hidrógeno de sodio acuoso saturado.

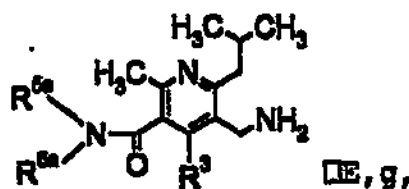


Tabla 1

Ejemplo	-NR ^{5a} R ^{5b}	-R ³	EIMS (M+1)	HA
113		4-Me-Fenilo	368	2CF ₃ COOH
114		4-Me-Fenilo	368	2CF ₃ COOH
115		4-Me-Fenilo	380	2CF ₃ COOH

S 10.

187
179

275

116		4-Me-Fenilo	402	2CF ₃ COOH
117		4-Me-Fenilo	416	2CF ₃ COOH
118		4-Me-Fenilo	384	2CF ₃ COOH
119		4-Me-Fenilo	432	2CF ₃ COOH
120		4-F-Fenilo	436	2CF ₃ COOH
121		2,6-di-F-Fenilo	454	2CF ₃ COOH
122		4-Me-Fenilo	460	2CF ₃ COOH
123		4-F-Fenilo	464	2CF ₃ COOH
124		2,6-di-F-Fenilo	482	2CF ₃ COOH
125		4-Me-Fenilo	430	2CF ₃ COOH
126		4-F-Fenilo	434	2CF ₃ COOH
127		2,6-di-F-Fenilo	452	2CF ₃ COOH

Tabla 2

Ejemplo	-NR ¹ R ²	-R ³	EIMS (M+1)	HA
128		4-Me-Fenilo	437	2CF ₃ COOH

182
180

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO

Radicación 07-97893
Trámite 011
Evento 378
Actuación 430
Oficio
Folios 010

0 2 3 3 5

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (Fase Nacional)

☒

Cap. I

☒

Cap. II

☐

No. Sol. Internacional

PCT/JP2006/304177

Fecha de Presentación Internacional

24/02/2006

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios 63 a 139 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 172 a 174 modificado.

Prioridad: Folio 1 JP 2005-052018 del 25/02/2005.

2. Objeto de la invención

Título: UN COMPUESTO DE PIRIDIL ACIDO ACETICO QUE TIENE UNA ACTIVIDAD INHIBITORIA DE LA PEPTIDASA.

Objeto: La solicitud consiste en compuestos derivados de 5- aminometilpiridina de fórmula general (I) con actividad inhibitoria de peptidasa IV (DPP-IV) así como sus composiciones farmacéuticas.

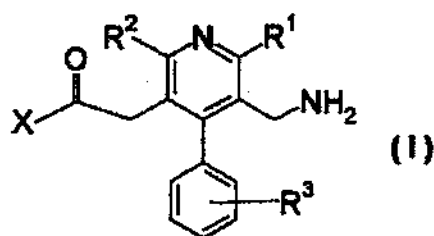
El problema planteado es proveer nuevos compuestos inhibidores de la DPP-IV con mejores propiedades de eficacia y especificidad que los ya existentes.

Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona derivados de 5- aminometilpiridina de fórmula (I) y sus composiciones farmacéuticas.

EXP 2007 097893

188 181

Reivindicaciones 1 a 14: Compuestos de fórmula general (I).



Reivindicaciones 15 y 16: Utilización de un compuesto de fórmula (I).

Reivindicaciones 17 a 19: Métodos para prevenir o tratar diabetes y complicaciones diabéticas.

Se catalogó la invención según la IPC así: C07D 213/55, A61K 31/4427 y A61P 3/08.

3. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En el capítulo reivindicatorio se utilizan términos muy generales como *heterociclo*, *prodroga*, *inhibidor de peptidasa* y *agente farmacéutico* que no son concisos y con los cuales se estaría reivindicando materia que no esta comprendida en la invención de acuerdo a lo soportado en la descripción.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D 486 literal a)-d))

Las reivindicaciones 17 a 19 se refieren a métodos de tratamiento, lo cual no es patentable de acuerdo a este artículo.

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

Las reivindicaciones 15 y 16 indican el uso de compuestos de fórmula (I), lo cual no se considera como invención y por lo tanto no es patentable

6. 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 25/02/2005, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	CO 200650514	COMPUESTOS DE PIRIDINA COMO INHIBIDORES DE DIPEPTIDIL PEPTIDASA IV.	03/06/2004 (fecha de prioridad)
D1. Divulga compuestos derivados de 5-aminometilpiridina inhibidores de DPP-IV sus procesos de obtención y sus composiciones farmacéuticas.			

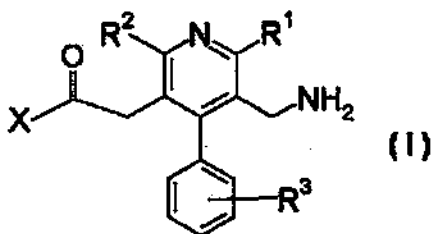
EXP 2007 097893

7. 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.

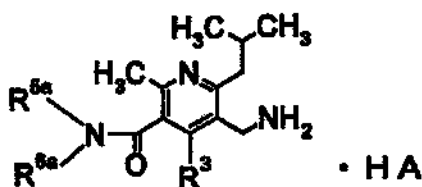
Novedad: (artículo 16 D 486)

La reivindicación 1 reclama compuestos derivados de 5-aminometilpiridina de fórmula (I)



Donde R¹ es isobutil
R²=R³= metil
X = NRR'

El documento D1 divulga procesos de síntesis y composiciones farmacéuticas de compuestos derivados de 5-aminometilpiridina de fórmula (Tablas 1 a 4 folios 509 a 513):



Comparando elemento por elemento la fórmula general (I) con la fórmula divulgada en D1, encontramos que tienen las mismas características estructurales y el mismo significado en los sustituyentes, encontrándose compuestos comunes, entre ellos los ejemplos de las tablas 1 a 4 de D1.

Estos compuestos particulares de D1 afectan la novedad de la fórmula general (I) de la reivindicación 1 de la presente solicitud, por lo tanto el objeto reivindicado no cumple con el requisito de novedad.

8. Conclusión

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	CO 200650514	1 a 14	Novedad

183
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 quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.



JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
_____ 19 FEB. 2011

CONCEPTO TECNICO No. 126

EXAMINADOR TECNICO
Código No. 202077