

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-68491- -7	FECHA: 2015-12-17 13:50:40
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 TRASLADOINFORME	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 14-68491- -7
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 15124
 Folios: 7

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2012/071398				
Fecha de Presentación Internacional	29/10/2012				

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:	Radicado N° 14-068491-00000-0000	31/Marzo/2014
Reivindicaciones:	Radicado N° 14-068491-00000-0000	31/Marzo/2014
	Radicado N° 14-068491-00002-0000	19/Junio/2014
	Radicado N° 14-068491-00006-0000	04/Diciembre/2015
Respuesta de la solicitante:	Radicado N° 14-068491-00006-0000	04/Diciembre/2015
Prioridad:	EP 11187967.2	04/Noviembre/2011

2. Análisis de la Prioridad

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

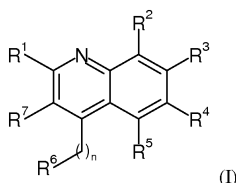
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por la solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a 16 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. 14-068491-00006-0000).

Título de la solicitud: “NUEVOS DERIVADOS DE ARIL-QUINOLINA”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos inhibidores de la actividad FABP 4/5 útiles en el tratamiento de la lipodistrofia, diabetes tipo 2, dislipidemia, aterosclerosis y enfermedades del hígado como inflamación, esteatosis y fibrosis.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I).



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/47 // 1/4709; A61P 3/10 // 35/00; C07D 215/56 // 401/04 // 401/14 // 413/04

4. De la solicitud de patente

Título

El título de la solicitud es general y ambiguo dado que se menciona de forma general el núcleo de aril-quinolina, el cual relaciona todos aquellos compuestos que comprenden dicho núcleo, sin embargo no todos ellos hacen parte del objeto de la solicitud. Se sugiere modificar el título, teniendo en cuenta que esta divulga y reclama compuestos derivados de ácido 4-aril-quinolina-3-carboxílico que actúan como inhibidores de la actividad FAB 4/5. Adicionalmente, se le recuerda a la solicitante que el título no debe referirse a atributos, por lo que se sugiere que la expresión “nuevos” sea eliminada.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

1- La reivindicación 1 no es clara porque la expresión “sales o ésteres farmacéuticamente aceptables” no es limitativa, por lo que no permite comprender los alcances de la materia reclamada. Se sugiere a la solicitante eliminar este término del capítulo reivindicatorio y mencionar las características estructurales de los compuestos reclamados de forma concreta.

Las reivindicaciones 1 y 2 no son concisas porque las definiciones de los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ así como la definición de la variable “n” dan lugar a una gran cantidad de compuestos posibles, que no están debidamente soportados por la descripción. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
R ¹	Ciclopropilo, -CH(CH ₃) ₂ , -OCH ₃ , -Piperidin-1ilo, -C(=O)NHCH ₃ , -OCH ₂ CF ₃ , morfolin-4il, -OCH(CH ₃) ₂ , -ciclopentilo, 4,4-difluor-piperidin-1-il, pirrolidin, dimetilamino, dietilamino, hidroximetil, 2,2,2-trifluor-etil, 2-oxo-pirrolidin-5 1-il, isopropil-metil-amino, isopropil-metil-amino, (2-hidroxi-etil)-metil-amino, (2-metoxi-etil)-metil-amino, etil-metil-amino, 2-metil-pirrolidin-1-il, 2,2,2-trifluor-1-metil-etoxi, 2-metil-pirrolidin-1-il, metil-amino, 2-metil-pirrolidin-1-il, pirrolidin-2-ona, ciclobutil, pentan-3-il,
R ²	H, metilo, etilo, fluor, dimetilamino,
R ³	H, -Cl,
R ⁴	-Cl, H, etilo, ciano,
R ⁵	-H, metoxi, trifluormetil,
R ⁶	Fenilo, 3-clorofenilo, 2-fluorfenilo, 2-clorofenilo, 2-trifluorometilfenil, 3-trifluor-metoxi-fenil, 3-isopropil-fenil, 3-etoxi-fenil, 3-cloro-4-fluor-fenil, 2-metoxi-bencil, 2,2,2-trifluor-etil, 2-trifluor-metoxi-fenil, 3-cloro-4-fluor-5 fenil, 3-etoxi-fenil, 3-iso-propil-fenil, (3-isopropil-fenil, 2-metil-piridin-4-il,

2- Las reivindicaciones 2, 4, 8 y 9 no son claras porque los términos “heterocicloalquilo”, “alquilo”, “haloalquilo”, “alcoxi” y “alquilos” son generales, por lo que no limitan claramente la materia reclamada. Se sugiere reemplazar dichos términos por definiciones concretas de este sustituyente.

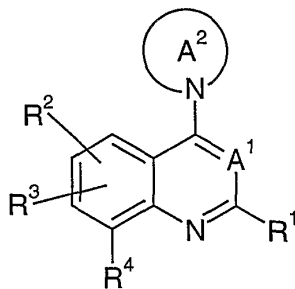
Se sugiere hacer las aclaraciones que se consideren pertinentes.

5. 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: 04 de noviembre de 2011 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

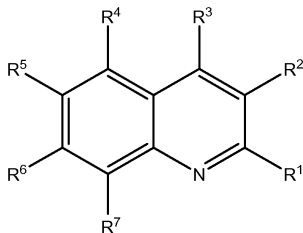
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO0220488	“Quinoline and quinazolidine derivatives”	14/Marzo/2002
D6	WO 2008049047	“Quinoline compounds”	24/Abril/2008

El documento D1¹ divulga composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos derivados de quinolinas útiles en el tratamiento de la diabetes, artritis, enfermedades cardiovasculares, falla renal, desórdenes alimenticios y obesidad (Resumen y Pág. 54, Ej. A).



¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0220488A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20020314&DB=&&locale=en_EP

El documento D6² divulga compuestos de quinolina moduladores de receptores X de hígado (LXR) útiles para el tratamiento de enfermedades como aterosclerosis, diabetes tipo I y tipo II, obesidad y desordenes lipídicos (Resumen; Pág. 11 líneas 30-32).

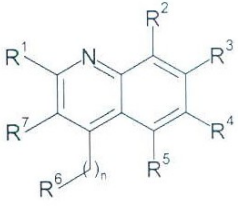
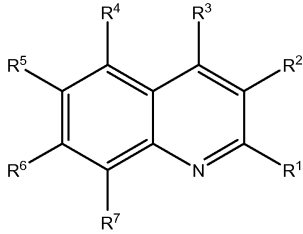
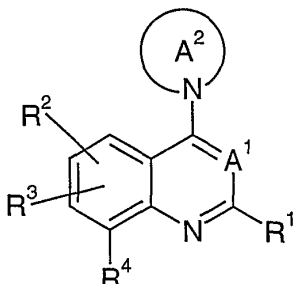
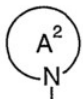


6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

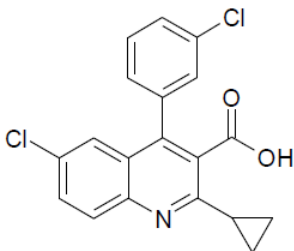
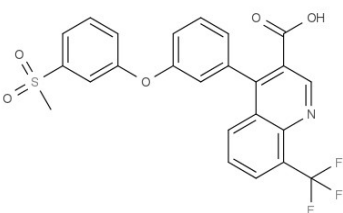
Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Compuestos de fórmula (I) (...)” (Radicado N°. 14-068491-00006-00000).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D6	D2
Un compuesto de fórmula (I):  (I) R⁵ es H n es = 0 o 1 Al menos uno de R²-R⁵ es diferente de hidrogeno	Un compuesto de fórmula (I)  (Pág. 250, Reivindicación 1)	Un compuesto de fórmula (I)  (Pág. 57, Reivindicación 1)
R¹ es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₁-C₆, hidroxialquilo C₂-C₄, heterocicloalquilo, amino, aminocarbonilo R¹ no es metilo o etilo	R¹ es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, NH₂, NH(alquilo C₁-C₆), o N(alquilo C₁-C₆)₂;	R¹ es alquilo, cicloalquilo, aralquilo o trifluoroalquilo
R² es hidrógeno, halógeno, es alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o amino sustituido con alquiloC₁-C₆	R⁵, R⁶, R⁷ es, independientemente: hidrógeno, R^c, alquilo C₁-C₂₀ o haloalquilo C₁-C₂₀	R⁴ es hidrógeno
R³ es hidrógeno, alcoxiC₁-C₆, halógeno		R² es hidrógeno, alquilo, alcoxi, hidroxi, halógeno, trifluoroalquilo, o difluoroalkoxy trifluoroalcox y R³ es arilo o heteroarilo
R⁴ hidrógeno, halógeno, alquiloC₁-C₆, nitro o ciano		
R⁶ es fenilo sustituido, piridinilo o piridinilo sustituido	R³ es C₆-C₁₄ arilo o heteroarilo de 5-14 átomos, los cuales están sustituido con 1-2 R¹⁰, y opcionalmente sustituido con de 1 -4 R^e	
R⁷ -COOH o tetrazol-5ilo	R² es X-R⁸, donde X es -C(=O)O	A es CH o N

²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument;jsessionid=zzVHhFmy456m6ySaWDHu5lc1.espacenet_levelx_p rod_1?CC=WO&NR=2011025927A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20110303&DB=&&locale=en_EP

Características esenciales	D6	D2
	y R ⁸ es H	
Comparación de ejemplos específicos		
 Pág. 53, Ejemplo 6	 ácido 4-{3-[3-(metilsulfonyl)fenoxi]fenil}-8-(trifluorometil)quinolina-3-carboxílico (Reivindicación 44)	

El documento D6 se considera el estado de la técnica cercano a la solicitud definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos derivados de quinolina, útiles como agentes terapéuticos para el tratamiento de enfermedades y desordenes asociados con LXR entre las que se encuentran aterosclerosis, diabetes tipo I y tipo II, obesidad y desordenes lipídicos (Resumen; Pág. 11 líneas 30-32) (Resumen).

La diferencia entre los compuestos reclamados de acuerdo a la reivindicación 1 y aquellos divulgados por el documento D6, consiste en los sustituyentes encontrados en la posición 2 de la quinolina, dado que en los compuestos reclamados el sustituyente R¹ corresponde a un cicloalquilo, mientras que en los compuestos divulgados por el documento D6 este sustituyente es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, NH₂, NH(alquilo C₁-C₆), o N(alquilo C₁-C₆)₂.

No hay evidencia de un efecto técnico asociado a la modificación de la estructura central de los compuestos reclamados, toda vez que el documento D6 no muestra una evaluación del efecto como inhibidores de la actividad FABP 4/5 de los compuestos allí reclamados, de esta forma no es posible realizar una comparación entre estos compuestos y los reclamados por la solicitud.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver la solicitud en estudio se puede considerar como la necesidad de proporcionar compuestos útiles en el tratamiento de la diabetes.

Sin embargo, la inclusión de grupos cicloalquilo en la posición 2 de un anillo de quinolina se había divulgado en el documento D1 que se refiere a divulga composiciones farmacéuticas que comprenden compuestos derivados de quinolinas útiles en el tratamiento de la diabetes, artritis, enfermedades cardiovasculares, falla renal, desórdenes alimenticios y obesidad, donde el sustituyente R¹ es cicloalquilo (Resumen; Pág. 57, Reivindicación 1).

Por lo tanto, la persona del oficio normalmente versada en la materia, modificaría la estructura de los compuestos del documento D6, incluyendo grupos cicloalquilo de acuerdo a lo enseñado en el documento D1, llegando así al objeto de la reivindicación 1, por lo que la materia allí reclamada se considera obvia.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en los documentos D6 y D1, carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones 2 a 16 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

Conclusión:

Las reivindicaciones 1 a 16 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18)

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO0220488	1-16	Nivel Inventivo
D6	WO 2008049047	1-16	Nivel Inventivo

8. Respuesta a los argumentos de la solicitante

La solicitante afirma que los compuestos de la solicitud difieren de los compuestos reclamados en el documento D1 por la presencia de un grupo ácido carboxílico en la posición 3 del anillo de quinolina, y que dicha diferencia no se sugiere en el documento D2.

Frente a este argumento, y teniendo en cuenta que la solicitud se limita ahora a los compuestos en los que el sustituyente R⁷ es un grupo ácido carboxílico o un grupo tetrazolilo, diferenciando los compuestos reclamados de aquellos divulgados en el documento D1, esta Oficina consideró pertinente realizar una nueva búsqueda, en la que se encontró el documento D6, que afecta el requisito de nivel inventivo como se mostró anteriormente.

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 del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2015-12-22

Elaboró: Ruth Andrea Rodriguez
Revisó: Dayron Alexander Ramirez Reyes

INFORME DE BÚSQUEDA DE PATENTES PARA EL RADICADO 14-068491-00006-0000						
CRITERIOS PARA LA BÚSQUEDA						
Palabras clave utilizadas		Quinoline AND acid type II diabetes				
CLASIFICACIONES INTERNACIONALES UTILIZADAS PARA LA BÚSQUEDA		A61K31/4709;				
BASES DE DATOS CONSULTADAS.						
Google patents		Espacenet		PubChem		
INFORMES DE EXÁMENES REALIZADOS EN OTRAS OFICINAS						
Oficina	Fecha del examen o de reporte de búsqueda de documentos	Anterioridades encontradas para el examen o reportados en el examen de búsqueda(relacionarlos todos)	Reiv. afectadas	RELEVANCIA (requisito que afecta)	FUERON TENIDOS EN CUENTA PARA EL EXAMEN EN LA OFICINA COLOMBIANA	
					SI	NO
EUROPEA	20/05/2014	EP0421456				X
		EP0585913				X
		WO2004063156				X
		US2011237575				X
USPTO	24/12/2014	US2010125091				X
		US2010125091				X
DOCUMENTOS ADICIONALES ENCONTRADOS POR EL EXAMINADOR DE ACUERDO A LOS CRITERIOS DE BÚSQUEDA.						
WO 2008049047						
BÚSQUEDA DE SECUENCIAS						
Número de depósito / patente y N° de secuencia % de identidad						
SEQ ID NO (de la solicitud)	NCBI	The Lens	EMBL-EBI	DDJB	Genome Quest	
N/A						