

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-166876- -4	FECHA: 2015-12-17 14:52:03
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8
ACT: 519 TRASLADOINFORME	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

Asunto: Radicación: 14-166876- -4
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 15261
Folios: 8

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/JP2013/050710				
Fecha de Presentación Internacional	17/01/2013				

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° 14-166876-00000-0000	31/Julio/2014
Reivindicaciones:	Radicado N° 14-166876-00000-0000	31/Julio/2014
	Radicado N° 14-166876-00001-0000	04/Septiembre/2014
Prioridad:	JP 2012-007840	18/Enero/2012

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

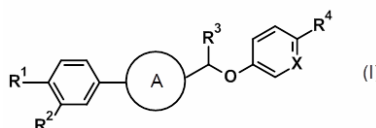
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por la solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud 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 10 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. 14-166876-00001-0000).

Título de la solicitud: “DERIVADO DE FENILAZOL SUSTITUIDO”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar, desarrollo de un agente hipoglucémico oral que puede resolver los efectos secundarios de los encontrados para la farmacoterapéutica convencional para la diabetes.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de fenilazol sustituidos que tienen un efecto hipoglucémico y/o un efecto de protección de células o páncreas, o sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que contienen aquellas como un ingrediente activo. Los compuestos de la solicitud presentan la fórmula (I):



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/4192 // 31/421 // 31/4245 // 31/426 // 31/427 // 31/4439; A61P 1/18 // 3/04 // 3/10; C07D 249/06 // 263/32 // 271/06 // 277/30 // 401/12 // 413/12 // 417/12

4. De la solicitud de patente

Titulo

El título de la solicitud no corresponde con el objeto de la solicitud dado que se menciona de forma general el núcleo de fenilazol, 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 de la solicitud, teniendo en cuenta que esta divulga y reclama compuestos derivados de oxialquil-aril-[tetrazol/triazol/tiazol/oxazol/oxadiazol]-[benzamida/urea] que actúan como protectores de las células β pancreáticas.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

1. Las reivindicaciones 1-10 no están soportadas en la descripción porque se reclaman sales farmacéuticamente aceptables de los compuestos de fórmula (I), sin embargo, el capítulo descriptivo no muestra desarrollo de dichas sales, por lo que se sugiere eliminar de las reivindicaciones esta característica.
2. La reivindicación 10 no es clara al tratarse de una composición que incluye a alguno de los compuestos de fórmula (I), sin embargo, este tipo de productos deben definir sus componentes en términos de denominación común internacional o nombre IUPAC y de los excipientes de formulación, estableciendo además sus proporciones. Es importante mencionar que el capítulo descriptivo no se muestra desarrollo de composiciones, sino que únicamente se limita a la mención o sugerencia de los ingredientes.

S sugiere hacer las aclaraciones que se consideren pertinentes.

5. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 5 grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

1. Grupo 1: Compuestos en los cuales A = triazolil. Reivindicaciones 1 y 9 parcialmente y 2 totalmente.
2. Grupo 2: Compuestos en los cuales A = tetrazolil. Reivindicaciones 1 y 9 parcialmente y 3 totalmente.
3. Grupo 3: Compuestos en los cuales A = tiazolil. Reivindicaciones 1 y 9 parcialmente y 4 totalmente.
4. Grupo 4: Compuestos en los cuales A = oxazolil Reivindicaciones 1 y 9 parcialmente y 5 totalmente.
5. Grupo 5: Compuestos en los cuales A = oxadiazolil Reivindicaciones 1 y 9 parcialmente y 6 a 8 totalmente. (divulgados en el documento D1)

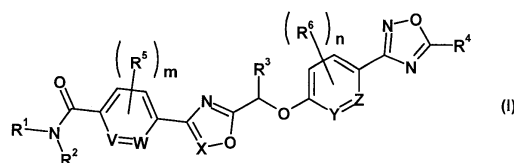
Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a un solo grupo inventivo, eliminando de ella las otras invenciones.

6. Determinación del Estado de la Técnica

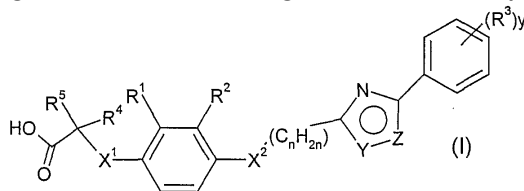
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 18 de enero de 2012 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	CA2770404	"Amide derivative"	10/Febrero/2011
D2	WO 2002046174	"1, 2, 4-oxadiazole derivatives as HPPAR alpha agonists"	13/Junio/2002
D3	WO 2005115383	"Substituted triazoles as modulators of PPAR and methods of their preparation"	08/Diciembre/2005

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de amida de fórmula (I) que tienen actividad como hipoglicémicos y/o protectora de células β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0001]; Pág. 3, Párr. [0008]).



El documento D2² divulga compuestos de fórmula general (I) o sus sales farmacéuticamente aceptables, que actúan como inhibidores de PPAR útiles como agentes terapéuticos de enfermedades mediadas por esta proteína entre las cuales se encuentra la diabetes (Pág. 1, líneas 3-5; Pág. 3, líneas 1-26).

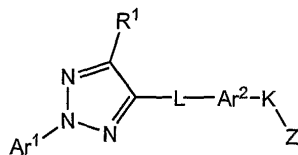


El documento D3³ divulga compuestos derivados triazol de fórmula (I), sus sales farmacéuticamente aceptables, solvatos, hidratos y profármacos útiles para el tratamiento de condiciones mediadas por PPAR tales como las relacionadas con el metabolismo de glucosa, lípidos y secreción de insulina, específicamente diabetes tipo 2 (Resumen).

¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2770404C&KC=C&FT=D&ND=&date=20140422&DB=&locale=en_EP

²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0246174A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20020613&DB=&locale=en_EP

³http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2007039178A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20070412&DB=&locale=en_EP



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Para el Grupo Inventivo 5

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto representado por la fórmula general (I) en donde el anillo A representa: (...)” (Radicado N°. 14-1666876-00001-00000).

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I): O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo Donde X es CH o N	Un compuesto de fórmula (I) Donde Y, V y W son CH (Pág. 120, Reivindicación 1)	Un compuesto de fórmula (I) (Pág. 28, Reivindicación 1) X ² es O o S;
A Representa: 	 X es CH o N	 Donde uno de Y o Z es N y el otro es O
R ¹ Representa -C(=O)-NH-R ⁵ , -NH-C(=O)-NH-R ⁵ , o - S(=O) ₂ R ⁵	-C(=O)-NR ¹ R ²	Cada R ³ es halógeno, CF ₃ , alquiloC ₁₋₆
R ² representa -F o -H	R ⁵ representa un átomo de halógeno o un alquiloC ₁₋₆	
R ³ Representa CH ₃ , -C ₂ H ₅	R ³ representa alquiloC ₁₋₆	-H
R ⁴ representa 	 Donde R ⁴ representa alquiloC ₁₋₆	-X ¹ -CR ⁴ R ⁵ -C(=O)-OH X ¹ es O o S; R ⁴ y R ⁵ son H o alquiloC ₁₋₆
R ⁵ representa -H, alquiloC ₁₋₆ , cicloalquilo C ₃₋₆ , o: 	R ¹ es H, alquiloC ₁₋₆ y R ² es H, alquiloC ₁₋₆ que esta opcionalmente sustituido por un grupo -OH	No se menciona
Comparación de ejemplos específicos		
 Pág. 170, Ej. 39	 (Pág. 80, Ej. 2)	 éster etílico del ácido 2-metil-2-[4-[5-(4-trifluorometil-fenil)-[1,2,4]oxadiazol-3-ilmetoxi]-fenoxi]-propiónico (Pág. 30, líneas 9-10)
 Pág. 231, Ej. 69	 (Pág. 111, Ej. 57)	

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano al grupo inventivo 5 de la solicitud definido en la reivindicación 1 porque divulga compuestos derivados de

amida de fórmula (I) que tienen actividad como hipoglicémicos y/o protectora de células β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0029]).

La diferencia entre los compuestos reclamados de acuerdo a la reivindicación 1 y aquellos divulgados por el documento D1, consiste en la disposición de los sustituyentes sobre el anillo de oxadiazol, dado que en los compuestos reclamados el sustituyente sobre el carbono 5 del oxadiazol es fluoro-fenilo y el sustituyente sobre el carbono 3 de dicho anillo es un grupo alquiloxi, mientras que en los compuestos divulgados por el documento D1 estos sustituyentes se encuentran en posiciones intercambiadas.

No existe evidencia un efecto técnico asociado a la modificación en la distribución de los sustituyentes sobre el anillo de oxadiazol en la actividad como hipoglucémico de los compuestos reclamados, toda vez que el documento D1 menciona una reducción de AUC de glucosa en plasma entre el 5-20% (Pág. 117, Párr. [0385]) mientras que la solicitud establece un valor de 4% para esta misma prueba técnica (Pág. 182).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver la solicitud en estudio se puede considerar como la necesidad de proporcionar compuestos hipoglucémicos orales alternativos a los divulgados por el documento D1.

Sin embargo, el documento D2 divulga compuestos derivados de oxadiazol sustituidos sobre el carbono 5 del oxadiazol con fenilo y con un grupo alquiloxi sobre el carbono 3 de dicho anillo (Pág. 30, líneas 9-10), los cuales actúan como inhibidores de PPAR y son útiles como agentes terapéuticos de enfermedades mediadas por esta proteína entre las cuales se encuentra la diabetes (Pág. 1, líneas 3-5; Pág. 3, líneas 1-26).

Por lo tanto, la persona del oficio normalmente versada en la materia, modificaría los compuestos divulgados en el documento D1, incluyendo un grupo oxadiazol con los sustituyentes dispuestos a lo sugerido en el documento D2, 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 D1 y D2, carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones 6 a 10 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

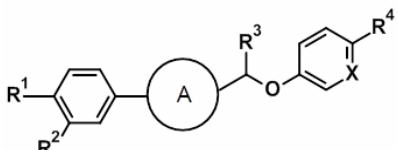
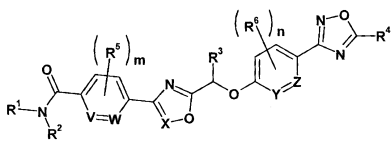
Conclusión:

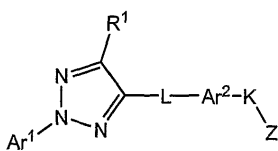
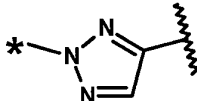
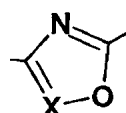
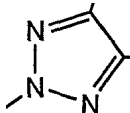
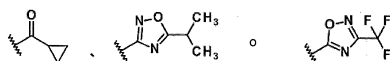
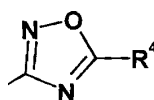
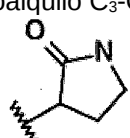
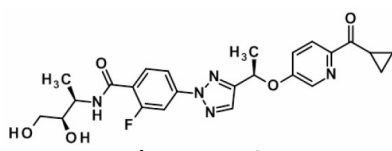
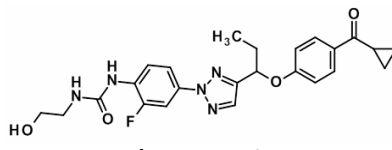
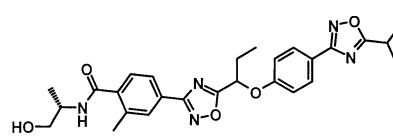
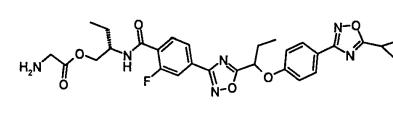
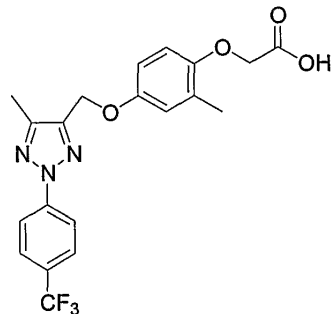
Las reivindicaciones 1 y 6 a 9 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18)

Para el Grupo Inventivo 1

La reivindicación 2 consiste en: “El compuesto de conformidad con la reivindicación 1 caracterizado además porque el anillo A es (...)” (Radicado N°. 14-1666876-00001-00000).

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

Características esenciales	D1	D3
Un compuesto de fórmula (I): 	Un compuesto de fórmula (I) 	Un compuesto de fórmula

O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo Donde X es CH o N	Donde V, W, X, Y y Z son independientemente CH o N. (Pág. 120, Reivindicación 1)	 (I) (Pág. 100, Reivindicación 1) Ar¹ se selecciona de un grupo que incluye fenilo Ar² se selecciona de un grupo que incluye fenilo L es un enlazante de entre 1 y 6 miembros de fórmula – Y¹_mY²_mY³_m–, donde cada Y se selecciona de un grupo que incluye CR⁴R⁵, -O-
A Representa: 		
R ¹ Representa -C(=O)-NH-R ⁵ , -NH-C(=O)-NH-R ⁵ , o – S(=O) ₂ R ⁵	-C(=O)-NR ¹ R ²	Hal, alquilo, haloalquilo, -OR ² , alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, arilalquenilo, arilalquinilo, heterocicilo, heterocicilalquilo, -COR ² , -CO ₂ R ² , -NR ² R ³ , -NO ₂ , -CN, -S(O) _n R ² , -X ¹ R ² , -X ¹ OR ² , -X ¹ R ² , -X ¹ NR ² R ³ , -X ¹ NO ₂ , -X ¹ CN, y – X ¹ S(O) _n R ²
R ² representa –F o -H	R ⁵ representa un átomo de halógeno o un alquiloC ₁ -C ₆	
R ³ Representa CH ₃ , -C ₂ H ₅	R ³ representa alquiloC ₁ -C ₆	R ⁴ y R ⁵ se seleccionan de un grupo que comprende H, halógeno, alquilo, haloalquilo, OR ² , arilo, heteroarilo y arilalquilo
R ⁴ representa 	 Donde R⁴ representa alquiloC₁-C₆	K es un enlazante de entre 1 y 6 miembros de fórmula – Y ⁴ _m Y ⁵ _m Y ⁶ _m –, donde cada Y se selecciona de un grupo que incluye C(=O), CR ⁴ R ⁵ Z se selecciona de un grupo que incluye CH ₂ OR ⁶ , CO ₂ R ⁶ , tetrazol- 5-II, CONHSO ₂ R ² y CHO
R ⁵ representa –H, alquiloC ₁ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , o: 	R ¹ es H, alquiloC ₁ -C ₆ y R ² es H, alquiloC ₁ -C ₆ que esta opcionalmente sustituido por un grupo -OH	No se menciona
Comparación de ejemplos específicos		
 Pág. 140, Ej. 1  Pág. 141, Ej. 2	 (Pág. 80, Ej. 2)  (Pág. 111, Ej. 57)	 (Pág. 92, Ej. 6F)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano al grupo inventivo 1 de la solicitud definido en la reivindicación 2 porque divulga compuestos derivados de amida de fórmula (I) que tienen actividad como hipoglucémicos y/o protectora de células

β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0029]).

La diferencia entre los compuestos reclamados de acuerdo a la reivindicación 2 y aquellos divulgados por el documento D1, consiste en el heteroarilo presente en la zona central del compuesto, dado que en los compuestos reclamados este corresponde a triazol, mientras que en los compuestos divulgados por el documento D1 este es oxadiazol.

No existe evidencia de un efecto técnico asociado a la sustitución del anillo de oxadiazol por uno de triazol en la actividad como hipoglucémico de los compuestos reclamados, toda vez que el documento D1 menciona una reducción de AUC de glucosa en plasma entre el 5-20% (Pág. 117, Párr. [0385]) mientras que la solicitud establece un valor de 4% para esta misma prueba técnica (Pág. 182).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver la solicitud en estudio se puede considerar como la necesidad de proporcionar compuestos hipoglucémicos orales alternativos a los divulgados por el documento D1.

Sin embargo, el documento D3 divulga compuestos derivados de triazol útiles para tratar o controlar enfermedades asociadas con el metabolismo de glucosa y lípidos, así como con la secreción de insulina, entre las cuales se encuentra la diabetes tipo 2 (Pág. 25, Párr. [0103]-[0104]).

Por lo tanto, la persona del oficio normalmente versada en la materia, sustituiría el anillo de oxadiazol en los compuestos del documento D1 por un anillo de triazol de acuerdo a lo enseñado en el documento D3, llegando así al objeto de la reivindicación 2, por lo que la materia allí reclamada se considera obvia.

En consecuencia, la reivindicación 2 de acuerdo a lo divulgado en los documentos D1 y D3, carece de Nivel Inventivo.

Conclusión:

La reivindicación 2 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18)

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CA2770404	1, 2, 6-10	Nivel Inventivo
D2	WO 2002046174	1, 6-10	Nivel Inventivo
D3	WO 2005115383	2	Nivel Inventivo

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 14-166876-00001-0000						
CRITERIOS PARA LA BÚSQUEDA						
Palabras clave utilizadas		Hypoglycemic triazole OR tetrazole OR thiazole OR oxazole OR oxadiazole				
CLASIFICACIONES INTERNACIONALES UTILIZADAS PARA LA BÚSQUEDA		A61K31/41				
BASES DE DATOS CONSULTADAS.						
Google patents			Espacenet			
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	03/07/2015	WO2011016469				X
		WO2011016470				X
		WO2007039178				X
		WO2005115383	2	Nivel Inventivo	X	
		WO0246174	1, 6-10	Nivel Inventivo	X	
		WO2007116229				X
		WO2012050151				X
		WO2013018675				X
DOCUMENTOS ADICIONALES ENCONTRADOS POR EL EXAMINADOR DE ACUERDO A LOS CRITERIOS DE BÚSQUEDA.						
CA2770404						
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						