

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 16-116444- -1	FECHA: 2016-06-07 14:46:32
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 6
ACT: 519 TRASLADOINFORME	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
JOSE ANDRES RINCON USCATEGUI

Asunto: Radicación: 16-116444- -1
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 6700
 Folios: 6

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° 16-116444-00000-0000	04/Mayo/2016
Reivindicaciones:	Radicado N° 16-116444-00000-0000	04/Mayo/2016
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. Presentación de solicitud Fraccionaria (Art 36 D 486)

Se acepta para examen la solicitud fraccionaria presentada e identificada como 16-116444-00000-0000 referenciada bajo el radicado N° 14-166876-00011-0000, porque no implica ampliación de la materia contenida en la solicitud inicial.

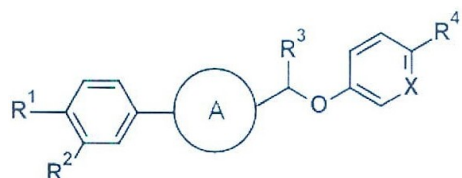
4. Objeto de la invención

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 4 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. 16-116444-00000-0000).

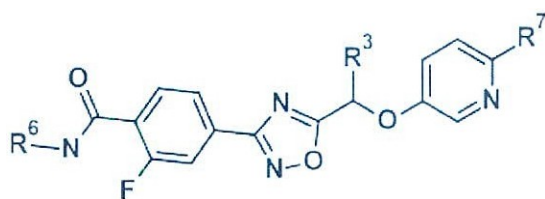
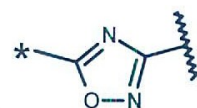
Título de la solicitud: "DERIVADO DE FENILAZOL SUSTITUIDO".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar, desarrollo de un agente hipoglucémico oral que favorezca la protección de las células beta del páncreas.

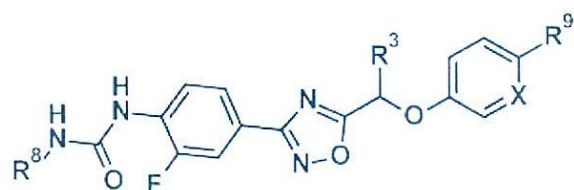
Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de fenilazol sustituidos novedosos que tienen un efecto hipoglucémico y/o un efecto de protección de células o páncreas, o sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que contienen aquellas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



Fórmula (I) Dónde el anillo A representa



Fórmula (II)



Fórmula (III)

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/41 // 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

5. De la solicitud de patente

Título

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, teniendo en cuenta que esta divulga y reclama compuestos derivados de oxialquil-aril-[1,2,4-oxadiazol-(3/5)il]-[benzamida/urea] que actúan como agentes hipoglucémicos o como protectores de las células β pancreáticas.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque todas sus reivindicaciones son independientes, a pesar de pertenecer a la misma categoría y presentar características técnicas similares. Se sugiere modificar la dependencia de las reivindicaciones teniendo en cuenta que las fórmulas (I), (II) y (III) comparten características técnicas, mientras que los compuestos de la reivindicación 4 representan una selección de los compuestos abarcados por dichas formulas.

La reivindicación 4 no es clara porque presenta errores de traducción, estos son evidentes en los compuestos 3 (Pág. 159), 12 (Pág. 160) y 30 (Pág. 61) en los que se emplea el sufijo “-y”, así como en uso de la expresión “and”. Se sugiere reemplazar el sufijo “y” por “/” y la expresión “and” por “y”.

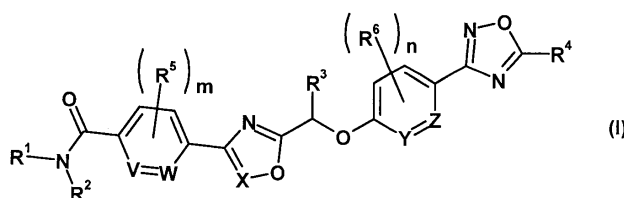
Se sugiere hacer las aclaraciones que se consideren pertinentes.

6. Determinación del Estado de la Técnica

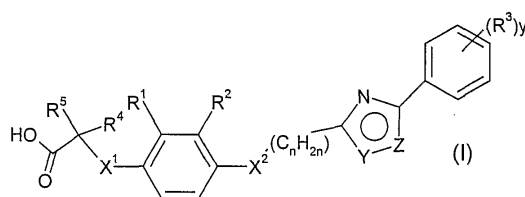
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 18 de enero de 2012 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	CA 2770404	“Amide derivative”	10/Febrero/2011
D2	WO 2002046174	“1, 2, 4-oxadiazole derivatives as HPPAR alpha agonists”	13/Junio/2002

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de amida de fórmula (I) que tienen actividad como agentes hipoglicemiantes y/o protectores de células β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0029]; 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).



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

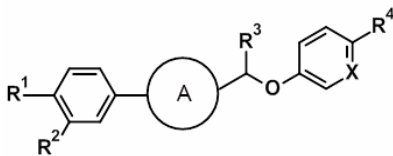
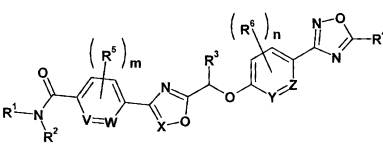
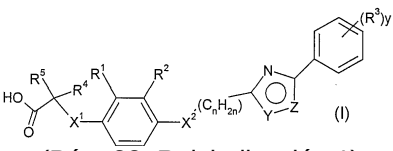
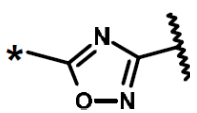
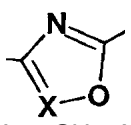
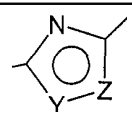
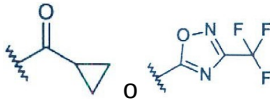
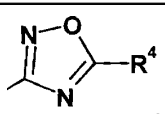
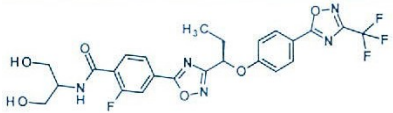
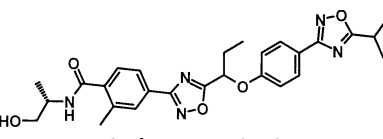
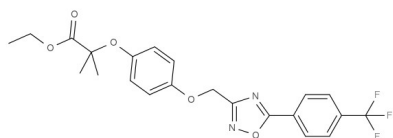
¹ Disponible en línea en: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2770404C&KC=C&FT=D&ND=&date=20140422&DB=&locale=en_EP

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

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°. 16-116444-00000-00000).

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 : -C(=O)-NH-R ⁵ o -NH-C(=O)-NH-R ⁵	-C(=O)-NR ¹ R ²	Cada R ³ es halógeno, CF ₃ , alquiloC ₁₋₆
R ² : -F	R ⁵ : halógeno o alquiloC ₁₋₆	
R ³ : CH ₃ , -C ₂ H ₅	R ³ : alquiloC ₁₋₆	
R ⁴ : 	 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 : -H, alquiloC ₁₋₆ , cicloalquilo C ₃₋₆ , cada uno de los cuales puede ser sustituido con 1 a 3 -OH	R ¹ : 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. 153, Ej. 55	 (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)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la solicitud definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos derivados de amida de fórmula (I) que tienen actividad como hipoglucémicos y/o protectores de células β pancreáticas, así como sus sales farmacéuticamente aceptables 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 heteroátomos, es decir en la orientación espacial del anillo de oxadiazol en la molécula, esto teniendo en cuenta 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 orientación del anillo de oxadiazol en la actividad como hipoglicémico 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. 154, líneas 22-23).

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 que presentan una orientación del anillo de oxadiazol en la que 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 (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).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, modificaría los compuestos divulgados en el documento D1, modificando la orientación del anillo de oxadiazol de acuerdo a lo sugerido en el documento D2, llegando así al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicación 4 no menciona características inventivas adicionales, tampoco se puede considerar inventiva.

Las reivindicaciones 1 y 4 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen 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	CA 2770404	1 y 4	Nivel Inventivo
D2	WO 2002046174	1 y 4	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 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.

Si como respuesta a este requerimiento el solicitante llegara a modificar: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presente un nuevo capítulo reivindicatorio, y desee que se realice un nuevo examen de patentabilidad a esta modificación, no deberá pagar la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente a la tasa de examen de patentabilidad. En todo caso, el número de requerimientos por no patentabilidad estará supeditado a que el término del estudio de patentabilidad no sea superior a 18 meses, contados desde la publicación de la solicitud de patente de invención. Adicionalmente, 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 deberá pagar la tasa 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 2016-06-14

Elaboró: Ruth Andrea Rodriguez

Revisó: Diego Armando Galvis Sanchez

INFORME DE BÚSQUEDA DE PATENTES PARA EL RADICADO 16-116444-00000-0000						
CRITERIOS PARA LA BÚSQUEDA						
Palabras clave utilizadas		Hypoglycemic OR of Antihyperglycemic oxadiazole PPAR agonist				
CLASIFICACIONES INTERNACIONALES UTILIZADAS PARA LA BÚSQUEDA		A61K31/41				
BASES DE DATOS CONSULTADAS.						
Google patents		Espacenet		ScienceDirect		Epoquenet
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				X
		WO0246174	1 y 4	Nivel Inventivo	X	
		WO2007116229				X
		WO2012050151				X
		WO2013018675				X
USPTO	24/06/2015	WO2011016469				X
		WO2011016470				X
		WO2012050151				X
DOCUMENTOS ADICIONALES ENCONTRADOS POR EL EXAMINADOR DE ACUERDO A LOS CRITERIOS DE BÚSQUEDA.						
CA2770404						
CA2770405						
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						

Search results: 28 results found for pub-date > 1996 and pub-date < 2012 and (Antihyperglycemic Agents) and oxadiazole.

 Save search alert |  RSS



 Purchase



Download PDFs



Export



Relevance



All access types

-  **Antihyperglycemic activity of new 1,2,4-oxadiazolidine-3,5-diones** Original Research Article 

European Journal of Medicinal Chemistry, Volume 36, Issue 1, January 2001, Pages 31-42

Michael S Malamas, Janet Sredy, Michael McCaleb, Iwan Gunawan, Brenda Mihan, Donald Sullivan

▸ [Abstract](#) |  [PDF \(174 K\)](#)

-  **Synthesis of dipeptidyl peptidase-4 inhibitors: a brief overview** Review Article 

Tetrahedron, Volume 66, Issues 27-28, 3 July 2010, Pages 4919-4938

Naveen Mulakayala, Upendar Reddy CH, Javed Iqbal, Manojit Pal

▸ [Graphical abstract](#) |  [PDF \(1346 K\)](#) | [Supplementary content](#)

-  **Medicinal chemistry approaches to the inhibition of dipeptidyl peptidase-4 for the treatment of type 2 diabetes** Review Article 

Bioorganic & Medicinal Chemistry, Volume 17, Issue 5, 1 March 2009, Pages 1783-1802

Shrikanth H. Havale, Manojit Pal

▸ [Abstract](#) | ▸ [Graphical abstract](#) |  [PDF \(1140 K\)](#)

-  **Identification of a series of oxadiazole-substituted α -isopropoxy phenylpropanoic acids with activity on PPAR α , PPAR γ , and PPAR δ** 

Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, Volume 11, Issue 17, 3 September 2001, Pages 2385-2388

Kevin G Liu, Jennifer S Smith, Andrea H Ayscue, Brad R Henke, Millard H Lambert, Lisa M Leesnitzer, Kelli D Plunket, Timothy M Willson, Daniel D Sternbach

▸ [Abstract](#) | ▸ [Graphical abstract](#) |  [PDF \(104 K\)](#)

-  **Chapter 7 The Emergence of GPR119 Agonists as Anti-Diabetic Agents** Review Article 

Annual Reports in Medicinal Chemistry, Volume 44, 2009, Pages 149-170

Robert M. Jones, James N. Leonard

▸ [Abstract](#) |  [Purchase PDF](#)