

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 16-116433- -1	FECHA: 2016-06-13 09:45:04
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)
JOSE ANDRES RINCON USCATEGUI

Asunto: Radicación: 16-116433- -1
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 7092
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° 16-116433-00000-0000	04/Mayo/2016
Reivindicaciones:	Radicado N° 16-116433-00000-0000	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 16-116433-00000-0000 referenciada bajo el radicado N° 14-166876-00009-0000, porque no implica ampliación de la materia contenida en la solicitud inicial.

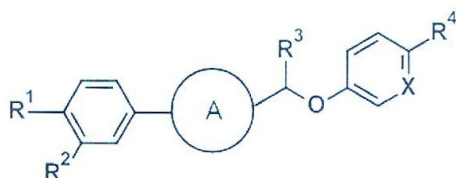
4. Objeto de la invención

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 2 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. 16-116433-00000-0000).

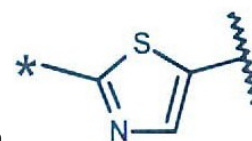
Título de la solicitud: "DERIVADO DE FENILAZOL SUSTITUIDO".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar, un agente hipoglucemiante oral capaz de disminuir los efectos adversos de los agentes ya existentes.

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):



Dónde el anillo A representa



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

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 ciclopropilcarbonil-oxialquil-aril-1,3-tiazol-2-il-benzamida o 4-(alquilsulfonyl)fenil-1,3-tiazol-5-il-oxialquil-aril-1,2,4-oxadiazol que actúan como agentes hipoglucémicos o como protectores de las células β pancreáticas.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y 2 no son claras ni se encuentran sustentadas en la descripción porque 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.

Se sugiere hacer las aclaraciones que se consideren pertinentes.

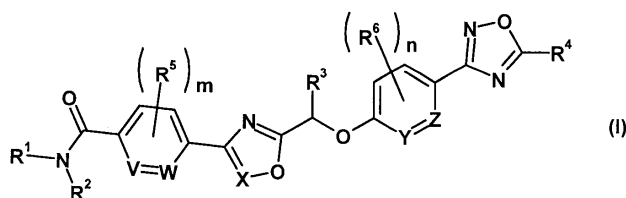
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la

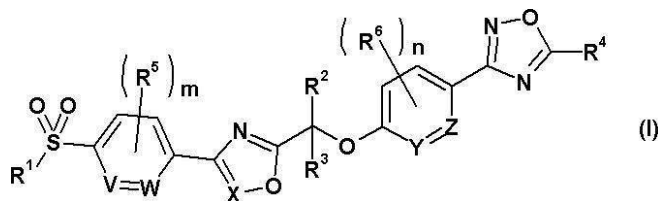
solicitud de prioridad: 18 de enero de 2012 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	CA2770404	"Amide derivative"	10/Febrero/2011
D2	CA 2770405	"Sulfone derivative"	10/Febrero/2011
D3	WO 2007039178	"Phenyl-[1,2,4]-oxadiazol-5-one derivatives with phenyl group, processes for their preparation and their use as pharmaceuticals"	12/Abril/2007

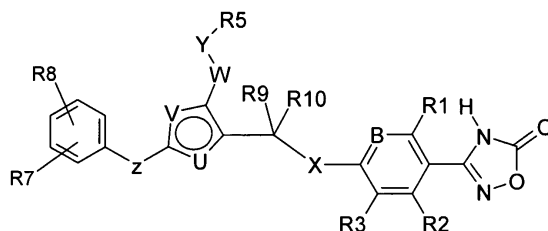
El documento D1¹ divulga compuestos derivados de amida de fórmula (I) que tienen actividad como agentes hipoglicemiantes y protectores de células β del páncreas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0029]; Pág. 3, Párr. [0008]).



El documento D2² divulga compuestos derivados de sulfona de fórmula (I) que tienen actividad como agentes hipoglicemiantes y protectores de células β del páncreas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0001]; Pág. 3, Párr. [0007]-[0008]).



El documento D3³ divulga compuestos derivados de fenil-[1,2,4]-oxadiazol-5-ona con un grupo fenilo, los cuales muestran actividad como agonistas de PPAR delta. Se enseñan compuestos de fórmula (I), sus sales farmacéuticamente aceptables y procesos de preparación. Los compuestos son aptos para su uso en el tratamiento y la prevención de desórdenes en el metabolismo de ácidos grasos y utilización de glucosa, entre otros. (Resumen).



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

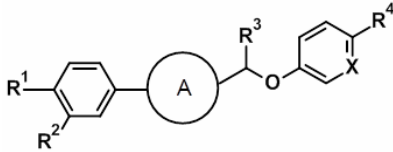
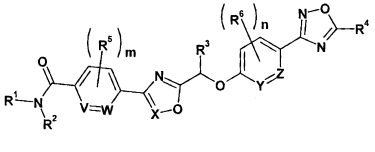
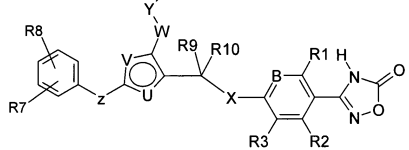
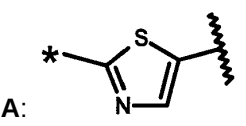
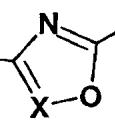
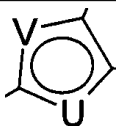
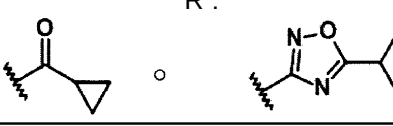
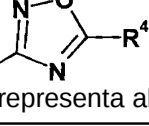
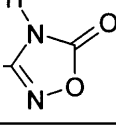
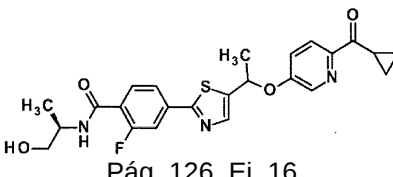
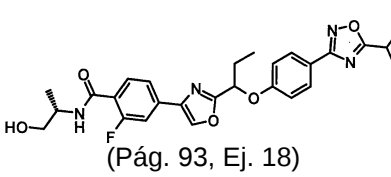
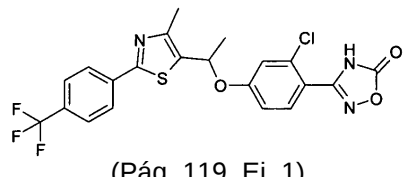
¹ Disponible en línea en: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2770404C&KC=C&FT=D&ND=&date=20140422&DB=&locale=en_EP

² Disponible en línea en: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2770405A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20110210&DB=&locale=en_EP

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

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto representado por la fórmula general (I) en donde el anillo A representa: (...)” (Radicado N°. 16-116433-00000-00000).

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

Características esenciales	D1	D3
Un compuesto de fórmula (I):  O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo Donde X es CH o N	Un compuesto de fórmula (I)  Donde V, W, X, Y y Z son independientemente CH o N. (Pág. 120, Reivindicación 1)	 Donde B es C(R4) o N X se selecciona de un grupo que incluye O Z se selecciona de un grupo que incluye enlace (Pág. 164, Reivindicación 1)
 A:		 Donde uno de U o V es N y el otro es S u O (Pág. 165, línea 10)
R¹: -C(=O)-NH-R⁵, o -S(=O)₂R⁵	-C(=O)-NR¹R²	R⁷ y R⁸ se seleccionan de un grupo que incluye H, halógeno, alquilo(C₁-C₈), alquilen(C₀-C₄)-O-alquilen(C₀-C₄)-H, -SCF₃, SF₅, S(O)₂CF₃, alquilen(C₀-C₄)-O-(C₆-C₁₂)arilo, alquilen(C₀-C₄)arilo(C₆-C₁₂), NO₂ (Pág. 166, líneas 4-6)
R²: -F	R⁵ representa un átomo de halógeno o un alquiloC₁-C₆	R⁹ se selecciona de un grupo que incluye alquilo (C₁-C₆) y R¹⁰ se selecciona de un grupo que incluye H
R³: -CH₃	R³ representa alquiloC₁-C₆	R⁹ se selecciona de un grupo que incluye alquilo (C₁-C₆) y R¹⁰ se selecciona de un grupo que incluye H
R⁴: 	 Donde R⁴ representa alquiloC₁-C₆	
R⁵: alquiloC₁-C₆ que puede ser sustituido con 1 a 3 -OH	R¹ es H, alquiloC₁-C₆ y R² es H, alquiloC₁-C₆ que esta opcionalmente sustituido por un grupo -OH	alquilo y alquilen en R⁷ y R⁸ son no sustituidos o mono-, di- o trisustituido por F y arilo está no sustituido o mono-, di- o trisustituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄) alquilo o O-alquilo(C₁-C₄)
Comparación de ejemplos específicos		
 Pág. 126, Ej. 16	 (Pág. 93, Ej. 18)	 (Pág. 119, Ej. 1)

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 hipoglicémicos y/o protectora de células β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0001]).

La diferencia entre los compuestos reclamados de acuerdo a la reivindicación 1 y aquellos divulgados por el documento D1, consiste en el anillo heterocíclico central, dado que en los compuestos reclamados dicho anillo es 1,3-tiazol, mientras que en los compuestos divulgados por el documento D1 este anillo es un grupo oxadiazol u oxazol.

No existe evidencia de un efecto técnico asociado a la modificación del sustituyente oxadiazol u oxazol por un grupo 1,3-tiazol, en la actividad como hipoglucémicos de los compuestos reclamados, toda vez que los compuestos divulgados en 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 útiles como agentes hipoglicemiantes orales alternativos.

Sin embargo, el documento D3 divulga compuestos derivados fenil-[1,2,4]-oxadiazol-5-ona con un grupo fenilo que actúan como inhibidores de PPAR delta y son útiles como agentes terapéuticos de enfermedades relacionadas con metabolismo de ácidos grasos y glucosa (Resumen) entre las cuales se encuentra la diabetes tipo 2 (Pág. 1, línea 18). Realizaciones preferidas de este documento enseñan compuestos cuyo núcleo heterocíclico de cinco miembros es un anillo de 1,3-tiazol (Pág. 119-124, Ej. 1-7).

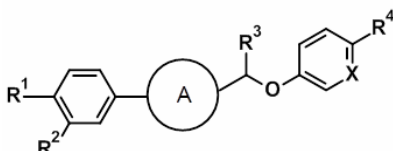
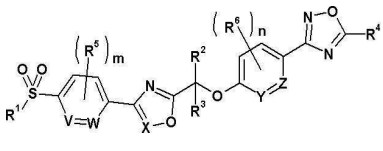
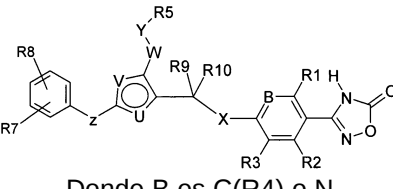
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un anillo de 1,3-tiazol de acuerdo a lo enseñado en el documento D3 en los compuestos del documento D1, llegando así al objeto de la reivindicación 1, por lo que la materia allí reclamada se considera obvia. Más aun cuando la persona del oficio normalmente versada en la materia conoce la relación entre la estructura y la actividad de los agentes antihiperglucémicos relacionados⁴.

Puesto que la reivindicación 2 no menciona características inventivas adicionales, tampoco se puede considerar inventiva.

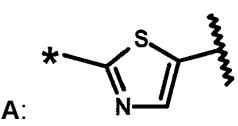
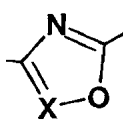
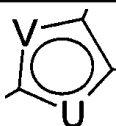
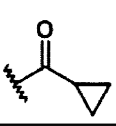
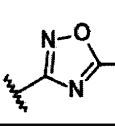
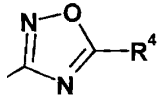
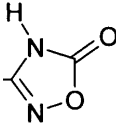
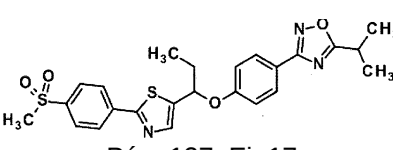
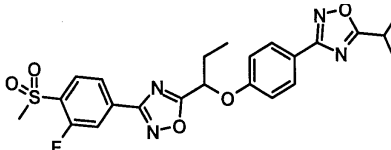
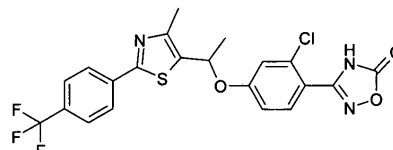
Las reivindicaciones 1 a 2 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto representado por la fórmula general (I) en donde el anillo A representa: (...)” (Radicado N°. 16-116433-00000-00000).

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

Características esenciales	D2	D3
Un compuesto de fórmula (I):  O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo Donde X es CH o N	Un compuesto de fórmula (I)  Donde V, W, X, Y y Z son independientemente CH o N. (Pág. 66, Reivindicación 1)	 Donde B es C(R4) o N X se selecciona de un grupo que incluye O Z se selecciona de un grupo que incluye enlace (Pág. 164, Reivindicación 1)

⁴ Three-dimensional Quantitative Structure Activity Relationships (3-D-QSAR) of Antihyperglycemic Agents. *Bioorganic & Medicinal Chemistry*. (1999) Vol. 7, No. 7, Págs. 1475-1485. Kulkarni et al. Disponible en línea en: <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0968089699000632>

Características esenciales	D2	D3
A: 		 Donde uno de U o V es N y el otro es S u O (Pág. 165, línea 10)
R^1: $-C(=O)-NH-R^5$, o $-S(=O)_2R^5$	$-S(=O)_2R^1$	R^7 y R^8 se seleccionan de un grupo que incluye H, halógeno, alquilo(C_1-C_8), alquilenilo(C_0-C_4)-O- alquilenilo(C_0-C_4)-H, $-SCF_3$, SF_5, $S(O)_2CF_3$, alquilenilo(C_0-C_4) -O-(C_6-C_{12})arilo, alquilenilo(C_0-C_4) arilo(C_6-C_{12}), NO_2 (Pág. 166, líneas 4-6)
R^2: $-F$	R^5 representa un átomo de halógeno o un alquiloC_1-C_6	
R^3: $-CH_3$	R^2 y R^3 representa independientemente H o un grupo alquiloC_1-C_6	R^9 se selecciona de un grupo que incluye alquilo (C_1-C_6) y R^{10} se selecciona de un grupo que incluye H
R^4:  	 Donde R^4 representa alquiloC_1-C_6	
R^5: alquiloC_1-C_6 que puede ser sustituido con 1 a 3 -OH	R^1 representa un grupo alquiloC_1-C_6	alquilo y alquilenilo en R^7 y R^8 son no sustituidos o mono-, di- o trisustituido por F y arilo está no sustituido o mono-, di- o trisustituido por halógeno, alquilo (C_1-C_4) alquilo o O-alquilo(C_1-C_4)
Comparación de ejemplos específicos		
 Pág. 127, Ej. 17	 (Pág. 51, Ej. 1)	 (Pág. 119, Ej. 1)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la solicitud, definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos derivados de sulfona que tienen actividad como hipoglicémicos y/o protectores de células β pancreáticas, sales farmacéuticamente aceptables de las mismas y composiciones farmacéuticas que los contienen (Pág. 1, Párr. [0001]).

La diferencia entre los compuestos reclamados de acuerdo a la reivindicación 1 y aquellos divulgados por el documento D2, consiste en el anillo heterocíclico central, dado que en los compuestos reclamados dicho anillo es 1,3-tiazol, mientras que en los compuestos divulgados por el documento D2 este anillo es un grupo oxadiazol u oxazol.

No existe evidencia de un efecto técnico asociado a la modificación del sustituyente oxadiazol u oxazol por un grupo 1,3-tiazol, en la actividad como hipoglucémicos de los compuestos reclamados, toda vez que los compuestos divulgados en el documento D1 menciona una reducción de AUC de glucosa en plasma entre el 5-15% (Pág. 63, Párr. [0218]) 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 útiles como agentes hipoglicemiantes orales alternativos.

Sin embargo, el documento D3 divulga compuestos derivados fenil-[1,2,4]-oxadiazol-5-ona con un grupo fenilo que actúan como inhibidores de PPAR delta y son útiles como agentes terapéuticos de enfermedades relacionadas con metabolismo de ácidos grasos y glucosa (Resumen) entre las cuales se encuentra la diabetes tipo 2 (Pág. 1, línea 18). Realizaciones preferidas de este documento enseñan compuestos cuyo núcleo heterocíclico de cinco miembros es un anillo de 1,3-tiazol (Pág. 119-124, Ej. 1-7).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un anillo de 1,3-tiazol de acuerdo a lo enseñado en el documento D3 en los compuestos del documento D2, llegando así al objeto de la reivindicación 1, por lo que la materia allí reclamada se considera obvia. Más aun cuando la persona del oficio normalmente versada en la materia conoce la relación entre la estructura y la actividad de los agentes antihiperoglucémicos relacionados⁴.

Puesto que la reivindicación 2 no menciona características inventivas adicionales, tampoco se puede considerar inventiva.

Las reivindicaciones 1 a 2 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	CA2770404	1 y 2	Nivel Inventivo
D2	CA 2770405	1 y 2	Nivel Inventivo
D3	WO 2007039178	1 y 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 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 2016-06-21

Elaboró: Ruth Andrea Rodriguez

Revisó: Diego Armando Galvis Sanchez