

REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

Señor(a)
HELSINN HEALTHCARE SA
NOTIFPAT@CAVELIER.COM

Asunto: PATENTE DE INVENCIÓN - PCT

Patente de Invención	PT	Patente de Modelo de Utilidad			
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	PCT	Capítulo I		Capítulo II	x
No. Solicitud Internacional	PCT/US2015/019112				
Fecha de Presentación Internacional	6 de marzo de 2015				

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	NC2016/0002770	7 de octubre de 2016
Reivindicaciones:	NC2016/0002770	7 de octubre de 2016
Prioridad(es):	País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA	
	Número: 61/949,664	Fecha: 7 de marzo de 2014

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido y el contenido técnico de esta solicitud 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

Oficio N° 13504

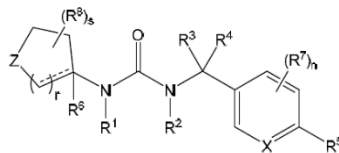
Ref. Expediente N° NC2016/0002770

la tasa pagada por el 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. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 10 del capítulo reivindicatorio (Radicado NC2016/0002770 del 7 de octubre de 2016).

Título de la solicitud: "UREAS ASIMÉTRICAS P-SUSTITUIDAS Y USOS MÉDICOS DE LAS MISMAS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de hallar nuevos compuestos que modulen la actividad del receptor de ghrelina.

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): C07D 401/06, C07C 275/06, C07C 275/26, C07D 401/12, C07D 211/58, C07D 211/60, C07D 211/94, C07D 211/96, C07D 213/00.

4. De la solicitud de patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque la solicitud hace referencia a moduladores de la actividad del receptor de ghrelina derivados de la N-(2,3-dihalofenil)metil-N'-(cicloalquil o heterocicloalquil)urea, composiciones que los comprenden y sus procedimientos de elaboración por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art. 30 D 486, Art. 22 PCT)

La expresión: "opcionalmente" precediendo una característica no es limitativo, porque hace opcional a la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

Las reivindicaciones 1 a 5 no están debidamente sustentadas en la descripción porque de la definiciones de r, s, n, X, Z, R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7 R8, R9, R10, R11, R12, R13, R14 y R15 se obtiene un gran número de compuestos, muchos de los cuales no están divulgados en la forma de ejemplos de la invención dentro del capítulo descriptivo, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de las composiciones que han sido elaboradas o probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados. El siguiente cuadro ejemplifica la afirmación anterior y presenta los sustituyentes que se encuentran soportados en la descripción (eliminando la necesidad de usar R⁹).

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

Sustituyentes de acuerdo con la reivindicación 1 de la solicitud		Sustituyentes soportados en la descripción
r	es 1 o 2	2 (ej. HO494)
X	CH o N	CH (ej.
Z	NR ⁹ , CR ¹⁰ R ¹¹ , u O;	N-metil o acetil pirrolidina, N-metil o acetilpiperidina, ciclohexano o 4-oxano NR ⁹ (ej. HO494) CR ¹⁰ R ¹¹ (ej. O584) Oxígeno (ej. HO586)
R¹	H, C1-6 alquilo, bencilo, OH, o C1-6 alcoxi, en donde dicho C1-6 alquilo, bencilo, o C1-6 alcoxi están opcionalmente sustituidos con 1-3 sustituyentes seleccionados de halo, OH, C1-6 alquilo, C1-6 alcoxi, C1-6 hidroxialquilo, CO(C1-6 alquilo), CHO, CO ₂ H, CO ₂ (C1-6 alquilo), y C1-6 haloalquilo	C1-6 alquilo (ej. O494) OH (ej. HO621) bencilo (ej. HO617) C1-6 alcoxi (ej. O741)
R²	H o C1-6 alquilo	Hidrógeno (ej. HO494)
R³ y R⁴	H, CN, halo, CHO o CO ₂ H; o C1-6 alquilo, C1-6hidroxialquilo, C1-6 , alquilocicloalquilo, C1-6haloalquilo, C1-6alcoxi, CO(C1-6 alquilo), CO ₂ (C1-6alquilo), o CONR ¹² R ¹³ opcionalmente sustituidos ó tomados en conjunto con el átomo de C al cual están unidos forman un anillo de 3-6 miembros	C1-6 alquilo (ej. HO494) Alquilocicloalquilo (ej. HO720) CN (ej. HO703) C1-6alcoxi (ej. HO620) CO ₂ (C1-6 alquilo) (ej. O662) C1-6hidroxialquilo (ej. HO670) tomados en conjunto con el átomo de C al cual están unidos forman un anillo de 3-6 miembros (ej. HO673) C1-6haloalquilo (ej. HO686)
R⁵	halo, CN, CHO, CO ₂ H, CO(C1-6 alquilo), CO ₂ (C1-6 alquilo), NR ¹⁴ R ¹⁵ , NHCON R ¹⁴ R ¹⁵ , CON R ¹⁴ R ¹⁵ , C1-6 alquilo, C1-6 alcoxi, C1-6 haloalquilo, C1-6 hidroxialquilo, C2-6 alqueno, C2-6 alquino, arilo, cicloalquilo, heteroarilo, o heterocicloalquilo	Ciclopropil(ej. HO494) difluorometilo (ej. HO621) Piridinilo (ej. HO496) Pirimidinilo (ej. HO516) Pirazinilo (ej. HO700) tiofeno (ej. HO531) pirrolilo (ej. HO535) pirazolilo (ej. HO499) imidazolilo (ej. HO542) tiazolilo (ej. HO568) oxazolilo (ej. HO569) triazolilo (ej. HO565) oxadiazolilo (ej. HO595) furanilo (ej. HO665) fenilo (ej. HO509) pirazolo[3,4-b]piridin-5-ilo (ej. HO623) indazolilo (ej. HO512) 1H-pirrol[2,3-b]piridin-5-ilo (ej. HO514) 4-(1H-indol-5-ilo) (ej. HO515) metilpiperidin-4-ilo (ej. HO520) benzo[d]isoxazol-6-ilo (ej. HO787) ciano (ej. HO790) cloro (ej. HO381)
R⁶	está ausente o es H	está ausente (ej. HO494)
R⁷	H, CN, o halo ó dos R ⁷ pueden ser tomados en conjunto con los átomos a los cuales están unidos para formar un anillo de 5-6 miembros	Halógeno (ej. HO494) dos R ⁷ pueden ser tomados en conjunto con los átomos a los cuales están unidos para formar un anillo de 5-6 miembros (ej. HO578)
R⁵ y R⁷	tomados en conjunto con los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido	tomados en conjunto con los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de 5-6 miembros opcionalmente sustituido (ej. HO623)

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

R ⁸	es H o C1-6 alquilo	C1-6 alquilo (ej. HO494) Halógeno (ej. HO587) No reivindica Acetil (No reivindica)
----------------	---------------------	--

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: 7 de marzo de 2014, y se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006014136	Piperidine derivatives as histamine H3 receptor ligands	9 de febrero de 2006
D2	US20080227780	Soluble epoxide hydrolase inhibitors	18 de septiembre de 2008
D3	WO2012113103	Asymmetric ureas and medical uses thereof	30 de agosto de 2012
D4	WO2009039461	N-substituted piperidine derivatives as serotonin receptor agents	26 de marzo de 2009
D5	Art. 1*	Reduction of hERG inhibitory activity in the 4-piperidinyl urea series of H3 antagonists	28 de enero de 2010

*Berlin, M., Lee, Y. J., Boyce, C. W., Wang, Y., Aslanian, R., McCormick, K. D., ... & Korfmacher, W. (2010). Reduction of hERG inhibitory activity in the 4-piperidinyl urea series of H3 antagonists. *Bioorganic & medicinal chemistry letters*, 20(7), 2359-2364.

El documento D1¹ divulga derivados de piperidina como ligando de receptores de hismina H3 (Título).

El documento D2² divulga compuestos de urea para inhibir hidrolasas epóxido solubles (Resumen).

El documento D3³ divulga ureas asimétricas para tratar enfermedades mediadas por el receptor ghrelin (Resumen).

El documento D4⁴ divulga derivados de piperidinas N-sustituidas como antagonistas del receptor serotoninergico (Resumen).

El documento D5⁵ divulga un compuestos de 4-piperidinl urea como antagonistas H3 (Resumen).

6. Examen de Patentabilidad (Art. 14 D486)

Novedad frente a los documentos D1, D2 y D3 (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “*Un compuesto de fórmula (I) donde...*” (Radicado N°. NC2016/0002770 del 7 de octubre de 2016).

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

1 <https://encrypted.google.com/patents/WO2006014136A1?cl=nl>

2 <https://encrypted.google.com/patents/US20080227780?cl=da>

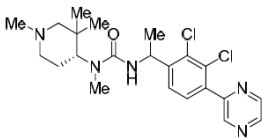
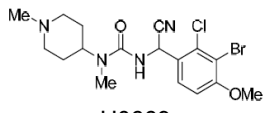
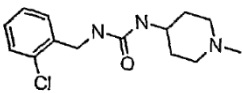
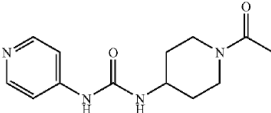
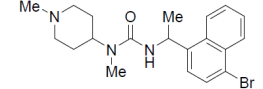
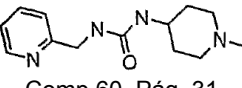
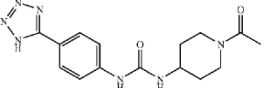
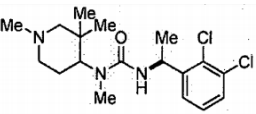
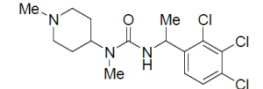
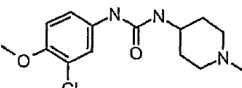
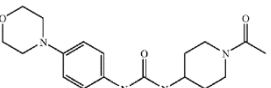
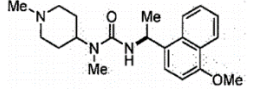
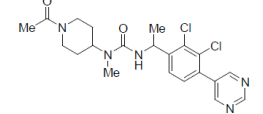
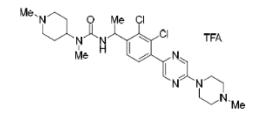
3 <https://encrypted.google.com/patents/WO2012113103A1?cl=en>

4 <https://encrypted.google.com/patents/WO2009039461A2?cl=en>

5 <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/20188550>

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

 H0824			
 H0669	 Comp 58, Pág. 31	 Comp 6-7, Tabla 6, Pág. 31	
 H0573	 Comp 60, Pág. 31	 Comp 6-9, Tabla 6, Pág. 31	 Reiv. 20, compuesto GA12
 H0381	 Comp 63, Pág. 32	 Comp 7-87, Tabla 7, Pág. 44	 Reiv. 20, compuesto GA91
 H0588			
 H0822			

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en los documentos D1 a D3, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en los documentos D1 a D3.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 10 no mencionan alguna característica que haga nueva(o) al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

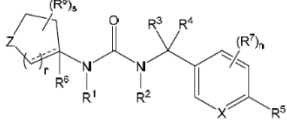
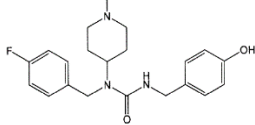
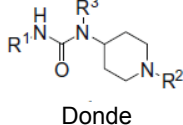
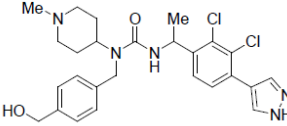
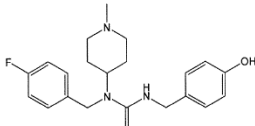
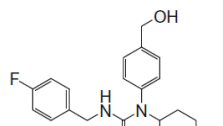
Novedad frente a los documentos D4 y D5 (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de fórmula (I) donde...” (Radicado N°. NC2016/0002770 del 7 de octubre de 2016).

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

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

Características esenciales	D4	D5
Un compuesto de fórmula I  Donde	Un compuesto de fórmula  (Reiv. 1)	Un compuesto de fórmula  Donde (Tabla 1)
X es CH o N	Aril (Reiv. 1)	R1 es bencil sustituido (Reiv. 1)
Z es N-metil o acetil pirrolidina, N-metil o acetilpiperidina, ciclohexano o 4-oxano	N-metilpiperidina (Reiv. 1)	N-alquilpiperidina (Tabla 1)
R1: H, C ₁₋₆ alquilo, OH, bencilo, C ₁₋₆ alcoxi	bencilo (Reiv. 1)	R3 es cicloalquil o aril sustituido (Tabla 1)
R2 Hidrógeno	Hidrógeno (Reiv. 1)	Hidrógeno (Tabla 1)
R3 y R4: H, C ₁₋₆ alquilo , Alquilcicloalquilo, CN, C ₁₋₆ alcoxi, CO2(C ₁₋₆ alquilo), C ₁₋₆ hidroxi-alquilo, tomados en conjunto con el átomo de C al cual están unidos forman un anillo de 3-6 miembros	Hidrógeno (Reiv. 1)	Hidrógeno (Tabla 1)
R5: H, Ciclopropil, difluorometilo, Piridinilo, Pirimidinilo, Pirazinilo, tiofeno, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, oxazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, furanilo, fenilo, pirazolo[3,4-b]piridin-5-ilo, indazolilo, 1H-pirrolo[2,3-b]piridin-5-ilo, 4-(1H-indol-5-ilo), metilpiperidin-4-ilo, benzo[d]isoxazol-6-ilo, ciano, OH, cloro, Iodo, Metoxilo y (trimetilsilil)etnil	-OH (Reiv. 1)	H, Halógeno o metoxilo (Tabla 1)
R6 está ausente	está ausente (Reiv. 1)	está ausente (Tabla 1)
R7 es H, Halógeno, dos R7 pueden ser tomados en conjunto con los átomos a los cuales están unidos para formar un anillo de 5-6 miembros	Hidrógeno (Reiv. 1)	H, Halógeno o metoxilo (Tabla 1)
R8: metil, acetil o flúor	Metil (Reiv. 1)	Alquil (Tabla 1)
 H0553	 Reiv. 1, Pág. 45	 Comp 13, Tabla 1, Pág. 2361

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en los documentos D4 y D5, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en los documentos D4 y D5.

Oficio N° 13504

Ref. Expediente N° NC2016/0002770

Las reivindicaciones dependientes 2 a 10 no mencionan alguna característica que haga nueva(o) al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006014136	1 a 10	Novedad
D2	US20080227780	1 a 10	Novedad
D3	WO2012113103	1 a 10	Novedad
D4	WO2009039461	1 a 10	Novedad
D5	Art. 1*	1 a 10	Novedad

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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante para los sesenta (60) días.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el Título I, Actuaciones ante la Superintendencia de Industria y Comercio; Capítulo sexto, publicación, comunicación, notificación y ejecutoria de las decisiones de la Superintendencia de Industria y Comercio, informándoles que contra el mismo no procede el recurso de la vía gubernativa.

Atentamente,



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES (C)

Elaborado: EDWARD BAUDILIO SUESCA QUINTERO.

Revisado: LENIN ROBERTO GUERRERO SUÁREZ.

Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ.