

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 16668

Ref. Expediente N° NC2016/0002714

Señor(a)
SHANGHAI HAIYAN PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY CO. LTD,
YANGTZE RIVER PHARMACEUTICAL GROUP CO. LTD.
notificaciones@bc.com.co

Asunto: PATENTE DE INVENCIÓN - PCT

Patente de Invención	PT	Patente de Modelo de Utilidad			
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	PCT	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/CN2015/073330				
Fecha de Presentación Internacional	27 de febrero 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	NC2016/0002714	5 de octubre de 2016
Reivindicaciones:	NC2016/0002714	5 de octubre de 2016
	NC2016/0002714	5 de octubre de 2016
Dibujos:	NC2016/0002714	4 de enero de 2017
Prioridad(es):	País: CN, REPUBLICA POPULAR DE CHINA Número: 201410081220.1 Fecha: 6 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 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

Oficio N° 16668

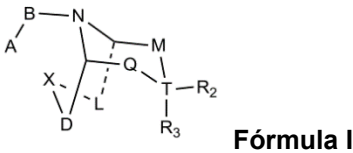
Ref. Expediente N° NC2016/0002714

cubiertas por la tasa pagada. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 11 del capítulo reivindicatorio (Radicado N° NC2016/0002714 del 4 de enero de 2017).

Título de la solicitud: “DERIVADOS DE PIPERIDINA COMO ANTAGONISTA DE RECEPTORES DE OREXINA”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos con actividad antagonista mejorada frente al receptor de orexina, también farmacocinética y vida media mejorada, que sean útiles para el tratamiento de desórdenes relacionados con dicho receptor.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 451/02, C07D 487/08, A61K 31/46, A61P 25/20, A61P 11/00, A61P 25/22, A61P 25/34, A61P 25/30.

4. De la solicitud de patente

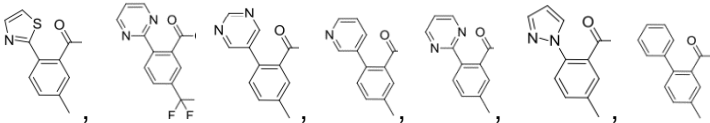
Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque los compuestos divulgados son derivados de azabicyclo[3.2.1]octano y no de piperidina, por lo cual se sugiere a la solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara porque menciona “R8 y R9 se seleccionan de manera independiente de H, F, Cl, Br, alquilo C1-6 no sustituido, en donde el número de sustituyente, **heteroátomo o grupo heteroátomo es arbitrario siempre que se alcance la estabilidad química...**” lo que corresponde a un objetivo a alcanzar y no es una característica técnica. Se sugiere caracterizar el compuesto por las características estructurales.

La reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de los sustituyentes son por ejemplo ciclohidrocarbilo o heterociclohidrocarbilo o heterohidrocarbilo cíclico de 3-12 miembros los cuales son géneros funcionales e incluyen sustituyetes que no han sido explorados, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
A	
B	-C(=O)-, -SO ₂ -

Oficio N° 16668

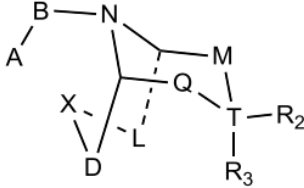
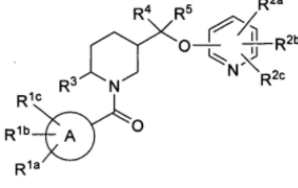
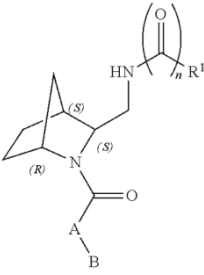
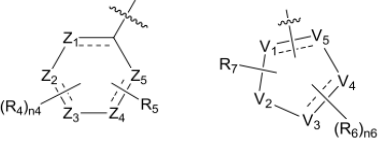
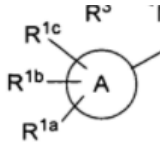
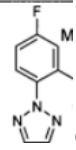
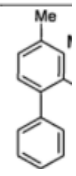
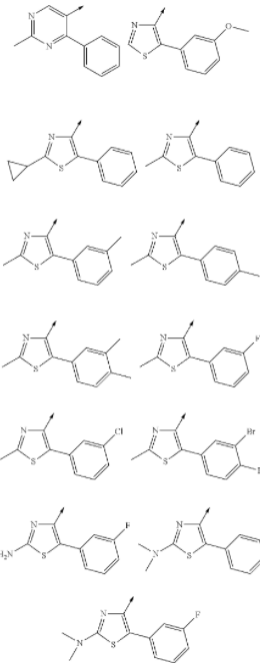
Ref. Expediente N° NC2016/0002714

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

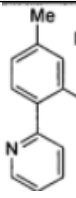
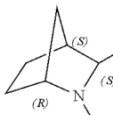
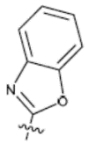
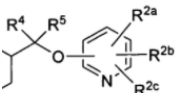
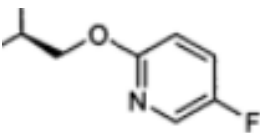
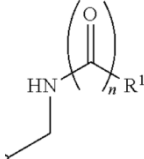
La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de la fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo...” (Radicado N°. XX-XXXXX-0000X-00000).

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de la fórmula (I), o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo 	Un compuesto de formula  (reiv. 1)	Compuesto de formula  (reiv. 1)
A se selecciona de un ciclohidrocarbilo o heterociclohidrocarbilo o heterohidrocarbilo cíclico de 3-12 miembros opcionalmente sustituido; en donde A se selecciona de una unidad de estructura como se muestra en la fórmula (A1) o (A2):  en donde: Z1, Z2, Z3, Z4, y Z5 se seleccionan de manera independiente de CH o CH2, NH, N; V1, V2, V3, V4, y V5 se seleccionan de manera independiente de CH o CH2, C, N, S, y al menos uno de V1 a V5 es C o N, representa un solo enlace o una unión doble; R4 y R6 se seleccionan de manera independiente de H, F, Cl, Br, alquilo C1-6 halógeno-sustituido, hidroxi-sustituido, amino-sustituido o no sustituido; R5 y R7 se	 donde a es un grupo seleccionado de fenil, naftil y heteroaril (reiv. 1)  ejemplo 1-8  ejemplo 1-10	A-B 

Oficio N° 16668

Ref. Expediente N° NC2016/0002714

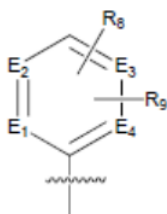
seleccionan de manera independiente de ciclohidrocarbilo o grupo heterocíclico de 5-6 miembros opcionalmente sustituido, mientras que el sustituyente se selecciona de F, Cl, Br, CN, OH, NH2, alquilo C1-6 halógenosustituido, hidroxisustituido, amino-sustituido o no sustituido; en donde el ciclohidrocarbilo o grupo heterocíclico de 5-6 miembros se selecciona cada uno de manera independiente de fenilo, piridilo, furilo, tienilo, tiazolilo, pirimidinilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo o 1,2,5-triazolilo. n4 se selecciona de 0, 1, 2, 3, 4; y n6 se selecciona de 0, 1, 2, 3	 ejemplo 1-15	(reiv. 1 y párr. [0024])
B ex C(=O) o S(=O)₂	-C(=O)- (reiv. 1 ejemplo 1-8, 1-10 y 1-15)	C(=O) (reiv. 1)
D y L se seleccionan de manera independiente de CH2 opcionalmente sustituido, en donde el sustituyente se selecciona de F, Cl, Br, OH, NH2, alquilo C1-6 halógeno-sustituido o alquilo C1-6 no sustituido	No menciona	
T es C	No se menciona	
M se selecciona de C(Y)(R1a) cuando Q se selecciona de C(R1b)(R1c), o M se selecciona de C(R1b)(R1c) cuando Q se selecciona de C(Y)(R1a); Y se selecciona de - (CH2)r4(G)r5(CH2)r6-Y1, en donde Y1 se selecciona de -O-E o una estructura de fórmula (Y22),  en donde el sustituyente se selecciona de F, Cl, Br, halógeno-sustituido o alquilo C1-6 no sustituido; G se selecciona de CH2 halógeno-sustituido o no sustituido; R4 y R6 se seleccionan de manera independiente de 0, R5 se selecciona de 0 o 1, y cuando R4,	 (reiv. 1)  (ejemplo 1-8, 1-10 y 1-15)	 (reiv. 1)

Oficio N° 16668

Ref. Expediente N° NC2016/0002714

R5 y r6 son todos 0, significa que la estructura correspondiente es una unión de vinculación única

en donde la E se selecciona de una unidad de estructura de fórmula (Ea):



en donde: E1, E2, E3, y E4 se seleccionan de manera independiente de CH, N halógenosustituido o no sustituido; y R8 y R9 se seleccionan de manera independiente de H, F, Cl, Br, alquilo C1-6 no sustituido, en donde el número de sustituyente, heteroátomo o grupo heteroátomo es arbitrario siempre que se alcance la estabilidad química. Cada uno de R1a, R1b, R1c, R2, y R3 se seleccionan de manera independiente de H, F, Cl, alquilo C1-6 halógeno-sustituido, hidroxi-sustituido, amino-sustituido o no sustituido; y el compuesto o la sal farmacéuticamente aceptable del mismo comprenden uno o más centros quirales.

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos de fórmula II con actividad antagonista de los receptores de orexina 1 y 2 (reivindicación 1 y tabla 2).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D1 consiste en que el compuesto de la solicitud comprende el bicyclo azabicyclo[3.2.1]octano, mientras que el compuesto en D1 comprende piperidina como núcleo central.

No se evidencia efecto técnico superior por el uso de azabicyclo[3.2.1]octano porque los compuestos más cercanos divulgados en D1 presentan IC₅₀ actividad antagonista del receptor OX1 y OX2 de 0,71 y 0,08 nM respectivamente (ejemplo 1-10 tabla 2), mientras que la mejor actividad de los compuestos de la solicitud es de 7 y 6 nM (ejemplo 32).

Oficio N° 16668

Ref. Expediente N° NC2016/0002714

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: Cómo modificar los compuestos conocidos en el documento D1 para proveer compuestos alternativos como antagonistas de receptor de orexina 1 y 2.

Sin embargo, la utilización del azabicyclos como núcleo central, ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a compuestos de la fórmula III (reiv. 1) útiles como antagonistas del receptor orexina (párr. [0432]) para tratamiento de enfermedades neurodegenerativas.

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el azabicyclo del documento D2 en el compuesto divulgado en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 11 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Las reivindicaciones 1 a 11 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	WO2008147518	1 a 11	Nivel inventivo
D2	US20110009401	1 a 11	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.

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.

Oficio N° 16668

Ref. Expediente N° NC2016/0002714

Atentamente,



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES (C)

Elaborado: JUAN NICOLAS TARQUINO CHIA
Revisado: DAYRON ALEXANDER RAMÍREZ REYES
Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ