

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

Señor(a)
ASTRAZENECA AB, EOLAS THERAPEUTICS INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: ***“PIPERIDINAS SUSTITUIDAS CON HALO COMO MODULADORES DEL RECEPTOR DE OREXINA”***.

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2017/017408.

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 10 de febrero de 2017.

PRIORIDAD(ES): US 62/294,940 del 12 de Febrero de 2016.

US 62/336,102 del 13 de Mayo de 2016.

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 01 de abril de 2019, bajo el número NC2019/0003210, por ajustarse a los requisitos legales.

2. 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, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 103 el radicado N° NC2019/0003210 del 01 de abril de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos heterocíclicos moduladores del receptor de orexina, y por tanto adecuados contra patologías tales como trastornos de sueño/vigilia, ansiedad y obesidad.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de formula (I), y composiciones farmacéuticas que las comprenden.

3. Excepción de Patentabilidad (Art. 20 Decisión 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 85 a 88 y 97 a 103, no es patentable de acuerdo con el artículo 20 de la Decisión 486, toda vez que hacen referencia a métodos de tratamiento para modular la actividad de un receptor de orexina y por tanto no es materia susceptible de patentabilidad.

4. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 Decisión 486)

El uso de las reivindicaciones 84 y 89 a 96, no es patentable, de acuerdo con el artículo 14, teniendo en cuenta que pretenden reclamar para el uso de los compuestos de la invención para el tratamiento de enfermedades o trastornos regulados por la actividad del receptor de orexina.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

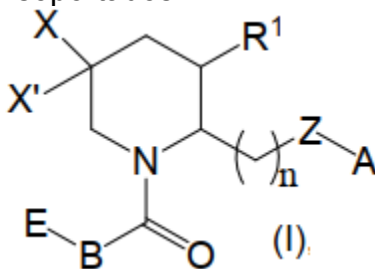
Ref. Expediente N° NC2018/0009290

5. De la solicitud de patente

5.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 1 no es concisa ya que presenta términos que no están debidamente sustentados en la descripción y con los cuales se podrían presentar múltiples opciones que se alejan de los sustituyentes soportados. Es el caso de los siguientes sustituyentes: “arilo, aroilo, heteroarilo, heteroarilo, alquilo, cicloalquilo, -N(Rc)C(O) alquilo, -N(Rc)CO2alquilo, -N(Rc)SO2alquilo, C(O)alquilo, -CO2alquilo, -CONRcRd, -SO2alquilo”, de los cuales se desconoce el número de átomos y el tipo de heteroátomos que los conforman, en los casos que aplique. Se requiere delimitar correctamente la invención.

Adicionalmente, al revisar la descripción, podemos observar que los siguientes sustituyentes son los que están soportados:



n es	1
Z es	NR ₂
R ₂ es	H
A es	piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, y benzoxazolilo sustituidos con halógeno, alquilo C ₁₋₃ y haloalquilo C ₁₋₃ , metoxi.
R ¹ es	metilo
X y X' son	F
B es	Fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, oxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, triazolilo, tiazolilo, tiofenilo, pirazolilo, y benzoimidazolilo opcionalmente sustituidos con metilo, halógeno y ciano
E es	Fenilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazolilo, piridinilo, oxadiazolilo, pirazinilo, y pirimidinilo opcionalmente sustituidos con metilo, halógeno y metoxi

El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción.

La anterior objeción aplica para las reivindicaciones 2, 11, 18, 26, 36, 42, 56, 59, 62, 64 y 72 a 75.

La reivindicación 82 no es clara cuando señala: “*Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en compuestos como se muestra en la Tabla 1*”, ya que hace referencia a la descripción y por tanto en el pliego reivindicatorio se debe mencionar de manera explícita la materia a proteger. Se requiere adicionar los compuestos de dicha tabla 1.

La reivindicación 83 no es clara cuando señala: “*y (b) un excipiente farmacéuticamente aceptable*”, ya que cualquier composición farmacéutica debe mencionar de manera explícita los componentes particulares y sus cantidades específicas.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

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 patente de la cual se invoca prioridad: 12 de Febrero de 2016, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2013119639	“Substituted prolines/piperidines as orexin receptor antagonists”	15/Agosto/2013
D2	WO2015123355	“Substituted prolines/piperidines as orexin receptor antagonists”	20/Agosto/2015

D2¹ enseña (resumen) compuestos heterocíclicos derivados de prolinas y piperidinas, que actúan como antagonistas del receptor de orexina.

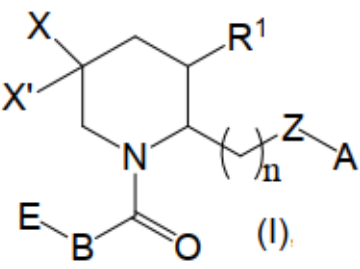
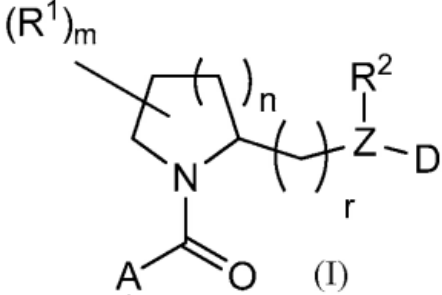
D2² enseña (resumen) compuestos heterocíclicos derivados de prolinas y piperidinas, que actúan como antagonistas del receptor de orexina.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

7.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “*Un compuesto de formula (I)...*” (Radicado N° NC2019/0003210 del 01 de abril de 2019).

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
 (I)	 (I) (reivindicación 1)
Piperidina	n es 2
R ¹ es alquilo	m es 1, 2 o 3; R ¹ es alquilo C ₁₋₄

1URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2013119639A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20130815&DB=&locale=en_EP
2URL:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

X y X' son halógeno	R ¹ es halo
n es 1	r es 1
Z es NR ² donde R ² es H	Z es N; R ² es H
A es arilo, aroilo, heteroarilo o heteroarilo	D es arilo, aroilo, heteroarilo o heteroarilo
B es arilo o heteroarilo	A es arilo o heteroarilo
E es arilo o heteroarilo	B es arilo o heteroarilo

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales de los compuestos de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reclamada en la reivindicación 1 no es nueva.

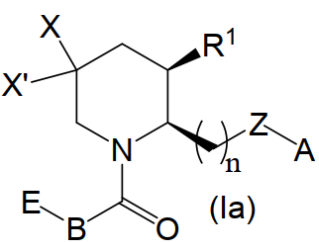
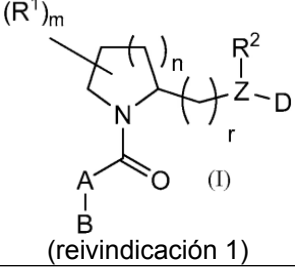
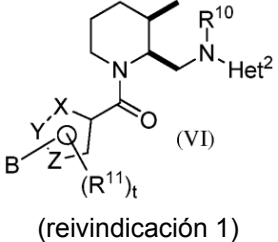
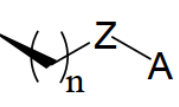
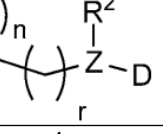
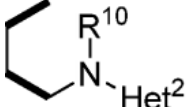
La materia reclamada en la reivindicación 2 también se encuentra anticipada en el documento D1.

Por lo tanto las reivindicaciones 1 y 2 no cumplen el requisito de novedad.

5.2. Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 3 reclama “El compuesto de la reivindicación 1 o 2, en donde el compuesto tiene la estructura de fórmula (Ia)”... (Radicado No. NC2019/0003210 del 01 de abril de 2019)

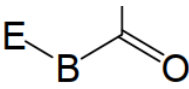
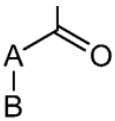
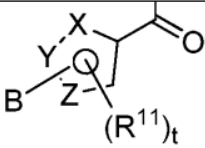
Tabla 2. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
 (Ia)	 (I) (reivindicación 1)	 (VI) (reivindicación 1)
Piperidina	n es 2	piperidina
R ¹ es alquilo	m es 1, 2 o 3; R ¹ es alquilo C ₁₋₄	Metilo
X y X' son halógeno	R ¹ es halo	---
		
n es 1	r es 1	CH ₂
Z es NR ² donde R ² es H	Z es N; R ² es H	N-R ¹⁰ donde R ¹⁰ es H

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

A es arilo, aroilo, heteroarilo o heteroarilo	D es arilo, aroilo, heteroarilo o heteroarilo	Het ² es heteroarilo monocíclico
		
B es arilo o heteroarilo	A es arilo o heteroarilo	X, Y y Z son N, CH y S respectivamente
E es arilo o heteroarilo	B es arilo o heteroarilo	B es fenilo o heteroarilo

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 3, porque divulga compuestos heterocíclicos derivados de prolinas y piperidinas, que actúan como antagonistas del receptor de orexina (reivindicación 1).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 3 y lo revelado en D1, consiste en la sustitución de metilo específica en la posición 3 de la piperidina.

No obstante dicha diferencia no parece conceder un efecto técnico a la presente invención, porque a partir de la información de la descripción no es posible determinarlo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos revelados en D1, para proveer moduladores del receptor de orexina, alternativos a los conocidos en el estado del arte?

Sin embargo, D2 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. D2 enseña compuestos particularmente compuestos heterocíclicos derivados de prolinas y piperidinas, que actúan como antagonistas del receptor de orexina y cuya piperidina se encuentra sustituida en la posición 3 con metilo (reivindicación 1).

Adicionalmente, cuando revisamos el capítulo descriptivo, observamos que la actividad de los compuestos de la presente invención es prácticamente la misma que la que se conocía en el documento D1 y por tanto dicha diferencia en los sustituyentes específicos no aporta ningún efecto técnico.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar las enseñanzas del metilo que sustituye la piperidina de D2, habría podido añadirla puntualmente en los compuestos de D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 3 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 4 a 83 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2013119639	1 a 2	Novedad
		4 a 83	Nivel Inventivo
D2	WO2015123355	4 a 83	Nivel Inventivo

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

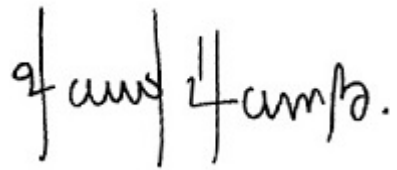
Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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 modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0009290		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2017/017408		10 de febrero de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
12 de Febrero de 2016				X					
Solicitante									
ASTRAZENECA AB, EOLAS THERAPEUTICS INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	84 y 89 a 96	Art. 15	-	Art. 20	85 a 88 y 97 a 103	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 83
Palabras clave utilizadas	HALO-SUBSTITUTED PIPERIDINE ; SUBSTANCE ADDICTION, PANIC DISORDER, ANXIETY, POST-TRAUMATIC STRESS DISORDER, PAIN, DEPRESSION, SEASONAL AFFECTIVE DISORDER, EATING DISORDER, HYPERTENSION, OREXIN A, OR OR-A, AND OREXIN B, OR OR-B, DIFLUORO-3-METHYL TRIFLUOROMETHYL PYRIDIN-2-YL)OXY)METHYL)PIPERIDIN (PYRIMIDIN-2-YL) PYRAZOL-3-YL) METHANONE.
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 403/14, C07D 401/14, C07D 405/14, C07D 409/14, C07D 413/14, C07D 417/14, A61K 31/445, A61K 31/497, A61K 31/506, A61K 31/53, A61P 1/04, A61P 1/12, A61P 3/04, A61P 9/12, A61P 13/12, A61P 15/00, A61P 25/06, A61P 25/08, A61P 25/16, A61P 25/18, A61P 25/20, A61P 25/24, A61P 25/28, A61P 25/32, A61P 25/36, A61P 29/00, A61P 35/00, A61P 37/00
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
SIPI	03110870	19/Diciembre/2003	N/A	N/A	A
	09054957	28/Mayo/2009	N/A	N/A	A
	09149373	30/Diciembre/2009	N/A	N/A	A
USPTO	US20120295921	22/Noviembre/2012	N/A	N/A	A
	US20120165339	28/Junio/2012	N/A	N/A	A
	US2010168134	01/Julio/2010	N/A	N/A	A
EPO	WO2013119639	15/Agosto/2013	1 a 83	(reivindicación 1)	X,Y
	WO2015123355	20/Agosto/2015	1 a 83	(reivindicación 1)	X,Y
	WO2013127913	06/Septiembre/2013	N/A	N/A	A
	JIANG, R. et al.	2012	N/A	N/A	A

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 8158 de 12 de agosto de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0009290

ORBIT	WO2010/017260	11/Febrero/2010	N/A	N/A	A
	WO2010/51236	06/Mayo/2010	N/A	N/A	A
	WO2014/159591	02/Octubre/2014	N/A	N/A	A
	WO2015/124934	27/Agosto/2015	N/A	N/A	A
Patbase	WO2017/139603	17/Agosto/2017	N/A	N/A	AP
	WO2017/156266	14/Septiembre/2017	N/A	N/A	AP
	US9896452	20/Febrero/2018	N/A	N/A	AP
	US20110263643	27/Octubre/2011	N/A	N/A	A
(1) Cita completa literatura no patente (LNP)		JIANG, R. et al. "Disubstituted piperidines as potent orexin (hypocretin) receptor antagonists", Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, (20120000), vol. 22, doi:doi:10.1016/j.bmcl.2012.04.122, pages 3890 - 3894, Page 3890 Abstract, page 3892 left column lines 16-19, Tables 1-5.			
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.					
O					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.					
(2) Categorías de documentos citados					
"A" Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante.			"T" Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos.		
"E" Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.			"X" Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.		
"L" Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan.			"Y" Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.		
"O" Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A.					
"P" Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.					
Fecha del reporte de búsqueda: 24/Julio/2019					
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ					