

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9725 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0007711

Señor
ELI LILLY AND COMPANY

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “N-[4-FLUORO-5-[[[(2S,4S)-2-METIL-4-[(5-METIL-1,2,4-OXADIAZOL-3-IL) METOXI]-1-PIPERIDIL]METIL]TIAZOL-2-IL]ACETAMIDA COMO INHIBIDOR DE OGA”

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2018/014331

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 19 de enero de 2018.

PRIORIDAD: US, 62/451,137, 27 de enero de 2017.

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)

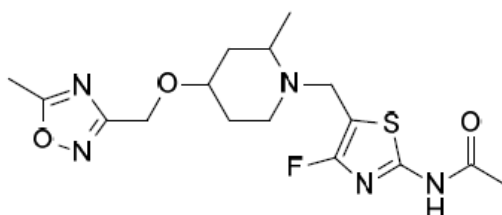
Se aceptan las modificaciones radicadas el 23 de septiembre de 2019, bajo el número NC2019/0010244, por ajustarse a los requisitos legales.

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 8 del radicado N° NC2019/0010244 del 23 de septiembre de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar agentes terapéuticos para el tratamiento de la enfermedad de Alzheimer, parálisis supranuclear progresiva (PSP) y tautopatías.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula I o su sal farmacéuticamente aceptable como inhibidor de OGA, una composición farmacéutica que comprende el compuesto de fórmula I o su sal, con uno o más portadores, diluyentes o excipientes farmacéuticamente aceptables, así como el proceso de preparación de una composición farmacéutica que comprende el compuesto de fórmula I o su sal farmacéuticamente aceptable.



Fórmula I



Oficio N° 9725 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0007711

3. De la solicitud de patente

3.1. Título

El nombre de la invención de que se trata en el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0007711 el 18 de julio de 2019, tituló la invención como: "N-[4-FLUORO-5-[[[(2S,4S)-2-METIL-4-[(5-METIL-1,2,4-OXADIAZOL-3-IL) METOXI]-1-PIPERIDIL]METIL]TIAZOL-2-IL]ACETAMIDA COMO INHIBIDOR DE OGA". Este título no se relaciona con el objeto de la solicitud contenido en algunas partes de la descripción y de las reivindicaciones, dado que no incluye las sales y las composiciones farmacéuticas que comprenden los compuestos reclamados, por lo cual se sugiere el título siguiente: "N-[4-FLUORO-5-[[[(2S,4S)-2-METIL-4-[(5-METIL-1,2,4-OXADIAZOL-3-IL) METOXI]-1-PIPERIDIL]METIL]TIAZOL-2-IL]ACETAMIDA O SU SAL FARMACÉUTICAMENTE ACEPTABLE COMO INHIBIDOR DE OGA, Y LAS COMPOSICIONES QUE LO COMPRENDEN".

3.2. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- Las reivindicaciones 5 y 6 no son claras, dado que un compuesto cristalino debe caracterizarse apropiadamente a través de diferentes parámetros fisicoquímicos, tales como el patrón de difracción de Rayos X en mono cristal (si la reivindicación caracteriza el polimorfo mediante este patrón no se exigirá otro dato), patrón de difracción de rayos X en polvo, y los obtenidos de espectroscopía Raman e IR, espectroscopía RMN C¹³, TGA, DTA y DSC. Se sugiere unificar las reivindicaciones 5 y 6, e incluir al menos uno de los parámetros fisicoquímicos faltantes.
- La reivindicación 6 no es clara, porque el símbolo "2-zeta" no es el aceptado en el campo técnico de farmacia, al cual pertenece la invención. Se sugiere reemplazarlo por el símbolo "2θ" puesto que existe una traducción incorrecta de acuerdo con el documento WO2018140299 (Reiv. 6).
- Los métodos de caracterización (Espectroscopia de Raman, IR, RMN C¹³, TGA, DTA o DSC) y los parámetros fisicoquímicos complementarios al patrón de difracción de Rayos X del cristal mencionado en las reivindicaciones 5 y 6, no se encuentran sustentados en la descripción, por lo tanto, se sugiere incorporarlos en el capítulo descriptivo.

3.3. Descripción (Art. 28 Decisión 486 literal(es) (a) – (f))

La descripción no divulga la invención de manera suficientemente completa para que la persona normalmente versada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla (o reproducirla), dado que no divulga los métodos de caracterización del cristal, ni los parámetros fisicoquímicos adicionales al patrón de difracción de Rayos X en polvo del cristal reclamado en las reivindicaciones 5 y 6.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 27 de enero de 2017 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad. Sin embargo,



Oficio N° 9725 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0007711

consultadas las fuentes de información con las que se cuenta hasta la fecha, no se encontraron documentos que anticipen el objeto de la solicitud tal y como se encuentra reivindicado.

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 el 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 de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

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.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



Oficio N° 9725 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0007711

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0007711		1°	x	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2018/014331		19 de enero de 2018							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
27/01/2017				x					
Solicitante									
ELI LILLY AND COMPANY									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 8
Palabras clave utilizadas	oxadiazol AND piperidyl AND thiazol AND acetamide O-GlcNAcase inhibitor* OR OGA inhibitor* Alzheimer Formula I N-[4-fluoro-5-[[[(2S,4S) -2-methyl-4- [(5-methyl-1,2,4-oxadiazol- 3-yl)methoxy]-l-piperidyl]methyl]thiazol-2-yl]acetamide
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 417/14, A61P 25/00, A61P 25/28, A61K 31/445
	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	03004834	24/01/2003	-	-	A
	05067917	11/07/2005	-	-	A
ISA/EPO/Derwent	WO2014159234	02/10/2014	-	-	A
Patbase	US2009099200	16/04/2009	-	-	A
	US2012184544	19/07/2012	-	-	A
	US6635655	21/10/2003	-	-	A
	US4303655	01/12/1981	-	-	A
	US6635655	21/10/2003	-	-	A
	US2013296301	07/11/2013	-	-	A
Derwent	WO2011140640	17/11/2011	-	-	A
	WO2016030443	03/03/2016	-	-	A
	WO1997003065	30/01/1997	-	-	A
	WO2004022558	18/03/2004	-	-	A
	WO2007006760	18/01/2007	-	-	A

Oficio N° 9725 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0007711

	US20100240720	23/09/2010	-	-	A
	WO2012062157	18/05/2012	-	-	A
	US20140073801	13/03/2014	-	-	A
(¹) Cita completa literatura no patente (LNP) Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen</i>(Número), pp-pp. O Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.		Mei, Ww., Ji, Ss., Xiao, W. et al. (2017). Synthesis and biological evaluation of benzothiazol-based 1,3,4-oxadiazole derivatives as amyloid β-targeted compounds against Alzheimer's disease. <i>Monatsh Chem.</i> Recuperado de : https://link.springer.com/article/10.1007/s00706-017-1993-x			
		Bergeron M, Goodwin T. et al. (2005). A Convenient Approach to Stereoisomeric Iminocyclitols: Generation of Potent Brain-Permeable OGA Inhibitors <i>Angewandte Chemie International Edition</i> , 54(51), 15429–15433.			
		Macauley, M. S., He, Y., Gloster, T. M., Stubbs, K. A., Davies, G. J., & Vocadlo, D. J. (2010). Inhibition of O-GlcNAcase Using a Potent and Cell-Permeable Inhibitor Does Not Induce Insulin Resistance in 3T3-L1 Adipocytes. <i>Chemistry & Biology</i> , 17(9), 937–948.			
		Wadood, A., Ghufuran, M., Khan, A., Azam, S. S., Jelani, M., & Uddin, R. (2018). Selective glycosidase inhibitors: A patent review (2012–present). <i>International Journal of Biological Macromolecules</i> , 111, 82–91.			
(²) Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “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. “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.			“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. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “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.		
Fecha del reporte de búsqueda: 09/04/2021					
Examinador: Laura Alejandra Martínez Contreras					