

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-052852- -00011-0000
Fec: 2006-05-15 17:00:24 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 2 PATENTES
Evo: 1 REGDEPOSITO
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

E. S. D.

Re: P1.-SANOFI-AVENTIS.-Solicitud de Patente de Invención para "NUEVOS DERIVADOS DE AMINOTIAZOLES, SU PREPARACIÓN Y LAS COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN".-Clase A.61.-Expediente número 00-052.852.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 16 de Febrero de 2006.
2. Con el fin de dar respuesta a las objeciones citadas por el señor Examinador en el Concepto Técnico No. 194, me permito manifestar que es deseo del solicitante realizar las siguientes modificaciones al capítulo reivindicatorio:

- ✓ **REIVINDICACIÓN 1:** Se ha restringido el alcance de la reivindicación 1, reemplazando el compuesto de fórmula (I) por el compuesto de fórmula (I-2) contenido en la reivindicación 4 del capítulo reivindicatorio, aclarando que la anterior modificación **no amplía** de ninguna manera el alcance de la presente solicitud, toda vez que la misma solamente obedece a **restringir de manera significativa** los compuestos posibles al establecer como invariable la definición de los sustituyentes R₄ y R₅. De esta manera, al definir en la nueva reivindicación 1 estos dos sustituyentes, las reivindicaciones 3 y 4 del capítulo estudiado deben eliminarse, pues los compuestos allí reclamados incluían la definición de dichos sustituyentes.
- ✓ **REIVINDICACIÓN 6:** Se sustituye el texto incorrecto "Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (**EJEMPLO 36**)" debido a un error involuntario en la transcripción del texto original, por el texto apropiado "Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (**EJEMPLO 54**)". Nuevamente, se resalta que dicha modificación **no amplía** en ningún momento el alcance de la solicitud, ya que como podrá ser verificado, el ejemplo correcto para ese compuesto químico es el No. 54 tal como se puede apreciar en el cuadro 5 de la descripción (página 96).

RECIBIDA
SECRETARIA
BOGOTÁ, D.C.

- ✓ **REIVINDICACIÓN 7:** En la estructura del compuesto de fórmula (II) se reemplaza el sustituyente R_4 por un grupo metilo buscando su coherencia con la nueva reivindicación 1. Debido a esto, se hace necesario eliminar la expresión R_4 del final de la reivindicación 7 tal como se hizo con dicha expresión en la reivindicación original 1.

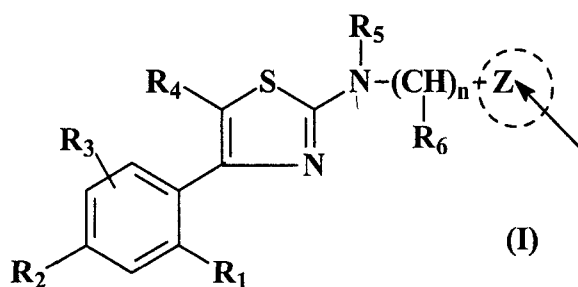
Es importante resaltar que dicha modificación **encuentra sustento en la descripción**, teniendo en cuenta que el intermediario de fórmula (II) que tiene un grupo metilo en la posición del sustituyente R_4 se encuentra en la Tabla 2 de la descripción de la solicitud en estudio, y nuevamente se manifiesta, que dicha modificación no amplía el alcance de la presente solicitud toda vez que se están restringiendo los posibles intermediarios al establecer como invariable la definición del sustituyente R_4 .

- ✓ **REIVINDICACIONES 9 y 10:** Son **eliminadas** de la solicitud en estudio por hacer referencia al uso del compuesto reclamado.

3. **NOVEDAD:** De acuerdo con el Concepto Técnico No. 194, el señor Examinador objeta la novedad de la reivindicación 7 con base en el documento **D1 (FR2735777)** y de las reivindicaciones 1 a 10 con base en el documento **D2 (FR2754258)**.

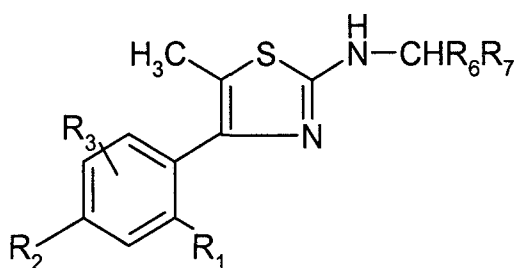
Sobre este particular me permito manifestar que tanto las modificaciones anteriormente presentadas, como los argumentos que se expondrán más adelante, pretenden superar dichas objeciones, tal como se demostrará a continuación:

- ✓ Como primera medida, me permito señalar una vez más que el documento **D1** describe los compuestos derivados de la fórmula:



mientras que los compuestos de la solicitud en estudio, de acuerdo con las modificaciones realizadas, son derivados de la fórmula





(II)

Adicionalmente, el señor Examinador anota que entre estas dos estructuras: "la única **diferencia se encuentra en el significado del sustituyente Z**, que dentro de los grupos aromáticos que comprende Z no se encuentra el fenilo, como si se encuentra en esa posición el fenilo, pero el resto de los sustituyentes todos y cada uno, iguales los significados de los sustituyentes con los de la solicitud en estudio, por lo que la anterioridad **se dice que es nueva**" (el resaltado es mío), es decir, reconoce la novedad de los compuestos reivindicados frente a **D1**.

Sin embargo, manifiesta en su Concepto Técnico No. **194** que "El proceso reclamado en la reivindicación 7, es una alquilación que se encuentra explícitamente representada en el (folio 192) en el esquema 1, renglones 35 a 37, donde se encuentra dicho proceso de alquilación que se reclama como nuevo en la solicitud en estudio".

Sobre este particular, me permito resaltar, que teniendo en cuenta la modificación anteriormente mencionada a la reivindicación 1, se presenta ahora una diferencia **aún mayor** entre el **compuesto** revelado en el documento **D1** y la solicitud presentada. Adicionalmente, me permito resaltar nuevamente que para el compuesto reclamado en el documento **D1**, el sustituyente Z es un grupo aromático o heteroaromático bi-tricíclico opcionalmente substituido, mientras que para el compuesto reclamado en la presente solicitud el sustituyente R_7 (que es, a nivel posicional dentro de la representación gráfica de la estructura, el equivalente a Z) es un grupo aromático o heteroaromático monocíclico de tipo fenilo con substituciones opcionales perfectamente definidas. Es claro entonces, que **todos** los sustituyentes posibles planteados como R_7 para el compuesto reclamado en la presente solicitud son de naturaleza diferente a la de aquellos contemplados para definir Z en el documento **D1**.

En consecuencia, habiendo establecido que el examinador **reconoce** la novedad de los compuestos reivindicados en la solicitud estudiada frente a los compuestos del documento **D1** y habiendo demostrado además, las diferencias estructurales existentes entre los compuestos mencionados,

226
321

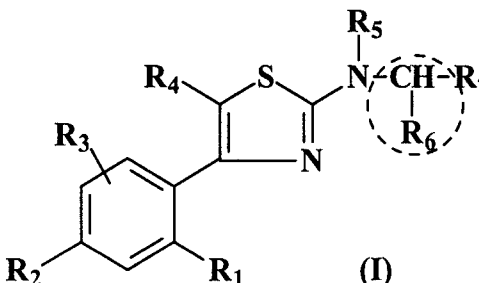
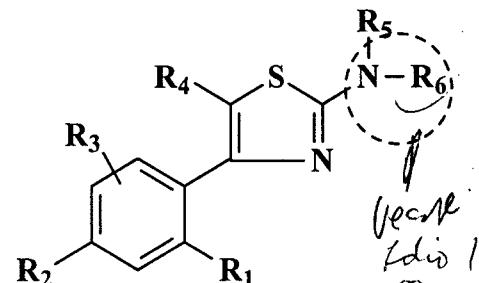
me permito anotar que la novedad del procedimiento reclamado en la reivindicación 7 está basada principalmente en la diferencia estructural entre el intermediario contenido en los renglones 35 a 37 de la página 8 del documento **D1** y el intermediario empleado en el proceso descrito en la solicitud estudiada, lo cual **inmediatamente** hace que las dos reacciones comparadas sean **diferentes**, toda vez que la obtención de productos químicos diferentes entre sí necesariamente implica la **existencia de condiciones de reacción particulares para cada uno**, demostrando de esta forma la novedad del procedimiento reivindicado, pues se está reclamando un proceso de síntesis en el cual mediante una reacción de alquilación determinada que se realiza **sobre un compuesto de fórmula estructural (II) es posible obtener específicamente el compuesto reclamado en la reivindicación 1** y no cualquier compuesto alquilado, incluyendo los compuestos de **D1**; por lo que se puede afirmar que el proceso de la reivindicación 7 difiere considerablemente con el compuesto involucrado del documento **D1**.

- ✓ Por otra parte, el señor Examinador afirma que en los compuestos extraídos del documento **D2** y enumerados en el Concepto Técnico No. **194** "... coinciden todos y cada uno de los significados de los sustituyentes con los de la solicitud en estudio, tal como lo muestra los compuestos específicos adjuntados a esta anterioridad, por lo cual la anterioridad carece de novedad".

Sobre este particular, me permito señalar tal como lo hice anteriormente en mi memorial de respuesta al concepto Técnico No. **1070**, que la diferencia principal entre los compuestos reivindicados en la solicitud estudiada y los del documento **D2** estriba en el hecho de que los compuestos de la presente invención son diferentes por la definición del grupo R_6 en las estructuras de las solicitudes en cuestión. Específicamente, **el grupo R_6 de los compuestos de D2 está enlazado a un átomo de nitrógeno** mientras que, por el contrario, **el grupo R_6 de los compuestos de la presente invención está enlazado directamente al grupo CH**, como lo demuestra claramente la siguiente comparación de las estructuras:

JOTANA
SEXIA
BOGOTÁ, D.C.he Jacopo
may
de 1701falso voce
folios 1890
192
(CH₂)_m 

227
322

PRESENTE INVENCION	DOCUMENTO D2
 (I)	 (I)

De aquí podemos ver que los compuestos resultantes en el documento **D2** siempre serán estructuralmente diferentes a los compuestos de la presente invención, debido a que el grupo R_6 en cada una de las estructuras correspondientes, está enlazado a un grupo completamente diferente. En efecto, una cosa es un átomo de nitrógeno y una muy diferente es un grupo (CH).

Por otro lado, teniendo en cuenta que la modificación realizada a la reivindicación 1, la cual **contempla la definición del sustituyente R_5 como un grupo alquilil** (específicamente 2-propinil) y que en ningún momento la definición de R_5 en el documento **D2** permite que este sustituyente sea un grupo alquilil, es **evidente** que existe una diferencia estructural **clara e importante** entre los compuestos reivindicados en la solicitud estudiada y los compuestos del documento **D2**.

Adicionalmente, me permito hacer notar que los compuestos de la lista suministrada por el señor Examinador en su Concepto Técnico **difieren estructuralmente de los compuestos revelados en la presente invención**, específicamente de los listados en la nueva reivindicación 4 de la presente solicitud, en los siguientes aspectos:

- Los compuestos listados en el documento **D2** contienen en su la expresión **-N-propilamino** mientras que los compuestos reclamados en la nueva reivindicación 4 contienen la expresión **prop-2-inilamina**, evidenciando aún más la diferencia expuesta anteriormente, y;
- Solo dos compuestos de la lista de la reivindicación 4 de la presente solicitud presentan en su nombre el texto "[4-(2-cloro-4-metoxifenil)..." (ejemplos 35 y 58) mientras que para **todos** los compuestos de la lista extraída del documento **D2**, se repite dicho texto. Adicionalmente, ninguno de los compuestos de la lista del

documento **D2** presenta en algún lugar de la molécula un sustituyente de tipo ciclopropilo, como sí lo presentan los compuestos de los ejemplos 35 y 58 mencionados en la reivindicación 4 de la presente solicitud.

Finalmente, me permito citar una vez más las enseñanzas del **Manual Andino de Patentes** en el cual se establece lo siguiente: "Para determinar la novedad de la invención, se debe comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contengan **explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención**. El examen de novedad se efectúa comparando elemento por elemento de la invención tal como está definido por las reivindicaciones con los del estado de la técnica"¹.

De acuerdo con lo anterior, es claro que los compuestos y el proceso reivindicados en la presente invención sí son novedosos frente a las enseñanzas de los documentos citados, toda vez que ninguna de estas referencias contiene **explícitamente todas** las características técnicas de los objetos reclamados en la solicitud en estudio pues como se ha demostrado, tanto el proceso del documento **D1** como los compuestos descritos en el documento **D2**, corresponden a enseñanzas diferentes respecto a lo ahora divulgado en la presente solicitud, y cualquier diferencia, por mínima que sea, hace posible que de manera **inmediata** se descarte la posibilidad de que dichos documentos afecten el requisito de novedad, pues tal como se señaló en mi memorial anterior, el mismo **Manual Andino** establece que "**Si una característica, aunque sea banal, no se encuentra contenida en el antecedente, la reivindicación es nueva**"².

CONCLUSIÓN

Finalmente, es importante tener en cuenta que el señor Examinador ha reconocido la claridad de las reivindicaciones 7 y 8, y que al haber eliminado del capítulo reivindicatorio de la solicitud estudiada las reivindicaciones 9 y 10, se entienden superadas las objeciones de claridad hechas por el señor Examinador.

En cuanto a las objeciones de novedad, al haberse realizado las modificaciones inicialmente mencionadas, que incluyen la restricción de los posibles compuestos reclamados y habiendo además demostrado que las diferencias resaltadas entre los compuestos reclamados en la presente solicitud y los compuestos de los documentos **D1** y **D2**, son **evidentes** y que no son de ninguna manera **banales**, es claro que la presente solicitud sí cumple con el requisito de **NOVEDAD**.

¹ COMUNIDAD ANDINA, Secretaría General, "Manual Andino de Patentes", Noviembre de 2003, Lima, Perú, página 61.

² Ibid1, página 62.

JOSE LLORED CAMACHO & CO.

Calle 72 No. 5-83 Piso 5, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

279
324

4. Anexo me permito presentar:

- (i) Recibo número 06 - 33,171 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas; y
- (ii) Copia de las nuevas páginas 99 a 103 del capítulo reivindicatorio, **que reemplazan las originalmente presentadas**, en las cuales se han realizado las modificaciones expuestas anteriormente.

5. En vista de lo anterior, ruego a usted proceder a estudiar nuevamente la solicitud a la luz de las argumentaciones presentadas y de las modificaciones realizadas y conceder el privilegio de patente solicitado.

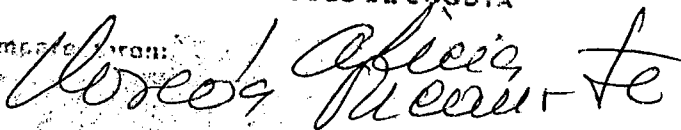
Señor Superintendente,

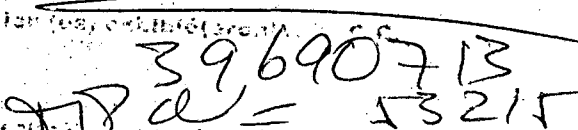
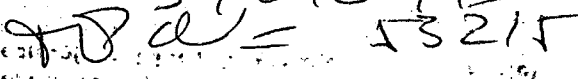
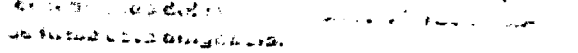
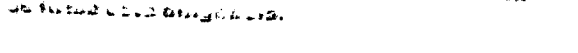

ALICIA LLORED RICAURTE
T.P. 53.215

NOTARIA
SEXTA
BOGOTÁ, D.C.

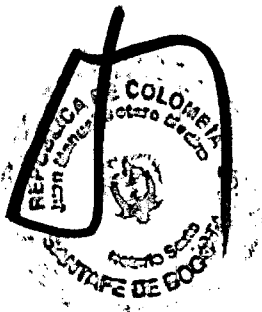
NOTARIA SEXTA DE NL
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERICIAL
Bogotá, D.C.
Acto en: JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTÁ

Comparecieron:



quien fue, en calidad de, 
39690713
53215
y de 
ed en 
que 
cia de 


ALICIA LLORED RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



230
325

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 33,171
FECHA : MAYO 4 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLORED A Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47044957	04/05/2006	950,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	95,000.00
		TOTAL :	95,000.00

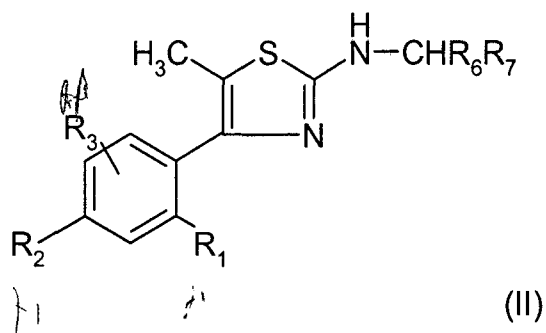
SON: NOVENTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Compuestos, en forma racémica o de enantiómero puro, de fórmula:



(II)

en la cual

- R₁ y R₂ idénticos o diferentes representan cada uno independientemente un átomo de halógeno; un hidroxil (C₁-C₅) alquilo; un (C₁-C₅) alquilo; un aralquilo en el cual la parte arilo es (C₆-C₈) y la parte alquilo (C₁-C₄); un (C₁-C₅) alcoxi; un grupo trifluorometilo; un grupo nitro; un grupo nitrilo; un grupo -SR en el cual R representa hidrógeno, un (C₁-C₅) alquilo o un aralquilo en el cual la parte arilo es (C₆-C₈) y la parte alquilo (C₁-C₄); un grupo S-CO-R en el cual R representa un radical (C₁-C₅)alquilo o un aralquilo en el cual la parte arilo es (C₆-C₈) y la parte alquilo es (C₁-C₄); un grupo -COORa en el cual Ra representa hidrógeno o un (C₁-C₅) alquilo; un grupo -CON RaRb con Ra y Rb tal como se los ha definido anteriormente para Ra; un grupo -NRaRb con Ra y Rb tal como se los ha definido precedentemente para Ra; un grupo -NRcRd en los cuales Rc y Rd constituyen con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo de 5 a 7 eslabones; o un grupo -NHCO-NRaRb con Ra y Rb tal como se los ha definido anteriormente para Ra;
- R₃ representa hidrógeno o es tal como se ha definido anteriormente para R₁ y R₂;
- ó bien R₂ constituye con R₃ cuando este substituye el fenilo en posición 5 un grupo -X-CH₂-X- en el cual X

representa independientemente un CH_2 , un átomo de oxígeno o de azufre;

- R_6 representa un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alcoxi $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo; un $(\text{C}_3\text{-C}_5)$ cicloalquilo; un $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ cicloalquil $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquiltio $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilsulfoxi $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilsulfodioxi $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo;
- R_7 representa un fenilo no substituido, mono, di o trisubstituido en posición 3, 4 ó 5 por un halógeno, por un $(\text{C}_1\text{-C}_5)$ alquilo, por un grupo $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ sobre dos átomos de carbono cercanos al fenilo, por un $-\text{CF}_3$, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, por un grupo $-\text{COOR}_8$, $-\text{CONR}_8\text{R}_9$ o por un grupo $-\text{CH}_2\text{OR}_8$ en los cuales R_8 y R_9 representan un $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo, OR_{10} en el cual R_{10} representa un $(\text{C}_1\text{-C}_5)$ alquilo; o bien R_7 representa un grupo piridilo, tiofeno, pirazolilo, imidazolilo, $(\text{C}_3\text{-C}_5)$ cicloalquilo o $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ cicloalquil $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilo;

sus sales de adición, sus hidratos y/o sus solvatos.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 **caracterizados** porque:

- R_1 y R_2 idénticos o diferentes representan cada uno independientemente un átomo de halógeno; un $(\text{C}_1\text{-C}_5)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_5)$ alcoxi;
- R_3 representa hidrógeno o es tal como se ha definido anteriormente para R_1 y R_2 ;
- R_6 representa un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilo; un $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alcoxi $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo; un $(\text{C}_3\text{-C}_5)$ cicloalquilo; un $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ cicloalquil $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ alquilo;
- R_7 representa un fenilo no substituido, mono o disubstituido en posición 3 ó 4 por un halógeno, un grupo $(\text{C}_1\text{-C}_5)$ alquilo, un grupo $-\text{CH}_2\text{OR}_8$ en el cual R_8 representa un $(\text{C}_1\text{-C}_3)$ alquilo o por un grupo $-\text{O}-\text{CH}_2-\text{O}-$ en posición 3,4; o bien R_7 representa un grupo $(\text{C}_3\text{-C}_5)$ cicloalquilo;

sus sales de adición, sus hidratos y/o sus solvatos.

3. Compuestos de acuerdo a la reivindicación 1 **caracterizados** porque R₃ está en posición 5 del fenilo.

4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, elegidos entre:

- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1R)-(1-(3-fluoro-4-metilfenil)-2-metoxietil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 31)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-fenilbutil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 33)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-feniletal)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 34)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxifenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-feniletal)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 35)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-fluorofenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 36)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-fenilpentil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 37)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1R)-(2-metoxi-1-(4-metoximetilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 40)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(4-metoximetilfenil)pentil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 42)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(4-fluorofenil)pentil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 45)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(ciclopropil-fenil-metil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 47)

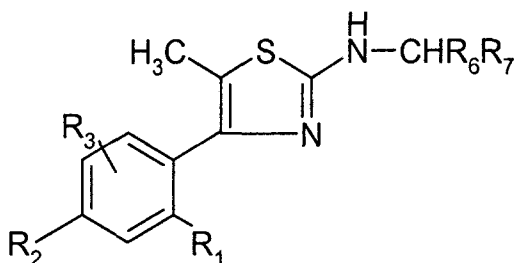
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(3-fluoro-4-metilfenil)pentil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 49)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(3-fluoro-4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 50)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(4-fluorofenil)butil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 51)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(3-fluoro-4-metoximetilfenil)butil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 52)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-clorofenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 53)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 54)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclobutil-1-(4-fluorofenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 55)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(4-bromofenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 56)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(3,4-metilendioifenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 57)
- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxifenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(3-fluoro-4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 58)
- Clorhidrato de [4-(2, 4-dimetoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(3-fluoro-4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 59)
- Clorhidrato de [4-(4-metoxi-2,5-dimetilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(2-ciclopropil-1-(3-fluoro-4-metilfenil)etil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 60)

235
330

- Clorhidrato de [4-(2-cloro-4-metoxi-5-metilfenil)-5-metiltiazol-2-il]-[(1S)-(1-(3,4-metilendioxifenil)butil)]prop-2-inilamina (EJEMPLO 61)

así como las bases correspondientes, las otras sales de adición, sus solvatos y/o hidratos.

5. Procedimiento de preparación de los compuestos de fórmula (I.2) de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizado porque esos compuestos se obtiene por alquilación de los compuestos de fórmula:



(II)

en la cual R_1 , R_2 , R_3 , R_6 y R_7 son tal como se los ha definido para (I.2). *Don't*

6. Composición farmacéutica **caracterizada** porque contiene como principio activo un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1.

236
331

375
2006-06-08

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C., 24 de mayo de 2006

Apoderado: Alicia Lloreda Ricaurte

Oficio: 6268

ASUNTO Radicación: 0-52852

Trámite 002

Evento 001

Actuación 430

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento nuevamente en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados:

- capitulo descriptivo, folios 05 a 102;
- capitulo reivindicatorio, folios 103 a 110;
- 1° examen de forma, folios a 114 y 141;
- respuesta técnica al 1° examen de forma, folios 142 a 148;
- solicitud de la cual se reivindica prioridad, junto con la traducción requerida, folios 128 a 239;
- 2° examen de forma, folio 257;
- Solicitud del examen de patentabilidad, folios 159 y 160;
- Examen de patentabilidad, folios 184 a 209;
- Respuesta técnica al examen de patentabilidad, 210 a 126.

Objeto de la invención:

El título de la invención es "NUEVOS DERIVADOS DE AMINOTIAZOLES, SU PREPARACIÓN Y LAS COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIEN".

El objeto de la presente solicitud se refiere a compuestos N-metil-4-fenil-1,3-tiazol-2-amina derivados.

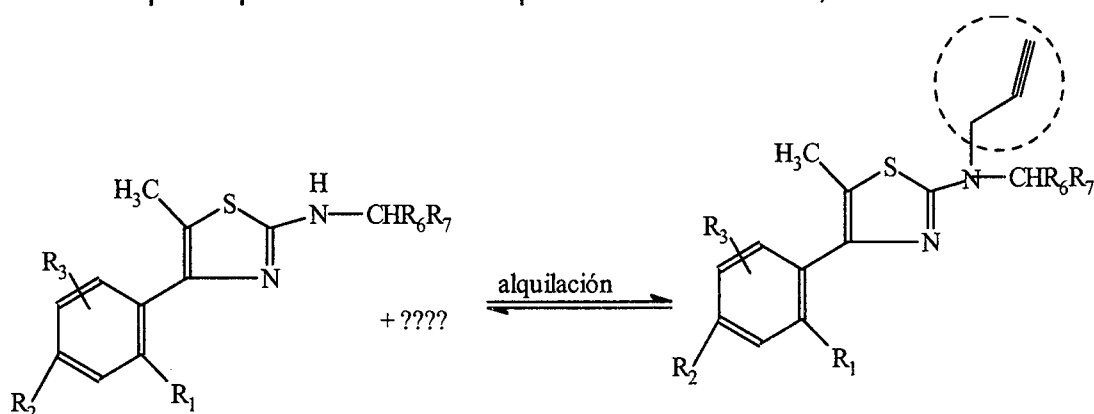
El objeto de la solicitud se puede clasificar según clasificación internacional en: A61K31/425, 31/13.

Claridad de la solicitud:

En el artículo 30 de la decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina se establece: "Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción".

-La reivindicación 5 introduce materia no contemplada en la descripción:

Reclama un proceso para la preparación de los compuestos de fórmula (I.2) obtenidos por alquilación de los compuestos de fórmula II, o sea:



En ninguna parte de la solicitud aparece explícitamente tal reacción, lo cual indica que esta introduciendo materia. Los procesos de alquilación son conocidos en el estado de la técnica. Además tal como es reivindicando no tiene ninguna característica técnica de proceso, porque los términos alquilación, no identifican los reactivos ni las condiciones de reacción, ni las etapas. (Vea folio 192 es lo que reclama)

De otra parte no cumple con el requisito de unidad inventiva, porque es un proceso para obtener un compuesto de fórmula (I.2), no los de fórmula (II), que son a los que se refiere el capítulo reivindicatorio, además que en la reivindicación no está establecido el significado de los sustituyentes de (I.2), están establecidos en la descripción, pero no en la reivindicación lo cual es inaceptable.

Por demás se encabeza como "Procedimiento de preparación de los compuestos de fórmula (I.2) de acuerdo con la reivindicación 1...." y los compuestos de fórmula (I.2), no caen dentro de los compuestos definidos por la fórmula (II), reclamados en la reivindicación 1.

Por lo tanto no se acepta el capítulo reivindicatorio enviado (folios 231 a 235) con la nueva respuesta al segundo examen de forma.

Por lo tanto se le indica nuevamente que:

Determinación del estado de la técnica:

El artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión establece: "El estado de la técnica

comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida.

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40."

Item	Documento	Fecha de publicación	Titulo
D1	FR2735777	27-dic-1996	Derives de 4-phenylaminothiazole, leur preparation et les compositions pharmaceutiques les contenant
D2	FR2754258	04-oct-98	D'aminothiazole, leur procede de preparation et les compositions pharmaceutiques les contenant

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

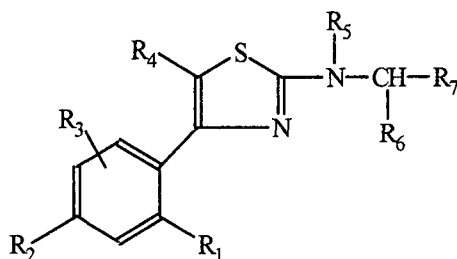
El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

En cumplimiento con este artículo, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

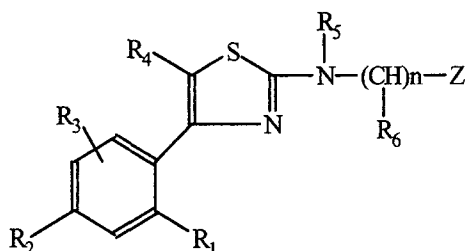
Evaluación de la Novedad:

El art.16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: "Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".

La solicitud en estudio se refiere a compuestos N-cetil-4-fenil-1,3-tiazol-2-amina derivados formula general (I).

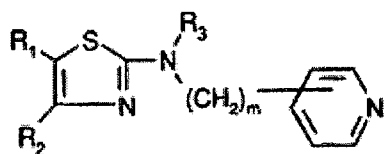


-La anterioridad D1 describe los compuestos de compuestos N-metil-4-fenil-1,3-tiazol-2-amina derivados de fórmula:



, R_1 , R_2 , R_3 , son iguales o diferentes representa cada uno independiente mente un átomo de halógeno, un radical alquilo $\text{C}_1\text{-C}_5$, un radical aralquilo, un grupo alcoxi....., R_4 es metilo.... R_5 , alquil $\text{C}_1\text{-C}_5$ por ejemplo; $n=1$ y Z representa un grupo aromático, o heteroaromático, por grupo aromático o heteroaromático según la descripción se entenderá grupos seleccionados de benzofurano, indano que puede ser sustituidos o no sustituidos. Además esta anterioridad también comprende (folio 189)

La demande de brevet EP-0 283 390, décrit parmi d'autres dérivés du thiazole, des dérivés du 2-(N-alkyl-N-pyridylalkylamino)thiazole de formule :

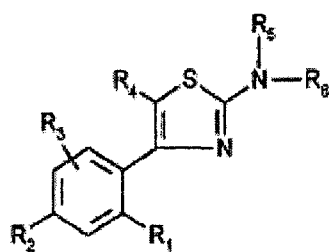


R_2 , es fenilo sustituido, $m=1$.

-El proceso de reclamado en la reivindicación 7, es una alquilación generica e indefinida, que se encuentra explícitamente representada en el (folio 192) en el esquema 1, renglones 35 a 37, donde se encuentra dicho proceso de alquilación que se reclama como nuevo en la solicitud en estudio.

-La anterioridad D2 describe compuestos derivados de compuestos N-metil-4-

fenil1,3-tiazol-2-amina especialmente los compuestos:



(I)

- R_1 et R_2 identiques ou différents représentent chacun indépendamment un atome d'halogène ; un (C_1-C_5) hydroxyalkyle ; un (C_1-C_6) alkyle ; un aralkyle dans lequel la partie aryle est en (C_6-C_8) et la partie alkyle en (C_1-C_4) ; un (C_1-C_6) alcoxy ; un groupe trifluorométhyle ; un groupe nitro ; un groupe nitrile ; un groupe $-SR$ dans lequel R représente l'hydrogène, un (C_1-C_5) alkyle ou un aralkyle dans lequel la partie aryle est en (C_6-C_8) et la partie alkyle en (C_1-C_4) ; un groupe $-S-CO-R$ dans lequel R représente un radical (C_1-C_5) alkyle ou un aralkyle dans lequel la partie aryle est en (C_6-C_8) et la partie alkyle est en (C_1-C_4) ; un groupe $-COORa$ dans lequel Ra représente l'hydrogène ou un (C_1-C_5) alkyle ; un groupe $-CONRaRb$ avec Ra et Rb tels que définis ci-dessus pour Ra ; un groupe $-NRaRb$ avec Ra et Rb tels que définis précédemment pour Ra ; un groupe $-CONRcRd$ ou $-NRcRd$ dans lesquels Rc et Rd constituent avec l'atome d'azote auquel ils sont liés un hétérocycle de 5 à 7 chaînons ; ou un groupe $-NHCO-NRaRb$ avec Ra et Rb tels que définis ci-dessus pour Ra ;
 - R_4 représente un (C_1-C_5) alkyle
 - R_5 représente un (C_1-C_5) alkyle
 - R_6 représente un phényle substitué par un ou plusieurs substituants Z tel que défini ci-dessous ; un groupe hétéroaromatique monocyclique en C_5-C_7 substitué par un ou plusieurs radicaux Z tels que définis ci-dessous ; ou un groupe bicyclique en C_9-C_{10} constitué d'un monocycle aromatique comportant éventuellement un ou plusieurs
- Par groupe hétéroaromatique monocyclique, on entend particulièrement un groupe choisi parmi azépinyle, pyridyle, pyrazinyle, pyridazinyle, pyrimidyle, triazinyle, furyle et thiényle.

Plus particulièrement préférés également sont les composés :

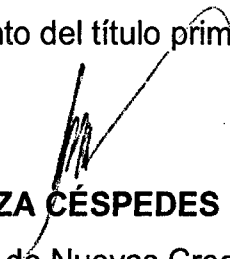
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxy-5-éthoxycarbonylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthyl-5-chlorophényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-trifluorométhylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxyphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2,6-dichlorophényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2,5-dichlorophényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-chloro-5-méthylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-chloro-5-trifluorométhylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-chloro-5-méthoxyphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxy-5-chlorophényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-éthoxy-5-chlorophényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxy-5-méthylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2,5-diméthylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2,5-ditrifluorométhylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxy-5-trifluorométhylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2,5-diméthoxyphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2-chloro-4-méthoxyphényl)-5-méthyl-2-[N-(2-méthoxy-5-méthoxycarbonylphényl)-N-propylamino]thiazole
- . 4-(2,4-dichlorophényl)-5-méthyl-2-[N-(2,5-dichlorophényl)-N-propylamino]thiazole, un de leurs stéréoisomères, un de leurs sels, un de leurs hydrates et/ou un de leurs

En la cual coinciden todos y cada uno de los significados de los sustituyentes con los de la solicitud en estudio, con el mero hecho de que un solo compuesto se solape la solicitud tiene falta de novedad, ya que la solicitud no tiene ningún derecho sobre compuestos del estado de la técnica, y esos compuestos se pueden observar, tal como lo muestra los compuestos específicos adjuntados a esta anterioridad, por lo cual la anterioridad carece de novedad.

No	Documento:	Reivindicaciones afectadas:	Requisito afectado:
D1	FR 2735777	1 a10	Novedad
D2	FR 2754258	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 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.

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.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 08 JUN. 2006

CONCEPTO TÉCNICO No	902	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202012
---------------------	-----	-------------------------------------