

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94 -76 - Of.305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tels: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

7/10
250

As: 2578/P.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Rad: 03-058084- -00004-0000

Fec: 2008-08-28 14:29:27 Dep. 2020 NUECREACIONES

Tít. 2 PATENTES

Evo: 1 REGDEPOSITO

Act 509 IMPULSOPROCESAL Folios: 1

Doctor

GIANCARLO MARCENARO JIMÉNEZ

Superintendente Delegado Para la Propiedad Industrial

EXPEDIENTE: 03-056.084

**ASUNTO: Solicitud de patente a nombre de
Janssen Pharmaceutical, N.V.**

Estimado Doctor:

En mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante de la patente de la referencia manifiesto a usted lo siguiente:

1. Mediante memorial radicado en ese despacho el 14 de julio de 2004, el cual no ha sido resuelto aún, solicité que se realizara el examen de patentabilidad.
2. En vista de que han transcurrido 2 años y 2 meses, sin que se haya atendido dicha solicitud, ruego a usted se sirva dar las instrucciones del caso para que se proceda de inmediato a resolver este asunto.

Cordialmente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
CC 39.779.452 de Usaquén.
T.P. 68228

251 25

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 03-56084

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION
FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 540, DE
FECHA 31 DE MAYO DE 2004, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA LEY
EXPIRA EL 30 DE AGOSTO DE 2004.

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI ☐ ☐

NO ☒ ☐

252 

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020/
Bogotá, D.C.,

Doctora
Jimena Escobar
Apoderada

Oficio N° 12927

REFERENCIA	Radicación	03 56084
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Folios	006

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 03 56084, realizado según el artículo 45 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica:

Documentos estudiados:

- . Descripción: folios 11-84
- . Ejemplos: folios 84-172
- . Capítulo reivindicatorio estudiado: folios 173-228
- . Se perdió el derecho a prioridad, debido a que no presentó dentro de los dieciséis meses siguientes, contados a partir de la fecha de prioridad, copia de la misma certificada por la autoridad que la expidió, de acuerdo a los artículos 9 y 10 de la decisión 486.

Objeto de la invención

Según las reivindicaciones 1 a 16 de la presente solicitud, se refiere a un receptor modulador CCK-1 de fórmula (I), cuyos sustituyentes se encuentran revelados en la descripción.

Clasificación internacional de patentes A 61 K 31/415

Excepciones a la patentabilidad

El artículo 20d de la decisión 486 establece que *"No serán patentables los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales"*

253 78

Teniendo en cuenta lo anterior, el contenido de la reivindicación 3, que trata de "Un método de tratamiento...", no es patentable.

Determinación del estado de la técnica:

Consultadas las fuentes de información con que cuenta este despacho, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de presentación de la presente solicitud - 03.07.03-, relacionados con la materia de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
1	EP 0293220	" (1', 5'-diaril-3-pirazolil)-N-hidroxiopropanamidas-2- y 3-sustituidas farmacológicamente activas y método para sintetizarlas"	30.11.88

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

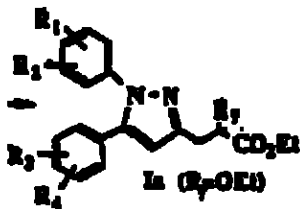
El artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina establece que: *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial"*

En cumplimiento del artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina, 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 artículo 16 de la decisión 486 establece que *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica"*

La publicación EP 0293220, revela compuestos de fórmula (Ia):



, cuyos sustituyentes se revelan en la descripción.

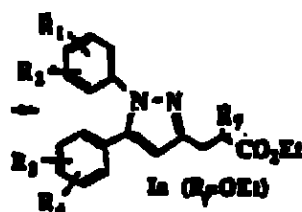
Comparando elemento por elemento, muchos de los compuestos de la presente solicitud, así como su método de síntesis, son iguales a los de la presente solicitud, y puede afectar la novedad de la presente solicitud.

Evaluación del NIVEL INVENTIVO

El artículo 18 de la decisión 486 establece que *"Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*

254 

La publicación EP 0293220, revela compuestos de fórmula (Ia):



, cuyos sustituyentes se revelan en la descripción. Son agentes anti inflamatorios y agentes para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proveer derivados de difenilpirazoles como agentes terapéuticos, es una derivación evidente del estado de la técnica ya que las enseñanzas del documento citado enseñarían a una persona versada en la materia a fabricar los compuestos de la presente solicitud.

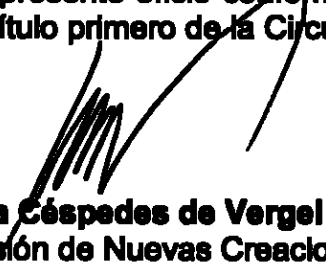
Finalmente no se demuestran propiedades sorprendentes o inesperadas de los compuestos de la presente solicitud en comparación con los del estado de la técnica.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	EP 0293220	1-16	Novedad
			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 días contados a partir de la fecha de la 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 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001


Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

09 NOV. 2006

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO Número 1710	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202024
---------------------------------	-------------------------------------



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

Publication number:

0 293 220
A2

255
T/K

②

EUROPEAN PATENT APPLICATION

⑤ Application number: 89304221.7

⑥ Date of filing: 27.05.88

⑦ Int. Cl.⁴: C 07 D 231/12
C 07 C 65/32, C 07 C 65/34,
C 07 C 65/36, C 07 D 213/79

⑧ Priority: 28.06.87 US 55908 27.04.88 US 101088

⑨ Date of publication of application:
20.11.88 Bulletin 88/48

⑩ Designated Contracting States:
AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL SE

⑪ Applicant: ORTHO PHARMACEUTICAL CORPORATION
U.S. Route 202 P.O. Box 308
Raritan New Jersey 08869-0308 (US)

⑫ Inventor: Murray, William V.
RD No. 1, Box 477 Township Line Road
Belle Mead, NJ 08804 (US)

Winkler, Michael P.
48 North St, P.O. Box 382
Bloombury, NJ 08804 (JP)

⑬ Representative: Jones, Alan John et al
CARPMAELS & RANSFORD 48 Bloomsbury Square
London, WC1A 2RA (GB)

⑭ Pharmacologically active 2- and 3-substituted (1',3'-diaryl-5-pyrazolyl)-N-hydroxypropanamides and method for synthesizing.

⑮ 2- and 3-substituted (1',3'-diaryl-5-pyrazolyl)-N-hydroxypropanamides, a method for their preparation, compositions containing the same and methods of their use are disclosed. The N-hydroxypropanamides are useful in alleviating inflammatory and cardiovascular disorders in mammals.

EP 0 293 220 A2

Revised/Revised (Rev)

256
7/16

amount of an above-described N-hydroxy-propanamide compound dispersed in a pharmaceutically acceptable carrier. The dose may be administered by topical, p.o., parenteral or aerosol routes. In preferred practice, the substituted N-hydroxypropanamide compound is capable of inhibiting both the cyclooxygenase and the lipoxygenase pathways in the amount present in the composition, when the composition is introduced into a mammal.

Further contemplated is a method for alleviating inflammation in a mammal exhibiting an inflammatory condition. That method comprises administering to that mammal a pharmaceutical composition that includes as the active ingredient an effective amount of an above-described N-hydroxypropanamide compound dispersed in a pharmaceutically acceptable carrier for topical, oral, parenteral and aerosol administration.

A method for synthesizing a 1',5'-diaryl-3-pyrazolyl-N-hydroxypropanamide is also contemplated.

The present invention provides several benefits and advantages.

A particular benefit of the invention is that it provides pharmacologically active compounds that are useful in treating inflammatory conditions.

Another benefit of the present invention is that some of its pharmacologically active compounds inhibit the cyclooxygenase enzyme pathway, thereby providing a further means for studying that biological process.

Another advantage of the present invention is that some of its pharmacologically active compounds inhibit the lipoxygenase enzyme pathway, thereby providing a further means for studying that biological process.

Still further benefits and advantages of the present invention will be apparent to those skilled in the art from the detailed description and Examples that follow.

Detailed Description of the Invention

1',5'-Diaryl-3-pyrazolyl-N-hydroxypropanamide compounds, pharmaceutical compositions containing a substituted propanamide compound as an active ingredient, a method of treating a mammal exhibiting an inflammatory condition and a method of synthesizing the substituted propanamide compound are contemplated herein.

In the above formula, R₁, R₂, R₃ and R₄ are substituents on phenyl rings that substitute for hydrogen atoms at positions 1 and 5 of the pyrazole ring. It is preferred that at least one of R₁ and R₂, and one of R₃ and R₄ be substituted at the 4-positions of their respective phenyl rings.

In examining the above structural formula to which the useful N-hydroxypropanamide compounds conform, it is noted that the R₁, R₂, R₃ and R₄ radicals can be a "lower" alkyl, "lower" alkoxy and the like. Groups and radicals referred to as "lower" denote that they possess 1 to about 6 carbon atoms. The same is true for "lower" groups and radicals that are substituents of the "lower" groups and radicals enumerated.

Lower alkyl radicals include, for example, methyl, ethyl, propyl, isopropyl, n-butyl, sec-butyl, t-butyl, n-pentyl, 2-methyl-3-butyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, neopentyl, n-hexyl, 1-methylpentyl, 3-methylpentyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 2-hexyl, 3-hexyl, and the like.

Lower alkoxy radicals are oxygen ethers formed from a before-described lower alkyl group. Exemplary radicals include methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy, n-butoxy, and the like.

Lower alkylthio radicals of R₁, R₂, R₃ and R₄ are sulfide ethers and are thus analogous to the oxygen ethers described above.

Halo radicals preferably include chloro and bromo, as well as fluoro and iodo.

Lower alkylsulfonyl radicals contain a before-described lower alkyl radical bonded to an SO₂ moiety that is itself also bonded to a phenyl ring. Exemplary lower alkylsulfonyl radicals thus include methylsulfonyl, ethylsulfonyl, 2-ethylbutylsulfonyl and the like.

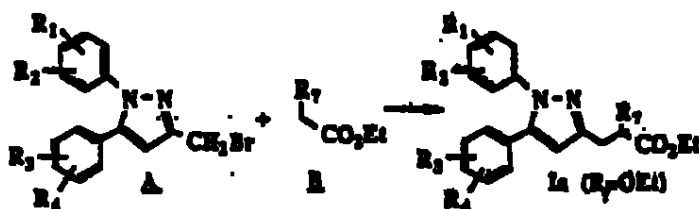
An omega-trifluoromethyl lower alkoxy radical is a lower alkoxy radical as before described that additionally includes a trifluoromethyl group at a position furthest on the alkyl chain from the place of bonding to the phenyl ring. Exemplary of such radicals are the 2,2,2-trifluoromethylethoxy.

Naphthyl and substituted naphthyl radicals can replace an aryl group herein at either the 1- or 2-positions to provide 1-naphthyl or 2-naphthyl substituents, respectively. Substituents on the naphthyl radicals can be any of those described herein as being useful aryl substituents. Exemplary substituted 1- and 2-naphthyls include 6-methoxy-2-naphthyl and the like.

The compounds of structure I in which R₂ is O-lower alkyl are synthesized by addition of the appropriately substituted 3-bromomethyl-1,5-diphenylpyrazole A to the anion of the appropriately substituted aryl ester B generated by treatment with sodium hydride in a suitable solvent such as dimethylformamide according to Scheme 1 (R₇=Aryl).

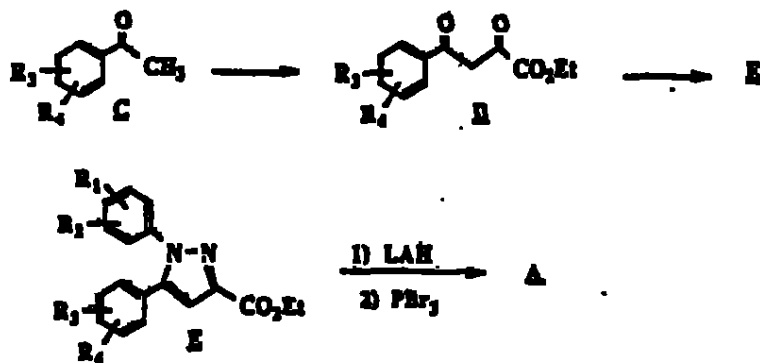
257
7/7

SCHEME 1



The 3-bromomethylpyrazole A is synthesized as depicted in Scheme 2. The 4-aryl-2,4-dioxobutanoate D is synthesized by treatment of the anion of acetophenone C with a dialkyl carbonate such as diethyl carbonate and then converted to the 3-carboalkoxypyrazole E with the appropriately substituted phenylhydrazine. Reduction with LiAlH₄ gave the corresponding hydroxymethyl analog which was then converted to the bromomethylpyrazole A with Phosphorus tribromide.

SCHEME 2



The compounds of Structure I in which R₆ is hydroxy and N(OH)Me are synthesized as shown in Scheme 3. Hydrolysis of the ester with aqueous base such as sodium or potassium hydroxide gives the pyrazole propionic acid (R₆ = OH) which upon treatment with oxalyl chloride in a suitable solvent such as CH₂Cl₂, for example, affords the corresponding acyl chloride which is then converted with an N-alkylhydroxylamine such as N-methylhydroxylamine to the hydroxamic acid (R₆ = N(OH)R₁₀ where R₁₀ is lower alkyl).