

CAVELIER

ABOGADO

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SIS
CARRERA 4 No.
BOGOTA 8, COL

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-051551- -00003-0000

Fecha: 2007-04-25 17:00:39 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

1
0
0
0

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación: 538

Referencia : Expediente No. 05051551
Asunto : Solicitud de patente para **DERIVADOS DE [6,7-DIHIDRO-5H-IMIDAZO[1,2- α]IMIDAZOL-3-SULFONILAMINO]-PROPIONAMIDA.**
Solicitante : **BOEHRINGER INGELHEIM PHARMACEUTICALS INC.**
Publicada en : La Gaceta No. 569 Del 31 de octubre de 2006
Fecha de Solicitud : 26 de mayo de 2005

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado en el asunto de la referencia, atentamente, solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia presentada de acuerdo con el Capítulo II del PCT y según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo por valor de \$ 202.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 36155 de 28 de diciembre de 2006.

2. Ruego atentamente a la Señora Jefe se sirva ordenar que se anexe este recibo para que se efectúe dicho examen y se continúe con el trámite de la solicitud.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 07612-841-010-7
JDF/ASG/ID-000300/WPCL7612
Cns M-2007-00002058

137
137

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-051551- -00003-0000

Fecha: 2007-04-25 17:00:39 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900174009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 8.083
FECHA : ENERO 29 DE 2007

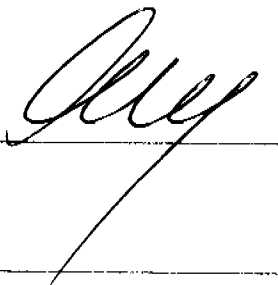
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PAGO	VAL. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-60110-6	55272635	29-01-2007	54.500.000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. ENTISTADO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 90005-01-01 SOLICITUDES	114 FTO CAP-II EXAMEN DE PATENTIDILTO	202.000.00
	TOTAL :	\$ 202.000.00

CON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

09612 841 CIO 7
COLO 14502 841 001 4

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 05-51551

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **569** DE

FECHA **31 DE OCTUBRE DE 2006**, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL **01 DE FEBRERO DEL 2007**

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 ___ **X** ___

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
1 February 2001 (01.02.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/07440 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07D 487/04,
C07F 9/40, C07D 519/00, C07F 9/38, A61K 31/41,
31/415, A61P 29/00 // (C07D 487/04, 233:00) (C07D
487/04, 233:00, 249:00) (C07D 487/04, 233:00, 257:00)

Main Street, New Canaan, CT 06840 (US). EMEIGH,
Jonathan, Emilian [US/US]; 6 Kenmere Boulevard, Dan-
bury, CT 06810 (US). SORCEK, Ronald, J. [US/US]; 8D
Beach Street, Bethel, CT 06801 (US).

(21) International Application Number: PCT/US00/18884

(74) Agents: RAYMOND, Robert, P. et al.; Boehringer In-
gelheim Corporation, 900 Ridgebury Road, P.O. Box 368,
Ridgefield, CT 06877 (US).

(22) International Filing Date: 12 July 2000 (12.07.2000)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/144,905 21 July 1999 (21.07.1999) US
60/150,939 26 August 1999 (26.08.1999) US

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR,
HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR,
LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ,
NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(71) Applicant (*for all designated States except US*):
BOEHRINGER INGELHEIM PHARMACEUTI-
CALS, INC. [US/US]; 900 Ridgebury Road, P.O. Box
368, Ridgefield, CT 06877 (US).

(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian
patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European
patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE,
IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (*for US only*): WU, Jiang-Ping
[US/US]; 55 Mill Plain Road, #32-11, Danbury, CT 06811
(US). KELLY, Terence, Alfred [US/US]; 66 Overlook
Drive, Ridgefield, CT 06877 (US). LEMIEUX, Rene,
M. [CA/US]; 1193 Old Turnpike Road, Plantsville, CT
06479 (US). GOLDBERG, Daniel, R. [US/US]; 284

Published:

— With international search report.

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 01/07440 A1

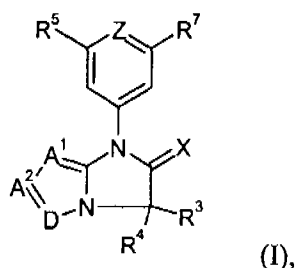
(54) Title: IMIDAZOIMIDAZOLES AND TRIAZOLES AS ANTI-INFLAMMATORY AGENTS

(57) Abstract: Compounds of formula (I) which are useful for treating or preventing inflammatory and immune cell-mediated dis-
eases.

140
140

What is claimed is:

1. A compound of the formula I



5

wherein:

A¹ is =N- or =C(H)-;

A² is =N-, =C(H)-, or =C(R')- wherein R' is halogen, -CN, -Oalkyl, -CO₂alkyl or
10 -SO₂alkyl, wherein the foregoing alkyl moieties are of 1 to 3 carbon atoms;

D is =N-, =C(R¹)-, =C(H)-, =C(SO₂R¹)-, =C(S(O)R¹)-, =C(C(O)R¹)-, =C(C(O)H)-,
=C(SR^{1a})-, =C(OR^{1a})- or =C(NHR^{1a})-,

wherein R¹ is selected from the class consisting of:

(A) -R¹⁰⁰, which is:

15 branched or unbranched alkyl of 1 to 6 carbon atoms, alkenyl of 2 to 6 carbon
atoms or cycloalkyl or cycloalkenyl of 3 to 6 carbon atoms, in which alkyl,
alkenyl, cycloalkyl or cycloalkenyl group one or more hydrogen atoms are
optionally and independently replaced with:

(i) halogen,

20 (ii) oxo,

(iii) aryl or heteroaryl which is selected from the class consisting of phenyl,
naphthyl, indolyl, thiophenyl, pyridyl, pyrimidinyl, furyl, pyrrolyl,
oxazolyl, thiazolyl, pyrazolyl, isoxazolyl, imidazolyl, isothiazolyl,
oxadiazolyl, triazolyl, thiadiazolyl, pyridazinyl, pyrazinyl, triazinyl,
25 indolizinyl, isoindolyl, benzo[b]furanyl, benzo[b]thiophenyl, indazolyl,

141
142

R⁴ is a group of the formula -CH₂R⁵⁵, wherein,

R⁵⁵ is:

phenyl, which is optionally substituted at the 4-position with:

5 (A) R^{59e}, which is aryl or heteroaryl selected from the class consisting of phenyl, thiophenyl, pyridyl, pyrimidinyl and furyl, wherein one of the hydrogen atoms of said aryl or heteroaryl group is optionally replaced with:

- (i) methyl,
(ii) -CN,
10 (iii) nitro, or
(iv) halogen,

- (B) methyl,
(C) -CN,
(D) nitro, or
15 (E) halogen;

R⁵ is Cl;

Z is =C(H)-; and,

R⁷ is Cl;

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

20

7. A compound of the formula I, as set forth in claim 1, wherein:

A¹ is =N-;

A² is =C(H)-;

25 D is =C(SO₂R¹)- or =C(C(O)R¹)-, wherein R¹ is selected from the class consisting of:

(A) -R^{100e}, which is:

branched or unbranched alkyl of 1 to 6 carbon atoms or cycloalkyl of 3 to 6 carbon atoms, in which alkyl, or cycloalkyl group one to three hydrogen atoms are optionally and independently replaced with:

142
142

- (i) oxo,
- (ii) a group of the formula -COOR^{18} , wherein R^{18} is straight or branched alkyl of 1 to 7 carbon atoms or cycloalkyl of 3 to 6 carbon atoms,
- (iii) a group of the formula $\text{-CONR}^{19}\text{R}^{20}$, wherein R^{19} and R^{20} are each, independently, a hydrogen atom, alkyl of 1 to 6 carbon atoms or cycloalkyl of 3 to 6 carbon atoms, or wherein R^{19} and R^{20} constitute a saturated hydrocarbon bridge of 3 to 5 carbon atoms which together with the nitrogen atom between them form a heterocyclic ring, and wherein one carbon atom in said hydrocarbon bridge is optionally replaced by -O-, -NH-, or -NMe-,
- (iv) a group of the formula -OR^{21} , wherein R^{21} is a hydrogen atom, or a straight or branched alkyl or acyl group of 1 to 7 carbon atoms, or
- (v) a group of the formula $\text{-NR}^{23}\text{R}^{24}$, wherein R^{23} and R^{24} are each, independently,
- (a) a hydrogen atom,
- (b) straight or branched alkyl or acyl of 1 to 7 carbon atoms or cycloalkyl of 3 to 7 carbon atoms,
- (c) a group of the formula $\text{-(CH}_2\text{)}_m\text{COOH}$, wherein m is 0, 1 or 2,
- (d) a group of the formula $\text{-(CH}_2\text{)}_n\text{COOR}^{25}$, wherein n is 0, 1 or 2, and wherein R^{25} is straight or branched alkyl of 1 to 6 carbon atoms, or
- (e) a group of the formula $\text{-(CH}_2\text{)}_n\text{CONHR}^{25}$, wherein n is 0, 1 or 2, and wherein R^{25} is straight or branched alkyl of 1 to 6 carbon atoms, and
- (B) saturated heterocyclic groups selected from the class consisting of pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl, morpholinyl and thiomorpholinyl, wherein said heterocyclic groups are optionally mono- or di-substituted with moieties independently selected from the class consisting of:
- (i) oxo,
- (ii) -OR^{101} , wherein R^{101} is:

143
43

- (a) a hydrogen atom,
- (b) alkyl of 1 to 7 carbons, wherein one hydrogen atom of said alkyl group is optionally replaced with -OH, -OR¹¹⁰ (wherein R¹¹⁰ is an alkyl moiety of 1 to 6 carbon atoms), -NH₂, -NHMe or -NMe₂,
- 5 (c) acyl of 1 to 7 carbons, wherein one hydrogen atom of said acyl group is optionally replaced with -OH, -OR¹¹¹ (wherein R¹¹¹ is an alkyl moiety of 1 to 6 carbon atoms), -NH₂, -NHMe or -NMe₂,
- (d) -CONR¹⁰²R¹⁰³, wherein R¹⁰² and R¹⁰³ are each independently a hydrogen atom or alkyl of 1 to 7 atoms, or wherein R¹⁰² and
- 10 R¹⁰³ constitute a saturated hydrocarbon bridge of 3 to 5 carbon atoms which together with the nitrogen atom between them form a heterocyclic ring, and wherein one carbon atom in said hydrocarbon bridge is optionally replaced by -O-, -NH-, or -NMe-, or
- (e) -COOR¹⁰⁴, wherein R¹⁰⁴ is alkyl of 1 to 7 atoms,
- 15 (iii) -CONR¹⁰⁵R¹⁰⁶, wherein R¹⁰⁵ and R¹⁰⁶ are each independently:
- (a) a hydrogen atom, or
- (b) straight or branched alkyl of 1 to 7 atoms or cycloalkyl of 3 to 7 atoms, wherein said alkyl or cycloalkyl group is optionally
- 20 monosubstituted with -OH, -OR¹²³ (wherein R¹²³ is an alkyl moiety of 1 to 6 carbon atoms), -NH₂, -NHMe, -NMe₂, pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl or morpholiny,
- or, wherein R¹⁰⁵ and R¹⁰⁶ constitute a saturated hydrocarbon bridge of 3 to 5 carbon atoms which together with the nitrogen
- 25 atom between them form a heterocyclic ring, and wherein one carbon atom in said hydrocarbon bridge is optionally replaced by -O-, -NH-, or -NMe-,
- (iv) -COOR¹⁰⁷, wherein R¹⁰⁷ is a hydrogen atom, or straight or branched alkyl of 1 to 7 carbon atoms ,

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
Emilio Ferrero
Apoderado

ASUNTO	Radicación	05 51551
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	012
	Folios	15730

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	PCT/US2003/033865		
Fecha de Presentación Internal.	27/10/2003		

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios 53 - 83
- 1.2. Reivindicaciones: Folios 84 - 89
- 1.3. Prioridad: Presentada en Estados Unidos el 30.10.02, bajo el número 60/422446

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "Derivados de [6,7-dihidro-5H-imidazo[1,2- α]imidazol-3-sulfonilamino]propionamida".

Según las reivindicaciones 1-14 se refiere a compuestos derivados de [6,7-dihidro-5H-imidazo[1,2- α]imidazol-3-sulfonilamino]propionamida de fórmula I que

son activos en el tratamiento de condiciones inflamatorias, se revela además su procedimiento de síntesis y composiciones farmacéuticas que los contienen.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de más compuestos que sean efectivos en la prevención de enfermedades inflamatorias e inmunes.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona los compuestos de la presente solicitud que son efectivos en el tratamiento de asma, dermatitis o enfermedades autoinmunes.

- Clasificación Internacional de Patentes A 61 K 31/4164

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- Los términos "alquileo", "alquenilo", "alquilo", "arilo", "heteroarilo" de la reivindicación 1 son muy amplios y pueden abarcar compuestos que no se encuentran revelados en la descripción

4. Excepciones a la patentabilidad (artículo 20d D 486)

- El contenido de las reivindicaciones 8-12, que trata de "Un método para tratar la inflamación...", no es patentable, debido a que se relaciona con métodos terapéuticos aplicados a los seres humanos o a animales.

5. Determinación del Estado de la Técnica

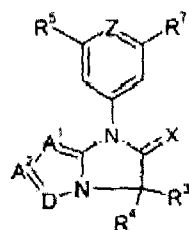
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 30.10.02, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 0107440	"Imidazoimidazoles y triazoles como agentes antiinflamatorios"	01.02.01

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

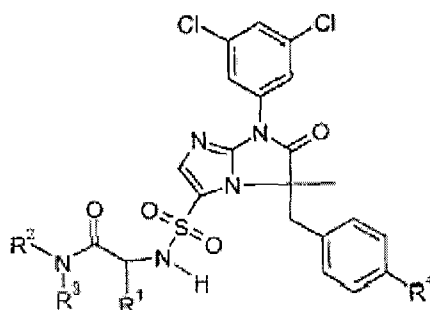
6.1. Novedad (artículo 16 D486)

- La solicitud WO 0107440 revela compuestos de fórmula:



, cuyos sustituyentes se revelan en la descripción y composiciones farmacéuticas que los contienen, así como su método de síntesis.

- La presente solicitud revela compuestos de fórmula



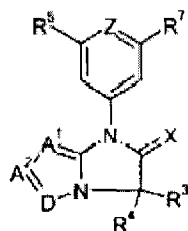
Comparando elemento por elemento, vemos que los compuestos de D1 son iguales a los de la presente solicitud cuando en D1:

- A1 es N
- A2 es CH
- D es C(SO2R1)
- R1 es -NR23R24
- R23 es H
- R24 es -CH2CONHR25
- R25 es una cadena lineal o ramificada de alquilo de 1-6 carbonos

En conclusión los compuestos revelados en D1 tienen todos los elementos característicos de los compuestos de las reivindicaciones 1-4, 6-7 y 13 y puede afectar la novedad de la presente solicitud.

6.2. Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

- La solicitud WO 0107440 revela compuestos de fórmula:



, cuyos sustituyentes se revelan en la descripción y composiciones farmacéuticas que los contienen, así como su método de síntesis, se ve que los compuestos con útiles para el tratamiento o prevención de enfermedades inflamatorias o autoinmunes. La diferencia con los compuestos de la reivindicación 5, es que estos últimos no se encuentran específicamente revelados en D1.

Teniendo en cuenta, el objeto de la presente solicitud el cual es proveer compuestos derivados de imidazoles que son activos en enfermedades inflamatorias o autoinmunes, es una derivación evidente del estado de la técnica, ya que D1 ya enseña compuestos muy similares que tienen la misma acción terapéutica.

Finalmente, no se demuestra el efecto mejorado o sorprendente de los compuestos de la presente solicitud en comparación con lo conocido en el estado de la técnica.

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 0107440	1-4, 6, 7, 13-14	Novedad
		5-7	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 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 División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 12-2-2024

CONCEPTO TECNICO No. 3640	EXAMINADOR TECNICO Código No.202024
-------------------------------------	---