

LLOREDA & CIA. S. A.

ABOGADOS

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-034776- -00004-0000

Fecha: 2007-06-22 16:59:50 Dep: 2020 NUECREACIONES
Ira: 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act: 538 PETICION Folios: 2

CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jlccco@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en
Fase Nacional PCT para "DERIVADOS DE BENCIMIDAZOL
Y DERIVADOS DE IMIDAZOPIRIDINA,
PREPARACIÓN DE LOS MISMOS, COMPOSICIONES
QUE LOS CONTIENEN Y USOS DE LOS MISMOS".-
Clase C07D 235/06.-Expediente número 05-034.776.-

1. Me refiero a mi memorial de 20 de Mayo de 2005.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número **574** de 30 de Marzo de 2007, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. Me permito recordar a usted, que tal como se informó en el Petitorio de la invención, la presente solicitud corresponde a Capítulo II.
4. Anexo me permito acompañar recibo número 07-45.760, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa.

Señor Superintendente,

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

161
162

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
FOLIO 379
Act. 538 PETICION
Folios: 2
Lve: 379 FASENACIONALII

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 45,760
FECHA : JUNIO 6 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55092733	06/06/2007	7,588,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILIDAD	202,000.00
	TOTAL :	\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-34776

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **574** DE

FECHA **30 DE MARZO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **03 DE JULIO DE 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

Nouveaux dialkylaminoalkyl-1 p-alkoxyphényl alkyl-2 benzimidazoles 5-substitués.
 (Invention : Serge LÉCOLIER.)

ÉTAT FRANÇAIS REPRÉSENTÉ PAR LE MINISTRE DES ARMÉES, DÉLÉGATION MINISTÉRIELLE POUR L'ARMEMENT (DIRECTION DES POUDRES) résidant en France (Seine).

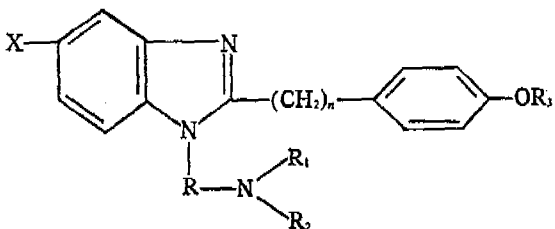
Demandé le 25 novembre 1965, à 14^h 30^m, à Paris.

Délivré par arrêté du 10 avril 1967.

(Bulletin officiel de la Propriété industrielle, n° 20 du 19 mai 1967.)

(Brevet d'invention dont la délivrance a été ajournée en exécution de l'article 11, § 7, de la loi du 5 juillet 1844 modifiée par la loi du 7 avril 1902.)

La présente invention a pour objet les nouveaux dialkyl-aminoalkyl-1- p-alkoxyphényl alkyl-2 benzimidazoles 5-substitués répondant à la formule générale :



dans laquelle :

R représente un groupe alkylène inférieur éventuellement ramifié ayant 2 ou 3 atomes de carbone ;

R₁ et R₂ peuvent être identiques ou différents et représenter des radicaux alkyle inférieur ayant au plus 4 atomes de carbone, ou bien ils peuvent participer avec l'atome d'azote auquel ils sont liés, à un hétérocycle ;

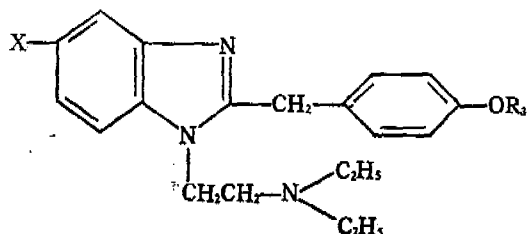
R₃ est un groupe alkyle inférieur ayant au plus 4 atomes de carbone ;

X est un substituant électro-accepteur choisi dans le groupe comprenant CF₃—, CH₃CO—, CH₃SO—, CF₃CO— et N = C— ; et n est égal à 1, 2 ou 3, ainsi que les sels d'addition d'acides de ces composés.

Plus particulièrement, la présente invention concerne les nouveaux β-diéthylaminoéthyl-1 p-alkoxyphénylméthyl-2 benzimidazoles 5-substitués répondant à la formule :

(Voir formule colonne ci-contre)

dans laquelle X, R₃ sont définis comme ci-dessus, ainsi que les sels d'addition d'acide de ces composés.

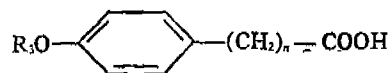


Certains composés de ce type présentent une activité analgésique intéressante.

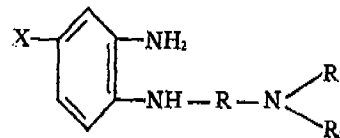
Il est bien entendu que le présent brevet ne couvre pas les applications thérapeutiques des produits obtenus.

La présente invention a également pour objet un procédé pour la préparation de ces nouveaux composés.

Selon ce procédé, on condense un chlorure de l'acide p-alkoxyphényl-alkylène carboxylique de formule :



dans laquelle R₃ et n sont définis comme ci-dessus avec un dialkyl-aminoalkylène-amino-1 amino-2 benzène 4-substitué de formule :



dans laquelle X, R, R₁ et R₂ sont définis comme ci-dessus au sein d'un solvant polaire choisi dans le groupe comprenant le dioxane et le diméthyl-formamide, à une température supérieure à 100 °C environ.

On illustrera l'invention par les exemples non limitatifs suivants :

164
165

Exemple 1. — β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 trifluorométhyl-5 benzimidazoles.

On porte à reflux pendant dix heures un mélange de 5,44 g de β -diéthyl-amino-éthylène amino-1 amino-2 trifluorométhyl-4 benzène et de 5,2 g de chlorure d'acide p-éthoxy-phénylacétique dissous dans 100 cm³ de dioxane absolu.

Le dioxane est évaporé sous pression réduite, et le résidu est lavé plusieurs fois avec 50 cm³ d'éther bouillant. On écarte les extraits étherés et on dissout le résidu dans le minimum d'eau distillée, chaude. A partir de la couche aqueuse obtenue, après deux nouveaux lavages à l'éther, on met la base en liberté à l'aide d'une solution concentrée d'ammoniaque, on reprend dans le chloroforme, on sèche, et on élimine le solvant. L'huile jaune clair obtenue est abandonnée plusieurs jours en glacière jusqu'à cristallisation complète. Les cristaux de β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 trifluorométhyl-5 benzimidazole, blancs sont recristallisés dans le mélange pentane-éther (10/1) et fondent à 76-77°C (en tube capillaire).

Exemple 2. — β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 méthylsulfonyl-5 benzimidazole.

A une solution de 2,5 g de β -diéthylaminoéthylène amino-1 amino-2 méthyl sulfonyl-4 benzène dans 50 cm³ de diméthylformamide absolu, on ajoute 4 g de chlorure de l'acide p-éthoxyphénylacétique. Le mélange est maintenu, sous agitation, 10 heures à 120°C. Après refroidissement le solvant est éliminé sous pression réduite et le résidu dissous à chaud dans le minimum d'eau distillée. La solution aqueuse est alcalinisée à l'aide d'une solution concentrée d'ammoniaque, après avoir été lavée plusieurs fois à l'éther. On extrait au chloroforme la base ainsi libérée, on évapore l'extrait chloroformique après l'avoir lavé avec une solution de carbonate de sodium et l'avoir séché sur du sulfate de magnésium. Le β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxy benzyl-2 méthyl-sulfonyl-5 benzimidazole brut que l'on obtient ainsi est abandonné en glacière jusqu'à cristallisation complète, et recristallisé ensuite dans le mélange benzène-ligroïne. Fusion (tube capillaire) : 71-72°C.

Exemple 3. — β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 cyano-5 benzimidazole.

On dissout dans 100 cm³ de dioxane absolu, 2,5 g de β -diéthylaminoéthylène amino-1 amino-2 cyano-4 benzène et à la solution obtenue sont ajoutés 2,7 g de chlorure de l'acide p-éthoxyphénylacétique. Le mélange réactionnel est porté à reflux et maintenu 10 heures à cette température. Le dioxane est ensuite évaporé sous pression réduite et le résidu dissous dans le minimum d'eau distillée chaude. La solution aqueuse est lavée à l'éther plusieurs fois, rendue alcaline par addition d'ammoniaque concentrée et extraite au chloroforme. Les extraits chloroformiques sont réunis, séchés sur sulfate de magnésium et évaporés sous pression réduite.

Le β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 cyano-5 benzimidazole brut que l'on obtient ainsi est dissous à chaud dans 25 cm³ d'acétate d'éthyle absolu, et après addition à chaud de 4 cm³ d'une solution 3,65 N de méthanol chlorhydrique est transformé en monochlorhydrate cristallisant à l'état de solvant par lent refroidissement, d'un point de fusion de 125-135°C.

On a également mis en évidence l'activité analgésique des composés selon l'invention en mesurant l'allongement significatif du temps de réaction chez la souris disposée sur une plaque chauffante portée à une température de 65°C.

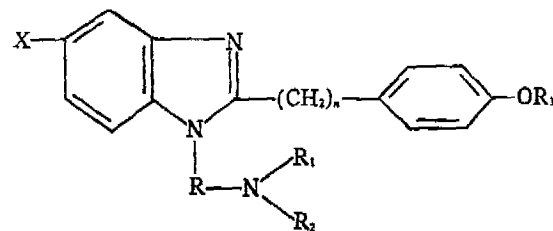
La comparaison des résultats est effectuée sur quinze animaux traités par le composé testé, par rapport à quinze animaux témoins. Les injections sont faites trente minutes avant l'exposition à la plaque chauffante, par voie sous-cutanée.

En particulier, le composé β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 cyano-5 benzimidazole sous forme de sel monochlorhydrate présente une action analgésique très marquée; son action est significative à 100 microgrammes/kg.

RÉSUMÉ

La présente invention a pour objet :

I. Les nouveaux dialkylaminoalkyl-1 p-alkoxyphényl alkyl-2 benzimidazoles 5-substitués répondant à la formule générale :



dans laquelle :

R représente un groupe alkylène inférieur éventuellement ramifié ayant 2 ou 3 atomes de carbone ;

R₁ et R₂ peuvent être identiques ou différents et représenter des radicaux alkyle inférieur ayant au plus 4 atomes de carbone, ou bien ils peuvent participer avec l'atome d'azote auquel ils sont liés, à un hétérocycle ;

R₃ est un groupe alkyle inférieur ayant au plus 4 atomes de carbone ;

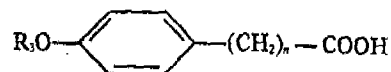
X est un substituant électro-accepteur choisi dans le groupe comprenant CF₃—, CH₃CO—, CH₃SO₂—, CF₃CO— et N = C—; et n est égal à 1, 2 ou 3, ainsi que les sels d'addition d'acides de ces composés et notamment :

Le β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 trifluoro méthyl-5 benzimidazole ;

Le β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 méthyl sulfonyl-5 benzimidazole ;

Le β -diéthylaminoéthyl-1 p-éthoxybenzyl-2 cyano-5 benzimidazole.

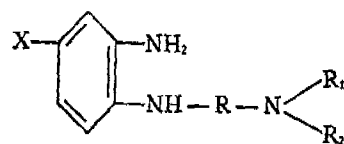
II. Un procédé pour la préparation des nouveaux composés selon I, caractérisé en ce que l'on condense un chlorure de l'acide p-alkoxyphényl alkylène carboxylique de formule :



dans laquelle R_3 et n sont définis comme ci-dessus, avec un dialkylaminoalkylène amino-1 amino-2 benzène 4-substitué de formule :

(Voir formule colonne ci-contre)

dans laquelle X , R , R_1 et R_2 sont définis comme ci-dessus au sein d'un solvant polaire choisi dans le groupe comprenant le dioxane et le diméthyl-



formamide, à une température supérieure à 100°C environ.

ÉTAT FRANÇAIS

REPRÉSENTÉ PAR LE MINISTRE DES ARMÉES,
DÉLÉGATION MINISTÉRIELLE POUR L'ARMEMENT
(DIRECTION DES POUDRES)

Par procuration :

Pierre, André, Gustave MARCAIRE

162

186

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALICIA LLOREDA RICAURTE

ASUNTO	Radicación	05-034776
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	10780
	Folios	9

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	PCT/SE2003/001604		
Fecha de Presentación Interna.	Octubre 15 de 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

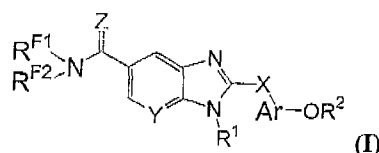
- | | | |
|-------------------------------|---|---|
| 1.1. <u>Descripción:</u> | Folios: 59 a 137 | como se radicó inicialmente
modificado |
| 1.2. <u>Reivindicaciones:</u> | Folios: 153 a 156 | como se radicó inicialmente |
| 1.3. <u>Prioridad:</u> | SE 0203070-8 del 16 de Octubre de 2002 | |

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: **"DERIVADOS DE BENCIMIDAZOL Y DERIVADOS DE IMIDAZOPIRIDINA, PREPARACION DE LOS MISMOS, COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN Y USOS DE LOS MISMOS"**. Modificado en folio No. 153.

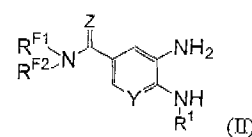
El objeto de la solicitud de la presente invención consiste en:

- **Reivindicaciones de la 1 a la 11:** Un compuesto de fórmula (I):



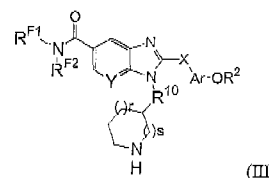
- **Reivindicación 12:** Una Composición farmacéutica

- **Reivindicación 13:** Un método para producir un compuesto, que comprende el paso de la reacción de un compuesto presentado por la fórmula (II):



Con **R²OArXCOA**

- **Reivindicación 14:** Un método para producir un compuesto, que comprende el paso de la reacción de un compuesto presentado por la fórmula (III):



Con **Un formaldehído**

El **problema a planteado en esta solicitud es la necesidad** de proveer compuestos agonistas del receptor CB2, que sean útiles para el manejo del dolor sin causar efectos secundarios indeseados, por ejemplo psicoactivos y el potencial abuso de los fármacos opiáceos

Para **solucionar este problema técnico la solicitud en estudio presenta** un compuesto de fórmula (I) y una composición farmacéutica del mismo.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: **A61K 31/4148 y A61P 25/04**

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

El título de la presente solicitud debe ser específico al compuesto que estan reivindicando y no al uso. Favor realizar el cambio pertinente.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- Las **Reivindicaciones** de la 1 a la 11: en éstas, se pretende proteger un compuesto de fórmula (I), realizadas las sustituciones de los radicales **Ar**, **R¹**, **R²**, **R³**, **R⁴**, **R⁵**, **R⁶**, **R⁷**, **R⁸**, **R⁹**, **R¹⁰**, **X**, **Y** y **Z**, se encuentran diversidad de grupos, sustituidos y no sustituidos; los compuestos resultantes de la formula (I) no están definiendo inequívocamente el alcance de la invención y si están ampliando el número de compuestos posibles, reclamados bajo la característica esencial de la fórmula (I).

De igual manera, al verificar los radicales Ar , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^{F1} , R^{F2} , X , Y y Z , con respecto a las posibilidades por usted presentadas a través de los ejemplos, me permito relacionar lo que se verifica a través de estos treinta y tres (33) ejemplos:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS	
Ar	Fenilo	
R^1	ciclopropilmetil, ciclohexilbutil, furanilmetil, pirrolidinilmetil, tetrahidropiranilmetil, ciclohexilmetil, tienilmetil, piperidinilmetil, ciclopentilmetil, ciclobutilmetil, tetrahidrofuranilmetil,	tetrahidrofuranilmetil, metilpiperidinilmetil, metilmorfolinilmetil, metilpirrolidinilmetil,
R^2	Alquilo C1-6	
R^{F1}	-CH ₃ CHF ₃	
R^{F2}	-CH ₃ CHF ₃	
X	Alquilo C1-6	
Y	-CH ₂	
Z	O	

- En la **Reivindicación 10**: los siguientes compuestos en éste listado, no se encuentran dentro del alcance de la invención; ya que no están dentro de las definiciones dadas para los compuestos de fórmula (I), estos son:

En el Folio 143:

- ✓ 2-[(5-etoxi-2-piridil)metil]-1-[(tetrahydro-2H-piran-4-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxi-2-piridil)metil]-1-(3-metilbutil)-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxi-2-piridil)metil]-1-[(2R)-2-pirrolidinilmetil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxi-2-piridil)metil]-1-[(2R)-1-metil-2-piperidinil]metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxi-2-piridil)metil]-1-[(2R)-1-metil-2-pirrolidinil]metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida

En el Folio 144:

- ✓ 1-(ciclobutilmetil)-2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 1-(ciclopentilmetil)-2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-1(3-furilmetil)-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-1(3-tienilmetil)-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 1-(ciclohexilmetil)-2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 1-(ciclohexilmetil)-2-[(5-isopropoxipiridin-2-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida
- ✓ 2-[(5-etoxipiridin-2-il)metil]-1-[(4-tmetilmorfolin-3-il)metil]-N,N-bis(2,2,2-trifluoroetil)-1H-bencimidazol-5-carboxamida

- En la **Reivindicación 11**: un compuesto no puede definirse por su uso.

- En las **Reivindicaciones 13 y 14**: éstas reivindicaciones no especifican el compuesto a obtener mediante los procesos dados. Los radicales de las fórmulas (II) y (III), no se encuentran inequívocamente definidos y en las mismas, en las que se están reivindicando procedimientos de preparación de derivados de bencimidazoles; estos no se encuentran inequívocamente definidos por sus etapas o pasos, los cuales deben ser detallados, claros y concisos; para que el experto en la materia cuando lo lleve a la práctica obtenga el producto correspondiente. Por lo tanto al hacer reaccionar por ejemplo, un compuesto de fórmula (II) con $R_2OArXCOA$ no se obtiene el compuesto de fórmula (I), o cuando se hace reaccionar un compuesto de fórmula general (III) con un formaldehído no se obtiene el compuesto de fórmula (I)
- Las **Reivindicaciones de la 1 a la 3, 5, 6, 13 y 14**: las palabras y/o expresiones: "grupos que retiran electrones", "por al menos", "grupo C1-6 ó C1-10 divalente", "por uno o más", "al menos"; no son concisas, y son muy amplias; por tanto no permiten delimitar la materia, allí a proteger.

Por lo anteriormente expuesto, es preciso requerir al interesado para que señale el verdadero alcance de su invención.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: **Octubre 16 de 2002**

Teniendo en cuenta la fecha indicada se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud; **aclarando, que esta búsqueda se realizó únicamente para aquellas partes que parecen ser claras y/o concisas:**

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	FR 1.481.049	NOUVEAUX DIALKYLAMINOALKYL-1 p- ALCOXIPHÉNYL ALKYL-2 BENZIMIDAZOLES 5- SUBSTITUÉS	Noviembre 25 de 1965

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1 Nivel inventivo (artículo 18 D486)

El Nivel Inventivo se evaluó por comparación entre lo solicitado y lo encontrado en el estado de la técnica. Con base a los ejemplos, se pudo observar que todos tienen en común las siguientes características, las cuales fueron base para la búsqueda:

R^{F1} y R^{F2} : -C₂H₅ sustituido por grupos de flúor (F)

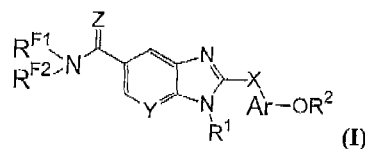
Z: O

Y: -CH=

X: alquilo

R^2 : -CH₃ y -C₂H₅

- **Reivindicaciones de la 1 a la 11:** Un compuesto de fórmula (I):



- **Reivindicación 12:** Una Composición farmacéutica

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 05-034776	D1: FR 1.481.049
Un compuesto de fórmula (1): (I) R^{F1} y R^{F2}: son independientemente grupos que retiran electrones Z: O= y S= Y: -CH= y -N= X: es un grupo C1-10 divalente Ar: -grupo aromático C4-12 divalente R1= Alquilo C1-10, alquilo C1-10 sustituido por al menos un halógeno, ciano, acetoximetilo y nitro; alqueno C2-10 sustituido por al menos halógeno, ciano, acetoximetilo y nitro ... alqueno C2-10, ... heterociclil-alquilo C1-6, ... heterociclil sustituido-alquilo C1-6, ... R2: Alquilo C1-6, alquilo C1-6 sustituido, alqueno C2-6, alqueno C2-6 sustituido, cicloalquilo C3-6 sustituido ... arilo, arilo sustituido, ...	Nuevo compuesto derivado de los dialquilaminoalquil-1 p-alcoxifenil alquil-2 bencimidazoles sustituidos en la posición 5; los mismos de fórmula general: X: En la sustitución de electrones elegidos, se encuentran los grupos: CF₃-, CF₃CO-, CH₃CO-, CH₃SO₂-, y NEC- CH2- (CH₂)_n: donde n puede ser 1, 2 ó 3 R= Alquilo inferior de C2-3 R1 y R2: representan diferentes radicales alquilo inferior hasta de 4 átomos de carbono, o bien unidos pueden formar un heterociclo R3: Alquilo inferior hasta de 4 átomos de carbono Págs. De la 1 a la 3 del documento
Una composición farmacéutica que comprende: ✓ Un compuesto de fórmula (I) ✓ Y vehículo farmacéuticamente aceptable	Una composición farmacéutica, que comprende: • Un compuesto de fórmula general (activo) • Excipientes farmacéuticamente aceptables Pág. 2 del documento

Compuestos de formula (I):

Comparando las características esenciales de la solicitud, las cuales corresponden a un compuesto de fórmula (I), el cual es un derivado de los 5-benzimidazoles; el **documento del estado de la técnica más cercano** es D1, ya que divulga compuestos derivados de los bencimidazoles sustituidos en la posición 5 los cuales presentan actividad analgésica.

La **única diferencia** con **D1 de la presente solicitud** es que en ésta, en la posición 5 del bencimidazol existe un radical carboxamida sustituido, mientras que en **D1** existen otros grupos diferentes (CF3-, CF3CO-, CH3CO-, CH3SO2-, y NEC-). Pero esto **NO parece conceder un efecto técnico inesperado** ya que en la descripción (folio **113**) solo se muestran los datos de los compuestos de la invención; sin presentar datos comparativos con los compuestos del estado de la técnica (**D1**), que permita reconocer la ventaja inesperada de los compuestos de la invención.

Puesto que el **Problema Técnico Objetivo** fundamental de la Invención es proveer compuestos agonistas del receptor CB2, que sean útiles para el manejo del dolor sin causar efectos secundarios indeseados, por ejemplo psicoactivos y el potencial abuso de los fármacos opiáceos; la invención presenta una alternativa a los compuestos del estado de la técnica en (**D1**), por falta de datos comparativos que le confieran nivel inventivo.

Así que, el problema técnico planteado en la solicitud, **sería solucionado fácilmente por el experto en la materia** conociendo los fundamentos de la síntesis orgánica y las enseñanzas de **D1**, con el fin de obtener compuestos alternativos a los del estado de la técnica. Por lo todo lo anterior, el **Compuesto de fórmula (I)** y sus **Composiciones Farmacéuticas** carecen de **Nivel Inventivo**.

6. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	FR 1.481.049	De la 1 a la 12	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 artículo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001, advirtiéndole que contra él no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

22 DEC 2006

CONCEPTO TÉCNICO No. 2093	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202080
---------------------------	---

72173

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION N° 5 1 2 5 8

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/05-34776

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 13 de abril del 2005 bajo el número 05034776, se presentó la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE BENCIMIDAZOL Y DERIVADOS DE IMIDAZOPIRIDINA, PREPARACION DE LOS MISMOS, COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN Y USOS DE LOS MISMOS", para los efectos de que se dé comienzo a la fase nacional, en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *"Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales.(...) Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente"*.

CUARTO: Que realizado el examen de fondo, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 163 a 171 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente. Frente a dicho requerimiento no hubo pronunciamiento alguno por parte del mismo, por lo cual es procedente negar el privilegio de patente solicitado con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486.

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION N° 5 1 2 5 8

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/05-34776

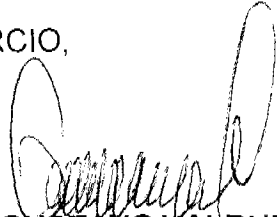
correspondiente a "DERIVADOS DE BENCIMIDAZOL Y DERIVADOS DE IMIDAZOPIRIDINA, PREPARACION DE LOS MISMOS, COMPOSICIONES QUE LOS CONTIENEN Y USOS DE LOS MISMOS", que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Alicia Lloreda Ricaurte, en su calidad de apoderada de AstraZeneca AB., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 28 NOV. 2008

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctora
ALICIA LLOREDA RICAURTE
Calle 72 N° 5 – 83, Piso 5.
Bogotá D.C.

202021

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
EL SECRETARIO GENERAL ad - 500
Certifica que la resolución 51258
de fecha 206
fue notificada mediante edicto / listado número 206
y deslizado el 21-28-08
fijado el 21-10-08