

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-67324- -6	FECHA: 2013-06-13 18:20:03
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 379 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO II
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 12-67324- -6
 Trámite: 11
 Evento: 379
 Actuación: 519
 Oficio: 10480
 Folios: 5

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I		Capítulo II	X
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2010/070045				
Fecha de Presentación Internacional	17/12/2010				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N°12-067324-00000-0000	Abril 24 de 2012
Reivindicaciones	Radicado N°12-067324-00000-0000	Abril 24 de 2012
Prioridad:	EP 09180504.4	Diciembre 22 de 2009

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

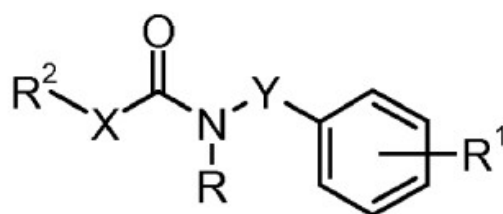
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Las reivindicaciones 11 a 18 del radicado N°12-067324-00000-0000 serán estudiadas, aunque solo se registra el pago por 5 reivindicaciones, de acuerdo con el recibo presente en el radicado N°12-067324-00003-0000. Se invita al solicitante realizar el pago por las 3 reivindicaciones faltantes.

Título de la solicitud: "Derivados benzamida sustituidos"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos con afinidad con los receptores asociados a rastros de aminas (TAARs) para el tratamiento de diversas enfermedades neurológicas.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos derivados de benzamida, afines con los receptores asociados a rastros de aminas (TAARs) para el tratamiento de diversas enfermedades neurológicas.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4025; A61K31/4523; A61K31/5355; C07D207/09; C07D207/10; C07D207/12; C07D211/26; C07D241/04; C07D265/30; C07D401/04; C07D401/12; C07D413/12; C07D413/14; C07D417/12; C07D417/14.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicación 16 a 18 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

5. De la Solicitud de la Patente

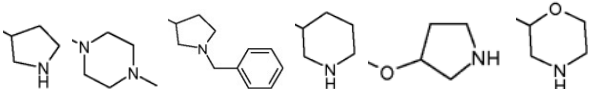
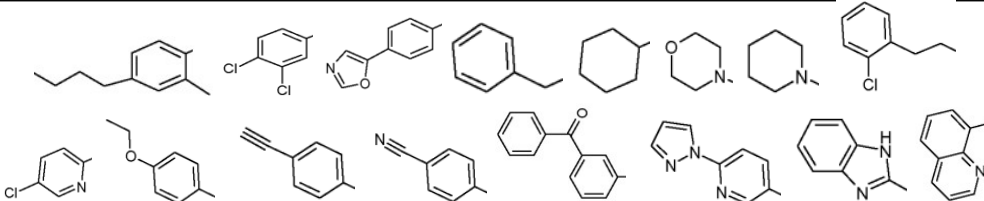
Título

El título de la presente solicitud se considera muy ambiguo, porque al mencionarlos como compuestos derivados de benzamida, se incluyen muchos compuestos que no hacen parte del objeto de esta invención. Se solicita modificar el título de tal manera que este describa mas especifica y detalladamente el objeto de la presente invención

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa, porque algunos sustituyentes se mencionan de manera general e indefinida (arilo, arilo, heteroarilo, heterocicloalquilo, OCH₂-cicloalquilo), y se mencionan sustituyentes que a pesar de ser una restricción a partir de una generalidad, incluyen muchas posibilidades de sustitución (alquilo C₁-

7, alcoxi C₁₋₇, S-alquilo C₁₋₇), de tal manera que a partir de estos sustituyentes indefinidos, se obtienen muchos compuestos posibles, donde la complejidad de la solicitud aumenta y no es posible establecer un alcance certero de lo que se desea proteger en la invención. Se solicita realizar una restricción más detallada y específica (arilo es fenil, naftil, antranil; cicloalquil es ciclopropil, ciclobutil, ciclohexil, ciclooctil; heteroarilo es furano, tiofeno, piridina, indol, quinolina, tiazina, entre otros más; alquilo C₁₋₇ es metil, isopropil, tercbutil, isobutil; así sucesivamente con los demás sustituyentes), de tal manera que a partir de estos sustituyentes se obtengan los compuestos sintetizados, probados y que representan la solución al problema técnico objetivo de esta invención. Es cierto que el inventor está en su total derecho de proteger su invención en la extensión que este lo decida, sin embargo, el artículo 30 de la Decisión 486 establece que las reivindicaciones que protegen una invención deben ser claras, concisas y debidamente soportadas en el capítulo descriptivo. Se sugiere realizar dicha restricción de acuerdo con los ejemplos del capítulo descriptivo y se ilustran en la siguiente tabla:

Sustituyente	Soportado en la descripción
R	H
R ¹	
R ²	
X	NH, O, CH ₂ , enlace, NCH ₃ , CHCH ₃ , CH(OCH ₃),

Para la reivindicación 1, la exclusión de los compuestos 2,2,2-difluoro-N-[4-(piperidin metil) fenil] acetamida, 4-(4-morfolin)-N-benciloxycarbonilanilina, 2-(2,4-diclorofenoxi)-N-[4-(4-metil piperazin-1-ilmetil) fenil] acetamida, 2-(4'-clorobifenil-4-iloxi)-N-(4-piperidin-1-ilmetilfenil) acetamida, 2-(4'-clorobifenil-4-ilmetil)-3-(4-piperidin-1-ilmetilfenil) urea, N-[3-(1-metil piperidin-4-iloxi) fenil]-3-fenil propionamida y 3-(4'-clorobifenil-4-il)-N-(4-piperidin-1-ilmetilfenil) propionamida, mencionados como disclaimer, no se acepta, porque este no se encuentra soportado dentro del capítulo descriptivo y por lo tanto, constituye una ampliación de la materia originalmente presentada, de acuerdo con los lineamientos de la Oficina Europea de Patentes (EPO). Se solicita eliminar este disclaimer de la reivindicación 1.

Para la reivindicación 15, se solicita mencionar los reactivos y condiciones a las cuales se llevan a cabo el proceso de síntesis de los compuestos de la fórmula I.

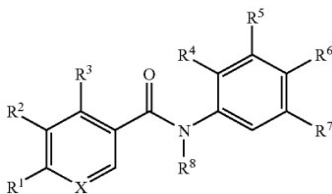
6. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 22 de diciembre de 2009.

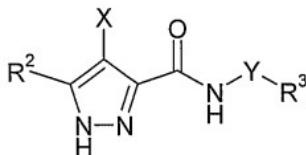
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US20090036420	"Benzamide derivatives and their use for CNS disorders"	Febrero 5 de 2009
D2	WO2006077425	"Combinations of pyrazole kinase inhibitors and further antitumor agents"	Julio 27 de 2006
D3	US6184242	"2 – (substituted phenyl) amido imidazoline derivatives"	Febrero 6 de 2001
D4	WO2007064818	"Isolated desfluoro Linezolid, preparation thereof and its use as a reference marker and standart"	Junio 7 de 2007
D5	WO2004039764	"Novel amide compounds with MCH antagonistic effects and medicaments comprising said compounds"	Mayo 13 de 2004
D6	DE2123246	"Dihidropyridazone"	Noviembre 30 de 1972

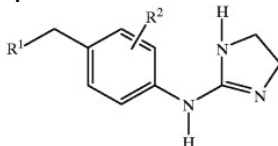
El documento D1¹ divulga compuestos derivados de benzamida para el tratamiento de alteraciones del sistema nervioso central (SNC)



El documento D2² divulga compuestos derivados de pirazol como inhibidores de CDK Kinasa para el tratamiento del cáncer.



El documento D3³ divulga compuestos derivados de fenilamino imidazol como inhibidores de prostaglandinas, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias.



El documento D4⁴ divulga la obtención de un derivado de Linezolid y su uso como

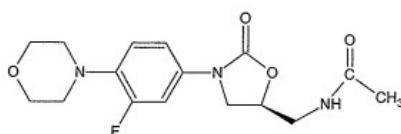
¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2009036420A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090205&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006077425A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20060727&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

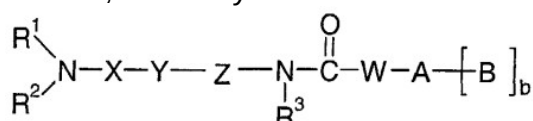
³http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=6184242B1&KC=B1&FT=D&ND=3&date=20010206&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

⁴<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

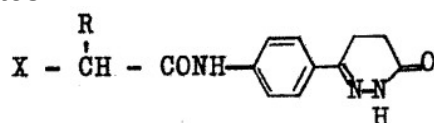
marcador estandarizado.



El documento D5⁵ divulga compuestos derivados de amida para el tratamiento de enfermedades como anorexia, bulimia y obesidad.



El documento D6⁶ divulga compuestos derivados de dihidropiridazones para ser usados como medicamentos



7. Examen de Patentabilidad.

Novedad (Art 16 D 486)

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12-067324-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1
Compuesto de la fórmula I X e Y son enlaces	Compuesto de la fórmula I
R es H o alquilo C ₁₋₇	R ⁸ es H o alquilo inferior
R ¹ es (CH ₂) _n (O) _o heterocicloalquilo, donde este es opcionalmente sustituido por alquilo C ₁₋₇ (n es 1 y o es 0)	R ⁵ y R ⁷ pueden ser 2,5-dimetil-imidazo-1-ilmetil, R ⁴ y R ⁶ son H

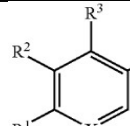
CC=WO&NR=2007064818A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070607&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

5[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2004039764A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040513&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP)

CC=WO&NR=2004039764A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040513&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

6[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=DE&NR=2123246A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19721130&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP)

CC=DE&NR=2123246A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19721130&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es_LP

R² es arilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos por uno o dos sustituyentes seleccionados de alquilo C₁₋₇, halógeno, heteroarilo, heteroarilo, hidroxilo, CF₃, OCF₃, OCH₂CF₃, OCH₂-cicloalquilo, S-alquilo C₁₋₇, alcoxi C₁₋₇, CH₂-alcoxi C₁₋₇, ciano, fenilo, O-fenilo, OCH₂-fenilo, CH₂-fenilo	 Donde X es CR⁹ o N; R¹ es H, halógeno, alcoxi, fenil, morfolin, pirrolidin, pirazol, piperidin, piperazin, 4-metilpiperazin, azetidin, azepan; R² es H, halógeno, alquilo, alcoxi, alcoxi sustituido por halógeno, alquilo sustituido por halógeno, ciano, morfolin, pirazolil; R³ y R⁹ son H, halógeno, alquilo, alcoxi.
---	---

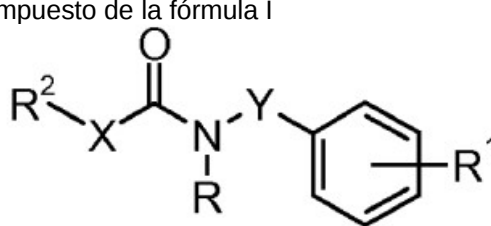
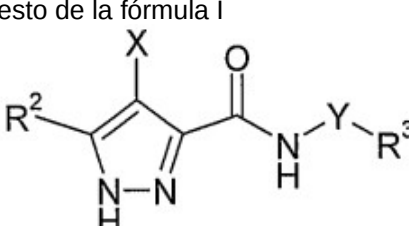
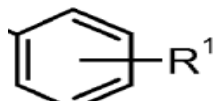
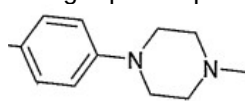
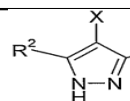
Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D1 (D1: Página 2, párrafos [0006]-[0017]), en donde se muestran compuestos derivados de benzamida, con afinidad por los receptores de trazas de amina, útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas como la enfermedad de Alzheimer, esquizofrenia, enfermedad de Parkinson, entre otras, con las características técnicas descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D1, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 4, 5 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12-067324-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D2
Compuesto de la fórmula I  X e Y son enlaces	Compuesto de la fórmula I  Y es enlace
 Donde R¹ es (CH₂)_n(O)_o heterocicloalquilo, donde este es opcionalmente sustituido por alquilo C₁₋₇ (n y o son 0)	R³ es carbociclo o heterociclo. El compuesto 230 divulga que R3 puede ser 
R² es heteroarilo opcionalmente sustituidos por uno o dos sustituyentes seleccionados de halógeno, heteroarilo, alcoxi C₁₋₇, fenilo	 Donde X es anillo carbociclico o

	heterocíclico de 5 o 6 miembros; R ₂ es H, halógeno, alcoxi
--	--

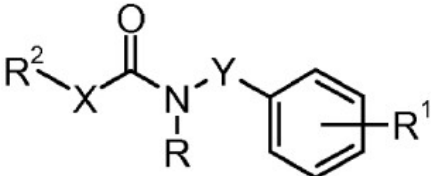
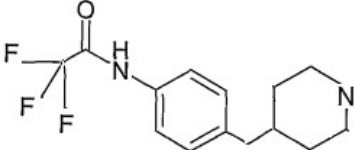
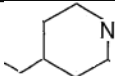
Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D2 (D2: Página 8, líneas 15 – 33; página 9, líneas 1 – 6; página 203, compuesto 230), en donde se muestran compuestos derivados de pirazol – 3 – il carboxamida, como inhibidores de CDK Kinasa como agentes anticancerígenos, con las características técnicas descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D2, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 4, 5 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12–067324–00000–0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D3
Compuesto de la fórmula I  X e Y son enlaces, R es H	2,2,2-trifluoro-N-[4-(piperidin-4-ilmetil)fenil]acetamida 
R¹ es (CH₂)_n(O)_o heterocicloalquilo (piperidina), (n es 1 y o es 0)	
R² es CF₃	CF₃

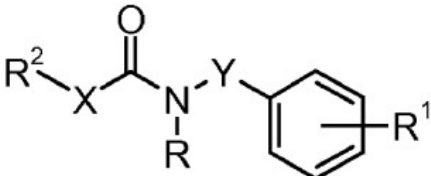
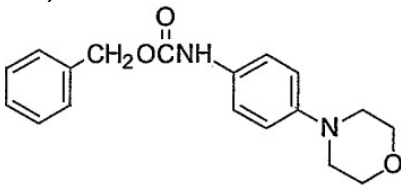
Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D3 (D3: Columna 58, líneas 15 – 17), en donde se muestra el compuesto 2,2,2-trifluoro-N-[4-(piperidin-4-ilmetil)fenil] acetamida, como intermediario de la síntesis de compuestos derivados de fenilamino imidazol como inhibidores de prostaglandinas. Este intermediario cumple con las características técnicas descritas en la tabla anterior y que se reclaman en la presente invención. Este compuesto se menciona manera a manera de disclaimer en esta reivindicación, sin embargo, dado que este disclaimer no es aceptado por considerarse ampliación de materia, este compuesto se considera como Estado de la Técnica existente antes de esta invención.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D3, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 4, 5 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12-067324-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D4
Compuesto de la fórmula I  X es CH₂O, Y es un enlace y R es H	4-(4-morfolin)-N-benciloxycarbonil anilina 
R¹ es (CH₂)_n(O)_o heterocicloalquilo (morfolina), (n es 0 y o es 0)	
R² es arilo	

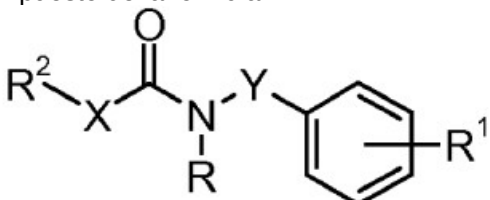
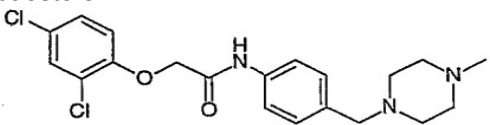
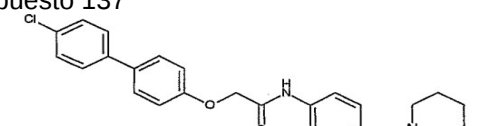
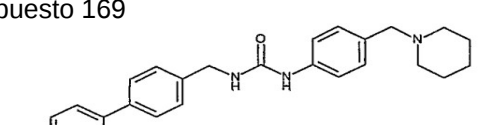
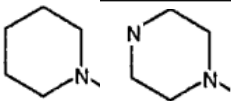
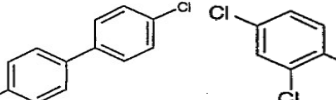
Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D4 (D4: Página 8, línea 10), en donde se muestra el compuesto 4-(4-morfolin)-N-benciloxycarbonil anilina, como intermediario de la síntesis del compuesto desfluoro Linezolid. Este intermediario cumple con las características técnicas descritas en la tabla anterior y que se reclaman en la presente invención. Este compuesto es mencionado a manera de disclaimer en esta reivindicación, sin embargo, dado que este disclaimer no es aceptado por considerarse ampliación de materia, este compuesto se considera como arte previo que antecede la presente invención

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D4, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 6, 7 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12-067324-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D5
Compuesto de la fórmula I  X es OCH₂ o CH₂NH, Y es un enlace y R es H	Compuesto 31  Compuesto 137  Compuesto 169 
R¹ es (CH₂)_n(O)_o heterocicloalquilo (piperidina o piperazina), (n es 1 y o es 0)	
R² es arilo sustituido por halogeno	

Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D5 (D5: Página 8, línea 10), en donde se muestran compuestos derivados de anilina para el tratamiento de enfermedades metabólicas, tales como anorexia, bulimia y obesidad, con las características técnicas descritas en la tabla anterior y que se reclaman en la presente invención. Estos compuestos se mencionan a manera de disclaimer en esta reivindicación, sin embargo, dado que este disclaimer no es aceptado por considerarse ampliación de materia, estos compuestos constituyen una antelación existente en el Estado de la Técnica.

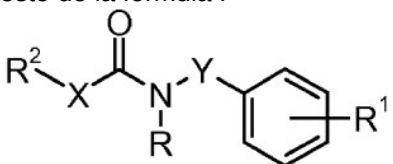
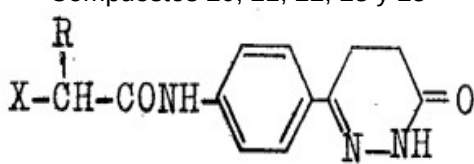
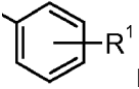
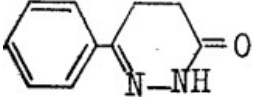
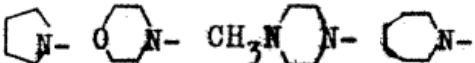
En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D5, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 8, 9 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga los compuestos de Fórmula (I), en la que... (Página 201 del radicado N°12-067324-00000-0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D6
-----------	----

Compuesto de la fórmula I	Compuestos 20, 21, 22, 23 y 25
	
X es CH ₂ o (CH)CH ₃ , Y es un enlace y R es H	R es H o CH ₃
 Donde R ¹ es (CH ₂) _n (O) _o heterocicloalquilo (piridazina), (n y o son 0)	
R ² es heteroarilo opcionalmente sustituido por alquilo	

Las características técnicas esenciales de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, se han divulgado previamente en D6 (D6: Página 8, compuestos 20 a 23 y 25), en donde se muestran compuestos derivados de piridazina, con las características técnicas descritas en la tabla anterior y que se reclaman en la presente invención.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo a lo divulgado en D6, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 10, 11 y 15 dependientes de la reivindicación 1, no divulgan características adicionales que le otorguen novedad a los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Novedad.

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de esta solicitud se ven afectados de la siguiente manera:

Item	Documento	Reivindicaciones	Requisitos que afecta
D1	US20090036420	1, 4, 5 y 15	Novedad
D2	WO2006077425	1, 4, 5 y 15	Novedad
D3	US6184242	1, 4, 5 y 15	Novedad
D4	WO2007064818	1, 6, 7 y 15	Novedad
D5	WO2004039764	1, 8, 9 y 15	Novedad
D6	DE2123246	1, 10, 11 y 15	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 (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-06-18

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo