

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

222
Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 540 0860
Fax in U.S.A.: (1-305) 381 9660

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-097869- -00003-0000

Fecha: 2007-09-20 17:04:33 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

Trámite : 011 Evento : 379 Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 05.097.869
Asunto : Solicitud de patente para: **MÉTODO PARA PREPARAR
SALES DE ADICIÓN DE ÁCIDOS DE COMPUESTOS
POLIACIDOS BÁSICOS**
Solicitante : **KOWA CO., LTD.**
Publicada en : Gaceta No. 575 del 30 de abril de 2005
Fecha solicitud : 27 de septiembre 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-14890-841-001-9
JGG\JGG\ID-108394\WPC14890
No. M-2007-108394\JGG

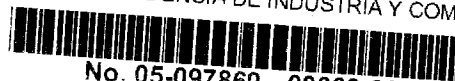
223

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 74,916
FECHA : SEPTIEMBRE 17 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-097869- -00003-0000

Fecha: 2007-09-20 17:04:33 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eje: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAMPESER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	63769923	17/09/2007	38,934,000.00

***** CONCEPTO *****

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

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 14890-841-001-9

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 05-97869

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **575** DE

FECHA **30 DE ABRIL DE 2007** EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **31 DE JULIO 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 _____



(11) **EP 0 987 254 A1**

(12) **EUROPEAN PATENT APPLICATION**
published in accordance with Art. 158(3) EPC

(43) Date of publication: **26.05.1998 Bulletin 2000/12**

(21) Application number: **98921809.4**

(22) Date of filing: **26.05.1998**

(51) Int. Cl.⁷: **C07D 233/70, C07D 235/28, C07D 263/58, C07D 277/74, C07D 277/80, C07D 401/12, C07D 413/04, C07D 413/12, C07D 417/12, C07D 498/04, C07F 9/653, A61K 31/495, A61K 31/55, A61K 31/505**

(86) International application number:
PCT/JP98/02300

(87) International publication number:
WO 98/54153 (03.12.1998 Gazette 1998/48)

(84) Designated Contracting States:
AT BE CH CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LI LU MC NL PT SE

(30) Priority: **26.05.1997 JP 14989297**

(71) Applicant: **Kowa Co., Ltd.**
Naka-ku, Nagoya-shi, Aichi 460-8625 (JP)

(72) Inventors:
• **SHIBUYA, K.,**
403, Lions-Hills-Nishitokorozawa
Tokorozawa-shi, Saitama 359-1142 (JP)
• **KAWAMINE, Katsumi,**
Kowa-Higashimurayama-ryo
Higashimurayama-shi, Tokyo 189-0022 (JP)

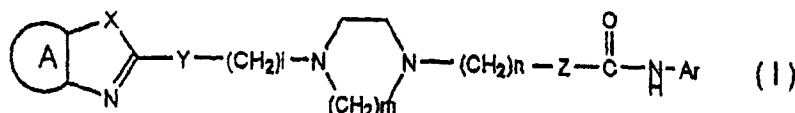
- **SATO, Yukihiro,**
Kowa-Higashimurayama-ryo
Higashimurayama-shi, Tokyo 189-0022 (JP)
- **MIURA, Toru**
Omiya-shi, Saitama 331-0062 (JP)
- **OZAKI, Chiyoka**
Nerima-ku, Tokyo 177-0045 (JP)
- **EDANO, Toshiyuki**
Kawagoe-shi, Saitama 350-1124 (JP)
- **HIRATA, Mitsuteru**
Tsurugashima-shi, Saitama 350-2211 (JP)

(74) Representative:
Cresswell, Thomas Anthony
J.A. KEMP & CO.
14 South Square
Gray's Inn
London WC1R 5LX (GB)

(54) **NOVEL CYCLIC DIAMINE COMPOUNDS AND MEDICINE CONTAINING THE SAME**

(57) The present invention offers novel cyclic diamine compounds and a pharmaceutical composition containing the same.

The present invention relates to a compound represented by the formula (I) or salt(s) or solvate(s) thereof.



(In the formula,

EP 0 987 254 A1

6 or, more preferably, 1-3 carbon atom(s) and its examples are methylenedioxy group, ethylenedioxy group and dimethylmethylenedioxy group.

[0034] "Lower alkylthio group" is preferably an alkylthio group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are methylthio group, ethylthio group, n-propylthio group and isopropylthio group.

5 [0035] "Lower alkylsulfinyl group" is preferably an alkylsulfinyl group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are methylsulfinyl group, ethylsulfinyl group, n-propylsulfinyl group and isopropylsulfinyl group.

[0036] "Lower alkylsulfonyl group" is preferably an alkylsulfonyl group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are methylsulfonyl group, ethylsulfonyl group, n-propylsulfonyl group and isopropylsulfonyl group.

10 [0037] "Lower alkylsulfonyloxy group" is preferably an alkylsulfonyloxy group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are methylsulfonyloxy group, ethylsulfonyloxy group, n-propylsulfonyloxy group and isopropylsulfonyloxy group.

[0038] "Lower acyl group" is preferably an alkylcarbonyl group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are acetyl group, ethylcarbonyl group, n-propylcarbonyl group and isopropylcarbonyl group.

15 [0039] "Lower acyloxy group" is preferably an alkylcarbonyloxy group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are acetyloxy group, ethylcarbonyloxy group, n-propylcarbonyloxy group and isopropylcarbonyloxy group.

[0040] "Lower alkoxy carbonyl group" is preferably a group where oxycarbonyl group is bonded to the above-mentioned lower alkyl group and its examples are methoxycarbonyl group, ethoxycarbonyl group and tert-butoxycarbonyl group.

20 [0041] "Di-(lower alkoxy)-phosphoryloxy group" is preferably a di-(lower alkoxy)-phosphoryloxy group comprising the above-mentioned lower alkyl group and its examples are dimethoxyphosphoryloxy group, diethoxyphosphoryloxy group, di-n-propylphosphoryloxy group and di-isopropylphosphoryloxy group.

[0042] Hydrogen atom of the lower alkyl group or alkyl group in those groups may be substituted with other substituent if necessary and examples of such a substituent are hydroxyl group, lower alkoxy group, lower alkylthio group, lower alkoxy carbonyl group, lower acyloxy group, halogen atom, amino group and nitro group. Upon substitution with such a substituent, the substituent may be only one or the substitution may be conducted by two or more substituents. Examples of the group having substituent are hydroxyalkyl group, hydroxy lower alkoxy group, lower alkoxy lower alkoxy group, lower alkoxy lower alkyl group, lower alkoxy carbonyl lower alkoxy group, lower alkoxy carbonyl lower alkyl group, halogenated lower alkoxy group, halogenated lower alkyl group and amino lower alkyl group.

30 [0043] Preferred examples of halogen atom are fluorine atom, chlorine atom, bromine atom and iodine atom.

[0044] The lower alkyl group in the optionally substituted silyl lower alkyl group is the above-mentioned lower alkyl group and examples of the substituent for the silyl group are the above-mentioned lower alkyl and aryl groups and an aralkyl group having 7-20 carbons or, preferably, 7-12 carbons such as benzyl group and phenethyl group. Trimethylsilylmethyl group and dimethylphenylsilylmethyl group are exemplified.

35 [0045] The optionally substituted amino group may be a free amino group or an amino group which is substituted with one or two substituent(s). Preferred substituent for the amino group are above-mentioned lower alkyl group; the above-mentioned aryl group such as phenyl group and naphthyl group; and an aralkyl group having 7-20 carbons or, preferably, 7-12 carbons such as benzyl group and phenethyl group. Those aromatic ring may be further substituted with the above-mentioned lower alkyl group, lower alkoxy group, and so on. Furthermore, the two substituents of the amino group may form a five- to seven-membered ring together with the nitrogen atom of the amino group. One or more carbon atom(s) in the ring may be substituted with oxygen atom, sulfur atom or nitrogen atom. Examples of such an amino group forming a ring are morpholino group, piperazino group and pyrrolidino group. Those rings may be further substituted with other substituent(s).

45 [0046] The alkyl group in the optionally substituted aminoalkyl group is the above-mentioned alkyl group and the amino group therein is the above-mentioned substituted or unsubstituted amino group.

[0047] The heterocyclic residue is a residue of a saturated or unsaturated five to seven-membered heterocyclic group containing one to four oxygen atom(s), nitrogen atom(s) or sulfur atom(s) as heteroatom(s) and its example is a tetrazolyl group. Such a heterocyclic residue may have one or more substituent(s) and examples of the substituent are those which were mentioned as the substituents for the above-mentioned alkyl group.

50 [0048] l in the formula (I) is an integer of from 0 to 15, preferably from 1 to 15, more preferably from 1 to 10 or, still more preferably, from 2 to 5 while n is an integer of from 0 to 3 or, preferably, from 1 to 3.

[0049] Examples of the acid addition salt(s) of the compound (I) of the present invention are inorganic acid salt(s) such as hydrochloride, sulfate, nitrate and phosphate and organic acid salt(s) such as methanesulfonate, maleate, tartrate and citrate.

55 [0050] The solvate(s) is a product where the solvent used during preparation, purification, and so on such as water and alcohol is added and there is no particular limitation therefor so far as that does not badly affect the ACAT inhibitory action, and so on. Hydrate is preferred as the solvate(s).

ent Publication Hei-10/025281) or the amine compound is diazotized with sodium nitrite in an acidic solution followed by heating in an aqueous solution of sodium lower thioalkoxide.

(3) Method for the preparation of a compound having lower acyloxy group, lower alkoxy group, lower alkylsulfonyloxy group or di-lower alkoxyphosphoryloxy group on Ar.

The compounds (I) having lower acyloxy group, lower alkoxy group, lower alkylsulfonyloxy group or di-lower alkoxyphosphoryloxy group on Ar can be manufactured as follows. Thus, the corresponding amine compound in the compound (I) is diazotized, heated in an aqueous solution to convert to hydroxyl compound and the compound is then subjected to lower acylation, lower alkylation, lower alkylsulfonylation or di-lower alkoxyphosphorylation.

Hydroxy compound can be manufactured by diazotizing the corresponding amine compound in a diluted sulfuric acid solution with sodium nitrite followed by pouring the aqueous solution of the resulting diazonium salt(s) into boiling water and by decomposing by heating.

Lower acyloxy compound can be manufactured by the reaction of the corresponding hydroxy compound with acid halide, acid anhydride, and so on in a solvent in the presence of a base. To be more specific, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with acetyl chloride in a pyridine solvent.

Lower alkoxy compound can be manufactured by the reaction of the corresponding hydroxy compound with lower alkyl sulfate, lower alkyl halide, and so on in a solvent in the presence of a base. To be more specific, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with sodium hydride in a dimethylformamide solvent followed by subjecting to a reaction with lower alkyl halide. Alternatively, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with diazomethane, trimethylsilyl diazomethane, and so on in a solvent in the presence of a base as well.

Lower alkylsulfonyloxy compound can be manufactured by the reaction of the corresponding hydroxy compound with lower alkyl sulfonic acid halide, lower alkyl sulfonic acid anhydride, and so on in a solvent in the presence of a base. To be more specific, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with methanesulfonyl chloride in a solvent in the presence of triethylamine.

Di-lower alkoxyphosphoryloxy compound can be manufactured by the reaction of the corresponding hydroxy compound with di-lower alkyl phosphoric acid halide in a solvent in the presence of a base. To be more specific, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with sodium hydride in a dimethylformamide solvent followed by subjecting to a reaction with dialkylphosphoric acid chloride.

(4) Method for the preparation of a compound having hydroxyl group and nitro group on Ar.

The compound (I) having hydroxyl group and nitro group on Ar can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound with nitric acid or acetyl nitrate in an inert solvent. To be more specific, it can be manufactured by the reaction of a hydroxy compound in an acetonitrile solvent with acetyl nitrate.

Intermediates and desired compounds obtained in the above reactions can be, if necessary, isolated and purified by means of purifying methods which have been commonly used in organic synthetic chemistry such as distillation, extraction, washing, drying, column chromatography, recrystallization, and the like. In the means with regard to intermediates, they may be subjected to the next reaction without particular purification.

The resulting compound (I) can be made into an acid addition salt(s) by a common method. It can also be prepared in a solvent(s) with a solvent for the reaction or for the next reaction, especially as a hydrate. Specific examples of the compounds obtained by the above-mentioned methods are shown in Tables 1-19.

Example 31

Preparation of 2-[4-[2-(benzothiazol-2-ylthio)ethyl]piperazin-1-yl]-N-(2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl)acetamide:

[0123] The same reaction and treatment as in Example 24 were conducted using 1-[2-(benzothiazol-2-ylthio)ethyl]piperazine ditrifluoroacetate instead of 1-[2-(benzoxazol-2-ylthio)ethyl]piperazine ditrifluoroacetate to provide the desired compound as colorless powdery crystals.

Melting point: 136-139°C.

IR (KBr) cm^{-1} : 3444, 2923, 1696, 1480, 1427.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-CDCl}_3$) δ :

2.42 (3H, s), 2.50 (3H, s), 2.52 (3H, s), 2.60-2.96 (10H, m), 3.18-3.27 (2H, m), 3.48-3.65 (2H, m), 6.67 (1H, s), 7.30 (1H, m), 7.41 (1H, m), 7.75 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 7.84 (1H, d, $J = 8.1$ Hz), 8.53 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 519 (M^+), 352 (100).

Elementary analysis as $\text{C}_{23}\text{H}_{29}\text{N}_5\text{OS}_4$				
Calculated:	C 53.15;	H 5.62;	N 13.47;	S 24.67.
Found:	C 53.17;	H 5.67,	N 13.24;	S 24.52.

Example 32

Preparation of 2-[4-[2-(benzimidazol-2-ylthio)ethyl]piperazin-1-yl]-N-[2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl] acetamide dihydrochloride:

[0124] The same reaction and treatment as in Example 24 were conducted using 1-[2-(benzimidazol-2-ylthio)ethyl]piperazine ditrifluoroacetate instead of 1-[2-(benzoxazol-2-ylthio)ethyl]piperazine ditrifluoroacetate, and further reaction and treatment are performed to the obtained 2-[4-[2-(benzimidazol-2-ylthio)ethyl]piperazin-1-yl]-N-[2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl] acetamide in order to provide dihydrochloride, then the compound as colorless powdery crystals was obtained.

Melting point: 214-218°C.

IR (KBr) cm^{-1} : 3240, 2923, 1679, 1485, 1438.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ :

2.40 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.00-3.81 (15H, m), 6.93 (1H, s), 7.13-7.23 (2H, m), 7.46-7.57 (2H, m), 9.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 519 (M^+), 352 (100).

Example 33

Preparation of N-[2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl]-3-[4-[3-(oxazolo[4,5-b]pyridin-2-ylthio)propyl]piperazin-1-yl]propaneamide dihydrochloride:

[0125] Triethylamine (277 mg, 2.75 mmol) was added to a solution of 3-amino-2,4-bis(methylthio)-6-methylpyridine (500 mg, 2.50 mmol) in THF (10 ml), then a solution of acryloyl acid chloride (225 mg, 2.50 mmol) in THF (3 ml) was gradually dropped thereinto and the mixture was stirred for 14 hours. The reaction solution was diluted with water and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with a sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate, the solvent was evaporated therefrom and the resulting crystals were recrystallized from chloroform-ethyl acetate-hexane to provide 276 mg (yield 44%) of N-[2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl]acrylamide as colorless powdery crystals.

[0126] Triethylamine (79 mg, 0.78 mmol) was added to a solution of 1-[3-(oxazolo[4,5-b]pyridin-2-ylthio)propyl]piperazine ditrifluoroacetate (199 mg, 0.39 mmol) in ethanol (10 ml), then the above-prepared N-[2,4-bis(methylthio)-6-methyl-3-pyridyl]acrylamide (100 mg, 0.39 mmol) was added thereto and the mixture was heated to reflux for four days. The reaction solution was concentrated, diluted with water and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with a saturated sodium chloride solution and dried over anhydrous sodium sulfate and the solvent was evap-

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO
Apoderado

ASUNTO

Radicación	05-097869
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Oficio	Nº 4 6 6 6
Folios	08

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT/JP2004/002375
Fecha de Presentación Internal. 27/02/2004

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

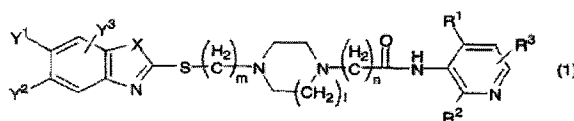
<u>Descripción:</u>	Folios: <u>117</u> a <u>154</u> y <u>159</u> como se radicó inicialmente
<u>Reivindicaciones:</u>	Folios: <u>155</u> a <u>158</u> y <u>470</u> como se radicó inicialmente
	Folios <u>162</u> a <u>167</u> modificadas (Enmienda PCT)
<u>Dibujos:</u>	Folios <u>168</u> a <u>191</u> como se radicó inicialmente
<u>Prioridad:</u>	Folios: <u>01</u> 28/02/03, JP, 2003-052700

2. Objeto de la Invención

Titulo de la invención: "Método para preparar sales de adición de ácidos de compuestos poliácidos básicos"

Problema Técnico Planteado: "proveer un método de preparación de una sal de adición de un compuesto poliácido básico o un aducto de agua que tiene un sitio (s) básico más fuerte que la piridina"

Solución: Un método para preparar una sal de adición de ácido de derivado de piperazina representado por la fórmula I o un aducto de agua de la sal de adición de la sal de adición del ácido mencionada.



IPC: C07D 401/12, C07D 413/12, 417/12, A61K 31/496

3. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 4 define dos objetos de invención tales como las sales de adición o un aducto de adición de agua. No es claro si mediante la reacción descrita se pueden producir ambos simultáneamente al tiempo o qué caracteriza la producción de las sales de adición o del aducto.

Las reivindicaciones 14 y 15 se encuentran de forma independiente de la reivindicación 4.

La reivindicación 15 referida a "cristal" no se encuentra caracterizada por sus elementos esenciales que lo definen.

No se encuentran ejemplos en la descripción de todos los compuestos empleados en el proceso de preparación que muestren la mejor forma de realizar la invención, sólo se relacionan los compuestos que contienen el anillo benzoimidazol.

7. 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: 28 de Febrero de 2003

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 28/02/2003 se encontraron los siguientes documentos del estado de la técnica relacionados, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

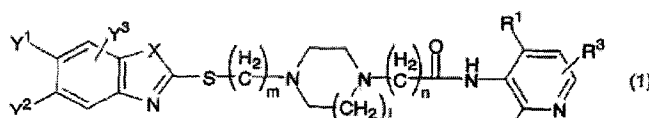
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	EP 0987254	Novel cyclic diamine compounds and medicine containing the same	22/03/2000

8. Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (artículo 18 D486)

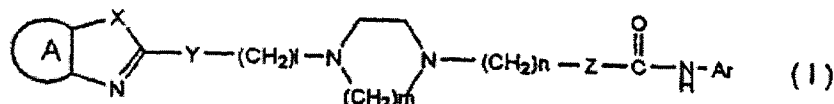
- 1) Respecto a la solicitud en estudio:

La reivindicación 4 se encuentra caracterizada por el método para preparar una sal de adición de ácido de un derivado de piperazina representado por la siguiente fórmula (1) o un aducto de agua de la sal de adición del ácido mencionada, la cual es caracterizada por la reacción del derivado de piperazina con una sal ácida de piridina;



2) Respecto al estado de la Técnica:

D1 divulga previamente compuestos novedosos de diamina cíclica, representado por la fórmula I o sus sales o sus solvatos. (Ver resumen)



En el proceso de preparación el compuesto de fórmula (I) puede ser convertido a sales de adición por los métodos comunes. También puede ser preparado como solvato(s) con un solvente para la reacción o para la recristalización especialmente como hidrato. (Ver página 18, líneas 35-40)

Ejemplos de las sales de adición del compuesto (I) son sales inorgánicas como clorhidrato, sulfato, nitrato y fosfato y sales orgánicas ácidas como metanosulfonato, maleato, fumarato y citrato. (Ver página 11, líneas 53-55-D1)

El proceso de reacción del ejemplo 32 presenta la obtención del diclorhidrato de 2-[4-[2-(benzimidazol-2il-tio)etil]piperazin-1-il]-N-[2,4-bis(metiltio)-6metil-3-piridil]acetamida (Ver página 56, líneas 24-40)

1) Estado de la Técnica más cercano: **D1**

La solicitud se diferencia de **D1** en el empleo de clorhidrato de piridina como fuente del anión en el proceso de preparación. En **D1** se anticipan otras sales de adición empleando como fuente el anión sulfato y maleato entre otros.

En la solicitud presentada entre otros los productos finales son sales de clorhidrato, disulfato, monosulfato y dimaleato (Ver folios 131-137)

Este empleo de la fuente de anión diferente, es evidente para el experto en la materia usar otras sales fuentes del anión clorhidrato y preparar el aducto de agua para aumentar su solubilidad.

El proceso de preparación se deriva de forma evidente del estado de la técnica, siendo obvio para el experto en la materia, empleando otra fuente del anión clorhidrato, sulfato entre otros, de forma tal que la solicitud carece de altura inventiva.

El Problema Técnico Objetivo fundamental el cual es "proveer un método de preparación de una sal de adición de un compuesto poliacídico básico o un aducto de agua que tiene un sitio (s) básico más fuerte que la piridina", queda plenamente resuelto con los procesos de la anterioridad encontrada, pues es evidente para el experto en la materia con el documento **D1**, se obtendría el proceso de la solicitud presentada; por lo tanto carece de nivel inventivo.

De manera tal que la solicitud en sus reivindicaciones 4 a 15 carecen de nivel inventivo.

9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 0987254	4-15	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 quinto del título primero de la Circular Única N° 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

 24 ABR. 2009

CONCEPTO TÉCNICO No. 03540

EXAMINADOR TÉCNICO
Código No. 202070