

G. HOLLMANN RESTREPO
ABOGADOS LTDA.

Señora
Jefe de la División de Nuevas Creaciones
Superintendencia de Industria y Comercio
Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo
E. S. D.

104
104

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-098784-00008-0000

Fecha: 2007-12-26 14:41:26 Dep: 2020 NULCREACION
Tipo: 11 PA - NULCREACION Lvs: 3/9 PASNACIONALIT
Aut: 1 NULCREACION Folios: 2

Re.: Expediente No. 05098784

Solicitud del examen de patentabilidad para: **NUEVA DIFENILAZETIDINONA CON CARACTERÍSTICAS FISIOLÓGICAS MEJORADAS, CORRESPONDIENTE MÉTODO DE PRODUCCION, MEDICAMENTOS QUE CONTIENEN DICHO COMPUESTO Y SU USO**

Solicitante: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH**

SOLICITUD EXAMEN DE PATENTABILIDAD

(CAPITULO II)

Yo, **LUIS PATIÑO LEYVA**, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, obrando en mi calidad de apoderado de la sociedad solicitante, atentamente me permito solicitar a Ud. que se realice el examen de patentabilidad de la invención arriba citada, para lo cual anexo el comprobante de pago correspondiente a la tasa establecida para dicha solicitud.

En consecuencia, atentamente solicito a Ud. se anexe este memorial junto con el comprobante de pago al expediente correspondiente a esta solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, y se continúe con su tramitación.

De la Señora Jefe,

Luis Patiño Leyva

C.C. No. 2.930.616 de Bogotá

T.P.A. No.2698 del C. Sup. de la Judicatura

Carrera 11A No. 94-78 Oficina 308 Santa Fe de Bogotá

Teléfonos: 6161948

Bogotá, D.C.,

2007

Gustad/Departamento de patentes/patentes/Luis Patiño/P20176/Memorial examen de patentabilidad

104A
105

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 95,195
FECHA : NOVIEMBRE 22 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-098784-00005-0000

ESTADO DE CUENTA DE CREDITO
NULCACION
FASL NACIONAL

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
GUSTAVO HOLLAHER G	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	71028673	22/11/2007	809,000.00
GUSTAVO HOLLAHER G	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	71028674	22/11/2007	1,513,000.00

***** 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. _____

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 05-98784

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

PCT FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 577

DE FECHA 29 DE JUNIO DEL 2007, EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL 27 DE SEPTIEMBRE 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 ☒ **_____**

(19) **United States**

(12) **Patent Application Publication**
Glombik et al.

(10) Pub. No.: **US 2002/0137689 A1**
(43) Pub. Date: **Sep. 26, 2002**

(54) **NOVEL DIPHENYLAZETIDINONES,
PROCESS FOR THEIR PREPARATION,
MEDICAMENTS COMPRISING THESE
COMPOUNDS AND THEIR USE**

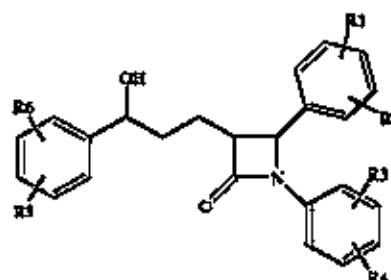
Publication Classification

(51) Int. Cl.⁷ A61K 31/70; A61K 31/397;
C07H 17/02
(52) U.S. Cl. 514/23; 514/210.02; 536/17.4;
540/200

(75) **Inventors:** Heiner Glombik, Hofheim (DE);
Werner Krampe, Mainz-Laubenheim
(DE); Stefanie Flohr, Eppstein (DE);
Wendelin Frick, Hanstein-Bonertsch
(DE); Hubert Hauer, Schwabenheim
(DE); Gerhard Jaschke, Frankfurt (DE);
Andreas Lindenschmidt, Bad Soden
(DE); Hans-Ludwig Schaefer,
Hochheim (DE)

(57) **ABSTRACT**
Compounds of the formula I,

Correspondence Address:
Fitzegan, Henderson, Farabow,
Garrett & Dunner, I.L.P.
1300 I Street, N.W.
Washington, DC 20005-3318 (US)



(21) Appl. No.: 10/021,502

(22) Filed: Dec. 19, 2001

(30) **Foreign Application Priority Data**

Dec. 21, 2000 (DE) 100643/8.1
Oct. 26, 2001 (DE) 10152981.3

in which R1, R2, R3, R4, R5, and R6 have the meanings given in the description, and their physiologically acceptable salts. The compounds are suitable for use, for example, as hypolipidemics.

$\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, $\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or $\text{SO}_2-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$ and the phenyl radical may be substituted up to two times by F, Cl, Br, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or NH_2 ; or

NH_2 , $\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-acyl}$, phenyl or $\text{O}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$, where the phenyl ring may be mono- to trisubstituted by F, Cl, Br, I, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, NH_2 , $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, SO_2-CH_3 , COOH , $\text{COO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or CONH_2 ;

(LAG) is a sugar residue, disugar residue, trisugar residue, tetrasugar residue;

a sugar acid, an amino sugar;

an amino acid residue, an oligopeptide residue comprising 2 to 9 amino acids;

a trialkylammoniumalkyl radical; or $-\text{O}-(\text{SO}_2)-\text{OH}$;

wherein at least one of the radicals R1 to R6 has the meaning $(\text{C}_0-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{LAG})$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-(\text{C}=\text{O})-$, $-\text{NH}-$, $-\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})-$ or $-\text{NH}-$, and where the radicals R1 and R2 may not have the meaning $-\text{O-sugar residue}$ or $-\text{O-sugar acid}$.

2. A compound as claimed in claim 1, wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 independently of one another are $(\text{C}_0-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{LAG})$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-(\text{C}=\text{O})-$, $-\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})-$ or $-\text{NH}-$; or

H, F, Cl, Br, I, CF_3 , NO_2 , CN, COOH , $\text{COO}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, CONH_2 , $\text{CONH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{CON}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkenyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkynyl}$ or $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, where one, more or all hydrogens in the alkyl radicals may be replaced by fluorine; or

SO_2-NH_2 , $\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}_2\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{S}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, $\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, $\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or $\text{SO}_2-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$ and the phenyl radical may be substituted up to two times by F, Cl, Br, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or NH_2 ; or

NH_2 , $\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-acyl}$, phenyl or $\text{O}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$ and the phenyl ring may be mono- to trisubstituted by F, Cl, Br, I, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, NH_2 , $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, SO_2-CH_3 , COOH , $\text{COO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or CONH_2 ;

(LAG) is a sugar residue, disugar residue, trisugar residue, tetrasugar residue;

a sugar acid, an amino sugar;

an amino acid residue, an oligopeptide residue comprising 2 to 9 amino acids;

a trialkylammoniumalkyl radical; or $-\text{O}-(\text{SO}_2)-\text{OH}$;

wherein at least one of the radicals R1 to R6 has the meaning $(\text{C}_0-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{LAG})$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-(\text{C}=\text{O})-$, $-\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})-$ or $-\text{NH}-$, and where the radicals R1 and R2 may not have the meaning $-\text{O-sugar residue}$ or $-\text{O-sugar acid}$.

3. A compound as claimed in claim 1, wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 independently of one another are $(\text{C}_0-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{LAG})$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-(\text{C}=\text{O})-$, $-\text{N}(\text{C}_2)-$ or $-\text{NH}-$; or

H, F, Cl, Br, I, CF_3 , NO_2 , CN, COOH , $\text{COO}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, CONH_2 , $\text{CONH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{CON}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkenyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkynyl}$ or $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, where one, more or all hydrogens in the alkyl radicals may be replaced by fluorine; or

SO_2-NH_2 , $\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}_2\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{S}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, $\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, $\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or $\text{SO}_2-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$ and the phenyl radical may be substituted up to two times by F, Cl, Br, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or NH_2 ; or

NH_2 , $\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-acyl}$, phenyl or $\text{O}-(\text{CH}_2)_n\text{-phenyl}$, where $n=0-6$ and the phenyl ring may be mono- to trisubstituted by F, Cl, Br, I, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF₃, $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, NH_2 , $\text{NH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{N}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, SO_2-CH_3 , COOH , $\text{COO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$ or CONH_2 ;

(LAG) is a sugar residue, disugar residue, trisugar residue, tetrasugar residue;

a sugar acid, an amino sugar;

an amino acid residue, an oligopeptide residue comprising 2 to 9 amino acids;

a trialkylammoniumalkyl radical; or $-\text{O}-(\text{SO}_2)-\text{OH}$;

wherein at least one of the radicals R1 or R6 has the meaning $(\text{C}_0-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{LAG})$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-(\text{C}=\text{O})-$, $-\text{N}(\text{CH}_2)-$ or $-\text{NH}-$, and where the radicals R1 and R2 may not have the meaning $-\text{O-sugar residue}$ or $-\text{O-sugar acid}$.

4. A compound as claimed in claim 1, wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 independently of one another are $-(\text{CH}_2)_{2-1}-\text{NH}-(\text{C}=\text{O})_{2-1}-\text{C}(\text{C}_2-\text{C}_{20})\text{-alkylene}-(\text{C}=\text{O})_{2-1}-\text{N}(\text{R}7)_{2-1}-\text{LAG}$, where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by oxygen atoms, or

H, F, Cl, Br, I, CF_3 , NO_2 , CN, COOH , $\text{COO}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, CONH_2 , $\text{CONH}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{CON}((\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkenyl}$, $(\text{C}_2-\text{C}_6)\text{-alkynyl}$ or $\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-alkyl}$, where one, more or all hydrogens in the alkyl radicals may be replaced by fluorine; or

[0236] Cholesterol absorption test. 0.25 ml/mouse Intralipid 20 (Pharmacia-Upjohn) (spiked with 0.25 μCi of ^{14}C -cholesterol) in 0.1 mg of cholesterol) is administered perorally by gavage.

[0237] Test substances are prepared separately in 0.5% methylcellulose (Sigma):5% Solurol (BASF, Ludwigshafen) or a suitable vehicle. The administration volume of the test substance is 0.5 ml/mouse. The test substance is administered immediately prior to the test meal (Intralipid labeled with ^{14}C -cholesterol) (cholesterol absorption test).

[0238] The feces are collected over a period of 24 hr: fecal elimination of ^{14}C -cholesterol and ^3H -taurocholic acid (TCA) is determined after 24 hours.

[0239] The livers are removed and homogenized, and aliquots are incinerated in an oxidate (Model 307, Packard) to determine the amount of ^{14}C -cholesterol which had been taken up/absorbed.

[0240] Evaluation

[0241] Feces Samples

[0242] The total weight is determined, the sample is made up with water to a defined volume and then homogenized, and an aliquot is evaporated to dryness and incinerated in an oxidate (Model 307 from Packard for the incineration of radioactively labeled samples); the amount of radioactive ^3H - H_2O and ^{14}C - CO_2 is extrapolated to the amount of ^3H -taurocholic acid and ^{14}C -cholesterol, respectively, that is excreted (dual isotope technique). The ED_{50} values as dose from a dose-effect curve are interpolated as those doses at which the excretion of TCA or cholesterol is doubled, based on a control group treated at the same time.

[0243] Liver Samples

[0244] The amount of ^{14}C -cholesterol taken up by the liver is based on the administered dose. The ED_{50} values are interpolated from a dose-effect curve as the dose at which the uptake of ^{14}C -cholesterol by the liver is halved (50%), based on a control group.

[0245] The ED_{50} values below demonstrate the activity of the compounds of the formula I according to the invention

Example No.	ED_{50} (Geva) [mg/mouse]
I	0.1
II	0.03
XIII	0.3
XV	0.01
XVII	1.0
XX	0.2
XXI	1.2
XXIV	0.3
XXV	0.3
XXIX	0.1

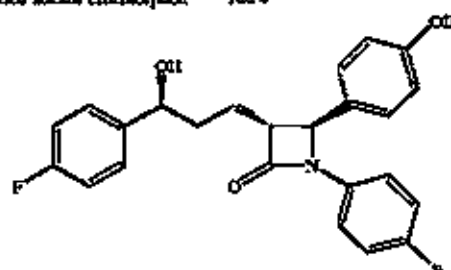
[0246] As can be seen from the table, the compounds of the formula I have very good cholesterol-lowering action. The compounds can thus be used to control cholesterol concentration. Such control can be by lowering the cholesterol concentration, or maintaining a desired level of cholesterol concentration.

[0247] Bioabsorption

[0248] The bioabsorption of the compounds of the formula I can be examined using the Caco cell model (A. R. Hilgers et al., Caco-2 cell monolayers as a model for drug transport across the intestinal mucosa, Pharm. Res. 1990, 7, 902).

[0249] Below is a bioabsorption measurement for a reference compound:

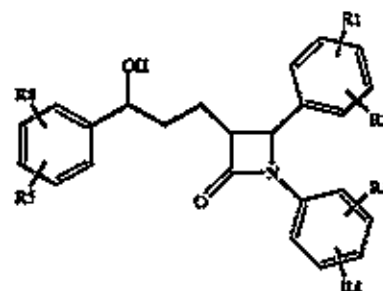
	Reference structure	Example
Apparent partition coefficient	4.28×10^{-3}	
P_{app} (cm/s) (according to L.A. Hilgers)		
Estimated human bioabsorption	100%	



Reference structure
Example

We claim:

1. A compound of the formula I,



or a pharmaceutically acceptable salt or ester thereof, in which

R1, R2, R3, R4, R5, R6 independently of one another are $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_{20})$ -alkylene-(LAG), where one or more carbon atoms of the alkylene radical may be replaced by $-\text{O}-$, $-\text{C}(=\text{O})-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, $-\text{N}((\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl})-$, $-\text{N}((\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkylphenyl})-$ or $-\text{NH}-$, or

H, F, Cl, Br, I, CF_3 , NO_2 , CN, COOH , $\text{COO}(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, CONH_2 , $\text{CONH}(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{CON}((\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $(\text{C}_2\text{--}\text{C}_6)\text{-alkenyl}$, $(\text{C}_2\text{--}\text{C}_6)\text{-alkynyl}$ or $\text{O}-(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, where one, more or all hydrogens in the alkyl radicals may be replaced by fluorine; or

$\text{SO}_2\text{--NH}_2$, $\text{SO}_2\text{NH}(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{SO}_2\text{N}((\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl})_2$, $\text{S}-(\text{C}_1\text{--}\text{C}_6)\text{-alkyl}$, $\text{S}-(\text{CH}_2)_6\text{-phenyl}$.

~~108~~
110

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
LUIS PATIÑO LEYVA

ASUNTO	Radicación	05-98784
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	Nº 7
	Folios	008

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Via Nacional	☐		
Via PCT (Fase Nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	<u>PCT/EP2004/002690</u>
Fecha de Presentación Internacional	<u>16/03/2004</u>

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

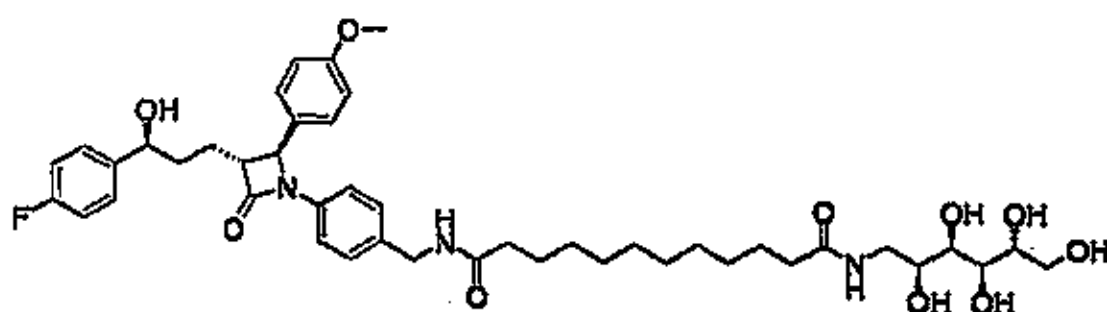
- 1.1. Descripción: Folios 32 a 54 como se radicó inicialmente.
- 1.2. Reivindicaciones: Folios 55 a 57 como se radicó inicialmente.
- 1.3. Prioridad: DE 10314610.5 del 01/04/2003.

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: NUEVA DIFENILAZETIDINONA CON CARACTERISTICAS FISIOLÓGICAS MEJORADAS, CORRESPONDIENTE METODO DE PRODUCCION, MEDICAMENTOS QUE CONTIENEN DICHO COMPUESTO Y SU USO.

Objeto de la invención:

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste compuestos derivados de difenilazetidinona y sus composiciones farmacéuticas.



I

Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (I) o sus sales farmacéuticamente aceptables.

Reivindicación 2: Un medicamento, que comprende un compuesto según la reivindicación 1.

Reivindicaciones 3 a 6: Un medicamento, que comprende un compuesto según la reivindicación 1 y al menos un compuesto activo adicional.

Reivindicación 7: Un proceso para preparar un medicamento que comprende el compuesto de la reivindicación 1, que comprende mezclar el compuesto activo con un vehículo farmacéuticamente aceptable.

Reivindicaciones 8 a 11: Uso de los compuestos de fórmula (I).

Reivindicaciones 12 a 14: Intermedios de fórmula III, IV y V.

El problema planteado en esta solicitud de patente es la necesidad de proveer un compuesto derivado de difenilazetidiona que tenga una solubilidad y una estabilidad incrementada y asegure una mejor disponibilidad en el sitio de acción y así una eficacia mejorada.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I) y sus sales, así como sus composiciones farmacéuticas.

Se catalogó el objeto de la invención según la IPC en las categorías C07D 205/08, A61K 31/397 y A61P 3/06.

3. De la solicitud de Patente

Título:

Se debe eliminar del título de la solicitud el término y su uso ya que no es patentable.

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 3 es muy general al indicar "**y al menos un compuesto activo adicional**" y además está reivindicando composiciones farmacéuticas que no están comprendidas en la invención de acuerdo al capítulo descriptivo.

La reivindicación 6 se refiere a un compuesto caracterizado por su uso, lo cual no lo hace diferente al reivindicado en las reivindicación 1.

La reivindicación 7 corresponde a un proceso que no tiene ninguna característica diferente a las ya conocidas para preparar un medicamento, la cual comprende mezclar un principio activo con un vehículo farmacéuticamente aceptable.

Las reivindicaciones 12 a 14 se refieren a compuestos de fórmula general III, IV y V, los cuales son intermedios en procesos de preparación de compuestos de fórmula (I), por lo tanto se deben modificar éstas reivindicaciones de tal manera que indiquen lo anterior.

4. Reivindicaciones relativas a uso o a uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

Las reivindicaciones 8 a 11 indican el uso de los compuestos de fórmula (I), lo cual no se considera como invención y por lo tanto no es patentable.

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 01/04/2003, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

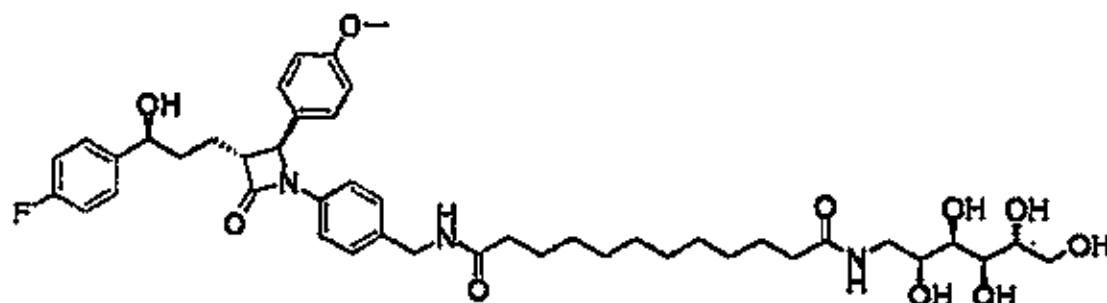
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US 2002137689	Novel diphenylazetidinones, process for their preparation, medicaments comprising these compounds and their use	27/06/2002

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

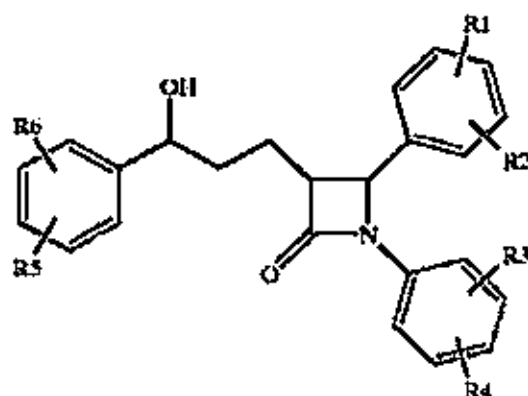
6.1. Novedad: (artículo 16 D 486)

La reivindicación 1 de la presente solicitud reivindica compuestos de fórmula (I).



I

El documento D1 describe compuestos de fórmula:



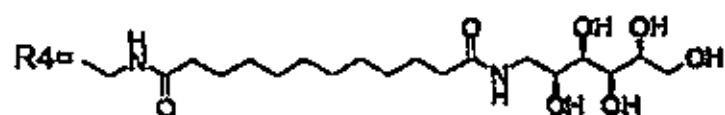
sus sales farmacéuticamente aceptables, medicamentos y procesos para su preparación

Comparando elemento por elemento la fórmula (I) con la de D1, encontramos que realizando los respectivos reemplazos en los sustituyentes R^1 a R^6 de la fórmula de D1, se obtiene el compuesto de fórmula (I) así:

$R1=O-CH_3$

$R2=H$

$R3=H$



$R5=F$

$R6=H$

De acuerdo a lo anterior, se considera que este compuesto, sus sales farmacéuticamente aceptables y los medicamentos que los contienen, no cumplen con el requisito de novedad.

7. Conclusión

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	US 2002/0137689	1 a 6	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 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
14 NOV 2001

CONCEPTO TECNICO No. 2886	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
----------------------------------	--