

358
353
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-010044- -00005-0000

Fecha: 2007-12-06 16:08:25 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 2

Clarke, Modet & C°

COLOMBIA

SEÑORES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
E.S.D

REF EXPEDIENTE No.: 06010044
PATENTE: ANÁLOGOS D 4-(METILSULFONILAMINO)FENILO
COMO ANTAGONISTAS VANILLOIDES QUE MUESTRAN
EXCELENTE ACTIVIDAD ANALGÉSICA Y COMPOSICIONES
FARMACÉUTICAS QUE COMPRENDEN LOS MISMOS
SOLICITANTE : GRÜNENTHAL GMBH

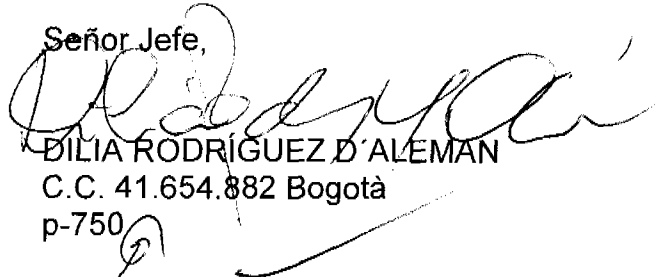
ASUNTO: SOLICITUD ESTUDIO DE FONDO

DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN, en mi condición de apoderada de la Sociedad solicitante, por el presente escrito atentamente solicito a Usted que habiéndose surtido la publicación de la presente solicitud, en la Gaceta de la Propiedad Industrial No.577 de fecha Junio 30 de 2007 y se proceda con el estudio de Fondo.

Para tal fin me permito anexar la tasa correspondiente.

Agradezco continuar con el presente trámite.

Señor Jefe,


DILIA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

C.C. 41.654.882 Bogotá

p-750

~~359~~
359.

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 87,034
FECHA : OCTUBRE 23 DE 2007

00005-0000

Dep. 2020 NUECREACIONE
Eve. 378 FASLNACIONALI
Folios: 2

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CLARKE MODET Y CO. COLOMB	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	71030061	23/10/2007	26.261,000.00

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	404,000.00
		TOTAL :	\$ 404,000.00

RESPONSIBLE _____

RECIBO DE CASH APLICADO AL EXPEDIENTE No.

316

P 75C

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-10044

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **577** DE

FECHA **29 DE JUNIO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **27 DE SEPTIEMBRE 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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
28 February 2002 (28.02.2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/16318 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07C 335/16,
311/00, A61K 31/00, C07D 221/00

(21) International Application Number: PCT/KR01/01407

(22) International Filing Date: 20 August 2001 (20.08.2001)

(25) Filing Language: Korean

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
2000/48385 21 August 2000 (21.08.2000) KR
2000/48388 21 August 2000 (21.08.2000) KR
2000/85126 29 December 2000 (29.12.2000) KR

(71) Applicant (for all designated States except US): PACIFIC
CORPORATION [KR/KR]; 181, Hankang-ro 2-ka,
Yongsan-ku, Seoul 140-777 (KR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): SUH, Young,
Ger [KR/KR]; 1223-602, Hanyang Apt., Sanbon-dong,
Gunpo-si 435-040, Kyunggi-do (KR). OH, Uh, Taek
[KR/KR]; 615-102, Eulji Apt., Sanbon-dong, Gunpo-si
435-040, Kyunggi-do (KR). KIM, Hee, Doo [KR/KR];
601-601, Mokdong Apt., Mok 6-dong, Yangchon-ku, Seoul
158 056 (KR). LEE, Jee, Woo [KR/KR]; 27-901, Misung
Apt., 406, Apgujung-dong, Kangnam-ku, Seoul 135-110
(KR). PARK, Hyeung, Geun [KR/KR]; 206-1103,
Doosan Apt., 1708-1, Bongchon-bondong, Kwanak-ku,
Seoul 151-782 (KR). PARK, Ok, Hui [KR/KR]; 179,
Gikyung 1 ri, Sangwal-myeon, Nonsan si 320-933, Chung-
chungnam-do (KR). LEE, Yong, Sil [KR/KR]; 103-ho,
196-54, Bongchon 11-dong, Kwanak-ku, Seoul 151-817
(KR). PARK, Young, Ho [KR/KR]; 3-1201, Daerim Apt.,
Sadang-dong, Dongjak-ku, Seoul 156-775 (KR). JOO,
Yung, Hyup [KR/KR]; 1062-13, Hwagok 5-dong, Kang-
suh-ku, Seoul 157-015 (KR). CHOI, Jin, Kyu [KR/KR];
308-203, Sunkyung 3-cha Apt., Ingae-dong, Paldal-ku,
Suwon-si 442-762, Kyunggi-do (KR). LIM, Kyung, Min
[KR/KR]; 835-1703, Byukjeokgol Jukong Apt., Young-
tong dong, Paldal-ku, Suwon-si 442-470, Kyunggi-do

(KR). KIM, Sun, Young [KR/KR]; 102-1604, Sannaedcul
Hyundae Apt., 331, Jukjeon-ri, Suji-eup, Yongin-si
449-984, Kyunggi-do (KR). KIM, Jin, Kwan [KR/KR];
344-208, Jukong Apt., Banpo 1-dong, Seocho-ku, Seoul
137-930 (KR). KOH, Hyun, Ju [KR/KR]; 604, Jayang
2-dong, Kwangjin-ku, Seoul 143-865 (KR). MOH, Joo,
Hyun [KR/KR]; 314-1, Bora-ri Kiheung-eup, Yongin-si
449-729, Kyunggi-do (KR). JEONG, Yeon, Su [KR/KR];
118-803, Sungwon Apt., Sanghyun-ri, Suji-eup, Yongin-si
449-840, Kyunggi-do (KR). YI, Jung, Bum [KR/KR];
113-205, SuwonHaniltown Apt., 881, Jowon-dong,
Jangan-ku, Suwon-si 440-850, Kyunggi-do (KR). OH,
Young, Im [KR/KR]; 102-304, Byuksantown Apt., 832,
Jukjeon-ri, Suji-eup, Yongin-si 449-840, Kyunggi-do
(KR).

(74) Agent: SUH, Jong, Wan; 7th Floor, New-Seoul Building,
828 8, Yeoksam dong, Kangnam ku, Seoul 135-080 (KR).

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

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

Published:

- with international search report
- entirely in electronic form (except for this front page) and
available upon request from the International Bureau

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

(54) Title: NOVEL THIOUREA DERIVATIVES AND THE PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THE
SAME

(57) Abstract: The present invention relates to novel thiourea derivatives as a modulator for vanilloid receptor (VR) and the phar-
maceutical compositions containing the same. As diseases associated with the activity of vanilloid receptor: pain acute pain, chronic
pain, neuropathic pain, post-operative pain, migraine, arthralgia, neuropathies, nerve injury, diabetic neuropathy, neurodegeneration,
neurotic skin disorder, stroke, urinary bladder hypersensitiveness, irritable bowel syndrome, a respiratory disorder such as asthma or
chronic obstructive pulmonary disease, irritation of skin, eye or mucous membrane, fervescence, stomach-duodenal ulcer, inflam-
matory bowel disease and inflammatory diseases can be enumerated. The present invention provides a pharmaceutical composition
for prevention or treatment of these diseases.



WO 02/16318 A1

362
35

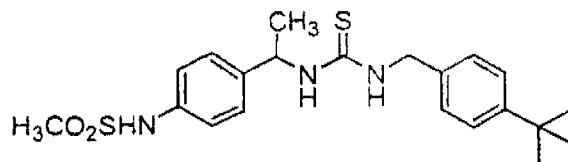
for 3 hours. The reaction solution was evaporated under reduced pressure. The residue was diluted with ethyl acetate (70 ml), and washed with water and brine. The solvent was evaporated under reduced pressure, and then the obtained residue was purified by column-chromatography (hexane/ethyl acetate = 30/1) to yield the compound **35-5** (56 mg, 33 %).

^1H NMR(300MHz, CDCl_3) : δ 8.60(s, 1H), 8.17(d, 1H, $J=8.76$ Hz), 7.88(dd, 1H, $J=1.95, 8.79$ Hz), 7.40(m, 4H), 4.80(d, 2H, $J=5.13$ Hz), 4.55(s, 2H), 3.10(s, 3H), 1.27(s, 9H)

MS (FAB) m/e 451 $[M^++1]$

10

Example 198: Synthesis of
1-(4-*t*-butylbenzyl)-3-(1-(4-methanesulfonylphenyl)ethyl)thiourea (36-4)

**36-4**

Step 1: Synthesis of 4-methanesulfonylaminoacetophenone (36-1)

4-aminoacetophenone (300 mg) was dissolved in dichloromethane, and to the solution were added methanesulfonic anhydride (2.44 mmol) and pyridine (53.85 μl) at 0°C , followed by stirring at room temperature for 3 hours. After confirming the

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES2020
Bogotá, D.C.,Abogado
DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

ASUNTO	Radicación	06-010044
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	7 8749

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐Vía Nacional ☐Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☒ Cap. II ☐No. Sol. Internacional PCT/KR2004/001641
Fecha de Presentación Internal. Julio 02 de 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

- 1.1. Descripción: Folios: 56 a 175 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 176 a 187 como se radicó inicialmente
- 1.3. Prioridad: KR 10-2003-0044552 del 02 de Julio de 2003

2. Objeto de la invención

- Título: "ANALOGOS DE 4-(METILSULFONILAMINO)FENILO COMO ANTAGONISTAS VANILLOIDES QUE MUESTRAN EXCELENTE ACTIVIDAD ANALGESICA Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE COMPRENDEN LOS MISMOS"

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

- Reivindicaciones 1 a 11: Compuestos de fórmula general (I)
- Reivindicaciones 12 a 14: Composiciones farmacéuticas del compuesto de fórmula general (I)

El problema planteado en la presente solicitud es proveer análogos novedosos de 4-(metilsulfonilamino)fenilo como potentes antagonistas del receptor vanilloide, y pueden resultar útiles como analgésicos.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula general (I) y sus composiciones farmacéuticas.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/18, A61K 31/136, A61K 31/17, A61K 31/216 y A61K 31/03

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

Se recomienda no mencionar el uso en el título, ya que los mismos no son patentables; hacer los cambios pertinentes.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1 no esta inequívocamente definida, porque los radicales tienen muchos significados y sustituciones de sustituciones; y amplían el número de compuestos posibles reclamados bajo las características esenciales del compuesto de fórmula (I). De otra parte, en la descripción no se encuentra en ninguna parte la formación de solvatos.
- Las Reivindicaciones 13 a 14; están definiendo una composición farmacéutica por su uso y no por sus componentes; por tal razón, éstas no se aceptan.
- Las Reivindicaciones 1 a 2, 4, 6 y 8; las palabras y/o expresiones: "al menos uno", "uno o más", "opcionalmente"; no son concisas; por tanto no delimitan de manera inequívoca la materia a proteger.

Debido a que la materia solicitada no es clara, concisa y no tiene alcance plenamente definido y no esta soportada por los resultados de actividad biológica para todos y cada uno de los ejemplos presentados en el capítulo descriptivo; es necesario que el solicitante concrete su solicitud acorde a los ejemplos que sustenten actividad como potentes antagonistas del receptor vanilloide y resulten útiles como analgésicos entre otros.

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: Julio 02 de 2003

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	WO 02/16318	NOVEL THIOUREA DERIVATIVES AND THE PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING THE SAME	Febrero 28 de 2002

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1 Novedad (artículo 16 D486)

- Reivindicación 1: Compuestos de fórmula general (I)
- Reivindicación 12: Composiciones farmacéuticas del compuesto de fórmula general (I)

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 06-010044	D1 = WO 02/16318
Un Compuesto de fórmula (I): Donde: R1, R2, R3, R4 y R5= Hidrógeno R6= Alquilo C1-6 A= NHC(=S)NH Donde: R7= Alquilo lineal o ramificado de C1-6	Compuesto 1-(4-t-butylbenzyl)-3-(1-(4-methanensulfonylphenyl)ethyl)thiourea Pág. 211 del Documento
Composiciones farmacéuticas que contienen el compuesto de fórmula (I)	Composición farmacéutica que contiene el compuesto 1-(4-t-butylbenzyl)-3-(1-(4-methanensulfonylphenyl)ethyl)thiourea Pág. 241 del Documento

Teniendo en cuenta el objeto de la invención, el documento D1 ya divulga el compuesto 1-(4-t-butylbenzyl)-3-(1-(4-methanensulfonylphenyl)ethyl)thiourea, el cual corresponde a los compuestos de fórmula (I) reclamados, por lo que no son nuevos, ni las composiciones farmacéuticas que los contienen.

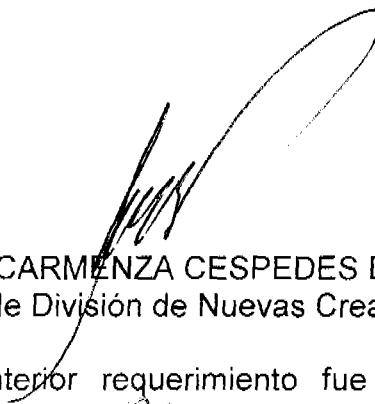
6. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 02/16318	1 a 14	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 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 CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

CONCEPTO TÉCNICO No. 2381	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202080
---------------------------	---