f

CAVELIER

ABO GAD OS

TelØfono: (57-1) 347 3611
EDIFICIO SISKI Telefax: (57-1) 211 8650
www.cavelier.com CARRERA 4 No. 72 - 3F, I71 c40 non
cavelier@cavelier.com BOGOTA 8, COLOMB
SUHERINJLNDLNCIA DE INDUSTR’IA Y COMERC.IO
Seæora Je f e de la

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES IltIIIIIIIIIIIIIIIIIIiHhiIiIIiIIIIIIIIIO

No. 06-098640- -00003-0000

Superintendencia de Industria y Comerc– Fec:ha. 2008-06-12 16.45.23 Dep 2020 NUECRLACIONI
E. S. D. Ira. 11 FAIEN[EIYII Dye: 378 FASENACIONAL!
Act, 538 PEI ICION Folios 2

TrÆmite : 011 Evento : 378 Actuacidn: 538

Referenda : Expediente No. 06098640
Asunto : Solicitud de patente para ANTAGONISTAS DE
CGRP SELECCIONADOS, PROCEDIMIENTOS PARA SD
PREPARACIÔN ASI COMa SJJ USO COMO MEDICAMENTO
Solicitante BOEHR.INGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH
Publicada en La Gaceta No. 583 del 18 de diciembre de 2007

SOLICITUD EXAMEN DE PATENTABILIDAD

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi
firma, actuando coma apoderado de la sociedad BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH, atentamente solicito se efectt3e el examen de patentabilidad de la solicitud en referenda presentada de acuerdo con las reglas del CapItulo I del PCT y segün 10 establecido en el artIculo 44 de la Decision 486 de la ComisiOn de la Comunidad Andina..

Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo
No. 08-46,056 del 9 de junio de 2008, por el valor de la tasa legal fijada para el efecto.

2. Por lo anterior, comedidamente solicito se prosiga con el
trªmite de este asunto.

. Seæora Jefe,

EMILItO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

CQLO-09255-841 -051-7

f’ SCT\SCT\ID-126116\WPCL9255
No. M-2008-128110\SCT

NIT 860.041.367-3

UPER!NTENOENCIA OE 1NDUSTRA V COMER13

RECflID oFICIAL DE CPJA
FFCHA

: 08 - 46.056
JUN10 9 DE 2000

NIT 074089-2

S’UPLRINI "DENCIAD[INo, Y
No, 0
ha.20o

6..098640
rre 00003.0000 111

Fec;. C6 12 1645

Act, 53B RA FLN FE/yjj Dep 2020 PE TicION LvCACIO NUL 378 OIfQS 2 NACIONALI

H** CUNSIGNACION H***

TIPO PAGO 8ANCQ CUENTA No. PASO FECHA P80 Vr. PAGU -- - AVEL1ER AOOSADOS CONSJCt4ACION BANCO DE POGOTA 062754387 2670328 09/06/2000 09445.00.0

*H** C 0 N C E P T 0 4Hfl

CANT. RENTISTICO

CONCEPTI) TOTAL CUNCEPTh ------------------ 50005-01-01 SOLICITUDES
SON: CUATROCIENTOS VEINTE NIL PESOS

PSP0NSABLE:

RECIBfJ DE CA,JA APLICADO AL EXPEDIENT No,

eckc ’(-?Yi‘2 6 q

85 EXAMEN DE PATEP4ThDJLJDAD DE INVEN 420000. 00
TOTAL $ 420000.00

Industria y Comercio
S P E R I N T E N D E N C I A

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACION EXPEDIENTE No. 06-98640

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 583 DE

FECHA 18 DE DICIEMBRE DE 2007 EL TERMINO HABIL SEtJALADO FOR LA

LEY EXPIRA EL 14 DE MARZO DE 2008

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberØ solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con 10 establecido en el Articulo 44 de la Decision 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI NO X

O’42

CAVEUER ABOGADOS COLO 13738-841-0643 PRPflD-000493

Industria Comercio V
SUPERINTENDENCIA I kftUU; NMI.11JJL_
J icl30*44 179119 115
1 I TP1ti 1119(1
pitisrnt
FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL 5-05 -0E
SOLICITUD DE:

I Patents do InvenclOn. 0 Patents do Modelo de Utilidad.
0 Capltulo I. 11 Capitulo II.

O P4ombre: BOEHRINGER INOELHEJM

PHARMA OMSH I CO. KG IDEN11FICACI6N

SOLIMANTIE scalodvd coi,stltulda exlstenta beo Is$ NIT 0 (71) bye. do Is RoptbIIc. Federal do AlemunIe

C.E. 0 Otto 0

DIreccIón: 55218 Ingslhelm, Cua RepOblica do Jsmenba
Dornbdibo: IneIhslm, Nümero
Repcibllca Federal do ftdernenla

O

Federal

CAVELIER ABOGADOS COLO 13738441-0543 PRPfl04XI0403 ZI

40

ThuIo(54) 6 ANTAG NISTftS DE CORP ELEGID 5, PROCEDIMIENTO PARA 8U

PREPARACION. AS! COMO SU EMPLEO COM MEDICAMENT S

()

Cluolflcaclón lntirnaclonil (61) C07D 401/14 A6 j f/4 545
,461P25frj,
(DPnoridad (33) Pals do Origen (32) Fecha [(31) NUmero do SoIictud

S119 NOD DE 25deoctubre do 2002 102 50080.0 I () Comprobanta di pago No.: 05-34.760 Ficha: 11 di Mayo di 2005

()
I1 Comprobanto do pago do Is tie@ do preeentaclôn do Is solicitud par 443.000.00.
D Comprobante do pago por rsivindlcaclón do pilorldad.
tEl Documento quo acredit. Is oxIstencle roprssentadón legal cuando el solicitants sea persons

Juridica.

tEl Podsres, si fuere ii caso.
tEl Documento do csalón del Inventor ii soilcltante o a au causante.
Declaraclories.

tEl Copia do Is solicitud Intemaclonal. (Rosumen, deithpclôn, rMndlceclons, dibujo.)
tEl Traducclón de Is solicitud Intsmaclonal ci castellano. (Resumen, desu1pci6n, roMndlcadonea,
dibujo.)
Copla del examen preilminar efoctuada por Is IPEA.
tEl Traducclôn del examen preilminar &ectuado por Is IPEA.
O Do eer el caso, copla del contrato do acceso.
O Di oar el caso, documento qua acredite Is llcencla 0 autortzadón de usa do conoclmlsntos
tradlclonales do lee comunidades Indigene..
El Do sir ii caso, certificado do depó&to del material biolOgico.

IN Arte final l2xl2
Do patents, titulos
tItular totalmente con invenclôn
esta
Otros:

6 q41

367

Son objeto de is presents invencióri antagonistas de GCRP de la formula general
5
V

4R2

w

ANIk
XR3

(I)

an is qua A, U, V, W, X y R1 a R3 estªn ciefinidos conto an is reivthdicaciOn 1,
sue tautónteroa, sus diastereoisómeros, sue enantiOmeroe, CUC
10 hidratos, sue mezclas y 5u$ sales, asi coma los hidratos de las sales, an particular sun sales fisiologicamente compati-bles con Æcidos inorgAnicos u orgªnicos, medicantentos qua contienon estos compuestos, su empleo y procedintientos pars
su preparaciOn.
15

20

cOLO L3736-141-064-3 30?P/!1.3736/XO-000456

1

Antagoniataa d. CORP.l.qidoa, proc.diainto para cu prspa-raai6n as5.. oo cu MWIOO ocł midioamentom

Son objeto de la presente invención antagonistas de GCRP de is formula general

10

sus tautÆmeros, sus diastereoi6in.ro, sue enantiómaros, SUe hidratos, sue mezclas y sus sales, ast como los hidratos de
las sales, en particular sus sales fisiolôgicamnerite compati-bles con âcidos inorgAnicos u orgÆnicos, medicamentos qua
15 contienen astos compuestos, CU wnpleo y procediin.tentos pars
su preparaciOn.
En is fOrmula general (I) anterior sigriifican, an una
primera forma de realizaciOn,
A un Atomo de oxigano o azufre, un grupo fenileulfonilarnino
. 20 o cianimino,
X un Ætoxno de oxigeno o azufre, un grupo imino, eventualmente sustituido con un grupo, a].quilo Cj.., o un grupo rnetileno, eventualiriente sustituido con un grupo aiquilo ci6,
25 U un grupo aiquilo C1.., aiquenilo C2-6 o aiquinilo C2.., an el
qua cads grupo methane puede ester sustituido con hasta 2 Atomon de de flilor y cada grupo metilo puede estar ustituido con haste 3 Ætomos de flAor,

2

V un Ætomo do cloro o broino, un grupo amino, metilainino 0 hidroxi,
W un Ætomo do hidrôgeno, flior, cloro, bromo 0 yodo, un
grupo difluorometilo o trifluorometilo,
5 R1 un hetarocjclo aze, diaza, triaza, oxaza, tiaza, tiadiaza o S,S-dióxido-tiadiaza do 5 a 7 miembros, seturado,
insaturado una o dos vecee,
estando los heterociclos precedenteinente mencionados
enlazados a travØs do un Ætozno do carbono o nitrbgeno,
10 conteniendo uno a doe grupos carbonilo o tiocarbonilo
contiguos a un Ætoxno do nitrdgeno,
. pudiendo ester sustituidos en uno do los Ætomos do
nitrógerio con tin grupo aiquilo,
pudiendo ester sutituidas en uno a en dos Atomos do
’ 15 carbono con un grupo aiquilo, con un grupo fenilo,
fenilmetilo, rtaftilo, biofenililo, piridinilo,
diazinilo, furilo, tienilo, pirroliio, 1,3-oxazoli10
1, 3-tiazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, 1-metilpirazo-
lila, imidazolilo o 1-metilimidazolilo, pudiendo los
20 eustituyentee ser igualas o diferentes,
y pudiendo eater coridensado un doble enlace o].efinico
do uno do los heterociclos ineaturados precedentemente mencionados con un anillo do fenilo, nafthlo,
piridina, diaziria, 1,3-oxazol, tienilo, furano,
25 tiazol, pirrol, N-metilpirrol 0 quinolina, con un
anillo do 1N-quiriolin-2-ona, aventualmanta suetituido

en

el Ætorno de nitrógerto con un grupo alquulo, o con
un anillo do imidazo]. o N-metilimidazo]., o ta.nbiØn doe
dobles enlaces olefinico3 do uno do los heterociclos
30 insaturados precedenteinente znencionados puedon estar
condeneados en cada caso con un anillo do fenilo,
en donde 105 grupos fenilo, piridinilo,
diazirtilo, furilo, tienilo, pirrolilo, 1,3-
oxazolilo, 1, 3-tiezolilo, isoxazolilo,
35 pirazolilo, l-’netilpirazolilo, imidazolilo o 1-

AI\

3

metilimidazolilo contenidos an R’, a3i como
hetarociclos condensados con benzo, tieno, pirido
y diazino pueden estar mono-, di- 0 tri-sustitui-
dos adicionalmente an el osquelato de carbonos
5 con Atcmos de flüor, cloro, bromo o yodo, con
grupos alqui].o, alcoxi, nitro, alquiltio,
alquilaulfinilo, alguilsuleonhlo, aiquilsulfonil-
an.tho, fenilo, difluorometilo, trifluorornetilo, alcoxicarbonilo, carboxi, hidroxi, amino,
10 alquilaxnino, disiquilamino, acetilo, acetilamirio,
propionilantino, am.tnocarbonilo, alquilaminocar-
boriilo, dialquilaminocarbonilo, (4-morfolinil)-
carbonilo, (1-pirro].idini].) carbonilo, (1-pipe-
ridini].) carbonilo, (hexahidro-1-azepini].) carboni-
15 lo, (4-meti].-1-piperazinil)carbonilo, metilendlo-
xi, aminocarbonilamino, alcanoilo, ciano,
difluorcinetoxi, trifluorometoxi, trifluorometil-
tio, trifluorometileulfinilo o trifluorometii.aul-
fonilo, pudiendo ser los sustituyentes igua].ee 0
20 diferente!,
R2 significa ci Ætomo de hidrógeno,
un grupo fenilmetilo o un grupo aiquilo C2..7, qua an poici6n
co puede ester sutituido con un grupo ciclohexilo, fenilo, piridinilo, diazinilo, hiciroxi, amino, aiquilainino,
25 diaJ.quilaxnino, carboxi, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, aininocarbonilainino, acetilamino, 1-pirrolidinilo, 1-

piperidinilo,4-(1-piperidinil)-].-piperidinilo, 4-morfo-
linilo, hexahidro-1H-1-azepinilo, (hi.- (2-hidroxietil) 3 -
amino, 4-alquil-1-piperazinilo o 4-(-hidroxi-alquil C2..7)-1-
30 piperazinilo,
un grupo fenilo o piridinilo,
on donde los radicales haterociclicos y grupos fenilo praceclentamente mencionados, pueden estar mono-, di- o tri-austituidos adicionalmente an al esqueleto cia
35 carborios con Ætonioa de flüor, cloro, bromo a yodo, con

4

grupos metilo, alcoxi, difluorometil.o, trifluoro-
metilo, hidroxi., amino, aiquil. C.3-amino, di-(alquii. Cj3)-amino, acetilamino, amninocarbonilo, ciano, metilsulfoniloxi, difluorometoxi, triflucrometoxi,
5 trifluorometiltio, trifluorometilsulfiril.lo, trifluo-rornetilsulfoni].o, amino-alquilo C1.., aiquil C1-3-amino-
aiquilo C3 a di-(alquil C1..3) -ain.ino-alquilo C..3 y los sustituyentes puederi ser iguales a diferentes,
R3 ci Ætomo de hidrdgeno o un grupo aiquilo C1-3,
10 eventt2almente sustituido con un grupo feni].o 0 piridinilo,
pudiendo estar unido ci grupo aiquilo CI-3 con Ufl grupo
aiquilo presente en R2 o con un anillo do fenllo a piridilo presente on R2, y el Ætomo do nitrógeno al quo
eetÆn unidos, con forniación do un anillo,
15 R2 y R1, junto con al Ætomo do nitrógeno incluido, un radical do la f6mula general

R5

A

/(CRR9)q

cR5R777 -- (CRaR1)r

(II)

20 en la que significan
el Ætomo de carbono 0, cuando R5 representa un par
do electrones libre, tambiØn el Ætomo de nitrôgeno,

q y r, cuarido yl reprasenta el Ætomo de carbono, los
nUmeros 0, 1 o 2, o
25 q y r, cuarido Y1 representa ci Ætozrto do nitrógeno, los riO.meros 1 a 2,
R4 e]. ªtoino do hidrógeno, un grupo amino, alquilamino,
cicloalquiiamino, dialquilamino, N- (cicloalquil) -aiquil-
amino, diciclociquilaMno, hidroxi, alguilo, cicloalquilo,
30 amino-alquilo C2..7, alquilainino-alquilo C2..7, dia 1quilaiino-
aiquilo C2..7, amino-im.inometilo, aiquil-carbonilo, al.quil-

i41

5

suifonilo, aiquiicarbonii.axnino, aiquilsu). fonilainino, N-
alquiicarbonil-N-alquilamir2o, N-alquilsulfonii-N-alquil-amino, axninocarbonll-amino, aiquil-arninocarbonhlantino, di-alquilam.inocarbonilainino, cicloalquiiazninocarboniiamino,
5 dicicioaiquiiam.tnocarbonilamino, fenil -aminocarboniiamlno,
aminocarbonilaiquilo, alquilantthocarboni].alquilo, dialquil-
arninocarbonilaiquilo, airiocarbonii-azitinoalquiio, aicoxicar-bonilo, alcoxicarbonil-aiquilo o carboxialquiio,
o tambiØn, cuando Y no represents el Ætomo de nitrbgeno,
10 significa el grupo carboxi, axninoxnetiio, alguilaininomatilo o
dialquiiaminometilo,
un grupo fanilo, fenil-alquiio C3, piridinilo, diôzinilo, 1-naftilo, 2-naftilo, piridinilcarbonilo o feriilcarbonilo, pueden estar mono-, di- o tri-sustituido
15 on ci esqueleto de carbonos con Atomos de fiAor, dora,
bromo a yodo, con grupos aiquilo, aicoxi, ruetilsulfonilaxi, difluoronietilo, trlfJ..uorometiio, lu.dxoxi, amino, acetilani-
no, eminocarborillo, aminocarbonilantino, amino-car-boniiamincmetiio, ciano, carboxi, alcoxicarbonilo, carboxi-
20 aiquilo, aicoxicarbonilalqui].o, aicanoilo, ca-(diaiquii-
amino) alcenoilo, - (diaiquilaxnino) aiquilo, c- (dialquiiaxni-
no)hidroxialquilo, c- (carboxi) aicanoilo, dif].uorometoxi,
trifluorometoxi, trifiuoroaietiitio, trifluorometiiauj.finilo
o trifluorometilsuifonilo, pudiendo ser los sustituyentes
25 igualea o diferentas,
un grupo azacicloaiquiio de 4 a 10 m.tembros, saturado o una
ovaries veces insaturado, un grupo oxaza, tiaza, diaza 0
triaza de 5 a 10 miembros, un grupo ezabiciclo- o diazabicicloaiquiio-alquiio de 6 a 10 miernbros, un grupo 1-
30 a1quii-4-piperidini1carboni10 o 4-aiquil- 1-piperazinil-
carbonilo, un grupo l-eiquil-4-piperidinilamino, 1-alquii-4-piperidinilantinocarbonilo o 1-aiquii-4-piperidinilaininosul-foniio,
estarido Los heterocicios rnonocicj.icos y biciclicos
35 precedentemente mencionados unidos a travØs cia tin

6

6tomo de riitrôgeno 0 un dtomo de carbono,
pudiendo ester reemplazado un grupo inetileno en los heterociclos moriocicuicos y biciclicos precedentemente mencionados por un grupo carbonilo o sulfonilo,
5 en los heterociclos moriocicJ.icos y bicic].icos
precedentemente mencionados, un grupo rnetiieno no
unido directamenite a un Ætozno de nitrógeno, oxigeno 0
azufre puede eater sustituido con uno o dos âtomos de
flüor,
10 103 heterocjclos iTtonQciCliCos y biciclicos preceden-
temerite mencionados, asi como ci grupo 1-alguii-4-piperidinilcarbonilo y 4-aiquil.-1-piperazirtilcarbonilo
pueden ester 3U3tituidos on ci anillo, una 0 varias
vecas, con un grupo aiquilo C, y/o
15 una vez con un grupo bencilo, alcanoilo,
dialquilamino, fenilcarbonilo, piridinil-carbonilo,
carboxi, carboxialcanoilo, carboxialguilo, aicoxicarbonilalquilo, alcoxicarbonilo, axninoca rbo-
nib, aiquilaminocarbonilo, aiquilsulfonilo, ciclo-
20 aiquilo o cicloalquiiaiquilo, con un grupo
cicloalquiicarbonilo, azaciclociquilcarbonilo, diaza-cicicaiquilcarbonilo u oxazacicloalquilcarboniil o, eventuaintente sustituido con aiguilo en el anillo,
abarcando isa partss al.iciclicas contenidas on
25 estos austituyantea 3 a 10 miexnbros del anillo y
las partes heteroalicIclicas en cada caso 4 a 10
. mieinbros del anillo y
Ice radicales fenilo y piridini].o contenidos on
Ion radicales pracedentemente mencionados pueden
30 eater a su v-az mono-, di- o tri-suatituidos con
Ætomoa de fiiior, dora, brouto o yodo, con grupos
abquilo, aicoxi, rnetiisulfoniiloxj, dif].uo-
rometilo, trifluorometibo, hidroxi, amino,
acetjlaxnino, aniinocarbonibo, axn.tniocarbonhiwnino,
35 sxuinocarbonjiaminoinetilo, ciano, carboxi, alcoxi-

7

carbonilo, carboxia].quilo, alcoxicarboniialquilo,
alcanoilo, @- (dialguileinino) elcanoilo, c- (carbo-xi)a].canoiio, diZluorometoxi, trifluoroznetoxi, trifluorontetiltio, trifiuoroinetil3ulfinhlo a
5 trifluorornetilaulfonilo, pudiendo ser los sustituyentee iguales a dierentes,
R5 un Ætomo de hidróg.no,
in radical alquilo pudiendo eatar austituido un radical
aiquilo no ramificado, en posicióri c, con un grupo fenij.o,
10 piridinilo, diaziniio, amino, alquiiamino, dia].quilamina, 1-pirro].idinilo, 1-piperidinilo, 4-metil-i-piperazinilo, 4-inorfolinilo o hexahidro-1R-1-azepinilo,
un grupo a].coxicarbonij.o, ci grupo ciano o aininocarbonilo a
taxnbiØrt, cuando Y represanta un Ætoxno de nitrdgeno, un par
15 de electroneB libre,
o, cuando Y1 no repreaenta un Ætoino de nitrógeno, tambiØn ci
Ætomo de flüor,
y R5 juntoa, cuando Y’ represents el &tomo de carbono, un anhlic cicloaiitÆtico de 4 a 7 miebroa, en ci qua uno a dos
20 grupos metilano pueden estar reernplazados por un grupo -NH--
o -N(aiquilo)- y uno o doe grupos inetileno adicionales pueden eatar raemplazadoa por grupos carbonilo,
pudiendo eater reemplazado un Ætonno de hidrógano urLido
a un Ætomo de nitrógeno dentro del grupo
25 precadentannente xnencionado par un radical protector,
RO y R’, qua pueden ser iguales a diferentas, on cede

casoun

Ætonno de hidrogeno, un grupo aiquilo 0 un
grupo diaiquiiamino o tanbiØn, cuando Y’ no representa
un Ætomo de nitrógeno, ci Ætonio do fior, y
30 y R’, qua pueden *or igualea o diferentes, en cede
caso un Ætomo de hidrbgano o un grupo aiquilo CI-3,
carboxi a alcoxi. CI-3-carbonilo,
en doricie todos lee grupos aiquilo y alcoxi precedentemente inencionados, ash conno los grupos aiquilo presantes dentro de
35 los otros radicales rnenicionados, si no cc indica de otro

6

8

modo, abarcan 1 a 7 Ætomos de carbono y pueden ser de cadana lineal o rarnificados, pudiando ester 8LlStitUidO cede grupo metileno con hasta 2 Ætomos de fiCior y pudiendo ester suetituido cede grupo metilo con haste 3 Ætomos do fiüor,
5 todos los grupos cicloalquilo precedentemente mencionados,
asi co los grupos cicioaiquilo presentas dentro de lo otros radicalea mencionado,, ci no se indica de otro modo, pueden abarcar 3 a 10 Ætomos de carbono, pudiendo ester sustituido cede grupo metileno con haste 2 &tomoa de fiüor,
10 todos los radicales aroznÆticoc y hetaroaroxnticos precedentemente nncionados pueden ester mono-, di- o tn-sustituidos adicionalinente con Ætomos de flüor, cloro a bromo, con grupos ciano o hidroxi, y los sustituyentes pueden ear iguales o diferentes,
15 por los radicales protectores mencionados an las definiciones qua antecedon y an lo qua sigue cc han de entender ba grupos protectorea habituales por la quirnica cia
los pØptidos, on particular
un grupo fenilaicoxicarbonilo con 1 a 3 Atomos de carbono an
20 la parte cia alcoxi, eventualmente suatituido an el rulcleo dc
fenilo con un Atomo de halógeno, con un grupo nitro 0 fenilo, con uno o dos grupos metoxi,
par ejampbo al grupo benciloxicarbonibo, 2-nitro-benciloxicarboni.io, 4-nitro-benciboxicarboni bo, 4-
2$ metoxi-’benciloxicarbonilo, 2-cioro-banciboxicarbonilo, 3-cloro-benciloxicarbonilo, 4 -cloro-bonciloxicarbo-
nib, 4-bifeniiii-a,a-dimetiibanciboxicarbonilo o 3,5-dimetoxi-a, cx-dim.tilbenciboxicarbonilo,
un grupo alcoxicarbonilo con on total 1 a 5 Ætomos dc
30 carbano on be parte de aiquilo,
POT ejenpbo al grupo metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicerbonilo, n-butoxi-carbonibo, l-znetilpropoxicarbonibo, 2-metiipropoxicar-
bonilo o terc. -butiloxicarbonibo,
35 al grupo aliloxicarbonilo, 2,2,2-tricloro-(l,1-djmetjl-

9

etoxi)carbonilo o 9-fluorenilmetoxicarbonilo o
el grupo formilo, acotilo a trifluoroacetilo.
Un.Æ seguncta forzna de realizacibn la presente inven-
ción consiste en los compuestos la formula general (I)
5 anterior, on 103 que
A, U, V, W, X, R2 y R3 etÆn dafinidos coino se ha inencionado precedenteniente on la priznera forma de realizaciOn,
R’ significa un heterociclo aa, diaza, triaza o tiaza de 5
a 7 mienibros, saturado o irisaturado una o dos vecea,
10 e5tando los heterociclos precedentemente mencionados
enlazados a travØs de un Ætoino de carbono o nitrogeno, conteniendo i.ino o dos grupos carbonilo contiguos a un
Atomo de nitrOgano,
pudiendo eater sustituidoa en un Ætomo de nitrôqeno
15 con un grupo fenilo, piridinilo, diazinilo, tienilo,
pirrolilo, 1,3-tiazolilo, isoxazolilo, pirazolilo a - metilpirazolilo, y
pudiendo ester condansado un dob].e enlace olefinico de
uno de los heterociclos insaturados pracedentamente
20 mencionados con un anillo de fenilo, naftilo,
piridiria, diazina, tienilo 0 quinolina, o con un
anillo de 1H-quiriolin-2-ona, eventualmante sustituido
an ci Ætomo cia riitrOgeno con un grupo metilo,
en donde los grupos fenilo, piridinilo,
25 diazinila, tienilo, pirrolilo, 1,3-tiazolilo,
isoxazolilo, pirezolilo a 1-metilpirazolilo,
. contenidos on R’, asi como los heterociclos
condensados con benzo, pirido y diazino pueden
astar mono-, di- o tri-sustituidos adicic,nalmente
30 en a) esqueleto de carborios con Ætomos de flor,
cloro, bramo o yodo, con grupes aiquilo, alcoxi,
nitro, difluorometilo, trifluorometilo, hidroxi,
amino, aiquilamino, dialquilamino, acetilamino,
acetilo, ciano, difluorometoxi o trifluorometoxi,
35 pudiendo ser lox austitiiyentes iguales 0

47

E!tructura Nontbre

f() -I(4-amino-3, 5-bi5-
trifluorometil-boncil) -2-
[4- (1-metil-piperidin-4-

(118) ii) -piperazin-1-ilJ -2-oxo-

etil}-amida de Æcidc 4-(2-
oxo-1, 2,4, 5-tetrahidro-

1, 3-banzodiazepin-3-il) - piperidin-1-carboxilico
(.R)-1-(4-amino-3,5-bio-
trifluoroinetjl-bencil) -2-
1, 4 ’ -bipiporidini].-1 I-il-

(119) 2-oxo-etil]-amida do Æcido

4-(2-oxo-1, 2,4, 5-tetrahi-
dro-1, 3-benzodiazepin-3-
___________________ ii) -piperidiri-1-carboxi-
______ lico
[(R) -1- (4 -amino-3, 5-bia-
trifluorontetjl-bencil)-2-
oxo-2-(4-piperazin-1-il-

(120)RIG
piperidin-1-il) -etil] - amida do Æcido 4-(2-oxo-
1,2,4, 5-tetrahidro-1, 3-

benzodiazepin-3-il) - ip.ridin-1-carboxi1ico
Eater (R) -(4-amino -3-
cloro-5-trifluoroxnetil-

bencil) -2- (4- (4-metil-
piperazin-1-il) -piperidin-
(121) 1-il]-2-oxo-atilico do

Æcido 4-(2-oxo-1,2,4,5- ___________________ tetrahidro-1, 3-benzodiaze-
pin-3-il) -piperidin-1- ______ carbox
(2-[1, 4’]bipiperidinil-1 ’-

il-i-(4-bromo-3-metil- bencil) -2-oxo-etil]-amida

(122) de Æcido 4-(2-oxo-1,4-

dihidro-2H--quinazolin- 3 - ii) -piparicttri-1-carboxi- _______ iiCo

[1-(4-bromo-3-meti].-
bencil) -2-(l ’-motil-
[4,4 ’]bipiperidinil-1-il)
(123) 2-oxo-eti1]--mida de Æcido
4- (2-oxo-1, 4-dihidro-2H-

quinazolin-3-il) -piperi- ______ din-1-carboxilico

91

an is qua R’ estÆ definido como as ha inencionado aJ. coinienzo.
5 La reacción so lieva a cabo bao condiciones do Schot-ten-Baumanri a coridicionea de Einhorn, as decir 10m coxnponen-
tea se hacen reaccionar on preericia de al menoa Un equiva-lente de una base auxiliar a tetperaturaa entre -501C y +1201C, preferibieinente -10IC y +301C, y eventualiiente an
10 preaencia de disol.ventea. Como bases auxiliares entran preferiblemente an conidaraci6n hidróxidos do metales aicalinos y de metales aicalinotØrreos, per ejemplo hidrdxido de sodia, hidróxido de potasio a hidróxido do bario carbonaton do metal.a alcalirtos, POE ejemplo
15 carbonato do sodio, carbonato cia potasio 0 carbonato de casio, acetatos de metales aicalinos, POE ejemplo acetato de sodio a potasio, asi como aminas terciarias, par ejemplo piridina, 2,4, 6-trimetilpiridina, quiriolina, trieti).aiuina, N-etil-diisopro-pilamina, N-atil-diciciohexilam.ina, 1,4 -di-
20 azabicicio[2,2,21octano a 1,8-diazabiciclo[5,4,0]-uridec-7-
eno, coma disoiventes entran en conaideración, por ejemplo,
dicloronietsrio, tetrahidroZurano, 1, 4-dioxano, acetonitrilo,
dimetilforznamida, diinetilacetamida, N-metiipirroiidona o
xnezcias de lam mismos; si Como bases auxiliarea!e utilizan
25 hidróxidos do metales alcalinos a de metales

I slcalinotØrreo, carbonates o acetatos cia metales aicalinos,

a is mazda de reacciôn tambiØn as is puecie afladir aqua coma
co-disolvente.

30 Pars la preparaci6n do compuestos de la formula general
(I), an is qua todos lam radicalea 3tÆri definidos como se
rnencioria al comienzo;
acop].azniento un Acido carboxiiico de is formula general

92

en la que todos los radicalas eat&n definidos comb so mericiona al comienzo, con una axnina de is fôrmula general
5 }INR2R3, on 1.5 qua R2 y R3 eatÆn definidos coztio as mnenciona al
ccmnienzo, con La coridiciôn de qua estos grupos no contengan niriquna furición Æcido carboxilico J.ibre y/o ninguna otra Sfunciôn amino alifÆtica, primaria a secundaria].ibre.
El ecoplani.tento se ileva a cebo preferiblemnente con ci
10 aznpleo de procedimientos conocidos pox is Quimica de los
PØptidos (vØase, par ejeznplo, Houben-Weyl, Methodan der Organiechen Chemnie, tomo 15/2), empleÆndose, por ejemplo, carbodiimnidas tales como, por ejamplo, diciclohaxilcarbodil-mide (DCC), diisopropilcarbodiimida (DIC) o etil-(3-
15 dimetilaittnopropil)-carbodiimida, hexafluorofoafato de 0-(lH-banzotriazol-1-ii)-N,N-’,N’-tetrsmetiluronio (HBTI.J) a tetrafluoroborato de 0-(1H-benzotriazol-1-il)-N,N-N’,N’- tetrametiluronlo (tBTU) o hexafluorofoafato de 1H-benzotriazol-1-il-oxi-tris- (dimetilamino) -fosfonio (50?).
20 Mediante is adici.6n de l-hidroxibenzotriazol (HOSt) o cIa 3-
?iidroxi-4-oxo-3, 4-dihidro-]., 2, 3-benzotriazina (I100bt) Se puede elevar is velocidad do reaccióri. Los acopiamieritos se ilevan a cabo normnalmenta con proporciones a equimnolares de
los componentes cIa acopi.amiento esi coma del rectivo de
25 acoplamniento en disolventes tales coma dicioromnetano, tetrahiclrofurano, acetonitrilo, diinetilformam.tda (DMF), dintetilacetamnida (DMA), N-metilpirroiidona (NM?) o mezclas a base de Østos y a temnperaturas entre -30 y 1-301C,

93

preferiblemente entre -20 y +251C. En Is medida an qua sea necesario, conto base auxiliar adicional se prefiere N-etil-diisopropilani.tna (DXEA) (base de Rtthig).
Como otro pracedizn.iento de acoplamiento para la
5 sintesis de cornpuestos de la fÆznu.ila general (I) se emplea
el denominado "procedimj.ento del anhidrido" (vØasa tambiØn:
N. Bodanszky, "Peptide Chemistry", editorial Springer 1988, 58-59; M. Bodanszky, "Principle! of Peptide
Synthesis", editorial Springer 1984, p.Ægs. 21-27).
10 Preferib].emente, e]. "procedim.tento del anhidrido mixto" sa
emplea on la veriante segirn Vaughan (J.R. Vaughan Jr., J. Amer. Chem. Soc. 73, 3547 (1951)),, on Is que, con empieo de Cater isobutilico de Ccido c].orocarbónico y an presencia de bases tales coino 4-metilmorfolina o 4-etilmorfolina as
15 obtiena.1 anhidrido mixto a partir del Coido carboxilico de
la fOrmula general (VIII) a acoplar y del Cater monoisobutilico de Æcido carbOnico. La preparaciOn de este anhidrido mixto y ci acoplamiento con las aminas de la fOrmula general 11NR2R3 se efectia en un procedlzniento an un
20 solo recipients con empieo de los disoiventes precedentemente mencionadoc y a teznperaturas entre -201C y +251C, preferiblemente entre OIC y +251C.

(e) Pare is preparaciOn de compuestos de la fOrmula general.
25 (I), an Is quo R1 estC coino cc ha mencionado al camienzo,
con la condiciOri de quo no estC contenida ninguna furiciOn
. amino primaria o secundaria libre
acoplamiento de un conipuesto de la fOrmula general.

94

(IX)

an la qua todos los radicales estÆn deinidos coma as znenciona al comi.enzo y Nu significa un grupo LÆbil, par
5 ejamplo tin Ætomo do halógeno tal coma ci Ætomo de cloro,
bromo o yodo, un grupo aiquilsulfoniloxi con 1 a 10 Ætomos
de carbono an la parts de alquilo, un grupo fenilsulfoniloxi eventualmente mono-, di- o tn-
austituido con Atoinos de cloro o braino, con grupos metilo o
10 nitro, pudiendo ser los sustituyentes iguales o diferentes,
un grupo 1R-imidazol-1-ilo, un grupo 1H-pirazol-1--ilo, evantualmente suatituido con uno o dos grupos metilo an el esqueleto do carbono, un grupo 1H-1,2,4-tniazol-i-ilo, 1H-1,2,3-tniazoi-1-ilo, 1H-1,2,34-tatrazol-1-ilo, un grupo
15 vinilo, propargilo, p-nitrofenilo, 2,4-dinitrofenilo,
tniclorofanilo, pantac].orofenilo, pentafluorofenilo,
piranilo o piridixiilo, tin grupo dirnetilaminiloxi, 2(1H)- oxopinidin-l.-il-oxi, 2,5-dioxopirrolidin-1-iloxi, ftaliml-
diloxi, 1E-benzo-tniazol-1-iloxi o azida,
. 20 con una amine de la fôrmula general HNR2R3 an la qua R2 y R3
etÆn definidos coma as menciona al cornienzo, con la conidi-
ción do qua no eaten conteniidas ninguna funciôn Æcido
carboxi].ico libra y/o ninguna otra función amino alifÆtica,
pnimaria o secundaria libre.
25 La reacción as ileva a cabo baja condicionas do Schot-
ten-Bawnann a condiciones do Einhorn, as decir los componen-
tea as hcen raaccionar on presencia do al menos tin equiva-lente do una base auxiliar a temperatures entre -501C y

360

sue enanti&eros, sue diaetereoisóxneros y sue sales.
10.- Sales isiol6gicaxnente compatibles do 105 compuastos segin al menos una do las reivindicaciones 1 a 9 con Æcidos a bases inorgÆnicos u orgÆnicas.
5 11.- Medicainerito, quo coritiene tin compuesto segin al
menos uris do las reivindicaciones 1 a 9 a una sal fisiológi-cainente compatible oeqin is reiviridicación 10, eventualmente junto a una 0 varias suatancias do soporte y/o agentes diiuyentes thertos *
1.0 1.2.- Empleo do un compuesto segn al menos tins do las
reivindicaciones 1 a 10, pars is preparación do un medicamento para ci tratamiento agudo y profi].Æctico do dolores do cabeza, en especial migrafa o dolor do cabeza per acumulación, cefalea y dolor do cabeza crónico.
1.5 13.- Ezup3.eQ do tin compuesto segdn al menos uris de las
reivindicaciones 1 a 10, pars la preparacion de tin medicamento pars ci tratamiento profiiÆctico do dolor do cabeza per migrafta duranta ci fenóuieno de prddrorno o pars el tratamiento agudo y profilÆctico do dolor do cabeza por
20 ntigrafia quo se maniflasta antes a durarite is mertstruación.
14.- Empleo do tin compuesto seg1n al menos tins do las
reivindicaciones 1 a 10, pars Is prepsrsción do un
medicamento pars ci tratamiento do diabetes mallitus no
dependianta do insuuina ("NIDDM").
25 15.- Empiso do tin compuesto segin el menos una do las
reivindicaciones 1 a 10, pars is preparaciOn do tin

S medicamento pars ci tratamiento do enfermedades

cardiovasculares, do tolerancia a la rnorfina, de
erifarmedados diarrei.cas condicioriadas por toxins do
30 Clostridium, do enfermedades de is piel, an particular do
lesionea tØrmicas y condicioriadas per radiaciones, incluidas
las quainadurss soisres, do onferatedades infismatorias tales
come, on particular, anfermedades infiamatorias do las articulaciortas tal come artritis, do inflaxnacionee
35 neurógenas do is mucosa oral, do erifermedades inflamatorias

361

do Los pulmones, de rthitis elrgica, de asctia, do enfermedadas quo van acompefladas do un ensanchamiento excesivo do los vasos y cia tine irrigaci6n sanguinea do ice tejidos disminuida condiciontada por 10 anterior tel coma,
5 an particular, choque a sepsis o anrojeciznientoe de is piel,
pars is mitigaciórt de eatados de dolor an general, en particular on al caso do dolores neuropAticos, an astados de dolor neuropAticos an el ntarco do enferinadades neurotóxicas sistØmicas, sat corno on el caso de astdos do dolor qua han
10 do atribuiree a procesos inflamatorios o pare influir terepØuticaxnente de forms preventiva o aguda sobre is sintomatologia do sofocos an muj ores deficientes en estroge-
floe menopÆuaicas y provocadas por un erisanichaxniento de los V&303 y tin fluja aanguineo incrannentedo, ai coma de
15 paciantes do carcinoma de is prôetata tratados con hormonas.
16.- E’rocedimiento pars la praparâción cia tin medicamento aegün is reivindicscidn 11, caracterizado porque, per via no quimica, tin compueeto segdn al menos uris
do lee reivinidcacionem 1 a 10 so incorpora an uris a varias
20 eustanciss do soporte y/o egontes diluy.rites inertes.
17.- Procedimienta pars is preparación cia coluptiestos
do is formula general I segn las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque

25 (a) pars is praparaciOn de coinpuestos do la fOrmula general
CX), an la quo X significa ci Ætomo do oxigeno o ci grupo NH
y a R3 estÆn definidos coma an is reivindicación 1, con
is coridiciOn do quo estos grupos no contengan ninguna funciOn Æcido carboxilico libre:
30 reacción de piperidinas do is fOrmula general

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES
2020
Bogota, D.C.

Abogado
EMILIO FERRERO

AS UNTO

Patente de lnvenciÆn

Via Nacional

Via POT (fase nacional)

Radicación 06-98640
TrÆmite 011
Evento 379
Actuaciôn 411
Oficio
Folios 025

No. Sol, Internacional
Fecha de PresentaciOn Internal

Pafente de Modelo de Utilidad 1-1

Cap.lEK Cap. II 1-1
PCT/EP2005/003094
23-03-2005

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artIculo 45 de la DecisiOn 486 de la Cornisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

DescripciOn:
Reivind icaciones:
Prioridad:

2. Objeto de la invención

Titulo de la solicitud:
PROCEDIMIENTO PARA

MEDICAMENTO (folio 1).

Folios 327-548 como se radicó inicialmente
Folios 549-586 como se radicó inicialmente
Folio 1 DE, 102004015723.5, 29-03-2004

ANTAGONISTAS DE CGRP SELECCIONADOS,
SU PREPARACION AS! COMO SU USO COMO

El problema tØcnico planteado en la solicitud estÆ relacionadocon la necesidad de obtener nuevos compuestos antagonistas de CGRP, que sean ütiles en el tratamiento de dolores agudos de cabeza, particularmente migraæao cefaleas (folios 327, 461; pÆg. 1, 135).

Para solucionar este problema tØcnico la solicitud en estudio proporciona en:

Reivindicaciones 1-20: antagonistas de CGRP de la formula general (I) sus isómeros, diastereisómeros, sus enantiOmeros, sus hidratos, sus mezelas y sus sales, asi como hidratos de las sales, en particular sus sales fisiolOgicamente compatibles con Æcidos bases inorgÆnicos u orgÆnicos.

Exp 2006 98640

11

D

\X

R3
R10

(I)

Reivindicaciones 21: medicamento que contiene un compuesto de formula I eventualmente con una a varias sustancias de soporte y/o agentes diluyentes.

Reivindicación 22: usa de un compuesto.

Reivindicaciôn 23: procedimiento para la preparaciôn de un medicamento.

Reivindicación 24: procedimiento para la preparación de un compuesto de formula (I)

Clasificación Internacional de Patentes (IPC): A611<31/551, C07D401/04, A61 P25/06.

3. De la solicitud de Patente

3.1 Reivindicaciones (artIculo 300 486)

Se solicita en las reivindicaciones 1-20, antagonistas de CGRP de la formula general (1) con radicales R1, R2, R3 y variables A, X, D, G, M, Q yE; sus isómeros, diastereoisómeros, sus enantiómeros, sus hidratos, sus mezclas y sus sales, asI coma hidratos de las sales, en particular sus sales fisiolOgicamente compatibles con 6cidos a bases inorgÆnicos u organicos. Pero,con elfin que la materia tenga claridad y sustento es necesario:

0 Cambiar la expresiOn "Antagonistas CGRP de formula general (I)" por Un
compuesto de formula general (I)".

Elimiriar los tØrminos "hidratos" e "hidratos de sus sales", puesto que no existe

401 soporte de ninguno.

0 Cambiar la frase sus sales biolOgicamente compatibles con Æcidos a bases" por
’sus sales de ÆcidosO bases, biológicamente compatibles".

0 La materia reclamada tiene un amplio alcance dada por las extensas y variadas
definiciones de los radicales Ri, R2, R3 y por las diversas variables A, X, D, G,
M, Q y E; por tanto, con elfin de que la materia reclamada bajo la formula I cumpla con el req ulsito de soporte, es necesario que Østa sea una generalizaciOn razonable de los compuestos ejemplificados y que de forma evidente presenten la actividad seæalada, puesto que revisando los compuestos ejemplificados se
encuentra:

X:O
A:O

El anillo /E’: es fenilo sustituida en G, M Q par uno a tres sustituyentes seleccionados de Br, Cl, OH, -CH3, -NH2 -CF3

Exp 2006 98640

S

S

CI704- R1: 2-oxo-1,2,4,5-tetrahidro-1,3-benzodiazepin-3-ilo

N(R2)R3: forman anillos de piperazinilo 6 piperidinilo sustituidos par piperidilo, piperazinilo, cicloalquiloC5-7, morfolinilo 6 pirrolidinilo,

En consecuencia, es preciso que el solicitante defina la materia reivindicada baja la fOrmula I, mediante una generalizaciOn razonable de los sustituyentes en cada radical de manera coherente y acorde con los camp uestos que evidencian tener la actividad antaganista de CGRP, ten ienda en cuenta las abservacianes aruba seæaladas,de forma que permita reconocer que la materia reclamada es la que resuelve el problema tØcnico planteado; teniendo en cuenta de realizar los correspond ientes cambios en las demÆs reivindicaciones de acuerdo con la delimitaciôn que se realice en la reivindicaciOn 1

En la reivindicaciOn 21 cambiar la palabra medicamento par camposición farmacØutica.

Par Jo anterior, el capitulo reivindicatario no cumple con el requisito de tener claridad, concisiOn y sustento de acuerdo con las exigencias del articulo 30 de la DecisiOn 486.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artIculos 14 y 2 D 486)

De acuerdo con el artIculo anterior, la reivindicaciones 22 relacionada con el uso de un compuesto, no se considera objeto de protecciOn porque el uso no es un producto a un procedimiento tecnológico; por tanto, es necesario eliminarla del alcance de la I nvendOn.

5. Determinación del Estado de la TØcnica

ConsIderando que la fecha de presentaciOn de la primera solicitud de patente de la que se reivindica prioridad es 25-03-2004, se buscaron documentos del estado de la tØcnica relacionados.

No Documento Iltulo Fecha 1 Antagonistas de CGRP elegidos,
Dl C005-50511 procedimiento para su preparación, asi 25102002 como SU empleo como medicamentos. Fecha de prioridad

Dl en folios 642660.

Dl hace referencia a antagonistas de CGRP de formula general (I) SUS tautómeros, diastereisOmeros, enantiómeros, y sus sales de ªcidos y bases fisiológicamente compatibles; sus medicamentos, Su empleo y sus procedimientos de preparación (folio 644; resumen).

Exp 2006 98640

6. AnØlisis de patentabilidad (articulo 14 D486)

6.1. Novedad (articulo 16 D486)

Se solicita en las reivindicaciones 1-20, antagonistas de CGRP de la formula general (I), sus isómeros, diastereisÆmeros, sus enantiómeros, sus hidratos, sus mezclas y sus sales y en la 21 una composición farmacØutica que comprende uno de tales compuestos.

Al comparar la materia solicitada con el estado de la tØcnica se encuentra:

Dl

antagonistas de CGRP de la formula antagonistas de CGRP de la formula general (I)
general (I) (folio 645; pÆg. 1)

0

Con radicales R1, R2, R3y variables A,
X, D, C, M, Q y E de acuerdo al
capitulo reivindicatorlo.

R1: igual a R1 de la solicitud (folios 646-647; pÆg. 2-3)
R2: igual a R2 de la solicitud (folios 647-648; pàg. 3-4)
R3: igual a R3 de la solicitud (folios 649-653; pg. 4-9)
U: alquiloCi.6, alqueniloCi alquiniloC1.6 opc. sustituidos por F
(folios 645, $g. 1)
V: halOqeno, NH2, NHCH3, OH (folios 646, pÆg.2)
W: H, halógenos, -C F3, -CHF2 (folios 646, pg. 2)

Que Dl ya divulga antagonistas de CGRP de la formula general (I) tal como se senala arriba en el cuadro comparativo y composiciones farmacØuticas que los contienen, encontrando asI, que la materia reclamada (compuestos y medicamentos que los contienen) no cumplen el requisito de novedad.

Se solicita en la reivindicaciÆn23, un procedimiento para la preparación de un medicamento que contiene un compuesto de formula (I), caracterizado porque un compuesto de formula (I) se incorpora en una o varias sustancias de soporte yb diluyentes inertes.

Dl ya divulga un mØtodo para prepara un medicamento de formula (I), caracterizado porque un compuesto de formula (I) se incorpora en una o varias sustancias de soporte y/o diluyentes inertes (folios 659; pÆg. 360); por ende, el procedimiento reclamado no cumple el requisito de novedad.

Se solicita en la reivindicaciôn 24 los siguientes procedimientos para la
preparación de un compuesto de formula (I):

Acoplar un acido carboxIlico de formula (V) con una amina de formula HNR2R3

. 5-

,

+

HNR2R3

(V)

Exp 2006 98640

O acoplar un compuesto de formula (VII) con una amina de formula HNR2R3

&xNu + HNR2R3

(VII) -

- (IL

Se encuentra que Dl divulga los siguientes procedimientos para obtener un compuesto de formula (I):

o Acoplar un acido carboxilico de formula (VII) con una amina do formula HNR2R3 (folios 655-656; pÆg. 91-92).

vw

HNR2R3 JNXIN R3 (VHI) R1 ’

o acoplar un compuesto de formula (VII) con una amina de formula HNR2R3 (folios 657-658; pÆg.9394).

G-.

VV

2

+HNR2R3

Por tanto, dado que Dl ya divulga los procedimientos reclamados, Østos no cumplen el requisito de novedad.

10 7. ConclusiOn

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

[No

Reivindicaciones -J - Documento N° Jectadas Requisito que Afecta
Dl C005-50511 1-21 y23-24 Novedad

En cumplimiento del artIculo 45 de la Decision 486 de la Comisiôn de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del tØrmino de sesenta Was contados a partir de la fecha do notificaciOn de la presente comunicaciOn. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegarÆ lapatente.

Exp 2006 98640

S

(’66
Notifiquese el preserite oficio conforme a Ia dispuesto en el articulo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001 advirtiendo que contra
Øl no procede recurso alguno en la via gubernativa.

SAL AR L60PEZ
Director de Nuevas Creaciones (E)

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

CONCEPTO TECNICO
No. 4576

Exp 2006 98640

EXAMINADOR TECNICO
Côdicio No. 202079