

103
~~103~~

BOGOTA - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-077621.-00002-0000

Fecha: 2008-05-13 16:22:15 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 2

Re: P1.-GLAXO GROUP LIMITED.-Solicitud de Patente de Invención en
Fase Nacional PCT "SALES DE CINNAMATO DE UN AGONISTA
BETA-2 ADRENÉRGICO".-Clase C07D 215/26; A61K 31/4704.-
Expediente número 07-077.621.-

1. Me refiero a mi memorial de 20 de Septiembre de 2007.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número 582 de 30 de Noviembre de 2007, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. Me permito recordar a usted, que tal como se informó en el Petitorio de la invención, la presente solicitud corresponde a Capítulo I.
4. Anexo me permito acompañar recibo número 08-37.145, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa.

Señor Superintendente,

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 37,143
FECHA : MAYO 12 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 07-077621-00002-0000

Fecha: 2008-05-13 16:22:15 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYI Eje: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 2

CONSIGNACION

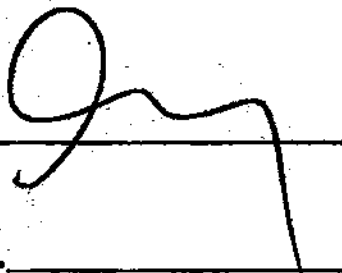
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Gr. PAGO
EDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2756073	12/05/2008	9,293,000.00

CONCEPTO

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 30003-01-01 SOLICITUDES	05 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	420,000.00
	TOTAL :	420,000.00

SOM: CUATROCIENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 07-77621

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 552 DE

FECHA 30 DE NOVIEMBRE DE 2007 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

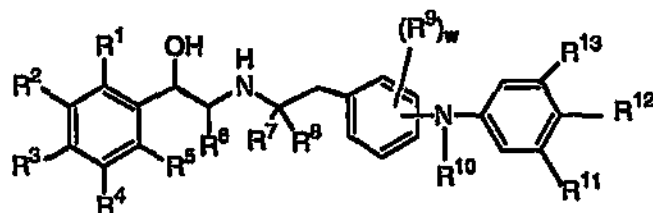
LEY EXPIRA EL 27 DE FEBRERO DE 2008

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, 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



(I)

wherein:

each of R^1 - R^5 is independently selected from the group consisting of hydrogen,
5 alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl, heterocyclyl, and R^a ;

or R^1 and R^2 , R^2 and R^3 , R^3 and R^4 , or R^4 and R^5 are joined together to form a
group selected from the group consisting of $-C(R^d)=C(R^d)C(=O)NR^d$ -,
 $-CR^dR^d-CR^dR^d-C(=O)NR^d$ -, $-NR^dC(=O)C(R^d)=C(R^d)-$, $-NR^dC(=O)CR^dR^d-CR^dR^d$ -,
 $-NR^dC(=O)S$ -, $-SC(=O)NR^d$ -, $-(CR^dR^d)_p$ -, $-S(CR^dR^d)_q$ -, $-(CR^dR^d)_rS$ -, $-S(CR^dR^d)_rO$ -,
10 $-O(CR^dR^d)_sS$ -, and $-NHC(R^j)=C(R^k)-$;

R^6 is hydrogen, alkyl, or alkoxy;

R^7 is hydrogen or alkyl;

R^8 is hydrogen or alkyl; or R^8 together with R^9 is $-CH_2-$ or $-CH_2CH_2-$;

R^9 is independently selected from the group consisting of alkyl, alkenyl, alkynyl,
15 aryl, heteroaryl, cycloalkyl, heterocyclyl, and R^a , or R^9 together with R^8 is $-CH_2-$ or
 $-CH_2CH_2-$;

R^{10} is hydrogen or alkyl;

each R^{11} , R^{12} , and R^{13} is independently selected from the group consisting of
hydrogen, alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, heterocyclyl, $-NO_2$, halo,
20 $-NR^dR^e$, $-C(=O)R^d$, $-CO_2R^d$, $-OC(=O)R^d$, $-CN$, $-C(=O)NR^dR^e$, $-NR^dC(=O)R^e$,
 $-OC(=O)NR^dR^e$, $-NR^dC(=O)OR^e$, $-NR^dC(=O)NR^dR^e$, $-OR^d$, $-S(O)_mR^d$, $-NR^d-NR^d-C(=O)R^d$,
 $-NR^d-N=CR^dR^e$, $-N(NR^dR^e)R^d$, and $-S(O)_2NR^dR^e$;

or R^{11} and R^{12} together with the atoms to which they are attached form a fused
benzo ring, which benzo ring can optionally be substituted with 1, 2, 3, or 4 R^e ;

25 or R^{11} and R^{12} together with the atoms to which they are attached form a
heterocyclic ring;

wherein for R^1 - R^6 , R^9 , and R^{11} - R^{13} , each alkyl, alkenyl, and alkynyl is optionally
substituted with R^a , or with one or more (e.g. 1, 2, 3, or 4) substituents independently
selected from R^b ; for R^1 - R^6 , R^9 , and R^{11} - R^{13} , each aryl and heteroaryl is optionally

108
108

substituted with 1, 2, 3, or 4 substituents independently selected from R^d , and for R^1 - R^d , R^9 , and R^{11} - R^{13} each cycloalkyl and heterocyclic ring is optionally substituted with 1, 2, 3, or 4 substituents independently selected from R^b and R^e ;

each R^a is independently $-OR^d$, $-NO_2$, halo, $-S(O)_nR^d$, $-S(O)_nOR^d$, $-S(O)_nNR^dR^e$,
 5 $-NR^dR^e$, $-O(CR^dR^e)_nNR^dR^e$, $-C(=O)R^d$, $-CO_2R^d$, $-CO_2(CR^dR^e)_nCONR^dR^e$, $-OC(=O)R^d$, $-CN$,
 $-C(=O)NR^dR^e$, $-NR^dC(=O)R^e$, $-OC(=O)NR^dR^e$, $-NR^dC(=O)OR^e$, $-NR^dC(=O)NR^eR^f$,
 $-CR^d(=N-OR^e)$, $-CF_3$, or $-OCF_3$;

each R^b is independently R^a , oxo, or $=N-OR^e$;

each R^e is independently R^a , alkyl, alkenyl, or alkynyl; wherein each alkyl, alkenyl
 10 and alkynyl is optionally substituted with 1, 2, 3, or 4 substituents independently selected from R^b ;

each R^d and R^e is independently hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl, or heterocyclyl; wherein each alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl and heterocyclyl is optionally substituted with one or more (e.g. 1, 2, 3, or 4)
 15 substituents independently selected from R^b ; or R^d and R^e together with the atoms to which they are attached form a heterocyclic ring having from 5 to 7 ring atoms, wherein the heterocyclic ring optionally contains 1 or 2 additional heteroatoms independently selected from oxygen, sulfur and nitrogen;

each R^f and R^g is independently hydrogen, alkyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl, or
 20 heterocyclyl; wherein each alkyl, aryl, heteroaryl, cycloalkyl and heterocyclyl is optionally substituted with 1, 2, 3, or 4 substituents independently selected from R^b ; or R^f and R^g together with the carbon atom to which they are attached form a ring having from 5 to 7 ring atoms, wherein the ring optionally contains 1 or 2 heteroatoms independently selected from oxygen, sulfur and nitrogen;

25 each R^h is independently halo, C_{1-3} alkyl, C_{1-3} alkoxy, $-S-C_{1-3}$ alkyl, aryl, (aryl)- C_{1-3} alkyl, (aryl)- C_{1-3} alkoxy, heteroaryl, (heteroaryl)- C_{1-3} alkyl, (heteroaryl)- C_{1-3} alkoxy, hydroxy, amino, $-NHC_{1-3}$ alkyl, $-N(C_{1-3}alkyl)_2$, $-OC(=O)C_{1-3}alkyl$, $-C(=O)C_{1-3}alkyl$, $-C(=O)OC_{1-3}alkyl$, $-NHC(=O)C_{1-3}alkyl$, $-C(=O)NHC_{1-3}alkyl$, carboxy, nitro, $-CN$, or $-CF_3$;

30 R^j and R^k together with the carbon atoms to which they are attached form a phenyl ring that is optionally substituted with 1, 2, 3, or 4 R^e ;

each R^n is independently aryl, heteroaryl, cycloalkyl or heterocyclyl; wherein each aryl or heteroaryl is optionally substituted with 1, 2, 3, or 4 substituents selected from the

109
TST

The phrase "disease or condition associated with β_2 adrenergic receptor activity" includes all disease states and/or conditions that are acknowledged now, or that are found in the future, to be associated with β_2 adrenergic receptor activity. Such disease states include, but are not limited to, bronchoconstrictive or pulmonary diseases, such as asthma and chronic obstructive pulmonary disease (including chronic bronchitis and emphysema), as well as neurological disorders and cardiac disorders. β_2 Adrenergic receptor activity is also known to be associated with pre-term labor (see, for example, U.S. Patent No. 5,872,126) and some types of inflammation (see, for example, WO 99/30703 and U.S. Patent No. 5,290,815).

10 The term "pharmaceutically-acceptable salt" refers to a salt prepared from a base or acid which is acceptable for administration to a patient, such as a mammal. Such salts can be derived from pharmaceutically-acceptable inorganic or organic bases and from pharmaceutically-acceptable inorganic or organic acids.

Salts derived from pharmaceutically-acceptable acids include acetic, 15 benzenesulfonic, benzoic, camphosulfonic, citric, ethanesulfonic, fumaric, gluconic, glutamic, hydrobromic, hydrochloric, lactic, maleic, malic, mandelic, methanesulfonic, mucic, nitric, pantothenic, phosphoric, succinic, sulfuric, tartaric, *p*-toluenesulfonic, xinafoic (1-hydroxy-2-naphthoic acid) and the like. Particularly preferred are salts derived from fumaric, hydrobromic, hydrochloric, acetic, sulfuric, phosphoric, 20 methanesulfonic, *p*-toluenesulfonic, xinafoic, tartaric, citric, malic, maleic, succinic, and benzoic acids.

Salts derived from pharmaceutically-acceptable inorganic bases include aluminum, ammonium, calcium, copper, ferric, ferrous, lithium, magnesium, manganic, manganous, potassium, sodium, zinc and the like. Particularly preferred are ammonium, 25 calcium, magnesium, potassium and sodium salts. Salts derived from pharmaceutically-acceptable organic bases include salts of primary, secondary and tertiary amines, including substituted amines, cyclic amines, naturally-occurring amines and the like, such as arginine, betaine, caffeine, choline, *N,N'*-dibenzylethylenediamine, diethylamine, 2-diethylaminoethanol, 2-dimethylaminoethanol, ethanolamine, ethylenediamine, *N*-ethylmorpholine, *N*-ethylpiperidine, glucamine, glucosamine, histidine, hydrabamine, 30 isopropylamine, lysine, methylglucamine, morpholine, piperazine, piperadine, polyamine

140

10

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
Alicia Lloreda
Apoderada

ASUNTO	Radicación	07 77621
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	007 4010

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/EP2006/000141
Fecha de Presentación Interna. 09/01/2006

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 37 - 86

1.2. Reivindicaciones: Folios 87 - 91

1.3. Prioridad: Presentada en Gran Bretaña el 11.01.05, bajo el número 0500513.7, así como las 0514199.9 y 0514200.5 de 11.07.05; y la 60/642844, presentada en Estados Unidos, el 11.01.05

2. Objeto de la Invención

- Título de la solicitud: "Sales de cinamato de un agonista beta-2 adrenérgico".

Según las reivindicaciones 1-23 se refiere a sales cinamato del compuesto (I), así como composiciones farmacéuticas que los contienen y su método de síntesis. Los compuestos con agonistas beta-2 adrenérgico.

191
111

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de más sales del compuesto (I)

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona las sales de fórmula (I) que son agonistas beta-2 adrenérgico.

- Clasificación Internacional de Patentes A 61 K 31/4704

3. Determinación del Estado de la Técnica

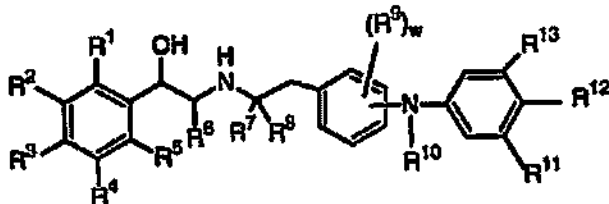
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 11.01.05, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 03042164	"Anil anilinas agonistas del receptor beta-2 adrenérgico"	22.05.03

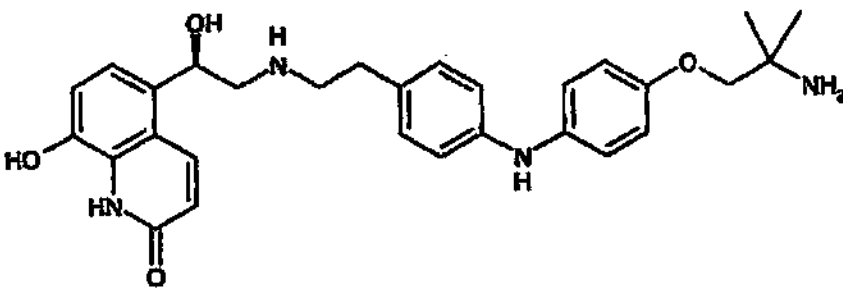
4. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

4.1. Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

- La publicación WO 02085866 se relaciona con compuestos de



fórmula:
reemplazos correspondientes encontramos el compuesto, haciendo los



así como las sales farmacéuticamente aceptables del mismo. La diferencia con el compuesto de la presente solicitud es que no se mencionan las sales de cinamato de manera específica.

Teniendo en cuenta el objeto de la solicitud, el cual es proveer sales de cinamato del compuesto (I), es una derivación del estado de la técnica, ya que una persona versada en la materia tomaría las enseñanzas de D1 y con sus conocimientos usuales en síntesis, cambiaría de manera obvia el tipo de ácido y llegaría a las sales reivindicadas con la expectativa de que también fueran agonistas beta-2.

Finalmente, no se demuestran efectos mejorados o sorprendentes de las

142
sales reivindicadas en comparación con lo conocido en el estado de la técnica.

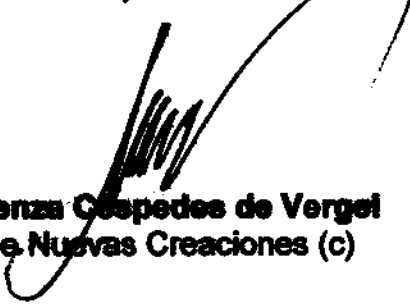
5. Conclusión:

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 03042164	1-23	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 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


Alix Carmenza Céspedes de Vergel
Directora de Nuevas Creaciones (c)

19 MAR. 2000

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

CONCEPTO TECNICO No. 1035	EXAMINADOR TECNICO Código No.202024
-------------------------------------	---