

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

ASUNTO Radicación 08-67243
 Trámite 011
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 006

125.071

Patente de Invención ☒

Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (Fase Nacional) ☐

Cap. I ☐

Cap. II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/US2006/046039

Fecha de Presentación Internacional 1 Diciembre de 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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 182 a 421	01/Julio/2007
Reivindicaciones:	Folios 422 a 436	01/Julio/2007
Figuras	Folio 444	01/Julio/2007
Prioridad:	US 60 741 366	01/Diciembre/2005

2. Análisis de la Prioridad

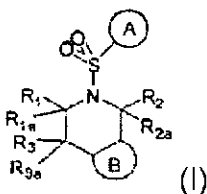
Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "5-(Arilsulfonil)-pirazolopiperidinas"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos útiles en la prevención y/o tratamiento de la Enfermedad de Alzheimer (AD).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 61 K 31/4162 // A 61 P 25/00 // C 07 D 471/002

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 18 que hace referencia a un método de tratamiento de la Enfermedad de Alzheimer no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara ni concisa porque la definición de la invención en término de sustituyentes "heteroarilo", "heterocicloalquilo", "arilo" y "cicloalquilo", entre otros, son géneros funcionales que no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Esto debido a que no se especifican el número de átomos de carbono que los conforman, en el caso de los anillos, ni el número y la clase de heteroátomos que los pueden llegar a conformar en el caso de los "hetero", motivo por el cual se obtienen un sin número de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

El capítulo reivindicatorio no es conciso, ni está sustentado en la descripción porque no hay suficientes ejemplos que demuestren que se hayan obtenido la totalidad de los compuestos con los sustituyentes tal como se encuentran allí definidos. Se encuentra que los compuestos obtenidos corresponden a los que comprenden preferiblemente los siguientes sustituyentes:

Radical	Ejemplo en la Descripción
A	Benceno sustituido con un compuesto halógeno,
B	Pirazol, piridina,
R1 y R1a, R2 y R2a, R3 y R3a	Átomo de hidrógeno, alquilo, CO2R',

La reivindicación 19 no es clara porque el uso del término "por lo menos" precediendo una característica no es limitativo, porque hace opcional a la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

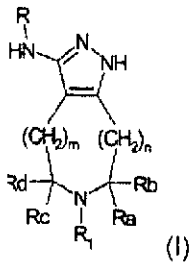
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: Diciembre 1 de 2005, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

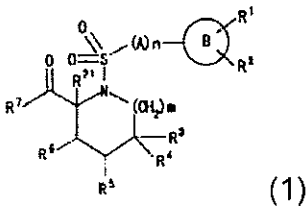
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	<u>WO2002012242</u>	Byciclo-pyrazoles active as kinase inhibitors, process for heir preparation and pharmaceutical	14/Febrero/2002

		pompositions comprising them	
D1	JP 2004/217654	Fused N-Containing Heterocyclic Compounds And Medical Use Thereof	22/Julio/2004

D1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0212242A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20020214&DB=EPODOC&locale=en> EPdivulga (página 3, línea 28) un compuesto de la fórmula (1), o una sal del mismo.



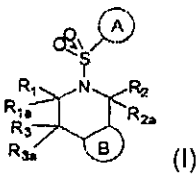
D2<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en> EP&FT=D&date=20040722&CC=WO&NR=2004060892A1&KC=A1 divulga (página 1, línea 54) un compuesto de la fórmula (1), pro fármaco o una sal del mismo.



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de formula (I).



Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Compuesto de Formula (I) (I)	Compuesto de Formula (I) (1)
Anillo A: Arilo, Cicloalquilo, heterocicloalquilo, cada uno Opcionalmente sustituido	R1: SO ₂ R' R': Aril C1-6, cicloalquill C3-6
Anillo B: Hetero-aril	Compuesto heterarilo
R ¹ -R ^{1a} ; R ² -R ^{2a} : Hidrógeno, Alquil o Alquenil, opcionalmente sustituido, C ₃₋₆ Cicloalquilo, Aril,	Ra, Rb, Rc, Rd: Átomo de hidrógeno, alquilo C1-6, arilo, arilo C1-6-alquilo o junto pueden

ArilC ₁₋₅ Alquil.	formas junto con el átomo de carbono al que se encuentran unido forman un cicloalquilo C3-6 m: 0 ó 1
R ¹ y R ^{1a} ; R ² y R ^{2a} ; R ³ y R ^{3a} : Con el carbono al que se enlazan, pueden formar ciclo-alquil C ₃₋₆ algún carbono opcionalmente sustituido por O, N, S, y el anillo opcionalmente sustituido	
R ³ – R ^{3a} : Hidrogeno, Halógeno, C ₁₋₆ Alquil, OH ó NR'R''	Átomo de hidrogeno

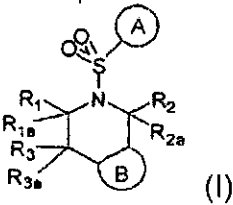
Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer un compuesto de formula (I) el cual presenta en su estructura un anillo heterociclo de 6 miembros con un heteroátomo, nitrógeno, el cual se encuentra fusionado con un compuesto heterocíclico de 6 miembros, que presenta dos átomos de nitrógeno, pirazol. El nitrógeno presente en el ciclohexano se encuentra sustituido con el grupo sulfonyl, SO₂, el cual es sustituido por un compuesto aromático o cicloalquilo. Adicionalmente dicho ciclo se encuentra sustituido por los compuestos Ra, Rb, Rc, Rd los cuales corresponden a un átomo de hidrogeno, alquilo C1-6, arilo, arilo C1-6-alquilo o junto con el carbono al que se encuentran unido pueden formar un compuesto cicloalquilo C3-6.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 2 – 6, 11 y 19 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

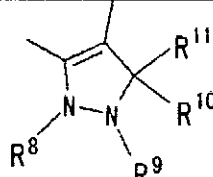
Novedad frente a D2

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de formula (I).



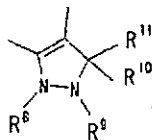
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D2
Compuesto de Formula (I) 	Compuesto de Formula (1)
Anillo A: Arilo, Cicloalquilo, Hetero-arilo , Heterocicloalquilo, cada uno Opcionalmente sustituido	A: C ₁₋₆ grupo alquileno, C ₂₋₆ grupo alquileno. n: 0, 1, 2 ó 3
R' – R'': Hidrogeno, C ₁₋₆ alquil ó Puedo formar un anillo de 3 a 8 miembros opcionalmente incluir un heteroátomo de N, O, S	Anillo B: C ₃₋₁₄ anillo hidrocarbonado opcionalmente sustituido Un Grupo heterociclo opcionalmente sustituido
Anillo B: Hetero-aril ó Hetero-ciclo-alquil, cada	R³ y R⁴ con R5: Un grupo Heterociclo

uno opcionalmente sustituido. Alquilo C₁₋₆ , Alquenilo C ₂₋₆ .	 R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ : Hidrógeno o grupo Alquilo C ₁₋₆
R¹-R^{1a}; R²-R^{2a} : Hidrógeno, Halógeno, C ₁₋₆ Alquilo o Alquenil, opcionalmente sustituido; C ₂₋₆ Alquinil, C ₃₋₆ Cicloalquilo; C3-6 CicloalquilC ₁₋₆ Alquil, Aril, ArilC ₁₋₅ Alquil, Hetero-aril; -CO ₂ R', CONR'R'', C ₁₋₆ Halo-alquil opcionalmente sustituido con C ₁₋₄ Alcoxi; C ₁₋₄ Halo-alcoxi-alquil, Hidroxilo C ₁₋₆ -Alquil, C ₂₋₆ Alcanoil, Ariloxy C ₁₋₆ Alquil, Heteroariloxy C ₁₋₆ Alquil, -C0-6 Aquil-OC(O)NR'R'', -C ₀₋₆ Alquil - NR'R'', Hidroxil, C0-6 Alquil-OC(O)Heterocicloalquil. Donde cada grupo aril, heteroaril y heterocicloalquil es opcionalmente sustituido	R⁷ : Hidrógeno, Grupo Hidroxilo ó hidroxiamino preferiblemente R⁸ : Hidrógeno o a C1-6 Alquilo (P. ej., metil, butil) preferiblemente, y un átomo de hidrógeno preferiblemente.
R³ - R^{3a} : Hidrogeno, Halógeno, C ₁₋₆ Alquil, OH ó NR'R''	R⁵ y R⁶ : Átomo de Hidrógeno preferiblemente
R¹-R^{1a}; R²-R^{2a}; R³-R^{3a} : =O; =NOR R = Hidrogeno, C ₁₋₆ Alquilo, Aril (fenilo), Aril-Alquil (benzil o feniletil)	m : 1,2 ó 3
R¹ y R^{1a}; R² y R^{2a}; R³ y R^{3a} : Con el carbono al que se enlazan, pueden formar ciclo-alquil C ₃₋₆ algún carbono opcionalmente sustituido por O, N, S, y el anillo opcionalmente sustituido	
R¹-R³ : Forman un doble enlace	

Las características esenciales de la estructura de la reivindicacion 1, habían sido divulgadas previamente en D2, el cual divulga un compuesto cuya estructura contiene un anillo de 6 miembros, uno de ellos nitrógeno sustituido por un grupo sulfonil, y este a su vez sustituido por un compuesto de formula A, unido a un compuesto de formula B. Según lo divulgado en D2 el compuesto de formula A es n, donde n=0, el compuesto a desaparece y el compuesto B definido por un anillo carbonado opcionalmente sustituido, ó un grupo heterociclo opcionalmente sustituido. (Folio 479)

R³, R⁴ y R⁵, se encuentran sustituido por un compuesto heterocíclico opcionalmente sustituido, ya que R8, R9, R10, R11 es opcionalmente grupo alquilo de C₁₋₆, de formula:



R⁷, en el compuesto de formula (1), esta dado por grupo Hidroxilo, unido a un grupo carbonilo, demostrando la presencia de un grupo carboxilo, en la solicitud en el R¹ puede ser un grupo CO₂R' donde R' es un átomo de Hidrogeno, convirtiéndose en un grupo carboxilo, divulgado en D2.

En consecuencia, la reivindicación 1, no es nueva, según lo divulgado en el documento D2.

Las reivindicaciones dependientes 2, 4, 5, 7, 8, 14, 15 y 19 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2002012242	1 – 6 , 11 y 19	Novedad
D2	JP 2004/217654	1, 2, 4, 5, 7, 8, 14, 15 y 19	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 (60) 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

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 No. 10 de 2001.



JESÚS FERNEL GARCÍA GARCÍA
Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
18 JUL 2012

Elaborado por: Paola Duarte 
Revisado por: Ana Pinzón.
Aprobado por: Jesús Fernel García García

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2004 年 7 月 22 日 (22.07.2004)

PCT

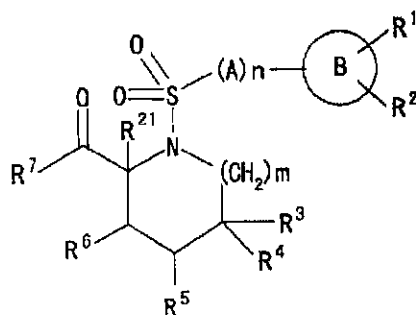
(10) 国際公開番号
WO 2004/060892 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 471/04, A61K 31/437, 31/444, 45/00, A61P 19/02, 29/00, 43/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2003/017067
- (22) 国際出願日: 2003 年 12 月 26 日 (26.12.2003)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2002-382573
2002 年 12 月 27 日 (27.12.2002) , JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本たばこ産業株式会社 (JAPAN TOBACCO INC.) [JP/JP]; 〒105-8423 東京都港区虎ノ門二丁目 2 番 1 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 塩崎 真 (SHIOZAKI, Makoto) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 須磨 陽 (SUMA, Akira) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 安江 克尚 (YASUE, Katsutaka) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 酒井 敦史 (SAKAI, Atsushi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 松尾 貴文 (MATSUO, Takafumi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 田中 正浩 (TANAKA, Masahiro) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP). 篠崎 雄一 (SHINOZAKI, Yuichi) [JP/JP]; 〒569-1125 大阪府 高槻市 紫町 1 番 1 号 日本たばこ産業株式会社 医薬総合研究所内 Osaka (JP).

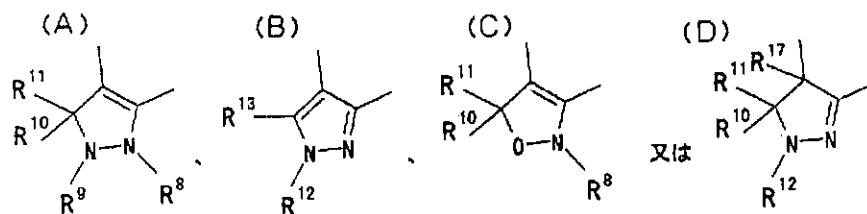
/ 続葉有 /

(54) Title: FUSED N-CONTAINING HETEROCYCLIC COMPOUNDS AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 縮合 N 含有ヘテロ環化合物及びその医薬用途



(1)



又は

(57) Abstract: It is intended to provide a compound which has an aggrecanase inhibitory effect or an MMP-13 inhibitory effect and is useful as a remedy for arthritis deformans, rheumatoid arthritis and so on, more specifically speaking, a fused N-containing heterocyclic compound represented by the following general formula (1), its prodrug or pharmaceutically acceptable salts thereof: (1) wherein R¹ and R² represent each hydrogen, etc.; R³ and R⁴ represent each hydrogen etc.; R⁵ represents, together with R⁶, R³ or R⁴, a group represented by any of the following general formulae: (A) (B) (C) (D) (wherein R⁵, R⁶, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³ and R¹⁷ represent each hydrogen, etc.); R⁷ represents hydrogen, etc.; R²¹ represents hydrogen, etc.; A represents alkylene, etc.; the ring B represents aryl, etc.; m is 1, etc.; and n is 0, etc.

/ 続葉有 /

WO 2004/060892 A1