

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALVARO CORREA ORDOÑEZ

ASUNTO Radicación 08-81992
 Trámite 11
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio 14
 Folios 14

11495

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad

Vía Nacional

Vía PCT (Fase Nacional) ☒ Capítulo I ☒ Capítulo II

No. Solicitud Internacional PCT/US2007/003134
Fecha de Presentación Internacional 07/Febrero/2007

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 78 a 490	06/Agosto/2008
Reivindicaciones:	Folios 491 a 543	06/Agosto/2008
Prioridad:	US 60 771 262	07/Febrero/2006

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.

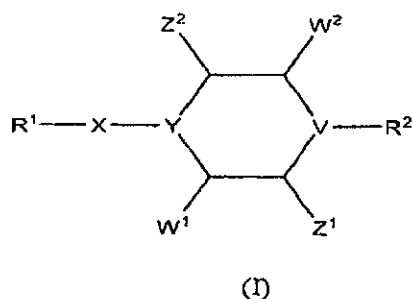
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "INHIBIDORES DE 11-BETA HSD1"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos útiles como inhibidores de la enzima hidroxisteroide deshidrogenasa 11βHSD1.

Expediente 08-81992 1er Art 45

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



(Ver folio 80)

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 61 K 31/44 // 31/495 ; C 07 D 211/96 // 295/22 // 401/04

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

El objeto de las reivindicaciones 94 – 102 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque contiene un excesivo número de reivindicaciones, lo cual hace difícil definir cuál es el objeto que se busca proteger. Se sugiere restringir la solicitud a los compuestos sustentados en la descripción.

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque las definiciones de R¹, R², W¹, W², Z¹ y Z² son géneros funcionales, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La Solicitud no cumple con el Requisito de Unidad de Invención porque se refiere a 4 Grupos Inventivos.

La característica estructural que es común a todos los compuestos de formula (I) que esta definida en las reivindicaciones independientes 1, 49, 75 y 88 es el anillo de piperidina o piperazina. La definición de los grupos y sustituyentes R¹, R², X, W¹, W², Z¹, Z² en las reivindicaciones independientes 49, 75 y 88 es diferente de la definición de la reivindicación 1 e incluye otras posibilidades que no son encontradas en la formula (I) de la reivindicación 1.

Las características técnicas especiales de la primera invención (reivindicación 1) la son las características (a) R^2 es arilo o heteroarilo, (b) X es $S(O)_n$ o $S(O)_nNR^6$ y (c) uno, dos, tres o cuatro de W^1 , W^2 , Z^1 , Z^2 , son diferentes de hidrógeno, y son seleccionados de los grupos i) a iv) como es definida en la reivindicación 1.

Las características independientes 49, 75 y 88 no contienen estas características especiales (a), (b) o (c) o sus equivalentes, por lo tanto las invenciones de las reivindicaciones independientes 49, 75 y 88 no forman con la primera invención un concepto común inventivo.

Los Grupos Inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

1. Compuestos de formula (I) donde R^1 es definido de (i) o (ii) según es definido en la reivindicación 1, R^2 es arilo o heteroarilo, X es $S(O)_n$ o $S(O)_nNR^6$ y uno o mas sustituyentes de W^1 , W^2 , Z^1 y Z^2 es diferente de hidrógeno y son seleccionados de (i) a (iv). (reivindicaciones 1-48). Los compuestos de este grupo inventivo ya se encuentran divulgados en los documentos: WO2005115983 (páginas 62 a 166, ejemplos 6, 7, 19-21, 23-25, 68-73, 77, 78, 81-83, 90, 94, 98-114, 118, 149, 177, 192-195, 197, 198, 200, 204, 206, 209, 213-222, 224, 226-229, 231, 232; reivindicaciones 52, 65, 66 y 71); US2005288308A1 (parágrafos 1, 8, 9, 15, 28-30, 69, 71); US2006025455A1 (página 2 parágrafos 0009 y 0013); WO2005118538 (página 8 parágrafos 0031 y 0032 y página 9 parágrafo 0035).
2. Compuestos de formula (I) donde R^1 es definido de (i) o (ii) según es definido en la reivindicación 49, R^2 es arilo o heteroarilo o OR^1 , SR^1 , NR^3R^4 , X es $S(O)_n$ o $S(O)_nNR^6$, W^1 , W^2 , Z^1 y Z^2 son todos hidrógeno (reivindicaciones 49-74). Los compuestos de este grupo inventivo ya se encuentran divulgados en los documentos: WO2005118538 (página 8 parágrafos 0031 y 0032 y página 9 parágrafo 0035); US6465468 (columna 1 línea 56 – columna 2 línea 48).
3. Compuestos de formula (I) donde R^1 es arilalquilo, cicloalquilo o arilcicloalquilo, R^2 es arilo o heteroarilo o OR^1 , SR^1 , NR^3R^4 , X es CO, W^1 , W^2 , Z^1 y Z^2 son seleccionados de (i) a (iv) según son definidos en la reivindicación 75 (reivindicaciones 75-87). Los compuestos de este grupo inventivo ya se encuentran divulgados en los documentos: US2875205 (columnas 1 a 6, ejemplos 1 a 14); WO2004089416 (página 210, línea 4).
4. Compuestos de formula (I) donde R^1 es arilo o heteroarilo, R^2 es cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclilo, heterocicloalquenilo, X es $S(O)_n$ o $S(O)_nNR^6$, (reivindicaciones 17-20) W^1 , W^2 , Z^1 y Z^2 son seleccionados de (i) a (iv) según son definidos en la reivindicación 88 (reivindicaciones 88-92). Los compuestos de este grupo inventivo ya se encuentran divulgados en los documentos: US2006025455A1 (página 2 parágrafos 0009 y 0013); WO2005118538 (página 8 parágrafos 0031 y 0032 y página 9 parágrafo 0035).

Se considera que los grupos inventivos no presentan un concepto inventivo general ya que presentan diferentes estructuras químicas.

Se sugiere presentar las Solicitudes Divisionales que considere necesarias, ó limitar la Expediente 08-81992 1er Art 45

solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones

7. 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: Febrero 07 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2005115983	Aryl Sulfonamide and Sulfonyl Compounds as Modulators of PPAR and Methods of Treating Metabolic Disorders	08/Diciembre/2005
D2	US2005288308A1	11B-HSD1 Inhibitors for The Treatment of Diabetes	29/Diciembre/2005
D3	US2006025455A1	New 5-Aryl Pyridines as 11-Beta Inhibitors for The Treatment of Diabetes	02/Febrero/2006
D4	WO2005118538	Arylsulfonamides and Uses Related Thereto	15/Diciembre/2005
D5	US6465468	Hidroxamic and Carboxilic Acid Derivatives	15/Octubre/2002
D6	US2875205	Dicarboxilic Acids Monopiperazides and A Process for Their Manufacture	24/Febrero/1959
D7	WO2004089416	Combination Therapy Using an 11beta-Hydroxysteroid Dehydrogenase Type 1 Inhibitor and an Antihypertensive Agent for The Treatment of Metabolic Syndrome and Related Diseases and Disorders	21/Octubre/2004

D1

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005115983A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20051208&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (página 12, párrafo 0060) un compuesto derivado de piperazina sustituida por un sustituyente fenilo y por un sustituyente sulfonilfenilo.

D2.

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005288308A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20051229&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (páginas 1 y 2 párrafos 0010 a 0017) una molécula consistente en un anillo de pirimidina sulfonilaminosustituida.

D3.

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2006025455A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20060202&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (página 2 párrafos 0009 a 0018) una molécula consistente en un anillo de pirimidina sulfonilaminosustituida.

D4

Expediente 08-81992

1er Art 45

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005118538A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20051215&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (página 8 párrafo 0031; página 31, parágrafo 0125 ejemplo L) un compuesto derivado de piperidina sulfonilsustituido.

D5
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=6465468B1&KC=B1&FT=D&ND=3&date=20021015&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (columna 1 línea 56 – columna 2 línea 48) un compuesto derivado de ácido hidroxámico.

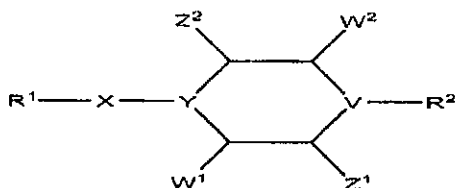
D6
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2875205A&KC=A&FT=D&ND=3&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (columnas 1 a 6 ejemplos 1-14) un compuesto derivado de piperazina carbonilsustituida.

D7
<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2004089416A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20041021&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en> EP divulga (páginas 210 línea 4) un compuesto derivado de piperazina carbonilsustituida.

8. Examen de Patentabilidad (Art.14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto que tiene la formula (I)



(I) (Ver folios 491 a 499)

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

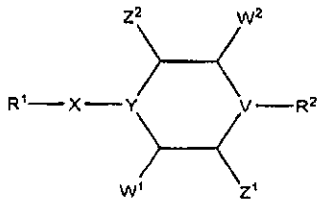
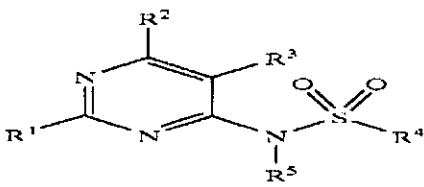
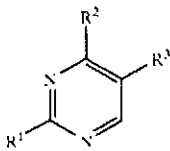
Características esenciales	D1
(I)	D1
Anillo de piperidina o piperazina	Anillo de piperazina
X S(O) _n siendo n 1 o 2	SO ₂

R¹ C ₆ -C ₁₈ Arilo	Fenilo
R² C ₆ -C ₁₈ Arilo o Heteroarilo que comprende 5 a 20 átomos.	Fenilo o piridilo
Z¹, Z², W¹, W² 1,2,3 o 4 de ellos son independientemente C ₁ -C ₁₂ alquilo o un grupo oxo, los otros son hidrógeno.	(R ¹⁴), donde R ¹⁴ es hidrogeno o C ₁ -C ₃ alquilo, i es 0,1 o 2 (página 13, párrafo 0074 ejemplos)

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer una molécula consistente en un anillo de piperazina sustituida por un arilo o heteroarilo y por un grupo sulfonilarilo (página 12, párrafo 0060) (Ver páginas 62 a 166, ejemplos 6,7,19-21,23-25,68-73,77,78,81-83,90,94,98-114,118,149,177,192-195,197,198,200,204,206,209,213-222,224,226-229,231,232; reivindicaciones 52, 65, 66 y 71)

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

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

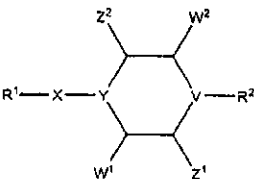
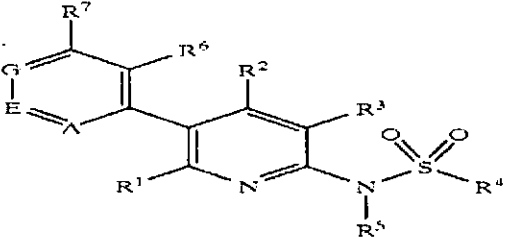
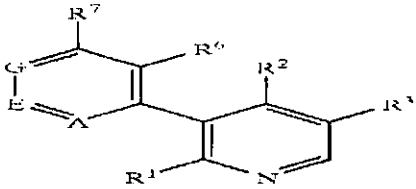
Características esenciales	D2
	
Anillo de piperidina o piperazina	R ⁴ Piperidina (página 4 parágrafos 69 y 71)
X S(O) _n NR ⁶ siendo n igual a 2 y R ⁶ es hidrógeno, C ₁ -C ₁₂ alquilo o C ₃ -C ₁₆ cicloalquilo	SO ₂ NR ⁵ donde R ⁵ es hidrógeno, alquil o cicloalquilalquilo.
R ¹ heteroarilo que comprende 5 a 20 átomos sustituido por 1 a 10 R ^a siendo R ^a C ₁ -C ₁₂ alcoxi, C ₁ -C ₁₂ alquilo, C ₇ -C ₂₀ arilalquilo, C ₃ -C ₁₆ cicloalquilo, heterociclilo que comprende 3 a 16 átomos o C ₆ -C ₁₆ arilo.	 R ¹ es alquilo, cicloalquilo, cicloalquilalcoxi, cicloalquilalcoxialquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, arilo, arilalquilo, ariloxialquilo, amino o alquilamino. R ² y R ³ son hidrógeno, alquilo o arilo
R ²	El anillo de piperidina es opcionalmente sustituido por

Heteroarilo que comprende 6 a 18 átomos	uno o más, preferiblemente uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de alquilo, halógeno, alcoxi, trifluorometilo, arilo, oxazolilo y piridinilo. (página 4 parágrafo 69).
Z^1, Z^2, W^1, W^2 1,2,3 o 4 de ellos son independientemente C_1 - C_{12} alquilo o un grupo oxo, los otros son hidrógeno.	El anillo de piperidina es opcionalmente sustituido por uno o más, preferiblemente uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de alquilo, halógeno, alcoxi, trifluorometilo, arilo, oxazolilo y piridinilo. (página 4 parágrafo 69).

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D2, (Ver párrafos 1,8,9,15,28-30,69,71) el cual da a conocer una molécula consistente en un anillo de pirimidina sulfonilaminosustituida en la cual el sustituyente del grupo sulfonil corresponde a piperidina (página 4 párrafos 69 y 71)

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

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

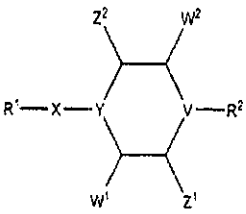
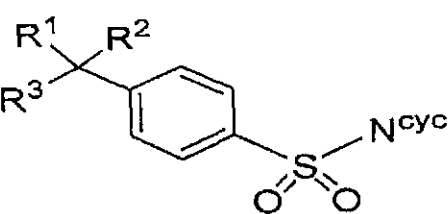
Características esenciales	D3
 (D)	
Anillo de piperidina o piperazina	R^4 Piperidina (página 2 parágrafo 13)
X $S(O)_n NR^6$ siendo n igual a 2 y R^6 es hidrógeno, C_1 - C_{12} alquilo o C_3 - C_{16} cicloalquilo	SO_2NR^5 donde R^5 es hidrógeno, alquil o cicloalquilalquilo.
R^1 heteroarilo que comprende 5 a 20 átomos sustituido por 1 a 10 R^a siendo R^a C_1 - C_{12} alcoxi, C_1 - C_{12} alquilo, C_7 - C_{20} arilalquilo, C_3 - C_{16} cicloalquilo, heterociclilo que comprende 3 a 16 átomos o C_6 - C_{16} arilo.	 R^1 es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, hidroxil, hidroxialquilo, alcoxi, alcoxialquilo, amino o alquilamino. R^2 y R^3 son hidrógeno, alquilo o halógeno. A es nitrógeno o CR^{10} E es nitrógeno o CR^9 G es nitrógeno o CR^8 Donde no mas de uno de A , E y G son nitrógeno. R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son independientemente seleccionados de hidrógeno, alquilo, halógeno, ciano,

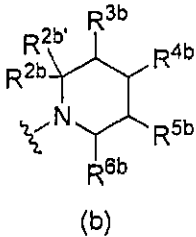
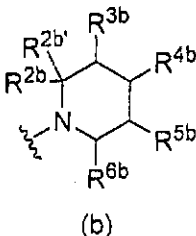
	trifluorometilo, alcoxi y alquil-SO ₂ (página 2 párrafos 0010 a 0018).
R² C ₆ -C ₈ Arilo Heteroarilo que comprende 5 a 20 átomos	El anillo de piperidina es opcionalmente sustituido por uno o más, sustituyentes independientemente seleccionados de alquilo, cicloalquilo, halógeno, hidroxí, hidroxialquilo, alcoxi, alcoxialquilo, hidroxialcoxi, ciano, trifluorometilo, trifluorometoxi, arilo, arilalquilo, ariloxi, heterociclilo, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilalcoxi y alquil-SO ₂ (página 2 párrafo 0013).
Z¹, Z², W¹, W² 1,2,3 o 4 de ellos son independientemente C ₁ -C ₁₂ alquilo o un grupo oxo, los otros son hidrógeno.	El anillo de piperidina es opcionalmente sustituido por uno o más, sustituyentes independientemente seleccionados de alquilo, cicloalquilo, halógeno, hidroxí, hidroxialquilo, alcoxi, alcoxialquilo, hidroxialcoxi, ciano, trifluorometilo, trifluorometoxi, arilo, arilalquilo, ariloxi, heterociclilo, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilalcoxi y alquil-SO ₂ (página 2 párrafo 0013).

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D3, el cual da a conocer una molécula consistente en un anillo de piperidina sulfonilaminosustituida en la cual el sustituyente del grupo sulfonil corresponde a piperidina (Ver página 2 párrafos 0009 y 0013)

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D3.

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

Características esenciales	D4
 (I)	
Anillo de piperidina o piperazina	Anillo de piperidina (Página 8 párrafo 0032 fórmula (b))

	 (b)
X S(O) _n siendo n 1 o 2	SO ₂
R ¹ C ₆ - C ₁₈ Arilo	Fenilo
R ² C ₆ -C ₁₈ Arilo	Arilo o heteroarilo (sustituyente 4b formula (b) página 9 parágrafo 0035)
W¹, W², Z¹, Z² 1,2,3 o 4 de ellos son independientemente C ₁ -C ₁₂ alquilo, un grupo oxo. C ₆ -C ₁₈ arilo , C ₅ -C ₂₀ heteroarilo, C ₇ -C ₂₀ arilalquilo , C ₃ - C ₁₆ cicloalquilo, heteroarilalquilo que comprende 6 a 20 átomos , C ₃ - C ₁₆ cicloalqueno, heterociclo que incluye 3 a 16 átomos, heterocicloalqueno que incluye 3 a 16 átomos los otros son hidrogeno	N ^{cyc} es  (b) R ^{2b} , R ^{2b'} , R ^{3b} , R ^{4b} , R ^{5b} y R ^{6b} se seleccionan de: C ₁ -C ₈ alquilo, C ₃ -C ₈ cicloalquilo , C ₅ -C ₁₄ heterocicloalquilo, arilo, heteroarilo, C ₃ -C ₈ cicloalquilo- C ₁ -C ₆ alquilo, heterocicloalquilo- C ₁ -C ₆ alquilo, heterocicloarilo- C ₁ -C ₆ alquilo, arilo- C ₁ -C ₆ alquilo, C ₂ -C ₈ alqueno y opcionalmente R ^{2b} y R ^{2b'} forman un grupo oxo; y por lo menos uno de R ^{2b} , R ^{2b'} , R ^{3b} , R ^{4b} , R ^{5b} y R ^{6b} es diferente de hidrógeno. (página 9 parágrafo 0035)

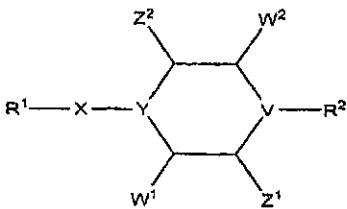
Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D4, el cual da a conocer un compuesto heterocíclico nitrogenado sulfonil sustituido(página 8 párrafos 0031 y 0032 y página 9 parágrafo 0035)

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D4.

La formula Markush reclamada en la reivindicación 1 es divulgada en los documentos D1, D2, D3 y D4. Por este motivo la novedad de los compuestos que presentan dicha formula Markush es anulada por estos tres documentos.

En consecuencia las reivindicaciones 1-48 carecen de novedad según lo divulgado en los documentos D1, D2, D3 y D4.

La reivindicación 49 consiste en un compuesto que tiene la formula (I)



(I) (Ver folios 510 a 519)

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:	
Características esenciales	D5
 (I)	$(B)_2N-X-(CH_2)_m-W-(CR^1R^2)_n-COY$
Anillo de piperidina o piperazina	Heterocicloalquilo correspondiente al sustituyente (B) ₂ N (columna 1 línea 56 – columna 2 línea 48)
X SO ₂	X S(O) ₁₋₂
R ¹ C ₆ -C ₁₈ Arilo	Arilo sustituyendo al sustituyente (B) ₂ N
R ² C ₆ -C ₁₈ Arilo Heteroarilo incluyendo 5-20 átomos.	Arilo Heteroarilo
W ¹ , W ² , Z ¹ , Z ² Hidrógeno	Sustituyente (B) ₂ N sin sustituir

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 49 habían sido divulgadas previamente en D5, el cual da a conocer un compuesto derivado de ácido hidroxámico (Ver columna 1 línea 56 – columna 2 línea 48)

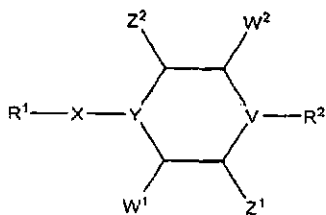
En consecuencia, la reivindicación 49 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D5.

El documento D4 divulga el compuesto objeto de la reivindicación 48 cuando N^{cyc} corresponde a la fórmula (b) teniendo en cuenta R^{4b} correspondiente a arilo o heteroarilo y R^{2b}, R^{2b'}, R^{3b}, R^{5b} y R^{6b} correspondientes a hidrógeno.

La formula Markush reclamada en la reivindicación 49 es divulgada en los documentos D4 y D5. Por este motivo la novedad de los compuestos que presentan dicha formula Markush es anulada por estos documentos.

En consecuencia las reivindicaciones 49-74 carecen de novedad según lo divulgado en los documentos D4 y D5

La reivindicación 75 consiste en un compuesto que tiene la formula (I)



(I)

(Ver folios 524 a 532)

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

Características esenciales	D6
 (I)	
Anillo de piperidina o piperazina	Piperazina (columnas 1 a 6, ejemplos 1 a 14)
X CO	CO
R¹ Alquilo sustituido	Grupo alquilo sustituido por un COOH
R² C₆-C₁₈ Arilo Heteroarilo incluyendo 5-20 átomos	Fenilo sustituido
W¹, W², Z¹, Z² Hidrógeno	Hidrógeno

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 75 habían sido divulgadas previamente en D6, el cual da a conocer un compuesto derivado de piperazina carbonilsustituida. (Ver columnas 1 a 6, ejemplos 1 a 14)

En consecuencia, la reivindicación 75 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D6.

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

Características esenciales	D7
 (I)	[4-(2-cloro-6-nitro-fenil)-piperazin-1-il]-p-tolil-metanona. (página 210, línea 4)

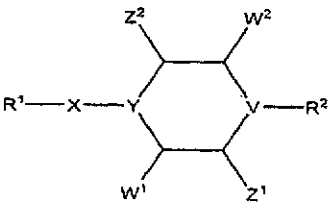
Anillo de piperidina o piperazina	Piperazina (página 210, línea 4)
X CO	CO (página 210, línea 4)
R ¹ Alquilo sustituido	Grupo alquilo sustituido por un COOH (página 210, línea 4)
R ² C ₆ -C ₁₈ Arilo Heteroarilo incluyendo 5-20 átomos	Fenilo sustituido (página 210, línea 4)
W ¹ , W ² , Z ¹ , Z ² Hidrógeno	Hidrógeno (página 210, línea 4)

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 75 habían sido divulgadas previamente en D7, el cual da a conocer un compuesto derivado de piperazina carbonilsustituida (página 210, línea 4).

La formula Markush reclamada en la reivindicación 75 es divulgada en el documento D6. Por este motivo la novedad de los compuestos que presentan dicha formula Markush es anulada por estos documentos.

En consecuencia las reivindicaciones 76-87 carecen de novedad según lo divulgado en los documentos D6 y D7.

La reivindicación 88 consiste en un compuesto que tiene la formula (I)

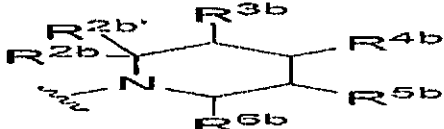


(I)

(Ver folios 533 a 541)

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

Características esenciales	D4
 (I)	 R ¹ , R ² , R ³ , N ^{cyc} , SO ₂
Anillo de piperidina o piperazina	Anillo de piperidina (Página 8 parágrafo 0032 fórmula (b)) (b)

X S(O) _n siendo n 1 o 2	SO ₂
R¹ C ₆ - C ₁₈ Arilo	Fenilo
R² C ₃ -C ₁₆ cicloalquilo, C ₆ -C ₁₆ cicloalquenilo, heterociclilo que incluye 6 a 16 átomos o heterocicloalquenilo que incluye 6 a 16 átomos	C ₁ -C ₈ alquilo, C ₃ -C ₈ cicloalquilo , C ₅ -C ₁₄ heterocicloalquilo, , C ₃ -C ₈ cicloalquilo- C ₁ -C ₆ alquilo, heterocicloalquilo- C ₁ -C ₆ alquilo, heterocicloarilo- C ₁ -C ₆ alquilo, C ₂ -C ₈ alquenilo (sustituyente 4b formula (b) página 9 parágrafo 0035)
W¹, W², Z¹, Z² 1,2,3 o 4 de ellos son independientemente C ₁ -C ₁₂ alquilo, un grupo oxo, C ₆ -C ₁₈ arilo , heteroarilo que comprende 5 a 20 átomos, C ₇ -C ₂₀ arilalquilo , C ₃ -C ₁₆ cicloalquilo, heteroarilalquilo que comprende 6 a 20 átomos, C ₃ -C ₁₆ cicloalquenilo, heterociclo que incluye 3 a 16 átomos, heterocicloalquenilo que incluye 3 a 16 átomos los otros son hidrogeno	N^{cyc} es  (b) R^{2b}, R^{2b'}, R^{3b}, R^{4b}, R^{5b} y R^{6b} se seleccionan de: C₁-C₈ alquilo, C₃-C₈ cicloalquilo , C₅-C₁₄ heterocicloalquilo, arilo, heteroarilo, C₃-C₈ cicloalquilo- C₁-C₆ alquilo, heterocicloalquilo- C₁-C₆ alquilo, heterocicloarilo- C₁-C₆ alquilo, arilo- C₁-C₆ alquilo, C₂-C₈ alquenilo y opcionalmente R^{2b} y R^{2b'} forman un grupo oxo; y por lo menos uno de R^{2b}, R^{2b'}, R^{3b}, R^{4b}, R^{5b} y R^{6b} es diferente de hidrógeno. (página 9 parágrafo 0035)

La novedad de la reivindicación 88 es afectada por el documento D4 cuando el anillo de piperidina es sustituido en la posición 4(R^{4b} en D4) por cicloalquilo o heterociclilo.

Igualmente el documento D3 anula la novedad de la reivindicación 88 cuando el anillo de piperidina (R⁴ en D3) es sustituido en la posición por cicloalquilo o heterociclilo (Ver página 2 parágrafo 0013).

Puesto que las reivindicaciones 89 a 92 no presentan características técnicas adicionales que hagan nueva a la invención de la reivindicación 88 tampoco se consideran nuevas.

La oficina estadounidense de patentes y marcas reporta que la formulas Markush objeto de la invención reclamada en la reivindicación 88 se divulga en el documento:

- Lee, Jae W; et al; Nitrophenol Resins for Facile Amide and Sulfonamide Library Synthesis. Journal of Combinatorial Chemistry (2003), 5(3), 330-335.

Finalmente la oficina europea de patentes reporta que las formulas Markush objeto de esta invención se divulgan en los siguientes documentos:

- MICHAEL D.B. FENSTER, BRIAN O. PATRICK, GREGORY R. DAKE: "Construction of azaspirocyclic ketones through alpha-hidroxyminium ion or alpha-siloxy epoxide semipinacol rearrangements" ORGANIC LETTERS, vol.3 no 13, 2001 páginas 2109 a 2112, XP002444780.

- YOSHINAO TAMARU, MAKOTO HOJO, SHIN-ICHI KAWAMURA, ZHEN-ICHI YOSHIDA: "Synthesis of five-and six-membered nitrogen heterocycles via a palladium(II)-catalized cyclization of unsaturated amides" J.ORG.CHEM; vol.51, 1986 páginas 4089 a 4090, XP002444781.
- RICHARD D.GLESS, HENRY RAPOPORT: "6,7-Benzomorphans. Stereospecific Synthesis of 2,9 alpha and 2,9 beta dimethyl 2'-metoxi-6,7-benzomorphans" J.ORG.CHEM; vol.44, no8, 1979 páginas 1324 a 1336, XP002444782.

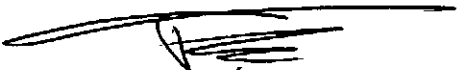
9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005115983	1 - 48, 93	Novedad
D2	US2005288308A1	1 - 48, 93	Novedad
D3	US2006025455A1	1 - 48, 88 - 92, 93	Novedad
D4	WO2005118538	1 - 74, 88 - 92, 93	Novedad
D5	US6465468	49 - 74, 93	Novedad
D6	US2875205	75 - 87, 93	Novedad
D7	WO2004089416	75 - 87, 93	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.

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.


JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
 Director de Nuevas Creaciones (C)

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

29 JUN. 2012

Elaborado por: Rodolfo Cadena Amaya.
 Revisado por: Gloria Jacqueline Alfonso.