

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá D.C.,

Abogado
 Carlos R. Olarte

ASUNTO	Radicación	08 105 789
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	6

08771

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de
 Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (Fase Nacional)

☒

Capítulo I

☒

Capítulo II

☐

No. Solicitud Internacional

PCT/EP2007/053118

Fecha de Presentación Internacional

30/Marzo/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 20 a 37	03/Octubre/2010
Reivindicaciones:	Folios 38 a 39	15/Junio/2003
Prioridad:	GB0607899.2	03/Abril/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.

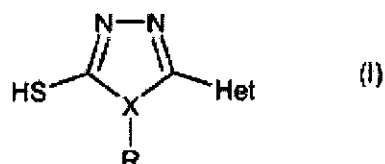
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Procedimiento para preparar derivados heterocíclicos"

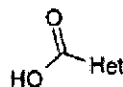
El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de un proceso novedoso para producir heterociclos que no comprenda reactivos explosivos a nivel industrial.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un proceso de preparación de compuestos heterocíclicos que consiste en: preparar compuestos de fórmula (I)

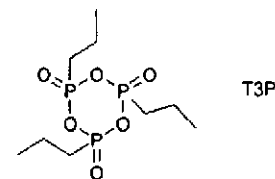
Expediente 08 105 789 1er Art 45



Donde **Het**: heteroarilo sustituido por metilo; **X**: nitrógeno; **R**: metilo; que comprende:



Reacción de un compuesto de fórmula (IIA): con derivados de 3-tiosemicarbazida en condiciones básicas, seguido por un tratamiento con base



inorgánica y anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) y finalmente ajuste de pH con ácidos inorgánicos.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/04

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 actualmente presentada no es clara porque la definición del grupo "Het" es muy amplia y abarca un gran número de compuestos que no encuentran un debido sustento en el capítulo descriptivo, lo cual impide entender el alcance de la invención. Es así como por ejemplo, dicho grupo puede corresponder a conjuntos de radicales tan amplios como "arilo" y "heteroarilo" sin tener en cuenta que el capítulo descriptivo enseña en los ejemplos allí ilustrados que en realidad corresponde a un

pequeño número de grupos tales como: Es necesario entonces que la definición del grupo "Het" sea restringida a los grupos específicos que han sido usados en el procedimiento para obtener los compuestos de fórmula (I). De manera similar, los ejemplos ilustrados en el capítulo descriptivo enseñan que el radical "X" corresponde únicamente a nitrógeno, y no a azufre tal como se menciona en la reivindicación 1. Se requiere restringir la definición de este radical de tal forma que sea coherente con el capítulo descriptivo.

De otra parte, la reivindicación 1 no es clara porque menciona un grupo "Z" pero la definición de dicho grupo no está presente. En este sentido es importante señalar que la definición del grupo Z tampoco está presente en el capítulo descriptivo y por tal razón se sugiere la eliminación de dicho grupo del capítulo reivindicatorio.

La expresión "arilo" presente en la definición del grupo "R3" es muy amplia y no permite entender el alcance de la invención. Es necesario limitar dicha expresión a los radicales específicos que fueron usados en el proceso reivindicado.

Las expresiones "base inorgánica" y "ácidos inorgánicos" son muy amplias y abarcan un número indetermindado de compuestos que no encuentran un sustento en el

capítulo descriptivo. Es necesario restringir dichas expresiones a las bases y ácidos inorgánicos específicos utilizados en el proceso reivindicado.

Por último, La reivindicación 1 no es clara porque menciona un procedimiento para preparar derivados de tiazol o triazol de fórmula (I) sin hacer referencia alguna a las condiciones en las cuales se lleva a cabo dicho proceso. Es necesario entonces indicar específicamente las condiciones empleadas para sintetizar los compuestos de fórmula (I), exaltando las características esenciales que lo hacen novedoso e inventivo frente al estado de la técnica y que estén debidamente sustentadas en el capítulo descriptivo.

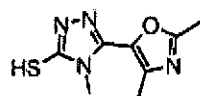
5. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de Presentación de la Solicitud de Prioridad: Abril 03 de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2005080382(A1)	Azabicyclo (3.1.0) hexane derivatives useful as modulators of dopamine d3 receptors	01/Septiembre/2005
D2	Abdellah Ech-Chahad Etal, Tetrahedron Letters 46 (2005) 5113–5115.	An expeditious hydroxyamidation of carboxylic acids	17/Junio/2005

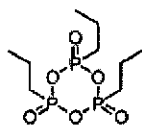
D1

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?FT=D&date=20050901&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=WO&NR=2005080382A1&KC=A1&ND=5 enseña un proceso de síntesis del



compuesto, que comprende reacción de ácido 2,4-dimetil-1,3-oxazol carboxílico con N-metilhidracinocarboxamida y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarboimida y una adición de NaOH y posteriormente adición de HCl.

D2 (folios 69 - 71) enseña un proceso de hidroxiamidación de ácidos carboxílicos que comprende reacción de un ácido carboxílico (página 5114, tabla 1 y tabla 2), con un anhídrido cíclico fosfónico de

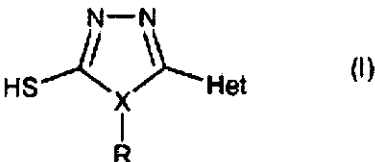


n-propano PPAA (T3P)

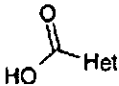
6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

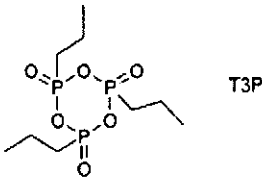
La reivindicación 1 consiste en un procedimiento para preparar compuestos de fórmula (I)



Donde **Het**: heteroarilo sustituido por metilo; **X**: nitrógeno; **R**: metilo; que comprende:



Reacción de un compuesto de fórmula (IIA): (IIA) con derivados de 3-tiosemicarbazida en condiciones básicas, Seguido por un tratamiento con base



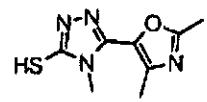
inorgánica y anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) y finalmente ajuste de pH con ácidos inorgánicos.

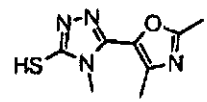
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
Procedimiento para prepara compuestos de fórmula (I) <chem>Sc1nc(X)c(R)c1Het</chem> (I) Donde Het: heteroarilo sustituido por metilo X: nitrógeno R: metilo Que comprende:	Procedimiento para la obtención del compuesto de fórmula (página 72, líneas 10-22, preparación 77): <chem>Cc1nc(C)nc(C2=CC(=O)N(C)C2)c1S</chem> Que comprende	Proceso de hidroxiamidación de ácidos carboxílicos que comprende
Reacción de un compuesto de fórmula (IIA): <chem>OC(=O)Het</chem> (IIA) Con derivados de 3-tiosemicarbazida en condiciones básicas	Reacción de ácido 2,4-dimetil-1,3-oxazol carboxílico con N-metilhidracinocarboxamida y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarboimida	Reacción de un ácido carboxílico (página 5114, tabla 1 y tabla 2)
Seguido por un tratamiento con base inorgánica y anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) <chem>CCOP(=O)(OCC)OP(=O)(OCC)OCC</chem> T3P	No se menciona	Con un anhídrido cíclico fosfónico de n-propano PPAA (T3P) <chem>CCOP(=O)(OCC)OP(=O)(OCC)OCC</chem>
Finalmente ajuste de pH con ácidos inorgánicos	Adición de NaOH y posteriormente HCl	No se menciona.

Los documentos considerados dentro del estado de la técnica de la invención
Expediente 08 105 789 1er Art 45

definida en la reivindicación 1 de la presente solicitud, corresponde a D1 y D2 porque:

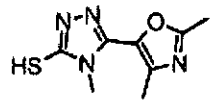


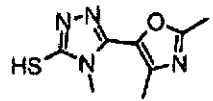
D1 enseña un proceso de síntesis del compuesto , que comprende reacción de ácido 2,4-dimetil-1,3-oxazol carboxílico con N-metilhidracinocarboxamida y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarboimida y una adición de NaOH y posteriormente adición de HCl.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el procedimiento de síntesis enseñado en el documento D1 consiste en que la hidroxiamidación del ácido carboxílico en la presente solicitud se realiza usando anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P), mientras que en proceso enseñado en la anterioridad D1 no se menciona el uso de dicho compuesto para realizar la hidroxiamidación.

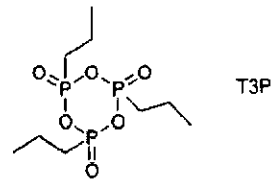
El efecto técnico que logra la hidroxiamidación del ácido carboxílico con el anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) en la presente solicitud, no puede ser determinado dado que no existe evidencia que sugiera que realizar esta etapa en la síntesis de los compuestos de fórmula I, otorgue a dicho proceso una ventaja técnica sobre el proceso ya conocido en la anterioridad D1.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el proceso de preparación del compuesto de



fórmula  enseñado en el documento D1, de tal forma que involucre el anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) como agente de hidroxiamidación.

Sin embargo, la utilización de anhídrido cíclico fosfónico de n-propano (T3P) como agente de hidroxiamidación de ácidos carboxílicos ya era conocido en el documento D2, el cual enseña un amplio número de reacciones de hidroxiamidación



de ácidos carboxílicos que involucran el

En consecuencia, la persona medianamente versada en la materia, incluiría de manera obvia el paso de hidroxiaminación de ácidos carboxílicos enseñada en D2 al proceso revelado por D1, con el fin de llegar al objeto de la reivindicación 1 de la presente solicitud.

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005080382(A1)	1	Nivel Inventivo
D2	Abdellah Ech-Chahad Etal, Tetrahedron Letters	1	Nivel Inventivo

	46 (2005) 5113- 5115.		
--	--------------------------	--	--

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

_____ **13-0 MAYO 2012**

Elaborado por: Juan Carlos Cortés García
Revisado por: Jacqueline Alfonso Roza

OKlt