

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO Radicación 08 125 886
 Trámite 11
 Evento 379
 Actuación 519
 Oficio 7 **0 9 1 1 3**
 Folios

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad

Vía Nacional

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

No. Solicitud Internacional PCT/EP2007/055188

Fecha de Presentación Internacional 29/Mayo/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 71 a 132	26/Noviembre/2008
	Folios 139 a 141	26/Noviembre/2008
Reivindicaciones:	Folios 133 a 137	26/Noviembre/2008
	Folios 142 a 143	26/Noviembre/2008
Prioridad:	EP 06381025.3	31/Mayo/2006
	EP 07380072.4	08/Marzo/2007

2. Análisis de la Prioridad

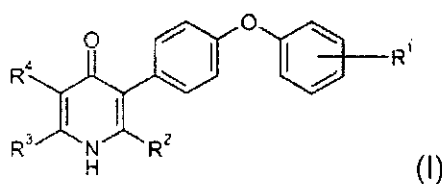
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Nuevos compuestos heterocíclicos".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos útiles en quimioterapia y en el tratamiento de malaria por *Plasmodium falciparum*.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I):



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/44, A61P33/06, C07D213/68

4. De la Solicitud de Patente

Titulo

El titulo es muy general y no define el objeto de de la solicitud, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 - 6 no son claras porque emplean el término "derivado farmacéuticamente aceptable", el cual es impreciso por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Además, según la descripción este término se refiere a "cualquier sal farmacéuticamente aceptable, solvato o profármaco", sin embargo en ninguna parte de la descripción se encuentra como se pueden formar u obtener todos los compuestos citados, ni tampoco que grupos estructurales los pueden conformar, y por tal motivo se obtendrían un número ilimitado de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Se sugiere sustituirlo por un término preciso sustentado en la descripción, o eliminarlo del alcance del pliego reivindicatorio

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 31 de mayo de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	EP 0 447 164	Heterocyclic compounds	18/Septiembre/1991

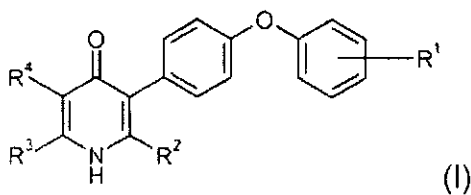
D1

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=0447164A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=19910918&DB=&locale=en_EP, divulga (pg. 6, ln 45) derivados de 4-piridona con actividad contra el parásito *Plasmodium falciparum*, específicamente el compuesto 3-cloro-5-(4-(4-trifluorometoxifenil)-2,6-dimetilpiridin-4(1H)-ona.

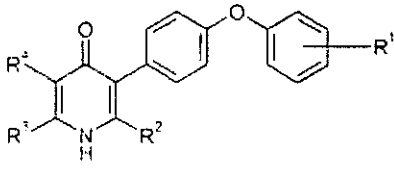
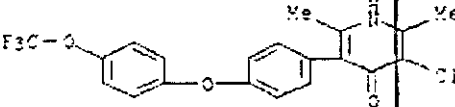
6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula (I):



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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula: 	Compuesto de fórmula (pg. 6, ln 45): 
R ¹ es CF ₃ , OCF ₃	OCF ₃
R ⁴ es halo	Cl
Uno de R ² y R ³ es metilo y el otro -(CH ₂) _n OH o -HC=N-OR ⁵ n es 1-4 R ⁵ es H o alquilo C ₁₋₄	R ² y R ³ son metilo

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga el compuesto 3-cloro-5-(4-(4-trifluorometoxifenoxi)fenil)-2,6-dimetilpiridin-4(1H)-ona, con actividad contra el parásito *Plasmodium falciparum*.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que uno de R² y R³ es metilo y el otro -(CH₂)_nOH o -HC=N-OR⁵.

El efecto que logra el incluir esta característica es que se mejora la solubilidad acuosa de los derivados de 4-piridona.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de modificar los compuestos derivados de 4-piridona conocidos en D1 para que tengan una mejor solubilidad acuosa.

Sin embargo, es conocimiento común para la persona del oficio normalmente versada en la materia que la sustitución en un compuesto de un grupo alquilo por un sustituyente hidrofílico como uno que contenga un hidroxilo aumenta la solubilidad acuosa del compuesto¹.

Por lo tanto, la persona del oficio normalmente versada en la materia cambiaría uno de los radicales metilo por un hidroxilo alquilo al compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:
La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-6 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

¹ Florence, A., Atwood, D.; Physicochemical principles of pharmacy; Fourth edition; Pharmaceutical Press; 2006; Chapter 5; The solubility of drugs, pg. 142-144, table 5.4 (fls 171-173).

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 0 447 164	1 - 6	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 (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
01 JUN. 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisado por: Jacqueline Alfonso Rozo

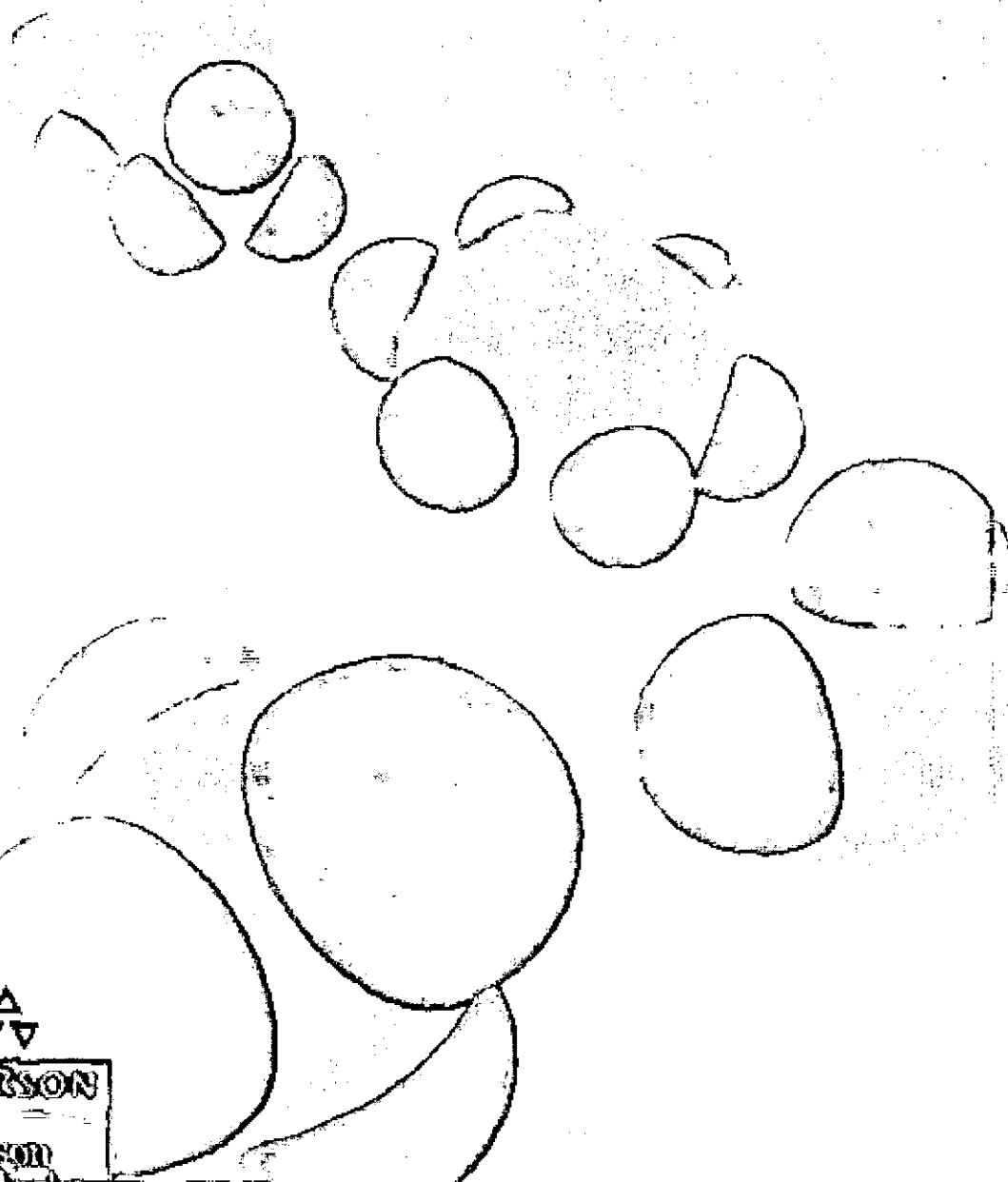
oelt

MORRISON Y BOYD



SONG OF THE BIRDS

THE BIRDS OF THE BIRDS



Versión en español de la obra titulada *Organic Chemistry, Fifth Edition*, de Robert Thornton Morrison y Robert Neilson Boyd, publicada originalmente en inglés por Allyn and Bacon, Inc., Boston, Massachusetts, E.U.A. Copyright © 1987, 1983, 1973, 1966, 1959.

Esta edición en español es la única autorizada.

© 1976, 1985 por Fondo Educativo Interamericano, S.A. de C.V.
© 1990 por Addison Wesley Iberoamericana S.A.

D.R.© 1988 por Addison Wesley Longman de México S.A. de C.V.

Atlacomulco Núm. 500-5º Piso
Col. Industrial Atoto
53519, Naucalpan de Juárez, Edo. de México

CNIEM 1031

Reservados todos los derechos. Ni la totalidad ni parte de esta publicación pueden reproducirse, registrarse o transmitirse, por un sistema de recuperación de información, de ninguna forma, ni por ningún medio, sea electrónico, mecánico, fotoquímico, magnético o electroóptico, por fotocopia, grabación o cualquier otro, sin permiso previo por escrito del editor. El préstamo, alquiler o cualquier otra forma de cesión de uso de este ejemplar requerirá también la autorización del editor o de sus representantes.

ISBN 968 444 340 4

Impreso en México. Printed in Mexico

QUIMICA ORGANICA

Quinta edición

Robert Thornton Morrison

Robert Neilson Boyd

New York University

Versión en español de

Rosa Zugazagoitia Herranz

Universidad Autónoma Metropolitana,

Unidad Xochimilco, México

y

Peter Fiedler

Universidad Técnica Federico Santamaría,

Valparaíso, Chile

Con la colaboración de

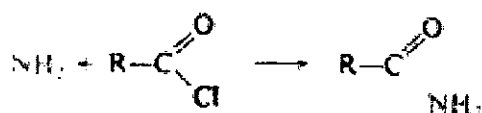
Cristina Rock

Universidad Nacional Autónoma de México

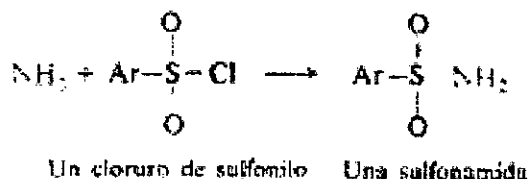
MÉXICO • ARGENTINA • BRASIL • COLOMBIA • COSTA RICA • CHILE

27.1 Conversión de aminas a amidas sustituidas

Hemos visto que el amoníaco reacciona con cloruros de ácidos para dar amidas (Sec. 24.11), compuestos en los que se ha reemplazado $-\text{Cl}$ por el grupo $-\text{NH}_2$. No debe extrañar que

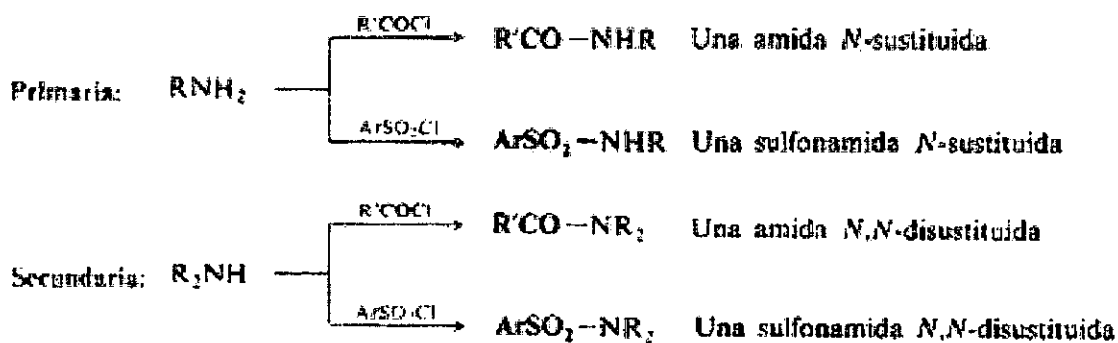


los cloruros de ácidos sulfónicos reaccionen de forma análoga. En estas reacciones, el amoníaco hace las veces de reactivo nucleofílico, atacando al carbono carbonílico o al azufre



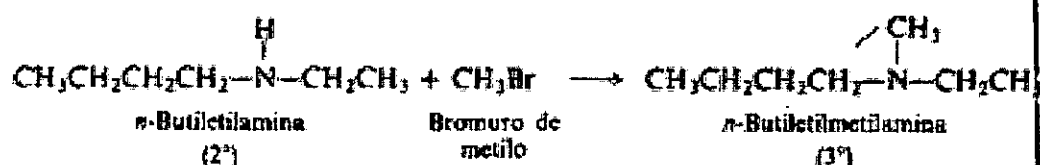
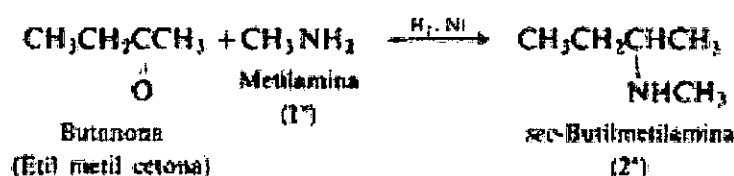
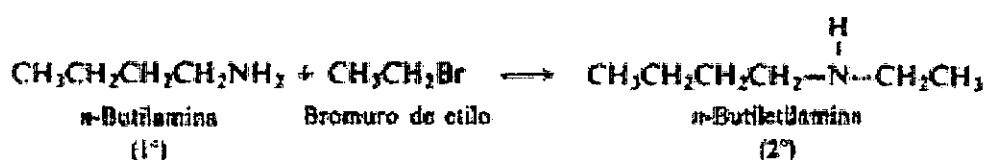
y desplazando un ion cloruro. Durante el proceso, el nitrógeno pierde un protón, que pasa a una segunda molécula de amoníaco u otra base.

Las aminas primarias y secundarias pueden reaccionar de manera similar con cloruros de ácidos para formar **amidas sustituidas**, que son compuestos donde se ha reemplazado $-\text{Cl}$ por el grupo $-\text{NHR}$ o $-\text{NR}_2$:



26.13 Síntesis de aminas secundarias y terciarias

Hasta aquí estudiamos principalmente la síntesis de aminas primarias. Las secundarias y terciarias pueden prepararse por adaptación de alguno de los procedimientos ya descritos: amonólisis de halogenuros y aminación reductiva. Por ejemplo:



Donde se empleó amoníaco para producir una amina primaria, puede usarse ésta para generar una amina secundaria y para obtener una terciaria. En cada una de estas síntesis, la tendencia es llegar más allá de la primera etapa, por lo que se forma la amina del tipo superior al deseado.

26.14 Aminas heterocíclicas

Un tipo de amino compuesto muy importante es aquel donde el nitrógeno forma parte de un anillo. Puesto que un anillo de estas características contiene más de un tipo de átomo —nitrógeno más el carbono usual—, se dice que el compuesto del cual forma parte es *heterocíclico*. (Compárense, por ejemplo, los compuestos heterocíclicos oxigenados en las Secs. 19.9 y 19.10.) Los compuestos heterocíclicos se estudiarán con detalle en el capítulo 35. Sin embargo, es difícil progresar en química orgánica sin encontrar compuestos heterocíclicos nitrogenados —de hecho, ya los hemos descrito como reactivos—, por lo que ahora canalizaremos brevemente algunos de ellos.

Estas aminas heterocíclicas pueden ser saturadas o no, alifáticas o aromáticas; un nitrógeno comparte el anillo con otro o con un heteroátomo de otro tipo: por ejemplo, oxígeno o azufre.