

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

ASUNTO	Radicación	08 129 207
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	07825
	Folios	5

Patente de Invención



Patente de Modelo de Utilidad

Vía Nacional



Vía PCT (Fase Nacional)



Capítulo I



Capítulo II

No. Solicitud Internacional

PCT/EP2007/005098

Fecha de Presentación Internacional

08/Junio/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 5 a 171	04/Diciembre/2008
Reivindicaciones:	Folios 172 a 277	04/Diciembre/2008
Prioridad:	AL 10 2006 027 229.3	09/Junio/2006

2. Análisis de la Prioridad

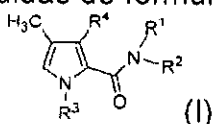
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "4-metil-1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-disustituidas y su uso para la producción de medicamentos".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos derivados de 4-metil-1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-disustituidas.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona 4-metil-1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-disustituidas de fórmula (I):



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D207/40//401/12//403/12//405/12//405/14//417/12.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 21 - 23 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. De la Solicitud de Patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque hace referencia al uso que se le da al compuesto de fórmula I, lo cual no es característica esencial de esta invención. Se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y 2 no son claras, ni concisas, por la definición de la invención en términos de radicales "alquilo", "alquenilo", "alquenilo", "cicloalquilo", "cicloalquenilo", "hetero-alquilo", "hetero-alquenilo", "hetero-alquenilo", "hetero-cicloalquilo", "hetero-cicloalquenilo, entre otros, los cuales, no permiten distinguir la invención del estado de la técnica. Para los radicales alquilo, alquenilo, alquinilo cicloalquilo no se definen los átomos de carbono que los conforman; y para los grupos cicloalquilo, hetero-cicloalquilo, hetero-alquilo, hetero-alquenilo, hetero-alquenilo, no se define el número de átomos de carbono o de miembros que los conforman, y para los "hetero" no se definen los heteroátomos que los conforman. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

Las reivindicaciones 1, 2, 11- 15 no son claras porque emplean el término "solvato", del cual, en ninguna parte de la descripción se menciona la manera en que la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda formarlos u obtenerlos, ni se encuentra soporte de los solvatos que han sido obtenidos en la presente invención. Se sugiere al solicitante eliminar éste término del alcance del pliego reivindicatorio.

Las reivindicación 15, 16 no son claras porque emplean los términos "opcionalmente", "al menos", o, "preferentemente" precediendo una característica, lo cual no es limitativo, porque hace opcional a la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere eliminar o sustituir estos términos.

Las reivindicaciones 18 a 20 no son claras porque indica el uso que puede darse a la composición farmacéutica reivindicada, lo cual no es una característica técnica que defina la invención o aporte algo adicional al medicamento ya reclamado. Se sugiere eliminar estas reivindicaciones del alcance del pliego reivindicatorio.

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

R¹ es alquilo C₁₋₄ opcionalmente sustituido por uno o más grupos seleccionados del grupo de -metilamino, -etilamino, cicloalquilo C₁₋₆, -C(O)O-alquilo-C₁₋₄, morfolin, naftalino, imidazo, tienilo, y pirrolidino piperidino, fenilo o bencilo opcionalmente sustituidos con uno o más grupos seleccionados del grupo de metilo, CF₃, metoxi, etoxi, flúor y cloro; o bencilo opcionalmente sustituidos con uno o más grupos seleccionados del grupo de metilo, metoxi, flúor y cloro.

R² es H, o

R¹ y R² forman juntos con el átomo de nitrógeno al cual están unidos un anillo del grupo seleccionado de piperazina opcionalmente sustituido por uno más grupos seleccionados de alquilo C₁₋₄, -metilamina, -etilamina, cicloalquilo C₁₋₇, p u o-tolilo, piridina, pirazina, y fenilo o bencilo opcionalmente sustituidos con uno o más grupos seleccionados del grupo de metilo, metoxi, flúor y cloro.

R³ es hidrógeno, alquilo C₁₋₄, o, bencilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos metilo, metoxi, CF₃ o halógeno (flúor, cloro o bromo).

R⁴ es furanilo, p-tolilo, o fenilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado de metoxi o cloro.

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 soportados.

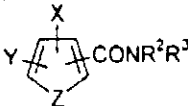
6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad 09 de junio de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud.

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	EP0957099	Heterocyclic carboxamides	17/Noviembre/1999
D2	WO2004/018455	Pyrrole based inhibitors of glycogen synthase kinase 3	04/Marzo/2004

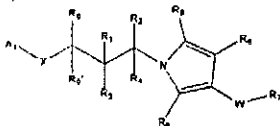
D1

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=0957099A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=19991117&DB=&locale=en_EP, divulga (pg. 2, pár. 0001, pg.13, pár. 0071- pg. 14, pár. 0078, reivindicaciones) 1H-pirrol-2-carboxamidas 3-sustituidas agonistas y antagonistas del receptor de serotonina 5-HT-1 y composiciones farmacéuticas que lo contienen, de estructura:



D2

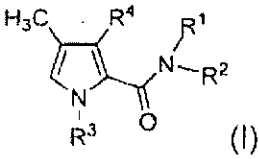
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2004018455&KC=&FT=E&locale=en_EP, divulga (abstract, reivindicaciones) 1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-disustituidas, inhibidoras de glicógeno sintasa quinasa 3, útiles en el tratamiento de diabetes, enfermedad de Alzheimer, enfermedades neurodegenerativas, entre otras, de estructura:



7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en 4-metil-1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-disustituidas de fórmula (I):



Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:		
Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula: <chem>Cc1cc(C(=O)N(R1)R2)n(c1)R3</chem>	Compuesto de fórmula: <chem>YC1=CC(=C(C(=O)N(R2)R3)C=C1X</chem> (reivindicación 1) Z es NQ X es alquilo C ₁₋₆ (-CH ₃)	Compuesto de fórmula: <chem>CC1=CC(=C(C(=O)N(R5)R6)C=C1N(R7)R8</chem> (reivindicación 1) R ₆ es H W es cero y R ₇ es alquilo (-CH ₃)
R ¹ H, alquilo, arilo, cicloalquilo, opcionalmente sustituidos	R ₂ H, alquil o fenil opcionalmente sustituido	R ₅ alquil-carbonil amino, aril-carbonil amino, aralquil-carbonil-amino.
R ² H, alquilo, arilo, cicloalquilo, opcionalmente sustituidos	R ₃ -(CH ₂) _t B, con t entre 0 y 2 y B es H, fenil, naftil o heteroaril opcionalmente sustituidos.	
o, R ¹ y R ² forman juntos con el átomo de nitrógeno que los une un heterocicloalquilo sustituido con un radical R ⁶ , donde R ⁶ es arilo sustituido	No aplica	R ₅ heteroaril-carbonil-amino, heteroaralquil-carbonil-amino
R ³ alquilo, hetero-alquilo, opcionalmente sustituidos	Q alquilo	Alquilo sustituido
R ⁴ fenilo, heterociclo, heteroarilo opcionalmente sustituidos	Y es fenilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos	R ₆ fenilo, heterociclo, heteroarilo opcionalmente sustituidos

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga 1H-pirrol-2-carboxamidas 3-sustituidas agonistas y antagonistas del receptor de serotonina 5-HT-1 (pg. 2, pár. 0001).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el procedimiento de D1 consiste en que las 1H-pirrol-2-carboxamidas 3-sustituidas, tienen una sustitución en la posición 4 correspondiente a un grupo metilo y una sustitución en la posición 1 obligatoria.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de fórmula (I) reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades farmacológicas superiores en comparación con los compuestos del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de compuestos derivados de 1H-pirrol-2-carboxamidas 3-sustituidas alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

El documento D2 divulga compuestos derivados de 1H-pirrol-2-carboxamidas 1,3-

disustituidas, en el cual la posición 1 de la 1H-pirrol-2-carboxamida 3-sustituida está sustituida por un grupo alquilo opcionalmente sustituido (abstract, reivindicación 1).

Así mismo, es la persona del oficio versada en la materia deduciría que la modificación de un hidrógeno por un grupo metilo en la posición 4 del anillo de pirrol no modifica la actividad farmacológica en este tipo de compuestos tal como lo sugiere D2 con la definición de radicales R5, R6, R7 y R8 (reivindicación 1) o el mismo documento D1 con la definición de los radicales X y Y (reivindicación 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, realizaría la modificación de la estructura de D1 de acuerdo a lo sugerido en D2 e incluiría un grupo metilo en la posición 4 del compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Además, D1, divulga composiciones farmacéuticas que contienen el compuesto de fórmula (I) (pg.13, pár. 0071- pg. 14, pár. 0078).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-14 y 17 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1		1 – 14 y 17	Nivel inventivo
D2		1 – 14 y 17	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 15 de MAYO 2012

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