

As. 90.740

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 03-031717- -00005-0000
Fed: 2007-01-25 16:28:23 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 2 PATENTES
E/c: 1 RECDPOSITO
Nº 444 RESPUESTAREQUE Folio 8

Señora

JEFE DE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
E. S. D.

REF: Expediente No. 03 031 717 - solicitud de patente de invención a favor
de UCB, S.A.

Respuesta a oficio No. 12263 del 26 de octubre de 2006

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO, portador de la tarjeta profesional No. 57.492 del C.S.J., obrando como apoderado de la sociedad BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY según lo acredita el documento de poder presentado ante esa división, me permito dar respuesta a las observaciones de carácter técnico y jurídico, relacionadas con la patentabilidad, para la concesión de la patente de acuerdo con la Decisión 486 según el concepto técnico No. 1656 notificado por fijación en lista de fecha 26 de octubre de 2006.

En atención a la objeciones del señor examinador, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio anexo a la presente con 1 - 19 reivindicaciones, las cuales no adicionan materia nueva ni extienden el alcance de la solicitud como se presentó originalmente, y reemplazan completamente el capítulo reivindicatorio presentado anteriormente.

El señor examinador objeta la claridad de las reivindicaciones, argumentando que su alcance es muy amplio y la materia que desean proteger es imprecisa. Al respecto es necesario anotar que la función de las reivindicaciones independientes es la de proporcionar una descripción

general de la invención en su forma más amplia, la cual es luego reducida hasta su forma más específica por aquellas reivindicaciones que dependen de la independiente. Los términos que el señor examinador objeta por ser excesivamente amplios, como los sustituyentes de R^2 , R^3 , R^4 , etc., son especificados más adelante como lo demuestra, a manera de ejemplo, la reivindicación 3, donde se establece la naturaleza de R^1 , o la reivindicación 4 donde se establece que R^2 es C_{3-4} cicloalquilo.

Por lo tanto, respetuosamente solicitamos al señor examinador se retire dicha objeción ya que, como queda comprobado, la invención se encuentra claramente delimitada por las reivindicaciones dependientes, lo cual es el modo correcto de delimitar la invención.

origen de la invención.

En cuanto a la reivindicación 18, esta ha sido eliminada de la solicitud, quedando así subsanada la objeción presentada por el señor examinador. *f's' E.*
Prosigue el señor examinador objetando también las reivindicaciones de uso, con el fin de superar esta objeción dichas reivindicaciones han sido eliminadas de la solicitud.

Así mismo el señor examinador objeta la unidad de invención de la presente solicitud, el nuevo capítulo reivindicatorio anexo elimina aquellas reivindicaciones que hacen referencia a compuestos de fórmula II, IV, X y XII, (quedando así subsanada esta objeción.

En lo referente a la objeción por excepciones a la patentabilidad, se han eliminado aquellas reivindicaciones relacionadas con métodos de tratamiento. ✓

Por último, el señor examinador objeta la novedad de la presente solicitud. Al parecer dicha objeción esta dirigida exclusivamente a las reivindicaciones 22, 23 y 24. Puesto que dichas reivindicaciones han sido eliminadas de la solicitud, ✓ queda entonces superada la objeción presentada por el señor examinador.

En vista de lo anterior, respetuosamente solicitamos el retiro de las objeciones a la presente solicitud, sobre la base del nuevo capítulo reivindicatorio presentado

ya que, en opinión del solicitante, la presente invención cumple con los requisitos de novedad, altura inventiva y aplicabilidad industrial de la Decisión 486.

De la Señora Jefe,

Atentamente,



JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

T.P. No. 57.492 del C.S.J

C.C. 80.410.337 de Usaquén

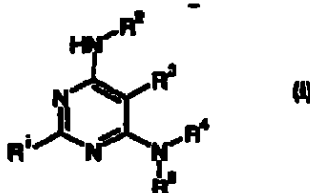
Carrera 7 No. 71-21, Torre B, Of. 402

Bogotá, Enero 25 de 2007

**CH/yg
anexos**

183
180**Reivindicaciones:**

1. Un compuesto que tiene la fórmula I, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables,



en el que

R^1 es C_{3-4} alquilo o C_{3-4} cicloalquilo,

R^2 es cicloalquilo, $\rightarrow + \alpha$?

R^3 es hidrógeno, alquilo, halógeno, hidroxilo, alcoxi o amino,

o R^2R^3 es un grupo de puente de alquileo,

R^4 es hidrógeno o alquilo,

R^5 es cicloalquilo, arilalquilo o heterocicil-alquilo,

o NR^4R^5 es un heterocicilo, que puede estar sustituido, que contiene solamente un heteroátomo el cual es un átomo de hidrógeno o que contiene dos heteroátomos en donde uno es un átomo de nitrógeno y el otro es un átomo de azufre no oxidado,

con la condición de que cuando R^2R^3 es un grupo de puente de alquileo, R^1 es un cicloalquilo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en donde

R^1 es alquilo o C_{3-7} -cicloalquilo,

R^2 es C_{3-7} -cicloalquilo ✓

R^3 es hidrógeno, C_{1-4} -alquilo, halógeno, hidroxilo, alcoxi o amino,

O R^2R^3 es un grupo puente C_{2-4} alquileo.

R^4 es hidrógeno o alquilo,

R^5 es C_{3-7} -cicloalquilo, arilalquilo o heterociclo-alquilo,

o NR^4R^5 es heterociclo, susceptible de sustituirse, que contiene solo un heteroátomo que es un átomo de nitrógeno o que contiene dos heteroátomos

K8A
181

en donde uno es un átomo de nitrógeno y el otro es un átomo de azufre no oxidado,

con la condición que cuando R^2R^3 es un grupo de puente de alquileo R^1 es un cicloalquilo.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en donde R^1 se selecciona del grupo de ciclopropilo, isopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, 2-metil-ciclopropilo y ciclopropilmetilo.

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde R^2 es C_{3-4} cicloalquilo.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5 en donde R^2 se selecciona de ciclopropilo o ciclobutilo.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde R^3 es hidrógeno, metilo, etilo, un átomo de Cl, un átomo de F, un átomo de Br, amino o metoxi.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-4 en donde R^2R^3 es un grupo de puente de alquileo seleccionado de etileno, propileno y butileno.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde R^4 es hidrógeno o C_{1-4} alquilo.

9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 9 en donde R^4 es hidrógeno o metilo.

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde R^5 es 2-(2-tienil)etilo, 2-furilmetilo, 2-tienilmetilo, 4-piridinilmetilo, bencilo, 2-(metilsulfanil)bencilo, 2,6-difluorobencilo, 2-fluorobencilo, 2-nitrobencilo, 3,5-bis(trifluorometil)bencilo, 3,5-difluorobencilo, ciclohexilo, cicloheptilo, 4-metilciclohexilo, o 2,2-difeniletilo.

185
182

11. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-8 en donde NR^4R^5 es 1,3-tiazolidin-3-ilo, 1-azepanilo, 1-azocanilo, 3,5-dimetil-1-piperidinilo, 4-(2-metoxifenil)-1-piperidinilo, 4-(hidroxi(difenil)metil)-1-piperidinilo, 4-(trifluorometil)-1-piperidinilo, 4,4-difluoro-1-piperidinilo, 4,4-dimetil-1-piperidinilo, 4-amido-1-piperidinilo, 4-bencil-1-piperidinilo, 4-carboxi-1-piperidinilo, 4-ciano-4-fenil-1-piperidinilo, 4-etoxicarbonil-1-piperidinilo, 4-etil-1-piperidinilo, 4-etil-4-metil-1-piperidinilo, 4-hidroxi-1-piperidinilo, 4-hidroxi-4-fenil-1-piperidinilo, 4-hidroximetil-1-piperidinilo, 4-metil-1-piperidinilo, 4-metileno-1-piperidinilo, 4-ona-1-piperidinilo, 3,6-dihidro-1(2H)-piridinilo, 3-azabicyclo[3.2.1] oct-3-ilo, 4-piridinilmetilo, 4-tiomorfolinilo, 2-ona-1-azapanilo, 3,4-dihidro-2(1H)-isoquinolinilo, 1,4-dioxa-8-azaespiro[4.5]dec-8-ilo, 1,3,3-trimetil-6-azabicyclo[3.2.1]oct-6-ilo, octahidro-2(1H)-isoquinolinilo o 8-azaespiro[4.5]dec-8-ilo.

12. Un compuesto seleccionado de 6-(1-azepanil)-N,2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; N-[6-(1-azepanil)-5-cloro-2-ciclopropil-4-pirimidinil]-N-ciclopropilamina; 6-azepan-1-il-5-bromo-N,2-diciclopropilpirimidin-4-amina; 6-(1-azepanil)-N,2-diciclopropil-4-pirimidinamina; 6-(1-azepanil)-N⁴,2-diciclopropil-4,5-pirimidinadiamina, 6-azepan-1-il-N-ciclopropil-2-isopropil-5-metilpirimidin-4-amina; 6-(1-azepanil)-N-ciclopropil-5-metil-2-(2-metilciclopropil)-4-pirimidinamina, 6-(1-azocanil)-N, 2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-metil-6-[4-(trifluorometil)piperidin-1-il]pirimidin-4-amina; N,2-diciclopropil-6-(4,4-difluoro-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-ciclopropil-6-(4,4-dimetil-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-6-(4-etil-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-5-etil-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-5-metil-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamida, N-ciclopropil-5-metil-2-(2-metilciclopropil)-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-5-metil-6-(4-metileno-1-piperidinil)-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-6-(3,6-dihidro-1(2H)-piridinil)-5-metil-4-pirimidinamida; 6-(3-azabicyclo[3.2.1] oct-3-il)-N,2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-5-etil-6-(4-tiomorfolinil)-4-pirimidinamida; N,2-diciclopropil-5-metil-6-(4-tiomorfolinil)-4-pirimidinamida; N⁴, 2-diciclopropil-N⁶-(2,6-difluorobencil)-5-metil-4,6-pirimidinadiamina; N⁴-ciclohexil-N⁶-ciclopropil-2-(2-metilciclopropil)pirimidina-4,6-diamina; N⁴,2-diciclopropil-5-metil-N⁶-(4-metilciclohexil)-4,6-pirimidinadiamina; 6-(1-



azepanil)-N-ciclopentil-2-ciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; 4-azepan-1-il-2-ciclopropil-5,6,7,8-tetrahidro-pirido[2,3-d]pirimidina y 4-azepan-1-il-2-ciclopropil-6,7,8,9-tetrahidro-pirimido[4,5-b]azepina, o sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

13. Un compuesto seleccionado de 6-(1-azepanil)-N,2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; N-[6-(1-azepanil)-5-cloro-2-ciclopropil-4-pirimidinil]-N-ciclopropilamina; 6-azepan-1-il-5-bromo-N, 2-diciclopropilpirimidin-4-amina; 6-(1-azepanil)-N⁴,2-diciclopropil-4,5-pirimidinadiamina; 6-azepan-1-il-N-ciclopropil-2-isopropil-5-metilpirimidin-4-amina; 6-(1-azepanil)-N-ciclopropil-5-metil-2-(2-metilciclopropil)-4-pirimidinamina; 6-(1-azocanil)-N,2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-metil-6-[4-(trifluorometil)piperidin-1-il]pirimidin-4-amina; N,2-diciclopropil-6-(4,4-difluoro-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-6-(4,4-dimetil-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-6-(4-etil-1-piperidinil)-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-etil-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamina; N-ciclopropil-5-metil-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamina; N-ciclopropil-5-metil-2-(2-metilciclopropil)-6-(4-metil-1-piperidinil)-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-metil-6-(4-metileno-1-piperidinil)-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-6-(3,6-dihidro-1(2H)-piridinil)-5-metil-4-pirimidinamina; 6-(3-azabicyclo[3.2.1]oct-3-il)-N,2-diciclopropil-5-metil-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-etil-6-(4-tiomorfolinil)-4-pirimidinamina; N,2-diciclopropil-5-metil-6-(4-tiomorfolinil)-4-pirimidinamina; N⁴,2-diciclopropil-N⁶-2, 6-difluorobencil)-5-metil-4,6-pirimidinadiamina; N⁴,2-diciclopropil-5-metil-N⁶-(4-metilciclohexil)-4,6-pirimidinadiamina; 6-(1-azepanil)-N-ciclopentil-2-ciclopropil-5-metil-4-pirimidinamida; 4-azepan-1-il-2-ciclopropil-5,6,7,8-tetrahidro-pirido[2,3-d]pirimidina y 4-azepan-1-il-2-ciclopropil-6,7,8,9-tetrahidro-pirimido[4,5-b]azepina, o sus sales farmacéuticamente aceptables de los mismos.

14. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes como un enantiómero puro.

15. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva de un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones

186
184

precedentes, en combinación con un diluyente o vehículo farmacéuticamente aceptable.

16. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 16 para su administración por inhalación.

17. Un compuesto seleccionado entre el conjunto que consta de 4,6-dicloro-2-ciclopropil-5-fluoropirimidina, 4,5,6-tricloro-2-ciclopropilpirimidina, 4,6-dicloro-2-ciclopropil-5-pirimidinil-metil-eter, 4,6-dicloro-2-ciclopropil-5-etilpirimidina, 4,6-dicloro-2-(2-metilciclopropil)pirimidina, 4,6-dicloro-5-metil-2-(2-metilciclopropil)pirimidina, 4,6-dicloro-2-(ciclopropilmetil)-5-metilpirimidina, 4,6-dicloro-2-ciclobutil-5-metilpirimidina, 4,6-dicloro-2-isopropil-5-metilpirimidina y 4,6-dicloro-2-ciclopentil-5-metilpirimidina.

18. 6-(1-azepanil)-N,2-diciclopropil-5-nitro-4-pirimidinamina.

19. 2-ciclopropil-6, 7-dihidro-5H-pirolo[2,3-d]pirimidin-4-ol.

107
185

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, DC, 19 de marzo de 2007

Apoderado: Juan Pablo Cadena Sarmlento

Ofi

ASUNTO

Radicación: 03-31717

Trámite 002

Evento 001

Actuación 430 4587

Folios

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento nuevamente en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados:

- ◆Capítulo descriptivo, folios 07 a 91;
- ◆Capítulo reivindicatorio modificado, folios 183 a 186;
- ◆1º examen de forma, folio 103;
- ◆Respuesta al 1º examen de forma, folio 104;
- ◆Solicitud de la cual se reivindica prioridad y la traducción exigida, folios 109 a 150;
- ◆2º examen de forma, folio 151;
- ◆Solicitud del examen de patentabilidad, folios 153 a 155;
- ◆Examen de patentabilidad, 165 a 179;
- ◆Respuesta al examen de patentabilidad, folios a 186.

Objeto de la invención:

El título de la invención "COMPUESTOS QUÍMICOS CON ACTIVIDAD DOBLE, PROCEDIMIENTOS PARA SU PREPARACIÓN Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS"

Tienen como objeto los compuestos derivados representados por 2-clcloalquilo o alquilo-pirimidine-4,6-diamina disustituidas, con forma de una formula Markush con significados para los sustituyentes indefinidos (nombrados de manera genérica).

El campo de la invención, según la Clasificación Internacional de Patentes: A61K31/505.

Claridad de la solicitud:

En el artículo 30 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina se establece: *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción"*.

1- No se modificó tal como se le indicó. El título debe estar acorde con el capítulo reivindicatorio y descriptivo, los cuales se refieren a derivados de 2-cicloalquilo o alquilo-pirimidina-4,6-diamina sustituidas.

-Las reivindicaciones 1, sigue presentando faltas de claridad, porque su alcance es ilimitado; puesto que los sustituyentes están denominados de manera genérica para no determinar inequívocamente una estructura; tal como por ejemplo " R^2 es cicloalquilo, $R^2 R^3$ es un puente de alquileo, R^4 es alquilo, alcoxi,... R^5 es un cicloalquilo, arilo o heterociclil-alquilo..., $N R^4 R^3$ es un heterociclilo que puede estar sustituido, que contiene un solo heteroátomo que es un átomo de nitrógeno o que contiene dos heteroátomos en los que uno de los heteroátomos es un átomo de nitrógeno y el otro es un átomo de azufre no oxidado....", y no es por cuestiones de esta oficina que impone el limitar claramente el alcance de las invenciones cualquiera que sea su naturaleza. Ahora bien respecto a la opinión del señor memorialista que dice *"como queda comprobado, la invención se encuentra limitada por las reivindicaciones dependientes, lo cual es el modo correcto de delimitar la invención"*.

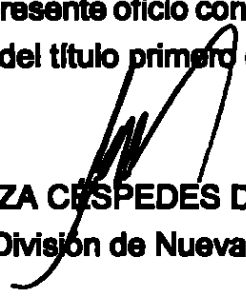
Eso en el estudio de patentes no es cierto, en primer lugar la legislación es clara, no dice, solo deben estar delimitadas las reivindicaciones independientes; en segundo lugar las reivindicaciones independientes solamente son maneras particulares de la invención general. Entonces se debe delimitar perfectamente la materia para la que se busca protección, porque el alcance de la protección conferida por una patente de invención está determinado por el contenido de las reivindicaciones, obsérvese que no dice: únicamente delimitese las reivindicaciones independientes, es todas las reivindicaciones, por lo tanto todas deben cumplir con las normas establecidas, en las D-485 de la comisión de la Comunidad Andina, por lo cual no puede

189
187

ser considerado que satisface el requerimiento de claridad y que este perfectamente definida la materia para la cual se solicita la protección mediante patente, tal como lo establece el artículo 30 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina.

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 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.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
19 ABR 2007

CONCEPTO TÉCNICO No. 577	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202012
--------------------------	--------------------------------------