

RAD: 11-461- -6	FECHA: 2013-04-02 18:04:24
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DILIA MARIA RODRIGUEZ D ALEMAN

Asunto:	Radicación:	11-461- -6
	Trámite:	11
	Evento:	378
	Actuación:	519
	Oficio:	5990
	Folios:	5

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2009/049027				
Fecha de Presentación Internacional	29/06/2009				

Descripción:	Fls. 20 a 112	4/01/2011
Reivindicaciones:	Fls. 113 a 135	4/01/2011
	Fls. 240 a 259	14/04/2011
Prioridad:	US 61/076.752	30/06/2008

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Teniendo en cuenta que el solicitante pagó la tasa correspondiente a las reivindicaciones adicionales, se procederá a estudiar el capítulo reivindicatorio modificado.

Título de la solicitud: "PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE DERIVADOS DE PIRIMIDINA SUSTITUIDOS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de un proceso de síntesis para derivados de pirimidina con un alto rendimiento y pureza.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) derivado de pirimidina.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/497.

4 . De la solicitud de patente

Título

El título de la solicitud debe especificar más el compuesto que se obtiene mediante el proceso que se reivindica, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

5 . Análisis de la(s) oposición(es)

No se presentaron oposiciones al objeto reivindicado.

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 la cual se invoca prioridad: 30 de junio de 2008.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2007/0244126	"Benzoimidazol-2-yl pyrimidines and pyrazines as modulators of the histamine H4 receptor"	18/Octubre/2007
D2	US6372743	"Certain alkylene diamine-substituted pyrazolo (1,5-a)-1,5-pyrimidines and pyrazolo (1,5-a) 1,3,5-triazines"	16/Abril/2002

El documento D1^[1] divulga compuestos derivados de benzoimidazol-2-il-pirimidina, sus composiciones y procesos para obtenerlos (Pág. 9, párrafo: 0096-0098, 0115, 0183).

El documento D2^[2] divulga derivados de alquilen-diamino-pirazolo[1,5-a]-1,5-pirimidinas y sus procesos de preparación (Col 33, Esquemas: 6, 8, 10, 11; Col. 35 línea 57, Col 36, líneas 9 y 10).

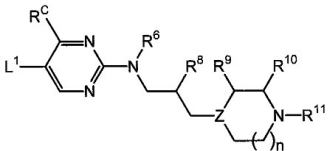
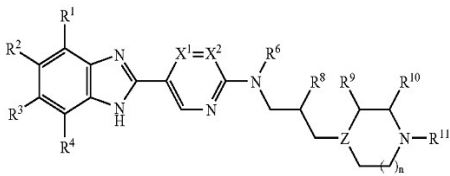
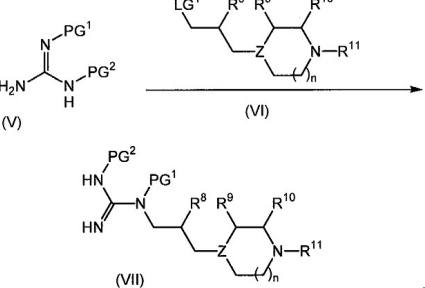
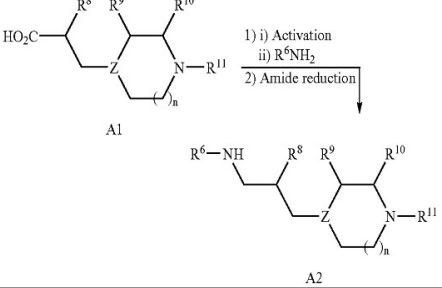
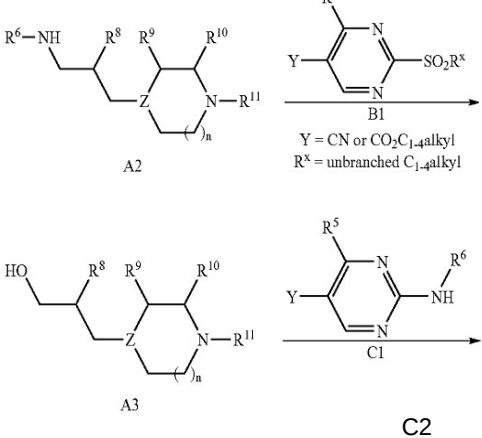
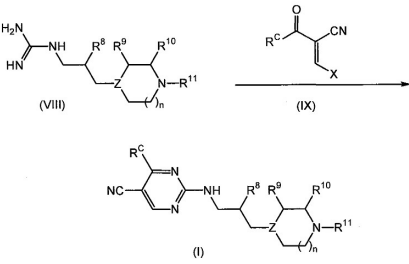
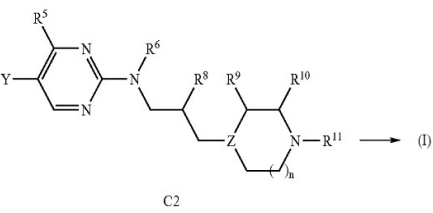
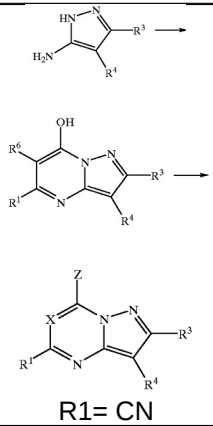
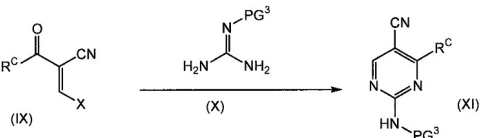
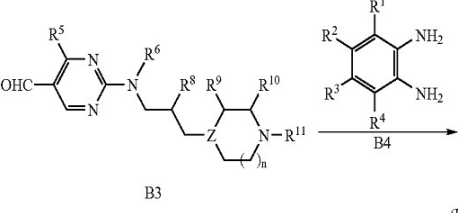
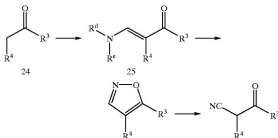
7 . Examen de patentabilidad (Art 14 D486)

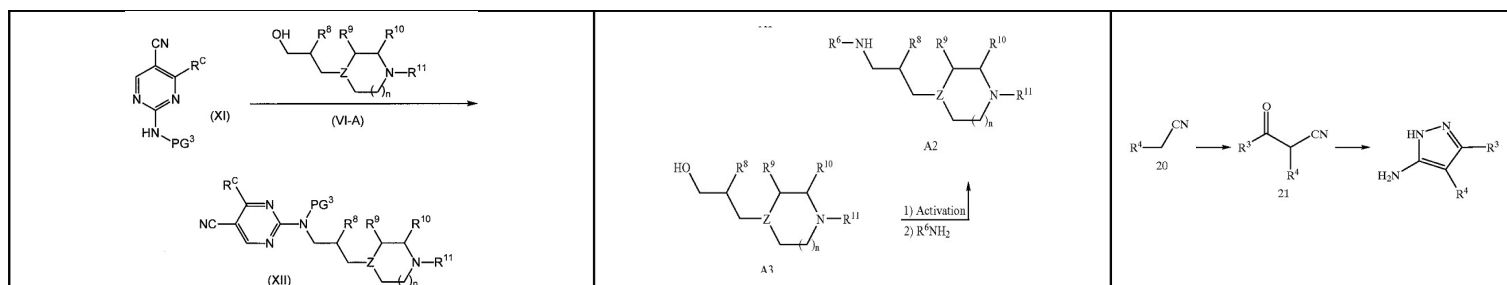
[1] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2007244126A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20071018&DB=EPODOC&locale=en_EP
[2] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=6372743B1&KC=B1&FT=D&ND=3&date=20020416&DB=EPODOC&locale=en_EP

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: "Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula I y sales farmacéuticamente aceptables de éstos..." (Fl. 240).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Proceso de obtención de: 	Proceso de obtención de: 	No menciona
		No menciona
		No menciona
		
		



Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan el proceso de los derivados de pirimidina de fórmula I de la presente solicitud.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el proceso del documento D1 consiste en que el significado para el equivalente de L1 no es CN, como lo es en la presente solicitud y R6 no es un grupo protector PG3 como en la presente solicitud.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el proceso del documento D2 consiste en que esta anterioridad no describe la protección y desprotección del reactivo de guanidina similar al compuesto de fórmula VIII de la presente solicitud.

El efecto que confiere la diferencia es que se logra una síntesis de un derivado de pirimidina más eficiente.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el procedimiento conocido en el documento D1 para hacerlo más eficiente”.

Sin embargo, la utilización de un reactivo de oxobutanonitrilo ciano sustituido condensando el reactivo de oxobutanonitrilo con una guanidina protegida y la amina secundaria de VI-A que elimina cualquier reacción secundaria con otros grupos amino para aumentar la eficiencia de la síntesis, ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a un procedimiento de preparación de un anillo ciano-pirimidina mediante la reacción de una amina primaria con un oxobutanonitrilo de fórmula IX para producir la pirimidina que corresponde al compuesto de fórmula I de la presente solicitud (Col. 27, líneas 45 a 54; Col. 30, líneas 1 a 30; Col. 32, líneas 48 a 67; Col. 33, líneas 1 a 39; esquemas 6, 8, 10 y 11).

La persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada con la tarea de proveer el procedimiento de obtención del compuesto de fórmula I con un rendimiento mejorado puede darse cuenta que a partir de los documentos D1 y D2 se puede diseñar una síntesis más eficaz de multi-anillo de pirimidina sustituido que permita la variación de los sustituyentes del anillo de pirimidina unido directamente a un aminoetilo-piperazina, utilizando el reactivo de oxobutanonitrilo ciano sustituido.

Así entonces, habría sido evidente para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente que mediante la protección de los grupos amina con grupos Cbz, efectivamente se puede bloquear cualquier reacción secundaria con las funciones aminas, con el fin de lograr una reacción más limpia con un rendimiento más alto del producto deseado y el producto final tendría que ser desprotegido usando condiciones adecuadas para el grupo protector, tal como hidrogenación con Pd / C para eliminar un grupo Cbz.

En el documento D1 no se dan a conocer los equivalentes molares de los agentes. No obstante, habría sido evidente para la persona del oficio normalmente versada en la materia que el sistema de agente de acoplamiento tendría que estar presente en un ligero exceso con el fin de conducir la reacción de acoplamiento.

En consecuencia, era obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia referirse a las enseñanzas divulgadas en el documento D2 con el fin de mejorar el rendimiento del proceso descrito en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud.

En ausencia de un efecto inesperado mostrado por el procedimiento reivindicado en relación con el procedimiento del arte anterior, la solución al problema técnico parece ser obvia a la luz de los documentos D1 y D2.

Conclusión:
La reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18). En cuanto a las reivindicaciones dependientes y las relacionadas con los compuestos intermediarios, no se observa que tengan alguna característica adicional y que pueda considerarse inventiva, por lo tanto, tampoco cumplen con el requisito en mención.

8. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2007/0244126	1 a 42	Nivel inventivo
D2	US6372743	1 a 42	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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2013-04-09

Elaboró: Lina Patricia Forero Tobaría
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza