



No. 03-079617- -00007-0000

Fecha: 2008-01-16 16:58:00 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Ref: Expediente No. 03.079.617

Solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE PIRAZOL."

Solicitante: PFIZER INC.

**RESPUESTA AL OFICIO No. 13302, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 378,**  
**DE FECHA 19 DE OCTUBRE DE 2007.**  
**(SEGUNDO EXAMEN DE FONDO)**

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal previsto en el artículo 45 de la Decisión 486:

1. En primer lugar y con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un Capítulo Reivindicatorio Modificado, compuesto por 25 reivindicaciones, en el cual se eliminó toda referencia al término "derivado".

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

2. a- El Examinador argumenta que el título modificado de la solicitud no se debe referir a términos o frases amplias y especulativas como por ejemplo "opcionalmente sustituidos", así como al uso de los compuestos reivindicados.

b- i) Es importante establecer que la descripción de la presente solicitud es clara en indicar que cierto átomo en las moléculas de la invención puede eventualmente presentar una sustitución. De hecho, al observar los diferentes ejemplos se establece claramente que las moléculas de la presente invención, representadas por la Formula I, pueden o no presentar

#  
681  
681

sustituciones en algunos de sus átomos sin ver alterada su actividad. Adicionalmente, en el nuevo título se indican específicamente las posiciones en las que opcionalmente se pueden efectuar dichas sustituciones, lo cual es completamente coherente con la materia que se encuentra enteramente sustentada en la descripción y en los ejemplos.

De otra parte, subrayo que la finalidad del Título de una patente de invención es permitir al lector reconocer rápidamente el sector tecnológico al que se refiere la invención, así como la materia desarrollada. En el caso de los compuestos pirazol-4-ariloxi de esta solicitud, considero fundamental que el lector pueda determinar con una primera aproximación a la patente que dichos compuestos resultan útiles y se ocupan de la inhibición de la enzima transcriptasa reversa. Sin embargo, aunque solicito respetuosamente que el Examinador reconsidere su posición respecto de la inclusión de la funcionalidad de la invención en el título, con el ánimo de facilitar el trámite de la presente invención, y sin que esto signifique una aceptación de los argumentos del Examinador, me permito modificar el título de la invención, de tal manera que éste no hace referencia a su funcionalidad, como sigue:

**"COMPUESTOS DE PIRAZOL-4-ARILOXI OPCIONALMENTE SUSTITUIDOS EN 1,3,5"**

3. a- Según el Examinador, en el capítulo reivindicatorio siguen apareciendo términos que no son concisos como por ejemplo: "derivado", "solvato" y "opcionalmente sustituidos"

b- i) El término derivado fue retirado por completo del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

ii) Tal como se mencionó anteriormente la expresión "opcionalmente sustituido" se encuentra precisada apropiadamente en la descripción, en donde se indica claramente y de manera directa que cierto átomo en las moléculas de la invención puede eventualmente presentar una sustitución. Lo mismo sucede con el término "solvato" que contempla exclusivamente a las moléculas la invención (ya definidas estructuralmente) que en estado sólido, puedan llegar a conservar restos del solvente utilizado en su procesamiento.

Así entonces, habiendo precisado la estructura molecular nueva e inventiva que define las moléculas de la invención (representadas por la Formula I) y que es la responsable de la actividad biológica, el inventor está en su derecho de reclamar protección para la totalidad de éste concepto inventivo desarrollado y cualquiera de sus modalidades. Es decir, está en su derecho de reclamar protección para las realizaciones en las que las moléculas ya definidas a través de sus

3  
602  
682

características técnicas, pueden o no incluir dichos sustituyentes y pueden o no incluir moléculas de solvente en su estado sólido.

Las nociones más elementales del sistema de patentes permiten la inclusión de materia análoga dentro de un mismo concepto inventivo, asumiendo, claro está, que el efecto técnico reclamado se reproduzca en dicha materia cercana a la ejemplificada. Es decir, el solicitante tiene el derecho a reclamar un concepto inventivo que abarque no solamente las modalidades expresamente descritas, sino también aquellas modalidades que constituyan variaciones de las modalidades descritas (como son las sales, hidratos, solvatos de los compuestos reivindicados). De no ser así, es competencia del Examinador indicar qué modalidades de la invención se encontrarían por fuera del concepto inventivo al cual el solicitante tendría legítimo derecho de reclamar, por no responder al efecto técnico divulgado en el Capítulo Descriptivo.

Por lo tanto, insisto respetuosamente que los términos “opcionalmente sustituido” y “solvato”, son perfectamente entendibles por cualquier persona medianamente versada en la materia, y no abarcan materia que pueda ir más allá de aquellas moléculas novedosas desarrolladas por el solicitante.

4. a- El Examinador considera que los derivados de compuestos de formula I, reivindicados en las clausulas 1 a 25 no guardan unidad de invención con los compuestos de Formula I correspondientes a compuestos con un núcleo pirazol-4-ariloxi.

b- i) En primer lugar, el término “derivado” fue retirado por completo del Capítulo Reivindicatorio Modificado. De esta forma, las nuevas reivindicaciones se limitan exclusivamente a aquellos compuestos que comparten un mismo núcleo estructural correspondiente únicamente a pirazol-4-ariloxi y con una actividad similar.

5. Para terminar, deseo poner bajo su conocimiento el hecho que en relación con la invención de la presente solicitud, se ha otorgado el privilegio de patente en diversas jurisdicciones a lo largo del mundo entero, como es por ejemplo en: Europa, Estados Unidos, Argelia, Bangladesh, Convención de Patentes de Eurasia, Georgia, Honduras, India, Japón, Líbano, Malta, México, Mongolia, Marruecos, Nueva Zelanda, Nigeria, O.A.P.I., Panamá, Perú, Singapur, Sur África, Sur Corea y Ucrania.

Si bien es cierto que las concesiones de patentes en oficinas de otros países no son vinculantes en el sentido que obliguen a la SIC a tomar una decisión en el mismo sentido, sí considero que dichas concesiones sugieren el cumplimiento de los requisitos de patentabilidad de la materia

4 683  
683

revindicada, ya que los criterios de evaluación y estudio aplicados para determinar la novedad y nivel inventivo resultan equivalentes a los que la Superintendencia debe emplear. Tan cierto es lo anterior, que el Manual Andino de Patentes, al comentar el Artículo 46 de la Decisión 486, establece que una Oficina nacional competente podrá reconocer los resultados de exámenes de novedad o de patentabilidad efectuados respecto a la solicitud extranjera equivalente, como suficientes para acreditar el cumplimiento de las condiciones de patentabilidad.<sup>1</sup>

De nuevo, aunque patentes otorgadas en otras jurisdicciones no son vinculantes para la oficina nacional, sí corresponden a un fuerte indicio sobre el cumplimiento de los requisitos de patentabilidad de la invención reivindicada, puesto que los requisitos de novedad, nivel inventivo son requisitos universales y objetivos que se evalúan alrededor del mundo bajo estándares similares.

6. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador han sido resueltas y por consiguiente solicito se expida un examen de fondo pronunciándose sobre los requisitos de patentabilidad, en particular respecto de la novedad y el nivel inventivo de la presente invención. De no haber objeciones adicionales en materia de patentabilidad, respetuosamente solicito se proceda con la concesión del privilegio de patente para la presente invención.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexos:

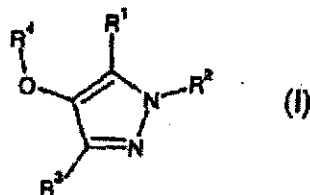
- Capítulo Reivindicatorio Modificado.
- Recibo de pago correspondiente a la tasa de modificación.

<sup>1</sup> Manual Andino de Patentes, Capítulo III, 7.3.

57684  
684

**CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO**  
(segundo examen de fondo)

1. Un compuesto de fórmula (I)



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,  
en la que:

R<sup>1</sup>, H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> o -OR<sup>7</sup>, estando dichos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y

cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> opcionalmente sustituidos con halo, -CN,

-OR<sup>10</sup>, S(O)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>10</sup>, -OCONR<sup>5</sup>R<sup>10</sup>, -NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>,

-NR<sup>5</sup>COR<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>10</sup>, -NR<sup>5</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>10</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> o R<sup>10</sup>;

R<sup>2</sup>, es H,

alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o R<sup>9</sup>, estando dicho alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>

opcionalmente sustituido con halo, -OR<sup>5</sup>, OR<sup>12</sup>, -CN, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>,

-OCONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -C(=NR<sup>5</sup>)NR<sup>5</sup>OR<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>12</sup>,

-NR<sup>5</sup>COR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>COR<sup>8</sup>, -NR<sup>5</sup>COR<sup>12</sup>, -NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>,

-NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup>;

R<sup>3</sup> es H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, estando dicho

alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> opcionalmente sustituido con halo, -CN, -OR<sup>5</sup>,

-CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -OCONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -NR<sup>6</sup>R<sup>6</sup>, -NR<sup>5</sup>COR<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>,

-NR<sup>5</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup>;

R<sup>4</sup> es fenilo sustituido con R<sup>8</sup>, halo,

-CN, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> o

alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

685

cada  $R^5$  es independientemente H, alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_7$  o, cuando dos grupos  $R^5$  están unidos al mismo átomo de nitrógeno, estos dos grupos, tomados conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, representan azetidínilo, pirrolidínilo, piperidínilo, homopiperidínilo, piperazinilo, homopiperazinilo o morfolínilo, estando dichos azetidínilo, pirrolidínilo, piperidínilo, homopiperidínilo, piperazinilo, homopiperazinilo y morfolínilo opcionalmente sustituidos con alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_7$ ;

cada  $R^6$  es independientemente H, alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_7$ ;

$R^7$  es alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_7$ ;

$R^8$  es un grupo heterocíclico aromático de cinco o seis miembros que contiene (i) de 1 a 4 heteroátomos de nitrógeno o (ii) 1 ó 2 heteroátomos de nitrógeno y 1 heteroátomo de oxígeno o azufre o (iii) 1 ó 2 heteroátomos de oxígeno o azufre, estando dicho grupo heterocíclico opcionalmente sustituido con halo, oxo,  $-CN$ ,  $-COR^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  $-SO_2NR^5R^5$ ,  $-NR^5SO_2R^5$ ,  $-OR^5$ ,  $-NR^5R^5$ ,  $-(alquilenos\ C_1-C_6)-NR^5R^5$ , alquilo  $C_1-C_6$ , fluoroalquilo ( $C_1-C_6$ ) o cicloalquilo  $C_3-C_7$ ;

$R^9$  es un grupo heterocíclico de cuatro a siete miembros, saturado o parcialmente insaturado, que contiene (i) 1 ó 2 heteroátomos de nitrógeno o (ii) 1 heteroátomo de nitrógeno y 1 heteroátomo de oxígeno o 1 heteroátomo de azufre o (iii) 1 heteroátomo de oxígeno o azufre, estando dicho grupo heterocíclico opcionalmente sustituido con oxo, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$ ,  $-SO_2R^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  $-COOR^5$ ,  $-CO-(alquilenos\ C_1-C_6)-OR^5$  o  $-COR^5$  y opcionalmente sustituido en un átomo de carbono que no es adyacente a un heteroátomo con halo,  $-OR^5$ ,  $-NR^5R^5$ ,  $-NR^5COR^5$ ,  $-NR^5COOR^5$ ,  $-NR^5CONR^5R^5$ ,  $-NR^5SO_2R^5$  o  $-CN$ ;

7 686  
686

$R^{10}$  es H,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{13}$ , alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$  o  
-(alquil  $C_1-C_6$ )-(cicloalquilo  $C_3-C_7$ ), estando dichos alquilo  
 $C_1-C_6$  y cicloalquilo  $C_3-C_7$  opcionalmente sustituidos con  $-OR^5$ ,  
 $-OR^{13}$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{13}$  o  $-COR^{13}$ ;

$R^{11}$  es H, alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_7$ , estando dichos  
alquilo  $C_1-C_6$  y cicloalquilo  $C_3-C_7$  opcionalmente sustituidos  
con  $-OR^5$ ,  $-NR^5R^5$ ,  $-NR^5COR^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  $R^8$  o  $R^9$ ;

$R^{12}$  es alquilo  $C_1-C_6$  sustituido con  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $-OR^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  
 $-NR^5COR^5$  o  $-NR^5R^5$ ;

$R^{13}$  es fenilo opcionalmente sustituido con halo,  $-CN$ ,  $-COR^5$ ,  
 $-CONR^5R^5$ ,  $-SO_2NR^5R^5$ ,  $-NR^5SO_2R^5$ ,  $-OR^5$ ,  $-NR^5R^5$ ,  $-(alquilenos\ C_1-C_6)-$   
 $NR^5R^5$ , alquilo  $C_1-C_6$ , haloalquilo ( $C_1-C_6$ ) o cicloalquilo  $C_3-C_7$ ;

y

x es 0, 1 ó 2.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en  
el que  $R^1$  es H, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_7$  o  $-OR^7$ ,  
estando dicho alquilo  $C_1-C_6$   
opcionalmente sustituido con halo,  $-OR^{10}$ ,  $-NR^{10}R^{11}$ ,  $-NR^5COR^{10}$  o  
 $R^{10}$ .

3. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación  
precedente, en el que  $R^2$  es H,  
alquilo  $C_1-C_6$ , alquilenilo  $C_3-C_6$  o  $R^9$ , estando dicho alquilo  $C_1-C_6$   
opcionalmente sustituido con  $-OR^5$ ,  $OR^{12}$ ,  $-CN$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  
 $-C(=NR^5)NR^5OR^5$ ,  $-CONR^5NR^5R^5$ ,  $-NR^6R^6$ ,  $-NR^5R^{12}$ ,  $-NR^5COR^8$ ,  $-NR^5COR^{12}$ ,  
 $-NR^5CO_2R^5$ ,  $R^8$  o  $R^9$ .

4. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación  
precedente, en el que  $R^3$  es H o alquilo  $C_1-C_6$ .

8  
687  
687

5. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>4</sup> es fenilo sustituido con halo, -CN o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>3</sup> es pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, furanilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo o pirazinilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con halo, -CN, -COR<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -(alquilenos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, fluoro(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>3</sup> es imidazolilo, pirazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, piridinilo, pirazinilo o pirimidinilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con halo, -CN, -COR<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -(alquilenos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, fluoroalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>3</sup> es imidazolilo, pirazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, piridinilo, pirazinilo o pirimidinilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup> o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

600  
658

9. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>9</sup> es azetidínilo, tetrahidropirrolilo, piperidínilo, azepínilo, oxetanilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, oxepínilo, morfolínilo, piperazínilo o diazepínilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -COOR<sup>5</sup>, -CO-(alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>5</sup> o -COR<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido en un átomo de carbono que no es adyacente a un heteroátomo con halo, -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>COR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>COOR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup> o -CN.

10. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>9</sup> es azetidínilo, piperidínilo, tetrahidrofuranilo, piperazínilo o morfolínilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -COOR<sup>5</sup>, -CO-(alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>5</sup> o -COR<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido en un átomo de carbono que no es adyacente a un heteroátomo con halo, -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>COR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>COOR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup> o -CN.

11. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que R<sup>9</sup> es azetidínilo, piperidínilo, tetrahidrofuranilo, piperazínilo o morfolínilo, estando cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -COOR<sup>5</sup>, -CO-(alquileno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-OR<sup>5</sup> o -COR<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido en un átomo de carbono que no es adyacente a un heteroátomo con -OR<sup>5</sup> o -NR<sup>5</sup>COR<sup>5</sup>.

~~689~~  
689

12. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{10}$  es H,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{13}$ , alquilo  $C_1-C_6$  o  $-(\text{alquil } C_1-C_6) - (\text{cicloalquilo } C_3-C_7)$ , estando dicho alquilo  $C_1-C_6$  opcionalmente sustituido con  $-OR^5$ ,  $-OR^{13}$ ,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{13}$  o  $-COR^{13}$ .

13. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{10}$  es H,  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{13}$ , alquilo  $C_1-C_6$  o  $-(\text{alquil } C_1-C_6) - (\text{cicloalquilo } C_3-C_7)$ , estando dicho alquilo  $C_1-C_6$  opcionalmente sustituido con  $-OR^5$  o  $R^{13}$ .

14. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{11}$  es H o alquilo  $C_1-C_6$ , estando dicho alquilo  $C_1-C_6$  opcionalmente sustituido con  $-OR^5$ ,  $-NR^5R^5$ ,  $-NR^5COR^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  $R^8$  o  $R^9$ .

15. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{11}$  es H o alquilo  $C_1-C_6$ , estando dicho alquilo  $C_1-C_6$  opcionalmente sustituido con  $-OR^5$  o  $-NR^5COR^5$ .

16. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{12}$  es alquilo  $C_1-C_6$  sustituido con  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $-OR^5$ ,  $-CONR^5R^5$ ,  $-NR^5COR^5$  o  $-NR^5R^5$ .

17. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{12}$  es alquilo  $C_1-C_6$  sustituido con  $R^9$ ,  $-OR^5$ ,  $-NR^5COR^5$  o  $-NR^5R^5$ .

690  
#169  
690

18. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{13}$  es fenilo sustituido con halo, -CN, -COR<sup>5</sup>, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, -OR<sup>5</sup>, -NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -(alquilenos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>.

19. Un compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, en el que  $R^{13}$  es fenilo sustituido con halo, -CN, -CONR<sup>5</sup>R<sup>5</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>5</sup> o -OR<sup>5</sup>.

20. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1:

3-{[3,5-Dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi}-5-fluorobenzonitrilo;

3-{[3,5-Dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi}-5-metilbenzonitrilo;

5-{[3,5-Dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi}isofaltonitrilo;

3-Cloro-5-{[3,5-dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi}benzonitrilo;

5-{[3,5-Dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}isofaltonitrilo;

3-{[3,5-Dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}-5-metilbenzonitrilo;

3-Cloro-5-{[3,5-dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}benzonitrilo;

3-{[1-(2-Aminoetil)-3,5-dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}-5-metilbenzonitrilo;

3-{[1-(2-Aminoetil)-3,5-dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}-5-clorobenzonitrilo;

5-{[1-(2-Aminoetil)-3,5-dietil-1H-pirazol-4-il]oxi}isofaltonitrilo;

o una sal, o solvato farmacéuticamente aceptable de los mismos.

694  
691

21. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1:

5-([3,5-Dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi)isofталонitrilo;

o una sal, o solvato farmacéuticamente aceptable del mismo.

22. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1:

5-([3,5-Dietil-1-(2-hidroxietil)-1H-pirazol-4-il]oxi)isofталонitrilo;

23. Una composición farmacéutica que incluye un compuesto de fórmula (I) o una sal, solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, de acuerdo con cualquier reivindicación precedente, junto con uno o más excipientes, diluyentes o vehículos farmacéuticamente aceptables.

24. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 23, que incluye uno o más agentes terapéuticos adicionales.

25. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 23, que incluye un antagonista CCR5.

\*\*\*\*\*

692  
B  
692

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-079617-00007-0000

Fecha: 2008-01-16 16:58:00 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra. 11 PATENTEIYII Eva: 379 FASENACIONALI  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 2,721  
FECHA : ENERO 9 DE 2008

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE    | TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO | FECHA PGO  | Vr. PAGO      |
|----------------|--------------|-----------------|-----------|----------|------------|---------------|
| OLARTE RAISBEK | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 106793   | 09/01/2008 | 15,878,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO               | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-01 | SOLICITUDES            |                |
|       |             | 84 FUSION DE SOLICITUD | 103,000.00     |
|       |             | TOTAL :                | \$ 103,000.00  |

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

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

**Radicación No. 03079617**

**Clasificación Internacional (IPC): A61K 31/415, C07D 231/18**

**Concepto Técnico No. 319**

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (fase nacional)

☒

Cap. I

☐

Cap. II

☒

No. Sol. Internacional

PCT/IB02/01234

Fecha de Presentación Internacional

4-04-2002

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

**1. Documentos estudiados:**

1.1. Descripción: (Folios: 163 a 563) como se radicó inicialmente.

1.2. Reivindicaciones: 1 a 41 (Folios: 564 a 601) como se radicó inicialmente.  
Modificadas 1 a 25 (Folios: 669 a 676). Modificadas: 1 a 25 (folios: 684 a 691).

1.3. Rta del Solicitante: Folios: 680 a 683.

1.4. Prioridad: Folios: 12 a 162, (10/04/2001 y 15/11/2001, GB 0108999.4 y GB 0127426.5).

**2. Objeto de la invención:**

La presente solicitud se titula: "Compuestos de pirazol-4-ariloxi opcionalmente sustituidos en 1,3,5".

El objeto de la presente solicitud se refiere a derivados de pirazol y a procedimientos para la preparación de los mismos, a intermedios usados en su preparación, a composiciones que los contienen y usos de tales derivados.

Según la descripción, los compuestos de la presente solicitud se unen a la enzima transcriptasa inversa y son moduladores, especialmente inhibidores de la misma. La transcriptasa inversa está implicada en el ciclo de vida infeccioso de VIH, y los compuestos que interfieren con la función de esta enzima han mostrado utilidad en el tratamiento de afecciones, incluyendo el SIDA.

De acuerdo con la presente solicitud, los compuestos que se reclaman son útiles en

el tratamiento de una diversidad de trastornos, incluyendo aquellos en los que está implicada la inhibición de la transcriptasa inversa. Los trastornos de interés incluyen los causados por el virus de inmunodeficiencia humana (VIH) y retrovirus relacionados genéticamente, tales como el síndrome de inmunodeficiencia adquirida (SIDA).

Reivindicaciones 1 a 22 (folios: 684 a 691): un compuesto de fórmula I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

Reivindicaciones 23 a 24 (folio: 691): una composición farmacéutica que incluye un compuesto de fórmula I o una sal, solvato farmacéuticamente aceptable del mismo, junto con uno o más excipientes, diluyentes o vehículo farmacéuticamente aceptables.

Reivindicación 25 (folio: 691): una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 23 que incluye un antagonista CCR5.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad constante de proporcionar moduladores nuevos y mejores, especialmente inhibidores de la transcriptasa inversa de VIH, ya que el virus puede mutar, volviéndose resistente a los efectos de los moduladores conocidos.

La solución propuesta por la presente solicitud consiste en compuestos derivados de pirazol-4-ariloxi sustituidos en 1,3,5 que son inhibidores de transcriptasa inversa.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A61K 31/415; C07D 231/18.

### **3. De la solicitud de Patente**

#### **3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)**

De acuerdo con las modificaciones realizadas en el título de la solicitud, cumple con el requisito de claridad o comprensión.

#### **3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)**

De acuerdo con las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio, folios: 684 a 691, las reivindicaciones cumplen con el requisito de claridad, concisión y sustento por la descripción.

### **4. Unidad de Invención (artículo 25 D 486)**

De acuerdo con las modificaciones realizadas, la (s) reivindicación (es) 1 a 25 (folios: 684 a 691), que se refiere(n) a un compuesto de fórmula I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, conforman un único concepto inventivo.

### **5. Es una invención (artículo 15 D 486 literal a)-f))**

La (s) reivindicación (es) modificadas 1 a 25 que se refiere(n) a un compuesto de fórmula I, se considera(n) invención(es) porque no se encuentran dentro de lo mencionado en el artículo 15.

695

**6. Excepciones de Patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))**

Según las modificaciones realizadas, la(s) reivindicación(es): 1 a 25 (folios: 684 a 691), es (son) patentable(s) porque no mencionan métodos de tratamiento.

**7. Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)**

De acuerdo con las modificaciones, la(s) reivindicación (es) 1 a 25 (folios: 684 a 691), que se refiere(n) a un compuesto de fórmula I se encuentra(n) dentro del campo de la patentabilidad (productos y procedimientos).

**8. Análisis de la(s) Oposición(es): (artículo 43 D. 486)**

No se presentaron oposiciones a la presente solicitud.

**9. Determinación del Estado de la Técnica:**

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria 10-04-2001 y 15-11-2001

Teniendo en cuenta la fecha indicada, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta y no se encontraron anterioridades que afecten la Patentabilidad del objeto de la presente solicitud.

**10. Respuesta a los argumentos del solicitante**

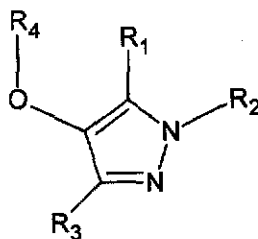
El señor solicitante modificó el título de la solicitud, conforme a lo solicitado en el examen de Fondo anterior.

De igual modo, modificó el capítulo reivindicatorio, donde ha eliminado el término "derivado", por lo cual cumple con los requisitos del artículo 30 y de unidad de invención del artículo 25 D 486.

**11. Análisis de Patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)****11.1. Novedad (artículo 16 D486)**

La presente Solicitud de Patente Colombiana No. 03079617, se refiere a:

Un compuesto de fórmula I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo:



De acuerdo con el numeral 9, no se encontró dentro del estado de la técnica, documento alguno que evidenciara la existencia de la invención por lo cual el objeto reivindicado es Nuevo.

696

### 11.2. Nivel inventivo (artículo 18 D 486)

La presente Solicitud de Patente reivindica lo siguiente: Un compuesto de fórmula I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo que son derivados de pirazol 4-ariloxi y son inhibidores de la enzima transcriptasa reversa para el tratamiento del VIH.

El problema técnico planteado en esta solicitud: la necesidad constante de proporcionar moduladores nuevos y mejores, especialmente inhibidores de la transcriptasa inversa de VIH, ya que el virus puede mutar, volviéndose resistente a los efectos de los moduladores conocidos, no se había resuelto previamente. Por tal motivo se considera que los compuestos derivados de pirazol 4-ariloxi reivindicadas(os) no son evidentes para una persona medianamente versada en la materia.

Asimismo, no se encontró dentro del estado de la técnica documento alguno que afecte el nivel inventivo y el objeto reivindicado no resulta obvio para una persona medianamente versada en la materia por lo cual tiene Nivel Inventivo.

### 11.3. Aplicación industrial (artículo 18 D 486)

El objeto de la presente solicitud cumple con el requisito de Aplicación Industrial.

### 12. **Conclusión:**

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 25 (folios: 684 a 691).

Bogotá, D.C., 31 de enero de 2008

CONCEPTO TECNICO No. 319

EXAMINADOR TECNICO  
Código No. 202005