

166

Clarke, Modet & C°
COLOMBIA

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS
Intellectual Property

2651/P

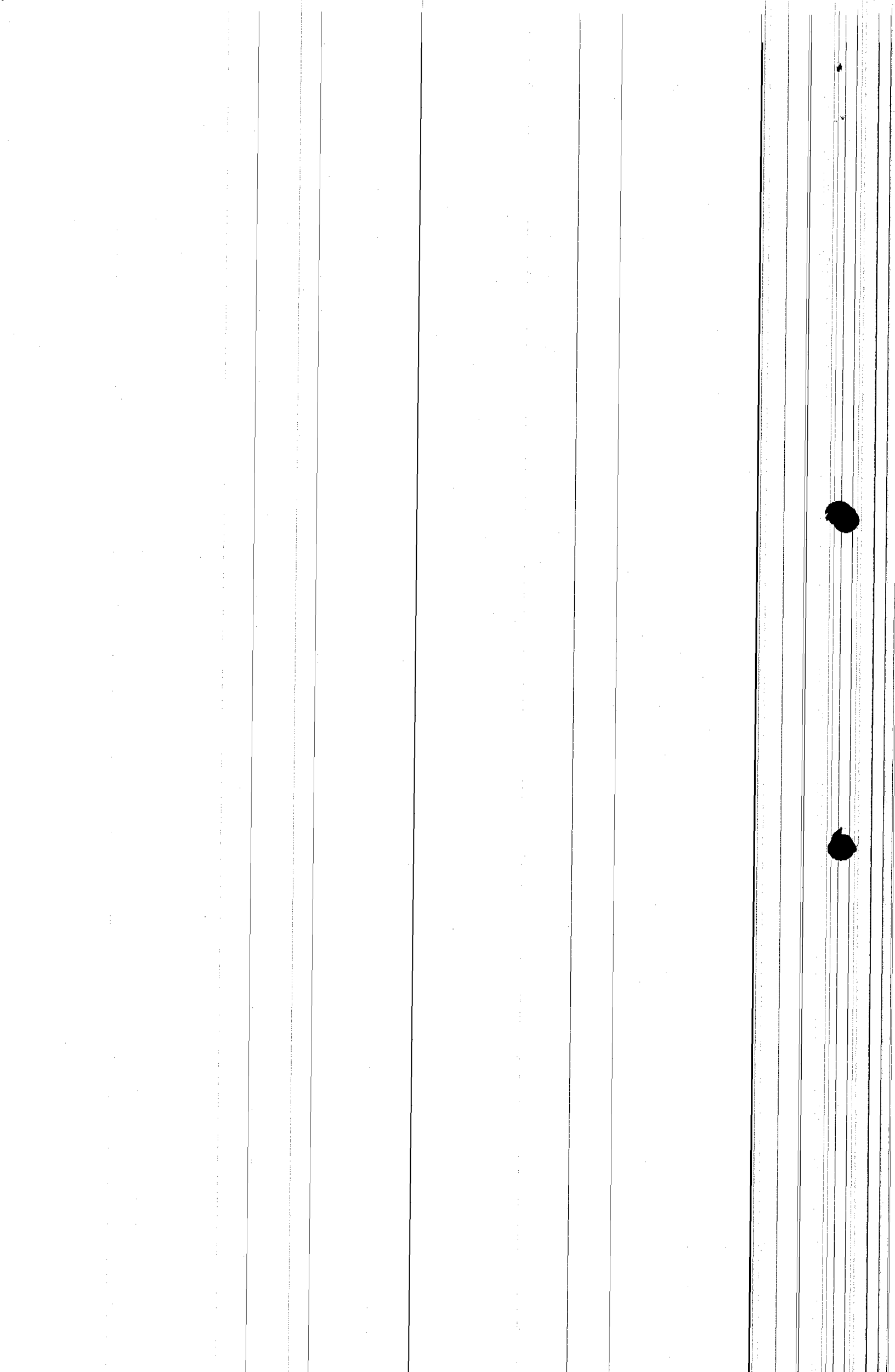
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

11048-07-0000
2020 NUECREACION
FASENACIONALII
Folios: 19

Re: Expediente No. 04-021.424
Solicitud de patente a nombre de **The Procter & Gamble Company**

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la Cra. 11 No. 86-53 Piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **The Procter & Gamble Company**, domiciliada en Cincinnati, Ohio, Estados Unidos de América, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 11048 del 7 de septiembre de 2007 relacionado con el concepto técnico No. 1434, me permito manifestar lo siguiente:

- 1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo capítulo reivindicatorio en el cual se han realizado las siguientes modificaciones:
 - 1.1 Se canceló la antigua reivindicación 18.
 - 1.2 Dentro de la reivindicación 1 se definieron términos como “sustituido”, “hirocarbilo” y “heterociclo” de acuerdo con lo divulgado en la descripción de la presente solicitud, especialmente en la página 7 , línea 6 hasta la página 11 línea 11.
 - 1.3 Se modificó la dependencia de la reivindicación 11 para que sea dependiente de la reivindicación 1.
 - 1.4 La antigua reivindicación 34 se numeró consecutivamente como la nueva reivindicación 16 y las antiguas 16 y 17 se renumeraron como las nuevas reivindicaciones 17 y 18.



167
167

Respecto a estas modificaciones, atentamente manifiesto que las mismas no amplían la materia objeto de la solicitud estudiada y se enfocan con el fin de brindar cabal cumplimiento al requisito de claridad de la solicitud expuesto por el señor examinador.

Para este efecto, me permito acompañar el recibo No. 08-1,812 del 8 de enero de 2008 con el cual queda cubierta la tasa correspondiente a la modificación de una solicitud de patente en cuanto a sus reivindicaciones.

2. Unidad de Invención

El examinador expone en su concepto técnico que *"...la reivindicación 1, esta cláusula tal como está redactada, abarca un número muy elevado de compuestos que tienen una gran cantidad de sustituyentes y que pueden no relacionarse unos con otros por sus diferencias en su estructura química, por lo tanto, se puede estar solicitando compuestos que no encuentran dentro del alcance del objeto de la invención y por ende no conforman un único concepto inventivo."*

[...]

"Así mismo, el radical heteroarilo y heterociclilo puede estar compuesto por uno o más heteroátomos seleccionados entre O, N ó S, lo cual generaría más grupos de invenciones."

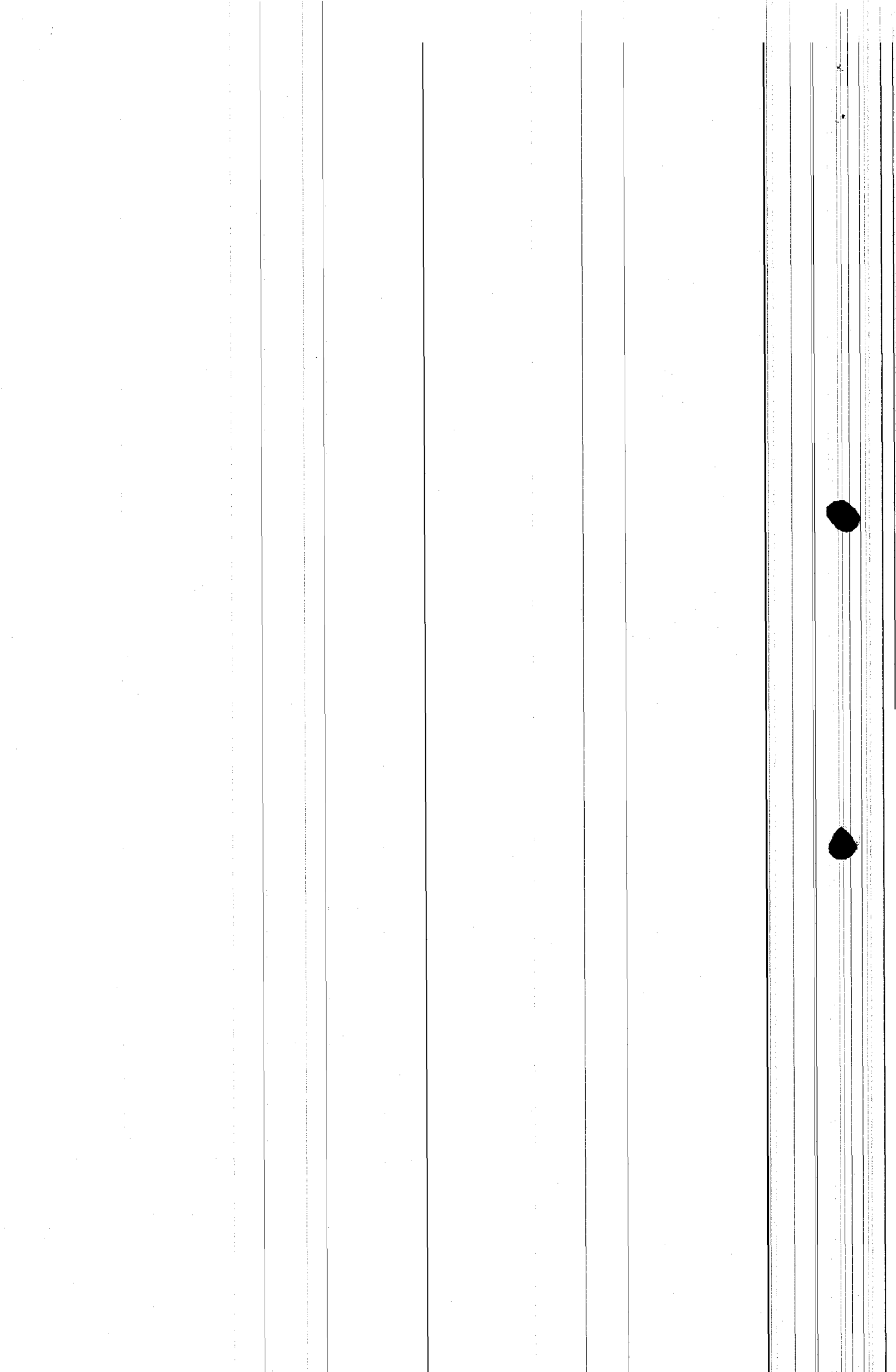
Sobre este particular, me permito decir que con las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio donde se han definido los sustituyentes, quedan totalmente especificados los compuestos que son abarcados por la invención y por lo tanto no se da cabida a compuestos que se encuentren por fuera del alcance de la invención de acuerdo con la reivindicación 1 modificada.

De otra parte, en cuanto a los compuestos de arilo y heteroarilo y los compuestos carbocíclicos y heterocíclicos, el solicitante desea aclarar que todos los compuestos reivindicados pueden ser considerados como una única invención, toda vez que los mismos presentan una estructura común básica como la que se muestra en la reivindicación 1. Aún más, con la limitación realizada en el capítulo reivindicatorio se ha restringido la variedad de compuestos cubiertos por la invención, donde dicha variedad comparte las mismas propiedades.

Así las cosas, solicito a ese despacho se sirva aceptar el requisito de unidad de la invención en estudio a la luz de las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio.

Como se mencionó anteriormente, los compuestos de la presente invención tienen como concepto inventivo común la estructura central mostrada por la fórmula I, a la cual mediante modificaciones y sustituciones específicas se pueden obtener los compuestos con las variaciones mostradas en la reivindicación 1 y

2



sustentadas por la descripción. En este orden de ideas, la presente invención sí posee unidad de invención.

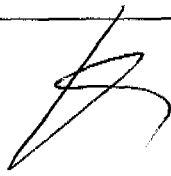
3. Excepciones a la Patentabilidad

Respecto a esta objeción, me permito manifestar que la misma queda cabalmente superada toda vez que se canceló la reivindicación 18.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
CC39.779.452 de Usaquén
T.P. 68228
Cód. 5376

RESPONSABLE :



SON: CIENTO TRES MIL PESOS

1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA 12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES TOTAL : \$ 103,000.00

RECIBISTO CONCEPTO TOTAL CONCEPTO

***** C O N C E P T O *****

CLARKE MODET Y CO. COLMBCONSIGNACION BANCO DE BOGOTA 062754387 2662954 08/01/2008 40,235,000.00

DEPOSITANTE TIPO PAGO BANCO CUENTA NO. PAGO FECHA PAGO VT. PAGO

***** C O N S I G N A C I O N *****

RECIBO OFICIAL DE CASH : 08 - 1,812 : ENERO 8 DE 2008

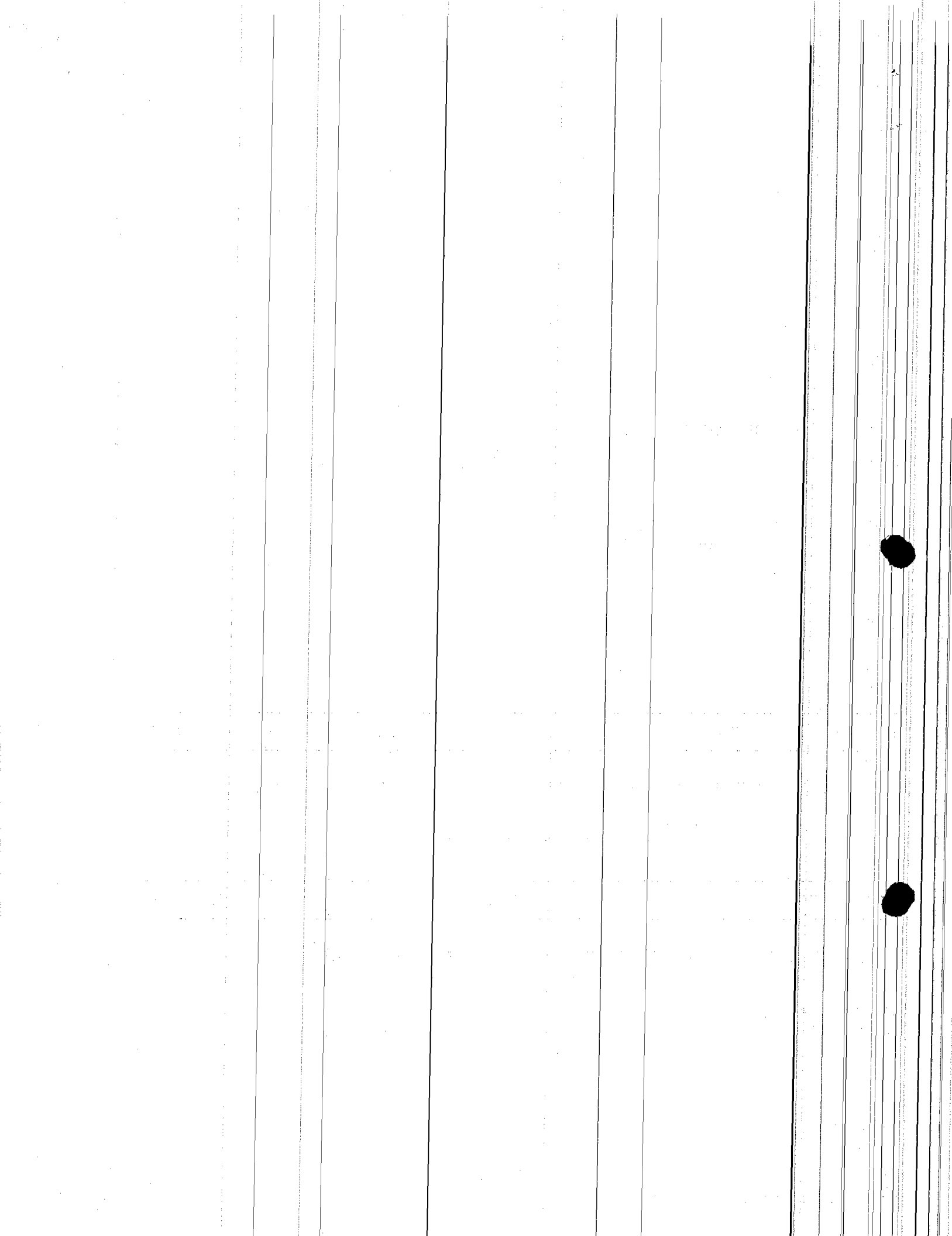
NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

2651

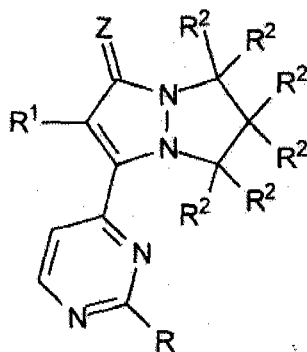
h

169
464



120
120**REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto que incluye todas las formas enantioméricas y diastereoméricas y las sales farmacéuticamente aceptables de las mismas, el compuesto corresponde a la fórmula:



caracterizada además porque R es:

a) $-O[CH_2]_kR^3$; o

b) $-NR^{4a}R^{4b}$;

R^3 es alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, hidrocarbilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo o alquilenarilo sustituido o no sustituido, heteroarilo o alquilenheteroarilo sustituido o no sustituido; el subíndice k es de 0 a 5;

R^{4a} y R^{4b} son independientemente:

a) hidrógeno; o

b) $-[C(R^{5a}R^{5b})]_mR^6$;

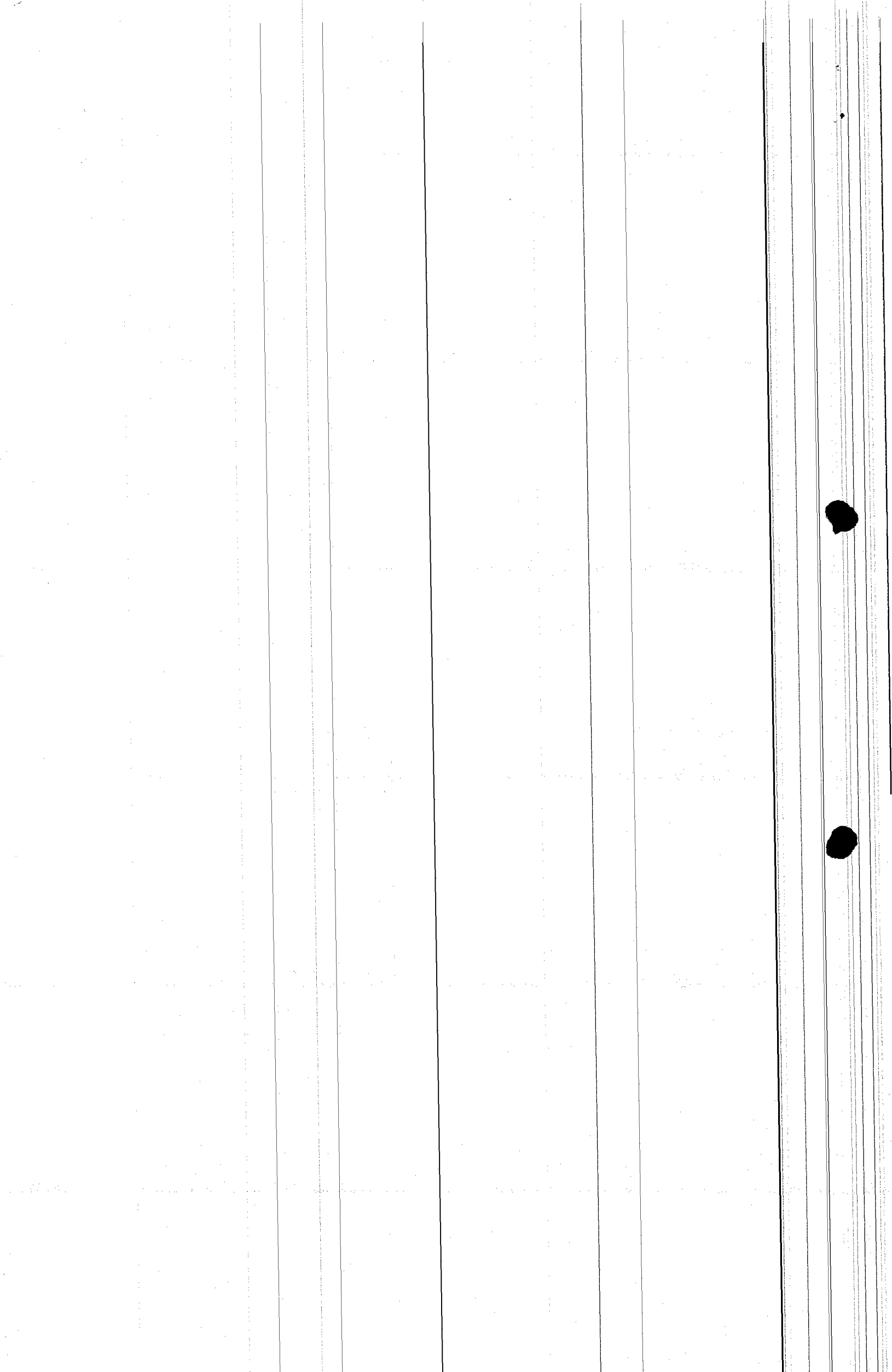
cada R^{5a} y R^{5b} son independientemente hidrógeno, $-OR^7$, $-N(R^7)_2$, $-CO_2R^7$, $-CON(R^7)_2$; alquilo C₁-C₄ lineal, ramificado o cíclico, y mezclas de los mismos; R^6 es hidrógeno, $-OR^7$, $-N(R^7)_2$, $-CO_2R^7$, $-CON(R^7)_2$; alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, aril heterociclo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido; R^7 es hidrógeno, un catión hidrosoluble, alquilo C₁-C₄ arilo sustituido o no sustituido; el subíndice m es de 0 a 5;

R^1 es:

a) arilo sustituido o no sustituido; o

b) heteroarilo sustituido o no sustituido;

5



121

cada unidad R^2 de manera independiente se selecciona del grupo que consiste de:

- a) hidrógeno,
- b) $-(CH_2)_jO(CH_2)_nR^8$;
- c) $-(CH_2)NR^{9a}R^{9b}$;
- d) $-(CH_2)_jCO_2R^{10}$;
- e) $-(CH_2)_jCO_2R^{10}$
- f) $-(CH_2)_jCON(R^{10})_2$;
- g) $-(CH_2)_jOCON(R^{10})_2$;
- h) dos unidades R^2 se pueden unir entre sí para formar una unidad carbonilo;
- i) y mezclas de los mismos;

R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , y mezclas de los mismos; R^{9a} y R^{9b} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; dos unidades R^{10} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; el subíndice j tiene un valor de 0 a 5, el subíndice n tiene un valor de 0 a 5;

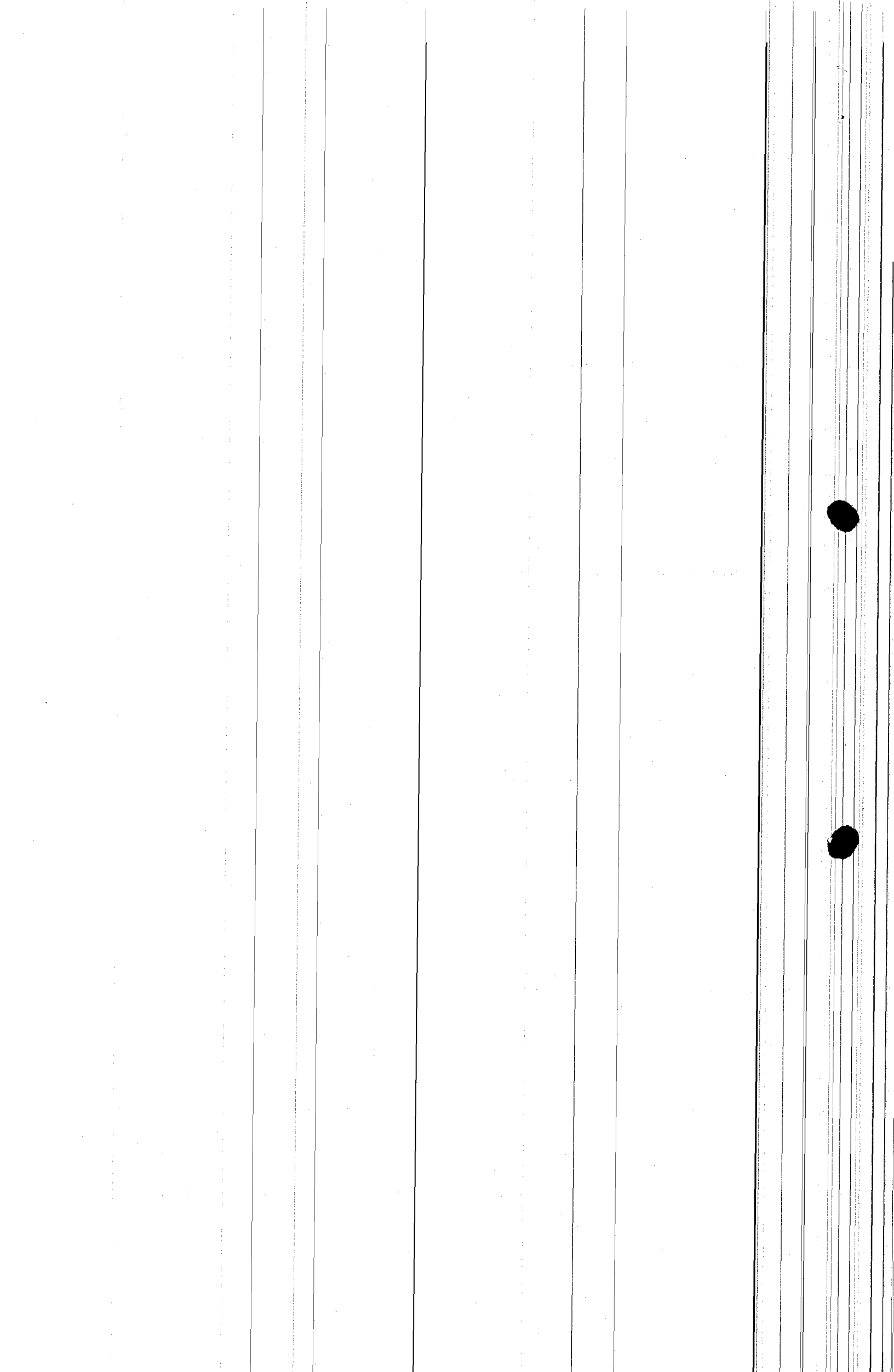
Z es O, S, NR^{11} o NOR^{11} ; R^{11} es hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 .

en donde las unidades que sirven como sustituyentes de los átomos de hidrógeno en una unidad hidrocarbilo que es sustituida son:

- i) $-[C(R^{12})_2]_p(CH=CH)_qR^{12}$; donde p tiene un valor de 0 a 12; q de 0 a 12;
- ii) $-C(Z)R^{12}$;
- iii) $-C(Z)_2R^{12}$;
- iv) $-C(Z)CH=CH_2$;
- v) $-C(Z)N(R^{12})_2$;
- vi) $-C(Z)NR^{12}N(R^{12})_2$;
- vii) $-CN$;
- viii) $-CNO$;
- ix) $-CF_3$, $-CCl_3$, $-CBr_3$;

- X) $-N(R^{12})_2$;
- xi) $-NR^{12}CN$;
- xii) $-NR^{12}C(Z)R^{12}$;
- xiii) $-NR^{12}C(Z)N(R^{12})_2$;
- xiv) $-NHN(R^{12})_2$;
- xv) $-NHOR^{12}$;
- xvi) $-NCS$;
- xvii) $-NO_2$;
- xviii) $-OR^{12}$;
- xix) $-OCN$;
- xx) $-OCF_3$, $-OCCl_3$, $-OCBr_3$;
- xxi) $-F$, $-Cl$, $-Br$, $-I$, y mezclas de los mismos;
- xxii) $-SCN$;
- xxiii) $-SO_3M$;
- xxiv) $-OSO_3M$;
- xxv) $-SO_2N(R^{12})_2$;
- xxvi) $-SO_2R^{12}$;
- xxvii) $-P(O)H_2$;
- xxviii) $-PO_2$;
- xxix) $-P(O)(OH)_2$;
- xxx) y mezclas de los mismos;

en donde R^{12} es hidrógeno, alquilo sustituido o no sustituido C_1-C_{20} lineal, ramificado o cíclico, arilo C_6-C_{20} , alquilenos C_7-C_{20} y mezclas de los mismos; M es hidrógeno o catión formador de sal; Z es $=O$, $=S$, $=NR^{11}$ y mezclas de los mismos;

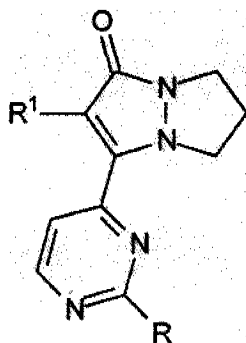


los cationes formadores de sales incluyen sodio, litio, potasio, calcio, magnesio, amonio y similares;

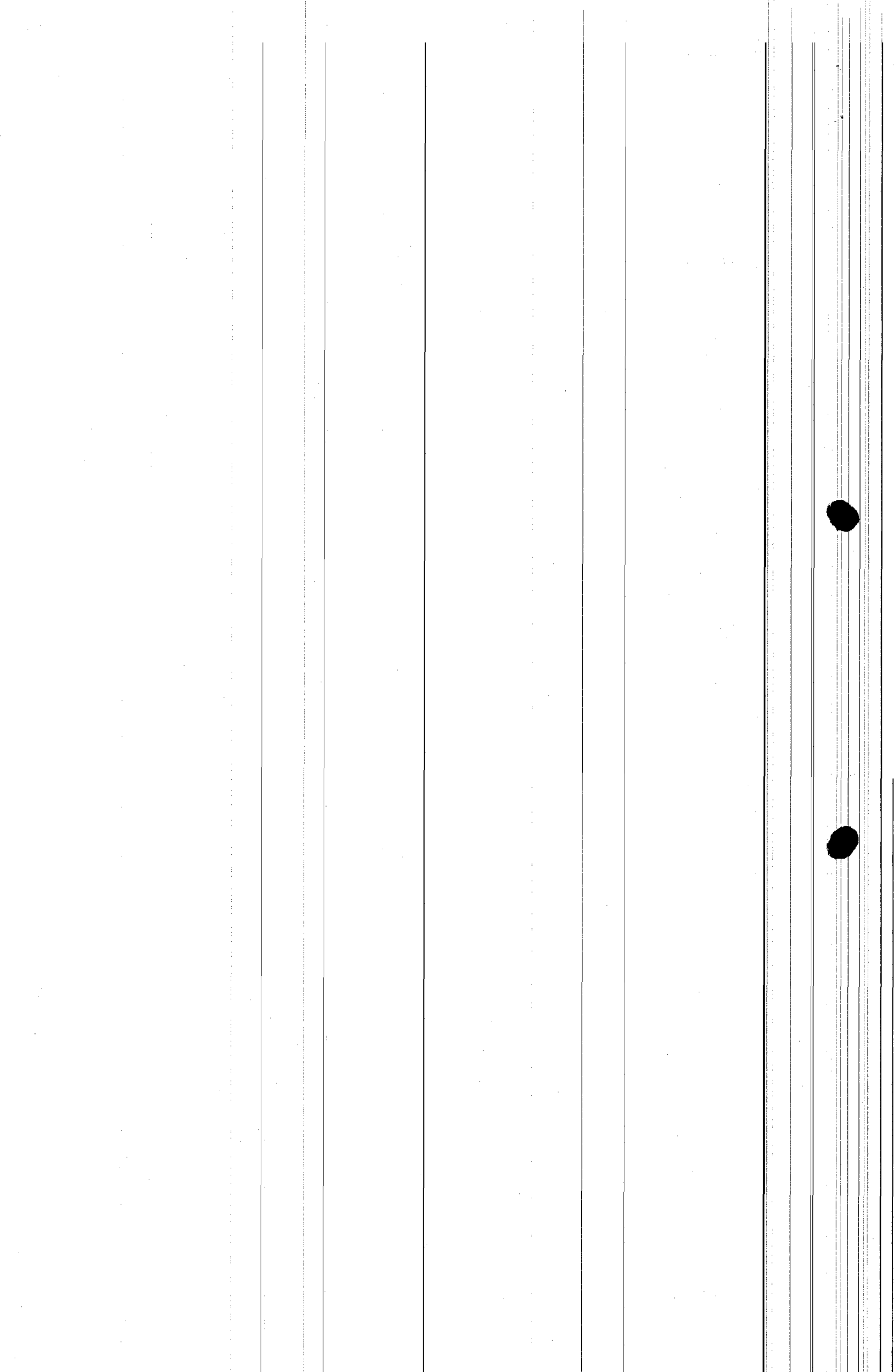
y en donde hidrocarbilo significa anillo carbocíclico aromático (arilo) y no aromático, que incluye ciclopropilo, ciclobutanilo, ciclopentanilo, ciclohexano, ciclohexenilo, cicloheptanilo, biciclo-[0.1.1]-butilo, biciclo-[0.1.2]-pentilo, biciclo-[0.1.3]-hexilo (tujanil), biciclo-[0.2.2]-hexilo, biciclo-[0.1.4]-heptanilo (caranil), biciclo-[2.2.1]-heptilo (norboranilo), biciclo-[0.2.4]-octilo (cariofilenilo), espiropentilo, dicitlopentanoespiranilo, decalinilo, fenilo, bencilo, naftilo, indenilo, 2H-indenilo, azulenilo, fenantrilo, antrilo, fluorenilo, acenaftilenilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalenilo, y otros similares;

y en donde heterociclo significa anillo heterocíclico aromático (heteroarilo) como no aromático, que incluyen pirrolilo, 2H-pirrolilo, 3H-pirrolilo, pirazolilo, 2H-imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, isoxazolilo, oxazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 2H-piranilo, 4H-piranilo, 2H-piran-2-ona-ilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piperazinilo, s-triazinilo, 4H-1,2-oxazinilo, 2H-1,3-oxazinilo, 1,4-oxazinilo, morfolinilo, azepinilo, oxepinilo, 4H-1,2-diazepinilo, indenilo, 2H-indenilo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, indolilo, 3H-indolilo, 1H-indolilo, benzoxazolilo, 2H-1-benzopiranilo, quinolinilo, isoquinolinilo, quinazolinilo, 2H-1,4-benzoxazinilo, pirrolidinilo, pirrolinito, quinoxalinilo, furanilo, tiofenilo, benzimidazolilo, y otros similares, cada uno de los cuales puede estar sustituido o sin substituir.

2. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 que corresponde a la fórmula:

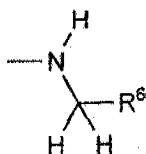


caracterizada porque R es una unidad éter que corresponde a la fórmula -OR³ en

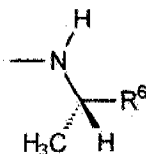


174
174

la que R^3 se selecciona del grupo formado por fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 2-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 3-N-acetilaminofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo y 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo; una unidad amino que corresponde a la fórmula:

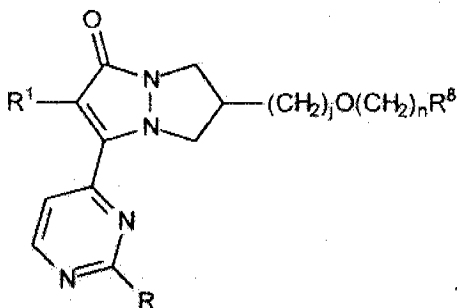


o una unidad amino que corresponde a la fórmula:



en donde R^6 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, vinilo, ciclopropilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, 1-hidroxi-1-metiletilo, carboxi, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-aminofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxifenilo, 4-(propansulfonil)fenilo, 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo.

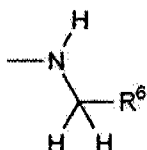
3. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 que corresponde a la fórmula:



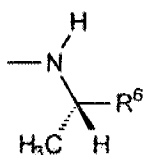
en donde R es una unidad éter que corresponde a la fórmula $-\text{OR}^3$ en la que R^3 se selecciona del grupo formado por fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 2-trifluorometilfenilo, 4-

trifluorometilfenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 3-N-acetilaminofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo y 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo;

una unidad amino que corresponde a la fórmula:

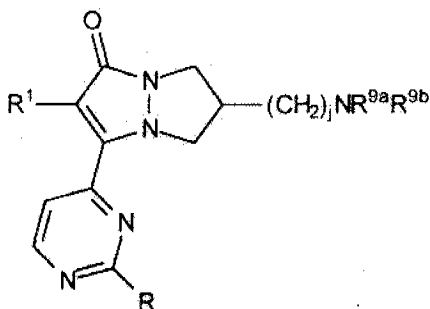


o una unidad amino que corresponde a la fórmula:

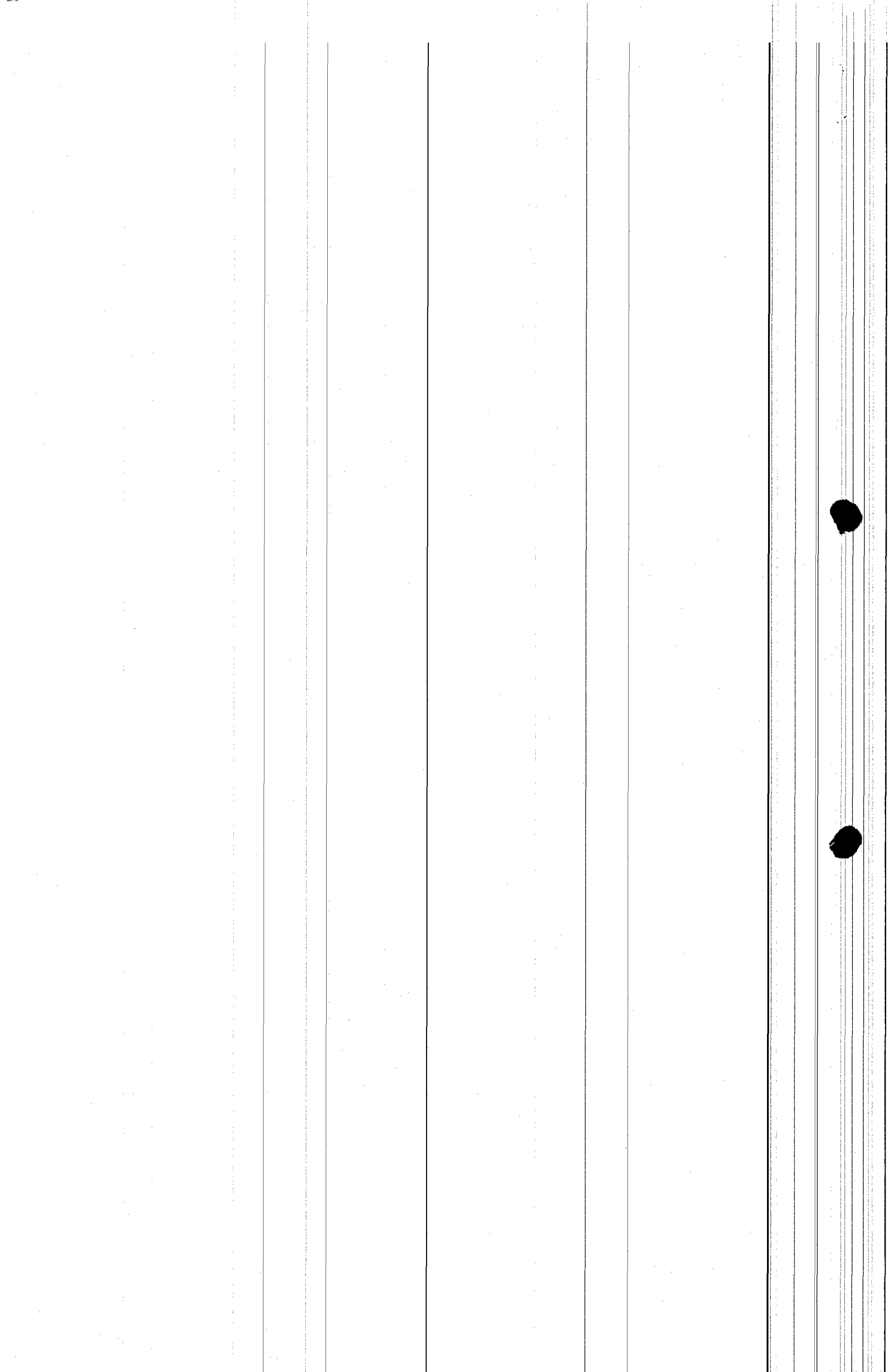


caracterizada porque R^6 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, vinilo, ciclopropilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, 1-hidroxi-1-metiletilo, carboxi, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-aminofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxi-fenilo, 4-(propansulfonil)fenilo, 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo; R^8 es hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 , cada uno de los índices j y n son iguales a 0.

4. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 que corresponde a la fórmula:

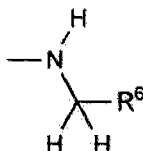


caracterizado porque R es una unidad éter que corresponde a la fórmula $-OR^3$ en la que R^3 se selecciona del grupo formado por fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 2-trifluorometilfenilo,

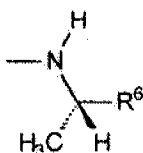


176
176

4-trifluorometilfenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 3-N-acetilaminofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo y 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo; una unidad amino que corresponde a la fórmula:



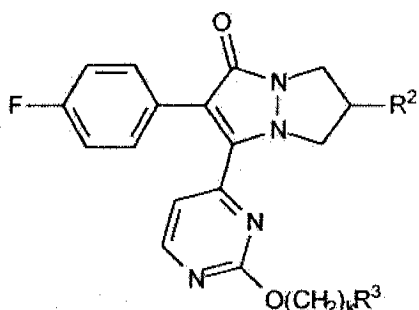
o una unidad amino que corresponde a la fórmula:



caracterizado porque R^6 se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, vinilo, ciclopropilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, 1-hidroxi-1-metiletilo, carboxi, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-aminofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxi-fenilo, 4-(propansulfonil)fenilo, 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo; R^{9a} y R^{9b} son independientemente hidrógeno o alquilo C_1-C_4 , el subíndice j es igual a 0.

5. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 4 en donde R^{9a} y R^{9b} se unen entre sí y forman un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; el subíndice j es igual a 0.

6. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 que corresponde a la fórmula:



177
177

en donde cada unidad R^2 independientemente se selecciona del grupo que consiste en:

- a) hidrógeno,
- b) $-(CH_2)_jO(CH_2)_nR^8$;
- c) $-(CH_2)_jNR^{9a}R^{9b}$;
- d) $-(CH_2)_jCO_2R^{10}$
- e) $-(CH_2)_jOCO_2R^{10}$
- f) $-(CH_2)_jCON(R^{10})_2$;
- g) $-(CH_2)_jOCON(R^{10})_2$;
- h) dos unidades R^2 se pueden unir entre sí para formar una unidad carbonilo;
- i) y mezclas de los mismos;

R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , y mezclas de los mismos; R^{9a} y R^{9b} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; dos unidades R^{10} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; el subíndice j tiene un valor de 0 a 5, el subíndice n tiene un valor de 0 a 5;

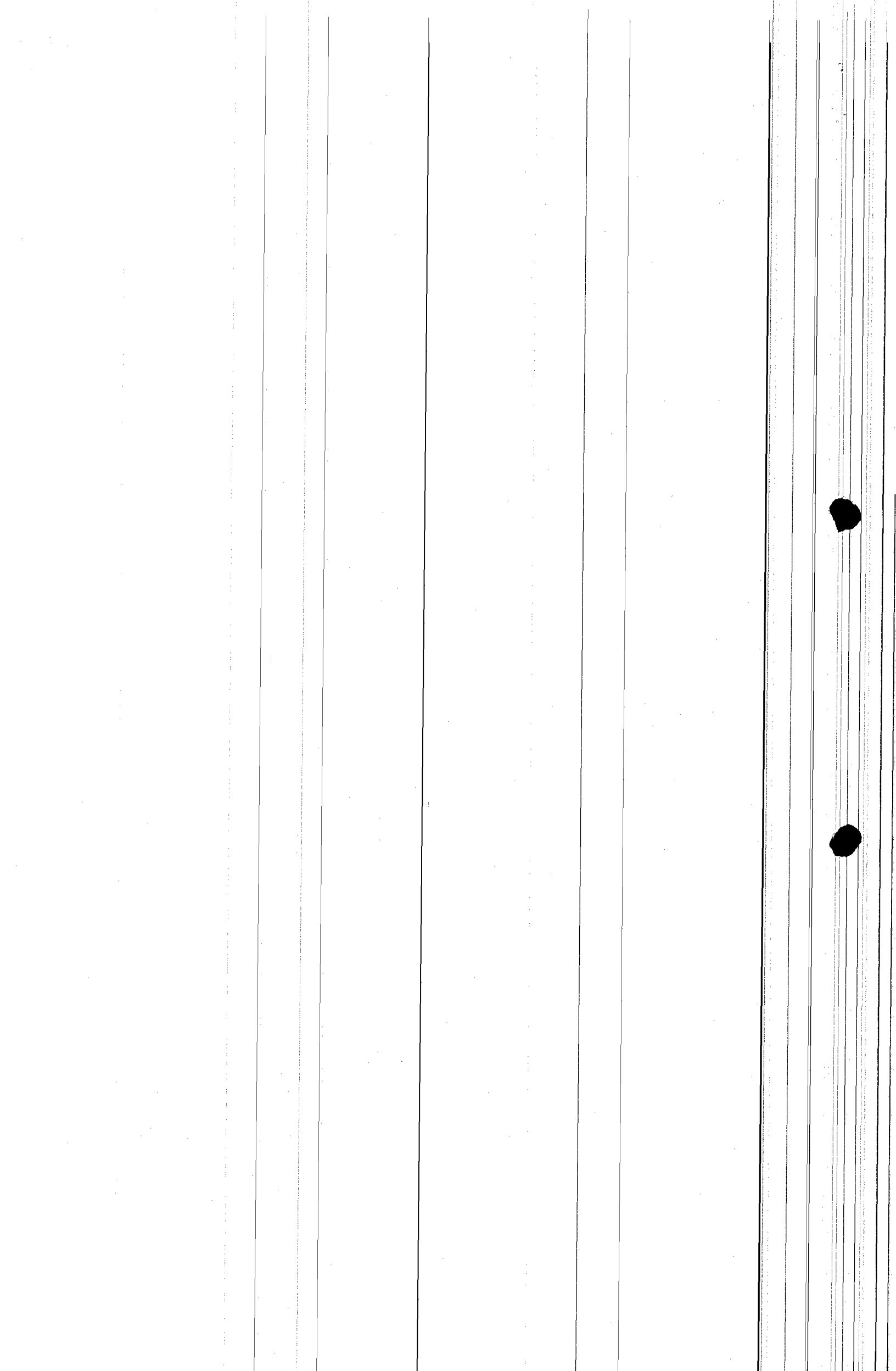
R^3 es alquilo C_1 - C_4 sustituido o no sustituido, hidrocarbilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo o alquilenarilo sustituido o no sustituido, heteroarilo o alquilenheteroarilo sustituido o no sustituido; el subíndice k es de 0 a 5.

7. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 6, en donde R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , y mezclas de los mismos.

8. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 6 ó 7, caracterizado porque R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, metilo, y mezclas de los mismos.

9. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 6-8, caracterizado porque R^3 se selecciona a partir del grupo que

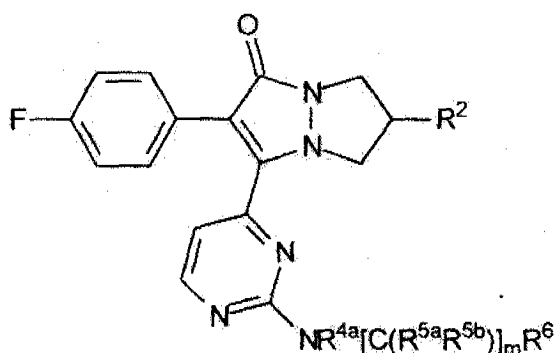
12



178
178

consiste en fenilo, 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 2-cianofenilo, 3-cianofenilo, 2-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 2,4-dimetilfenilo, 3-N-acetil-aminofenilo, 2-metoxifenilo, 4-metoxifenilo y 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo.

10. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1, que corresponde a la fórmula:

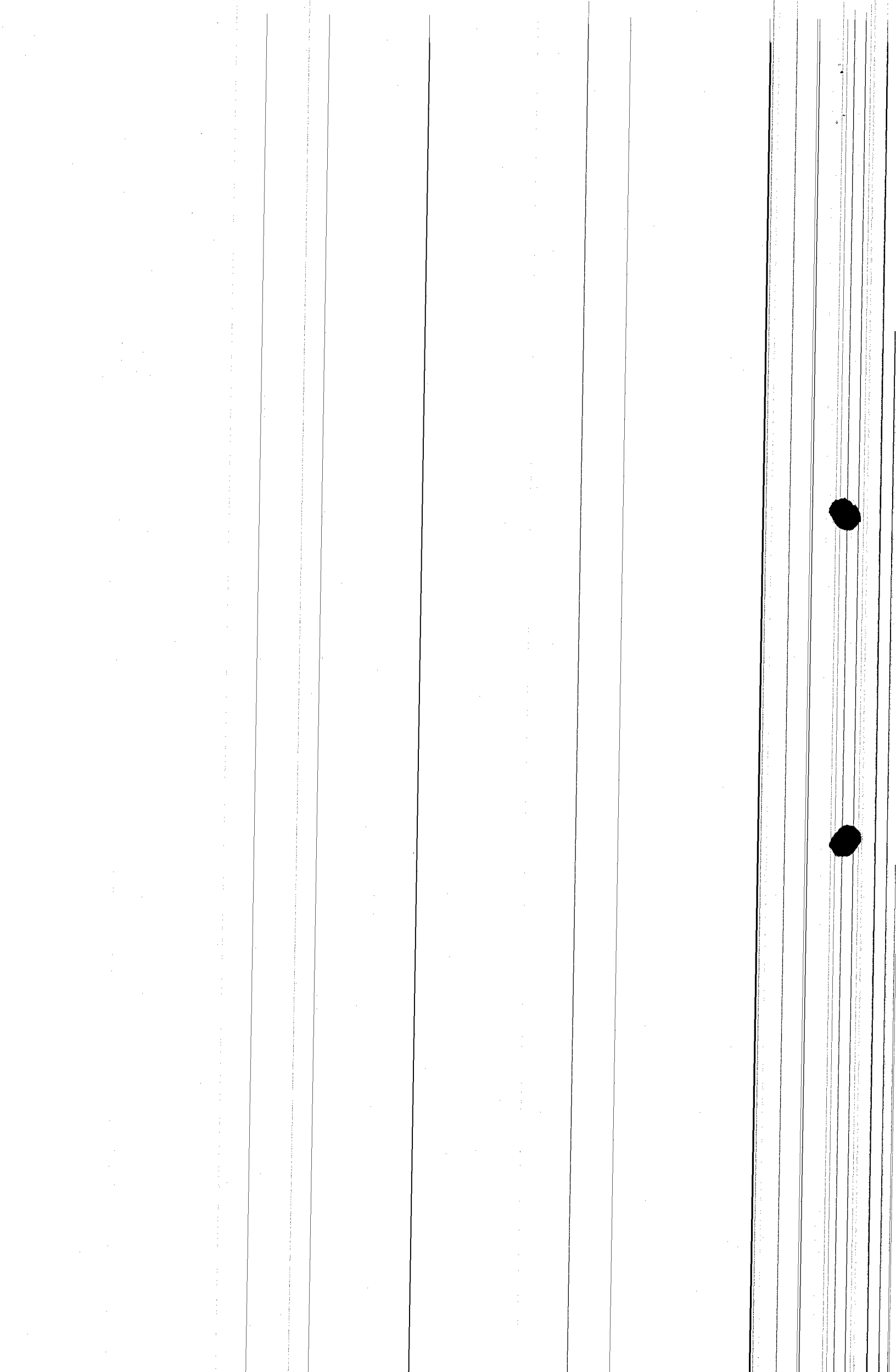


caracterizado porque cada unidad R^2 independientemente se selecciona del grupo que consiste en:

- hidrógeno,
- $-(CH_2)_jO(CH_2)_nR^8$;
- $-(CH_2)_jNR^{9a}R^{9b}$;
- $-(CH_2)_jCO_2R^{10}$
- $-(CH_2)_jOCO_2R^{10}$
- $-(CH_2)_jCON(R^{10})_2$;
- $-(CH_2)_jOCON(R^{10})_2$;
- dos unidades R^2 se pueden unir entre sí para formar una unidad carbonilo;
- y mezclas de los mismos;

R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , y mezclas de los mismos; R^{9a} y R^{9b} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; dos unidades R^{10} se pueden unir entre sí y formar a anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; el subíndice j tiene un valor de 0 a 5, el subíndice n tiene un valor de 0 a 5;

13



179
179

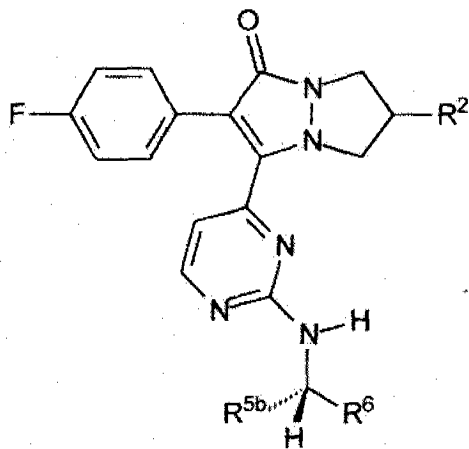
R^{4a} es hidrógeno o $-[C(R^{5a}R^{5b})]_mR^6$;

cada R^{5a} y R^{5b} es independientemente hidrógeno, $-OR^7$, $-N(R^7)_2$, $-CO_2R^7$, -

$CON(R^7)_2$; alquilo C_1-C_4 lineal, ramificado o cíclico, y mezclas de los mismos; R^6 es hidrógeno, $-OR^7$, $-N(R^7)_2$, $-CO_2R^7$, $-CON(R^7)_2$; alquilo sustituido o no sustituido C_1-C_4 , heterociclo sustituido o no sustituido o arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido; R^7 es hidrógeno, un catión hidrosoluble, alquilo C_1-C_4 arilo sustituido o no sustituido; el subíndice m es de 0 a 5;

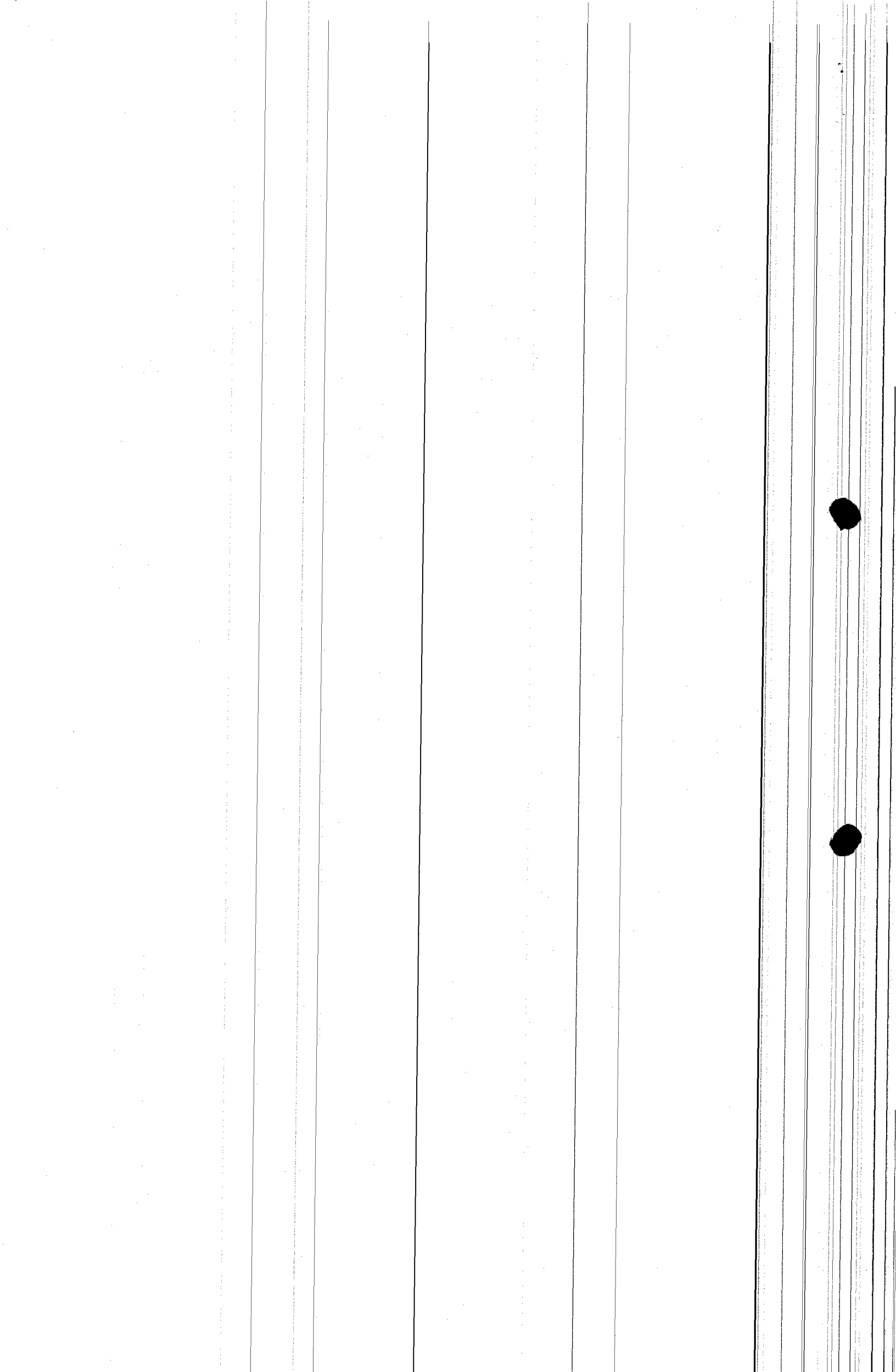
11. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1, caracterizado porque R^2 es hidrógeno, R^{4a} es hidrógeno; y R^{5a} y R^{5b} son cada uno hidrógeno y R^6 se selecciona a partir del grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, vinilo, ciclopropilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, 1-hidroxi-1-metiletilo, carboxi, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-aminofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxi-fenilo, 4-(propansulfonil)fenilo, 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo, piridin-2-ilo y piridin-3-ilo.

12. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 11 que corresponde a la fórmula:



13. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 10-12, caracterizado porque R^{5b} es metilo; R^6 se selecciona a partir del grupo que consiste en $-OH$, $-NH_2$, $-CO_2H$, $-CO_2CH_3$ y $-CONH_2$.

14



14. Un compuesto de conformidad con cualquiera de las Reivindicaciones 10-12, caracterizado porque R^{5b} es metilo; R^6 se selecciona del grupo que consiste en metilo, etilo, vinilo, ciclopropilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, 1-hidroximetiletilo, carboxi, fenilo, 4-fluorofenilo, 2-aminofenilo, 2-metilfenilo, 4-metilfenilo, 4-metoxifenilo, 4-(propansulfonil)fenilo, 3-benzo[1,3]dioxol-5-ilo, piridin-2-ilo y piridin-3-ilo.

15. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1, seleccionado a partir del grupo que consiste en:

2-(4-Fluorofenil)-3-(2-fenoxipirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

N-(3-{4-[2-(4-Fluorofenil)-3-oxo-6,7-dihidro-3H,5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-il]-pirimidin-2-iloxi}-fenil)-acetamida;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(2,4-dimetilfenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(2,4-Difluorofenil)-3-(2-fenoxipirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(4-fluorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(2,6-difluorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(2-fluorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona; y

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(3-fluorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona.

16. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 seleccionado a partir del grupo que consiste en:

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(S)-(1-feniletilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(N'-metil-N'-fenilhidrazin)-pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

Ester metílico del ácido (R)-{4-[2-(4-Fluorofenil)-3-oxo-6,7-dihidro-3H,5H-

181
~~181~~

pirazol[1,2-a]pirazol-1-il]-pirimidin-2-ilamino}-fenilacético;

2-(4-Fluorofenil)-3-(2-bencilaminopirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(1-(S)-metiletilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(alilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[1-(S)-(4-metilfenil)etilamino]pirimidin-4-ilo}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(1-(S)-ciclohexil-etilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(1-(R)-feniletilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(ter-butilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[2-(2-hidroxi-1,2-dimetilpropilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[(2-ciclopropilamino)pirimidin-4-N]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[(2-ciclopropilmetil)aminopirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[(2-metoxietilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-[(2-metoxietilamino)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona;

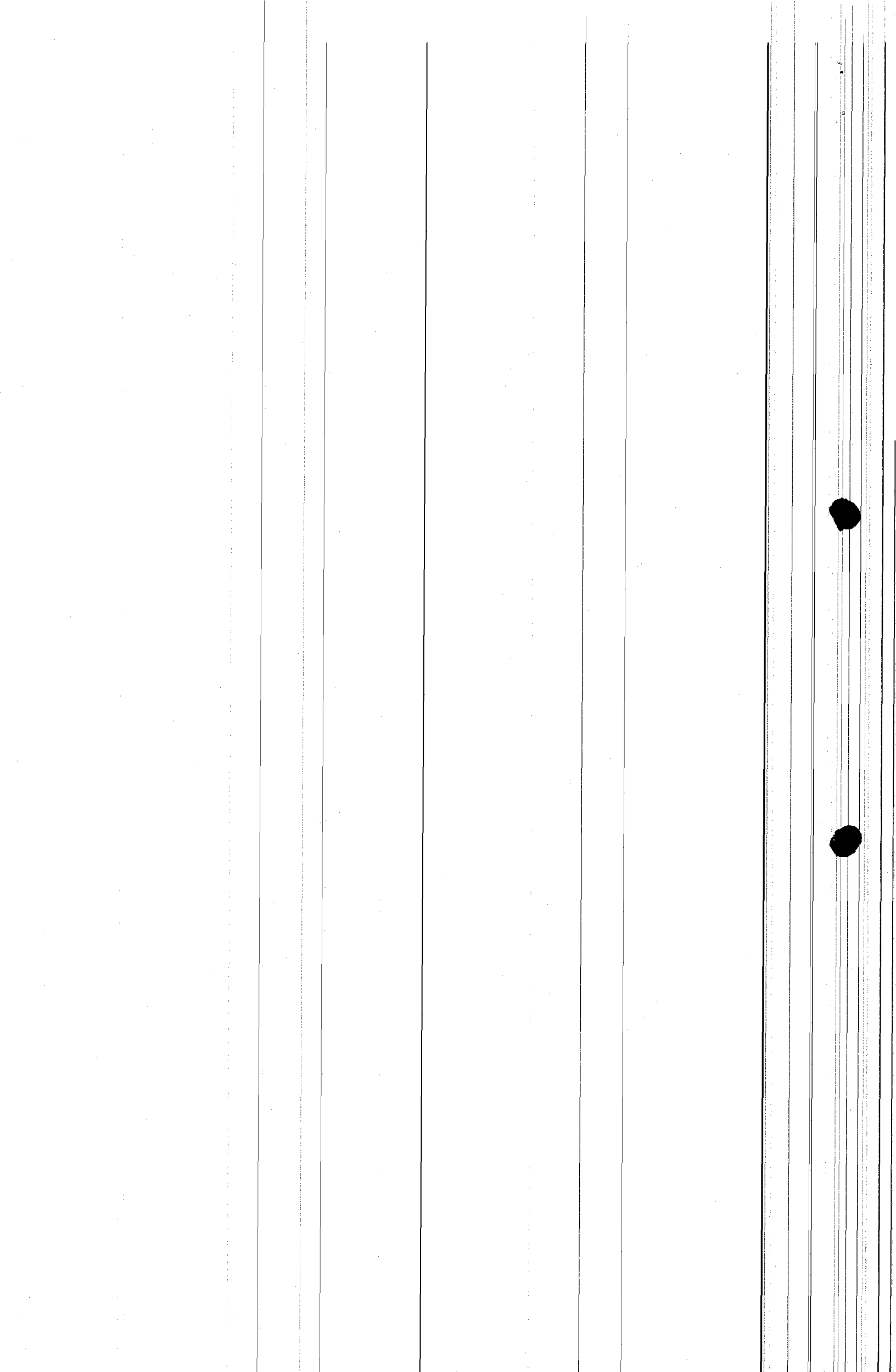
2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[1-(S)-(4-fluorofenil)etilamino]pirimidin-4-ilo}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona; y

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[(piridin-3-ilmetil)amino]pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-ona.

17. Un compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 seleccionado a partir del grupo que consiste en:

2-(4-Fluorofenil)-6-morfolin-4-il-3-[2-(4-fluororofenoxi)-pirimidin-4-il]-6,7-

16



dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

6-dimetilamino-2-(4-fluorofenil)-3-[2-(1-feniletilamino)-pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-6-hidroxi-3-(2-fenoxipirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

6-(4-Fluorofenil)-5-oxo-7-(2-fenoxipirimidin-4-il)-2,3-dihidro-1H,5H-pirazol[1,2-a]pirazol-2-il éster del ácido morfolin-4-carboxílico;

2-(4-Fluorofenil)-6-metoxi-3-[2-(2-(S)-metoxi-1-metiletilamino)-pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-6-metilen-3-[2-(2-(S)-fenil-1-metiletilamino)-pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-6-hidroxi-6-hidroximetil-3-(2-fenoxipirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(3-trifluorometilfenil)-3-(2-fenoxi-pirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-fluorofenil)-3-(2-(6-aminopirimidin-4-iloxi)pirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-fluorofenil)-3-[2-(3-fluorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-fluorofenil)-3-[2-(2,4-dimetilfenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(2,4-difluorofenil)-3-(2-fenoxi-pirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-fluorofenil)-3-[2-(4-clorofenoxi)pirimidin-4-il]-6,7-dihidro-5H-pirazol-[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[1-(R,S)-(4-fluorofenil)etilamino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

Ácido 2-{4-[2-(4-Fluorofenil)-3-oxo-6,7-dihidro-3H,5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-il]-pirimidin-2-ilamino}-propiónico;

2-{4-[2-(4-Fluorofenil)-3-oxo-6,7-dihidro-3H,5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1-il]-pirimidin-2-ilamino}-N,N-dimetil propionamida;

2-(4-Fluorofenil)-3-(2-([1,3,4]tiadiazol-2-ilamino)pirimidin-4-il)-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[(piridin-2-ilmetil)amino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-(2-metoxipropilamino)pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[(furan-2-ilmetil)amino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

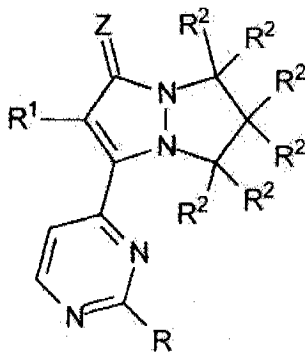
2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[(3-benzo[1,3]dioxol-5-il)amino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona;

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-[(1-(propan-1-sulfonyl)piperidin-4-ilamino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona; y

2-(4-Fluorofenil)-3-{2-(4-metoxibencilamino)amino]pirimidin-4-il}-6,7-dihidro-5H-pirazol[1,2-a]pirazol-1 -ona.

18. Una composición farmacéutica que comprende:

a) una cantidad eficaz de una o más pirazolonas bicíclicas incluidas todas las formas enantioméricas y diastereoméricas y sales farmacéuticamente aceptables de las mismas, el compuesto corresponde a la fórmula:

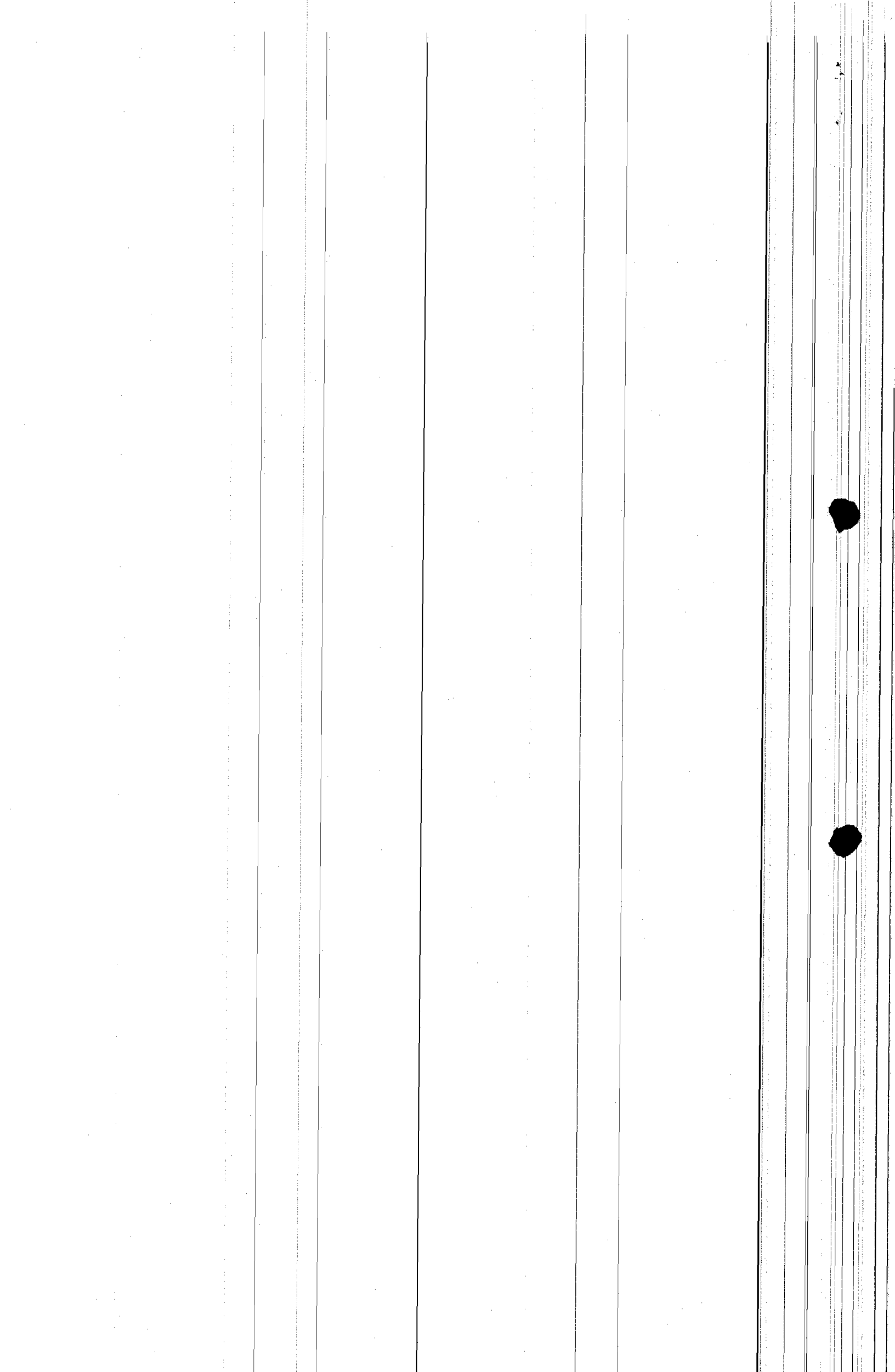


en donde

a) $-O[CH_2]_kR^3$; o

b) $-NR^{4a}R^{4b}$;

R^3 es alquilo C_1 - C_4 sustituido o no sustituido, hidrocarbilo sustituido o no sustituido, heterociclilo sustituido o no sustituido, arilo o alquilenarilo



sustituido o no sustituido, heteroarilo o alquilenheteroarilo sustituido o no sustituido; el subíndice k es de 0 a 5;

R^{4a} y R^{4b} son independientemente:

- a) hidrógeno; o
- b) $-[C(R^{5a}R^{5b})]_mR^6$;

cada R^{5a} y R^{5b} son independientemente hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 lineal, ramificado o cíclico, y mezclas de los mismos; R^6 es hidrógeno, $-OR^7$, $-N(R^7)_2$, $-CO_2R^7$, $-CON(R^7)_2$; alquilo C_1 - C_4 sustituido o no sustituido, aril heterociclo sustituido o no sustituido, arilo sustituido o no sustituido o heteroarilo sustituido o no sustituido; R^7 es hidrógeno, un catión hidrosoluble, alquilo C_1 - C_4 o arilo sustituido o no sustituido; el subíndice m tiene un valor de 0 a 5;

R^1 es:

- a) arilo sustituido o no sustituido; o
- b) heteroarilo sustituido o no sustituido;

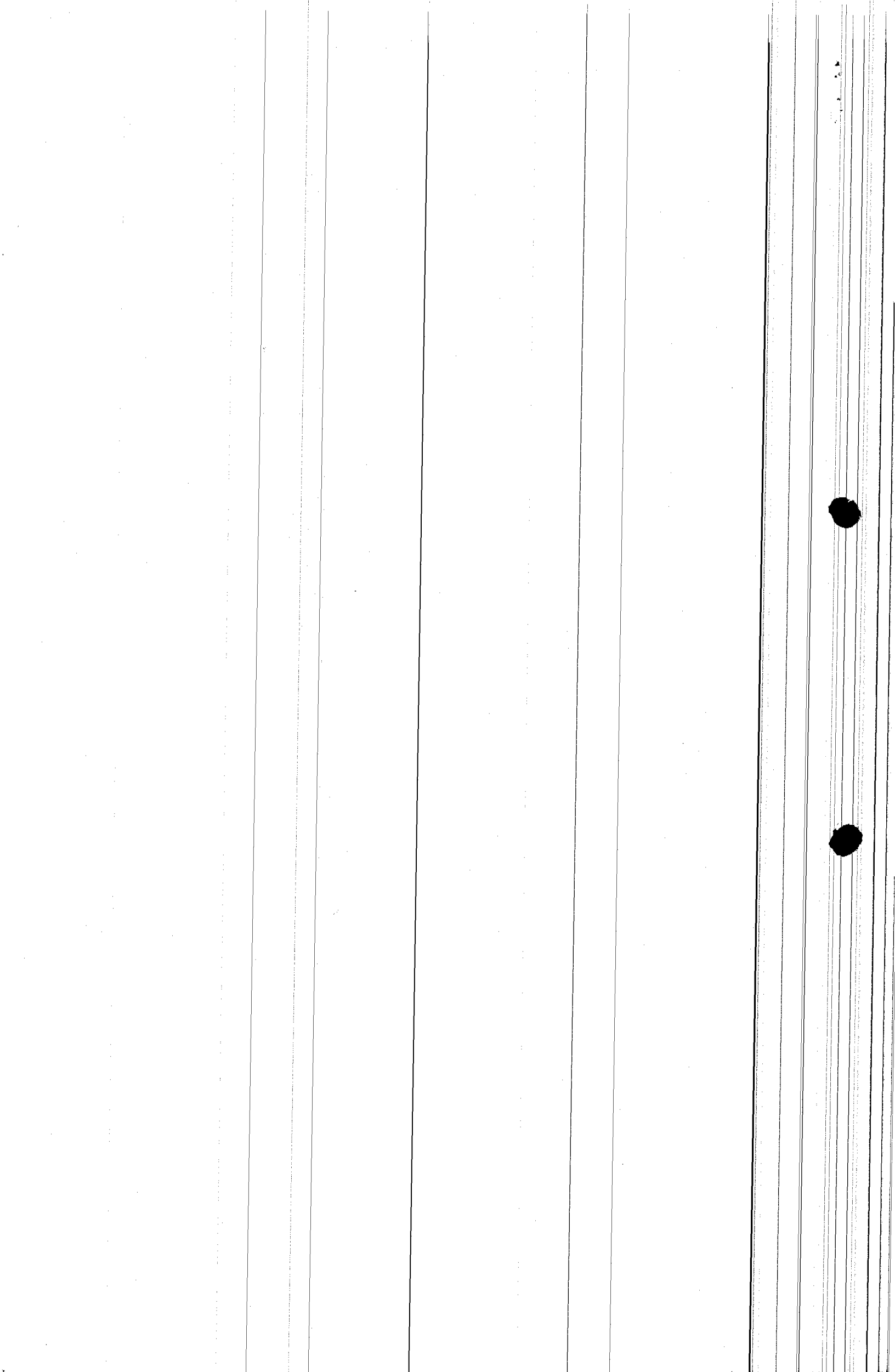
cada unidad R^2 de manera independiente se selecciona del grupo que consiste de:

- a) hidrógeno,
- b) $-(CH_2)_jO(CH_2)_nR^8$;
- c) $-(CH_2)_jNR^{9a}R^{9b}$;
- d) $-(CH_2)_jCO_2R^{10}$
- e) $-(CH_2)_jOCO_2R^{10}$
- f) $-(CH_2)_jCON(R^{10})_2$;
- g) $-(CH_2)_jOCON(R^{10})_2$;
- h) dos unidades R^2 se pueden unir entre sí para formar una unidad carbonilo;
- i) y mezclas de los mismos;

R^8 , R^{9a} , R^{9b} y R^{10} son independientemente hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , y mezclas de los mismos; R^{9a} y R^{9b} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; dos unidades R^{10} se pueden unir entre sí y formar un anillo carbocíclico o heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos; el subíndice j tiene un valor de 0 a 5, el subíndice n tiene un valor de 0 a 5;

Z es O, S, NR^{11} o NOR^{11} ; R^{11} es hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 ; y

- b) uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.



(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
9. August 2001 (09.08.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 01/57042 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07D 487/04**,
A61K 31/395, C07D 513/04, 471/04, 498/04

(74) Anwälte: **KINZEBACH, Werner** usw.; Reitsstötter,
Kinzebach & Partner, Sternwartstr. 4, 81679 München
(DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/01011

(22) Internationales Anmeldedatum:
31. Januar 2001 (31.01.2001)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 04 157.4 1. Februar 2000 (01.02.2000) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **MERCKLE GMBH** [DE/DE]; Graf-Arco-Str. 3,
89079 Ulm (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

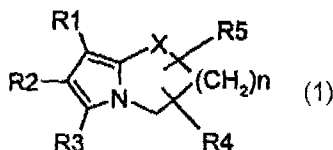
Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu
veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.

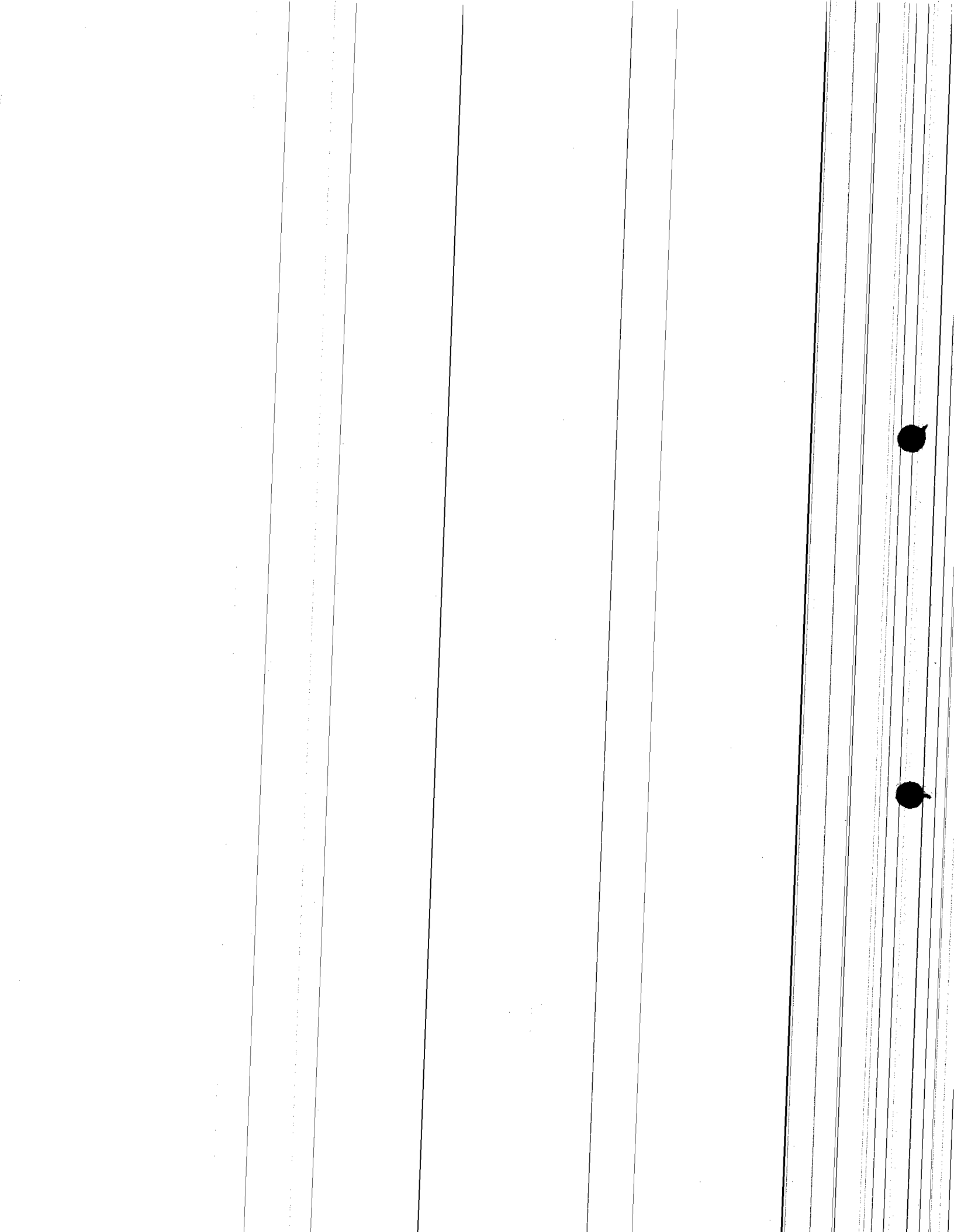
(54) Title: 4-PYRIDYL-AND 2,4-PYRIMIDINYL-SUBSTITUTED PYRROLE DERIVATIVES AND THEIR USE IN PHAR-
MACY

(54) Bezeichnung: 4-PYRIDYL- UND 2,4-PYRIMIDINYL-SUBSTITUIERTE PYRROLDERIVATE UND IHRE ANWEN-
DUNG IN DER PHARMAZIE

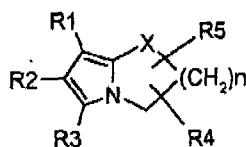


(57) Abstract: The invention concerns 4-pyridyl- and 2,4-pyrimidinyl-substituted
pyrrole derivatives of formula (1) and their use in pharmacy, wherein the variables
have the meaning cited in the description. The compounds according to the invention
have immunomodulating and/or cytokine release-inhibiting effect and are hence
useful for the treatment of diseases associated with disorders of the immune system.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung 4-Pyridyl- und 2,4-Pyrimidinyl-
substituierte Pyrrolerivate und ihre Anwendung in der Pharmazie der Formel (1), wo-
rin die Variablen die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen besitzen. Die erfindungsgemässen Verbindungen besitzen im-
munmodulierende und/oder die Cytokinfreisetzung hemmende Wirkung und sind daher zur Behandlung von Erkrankungen brauch-
bar, die mit einer Störung des Immunsystems im Zusammenhang stehen.

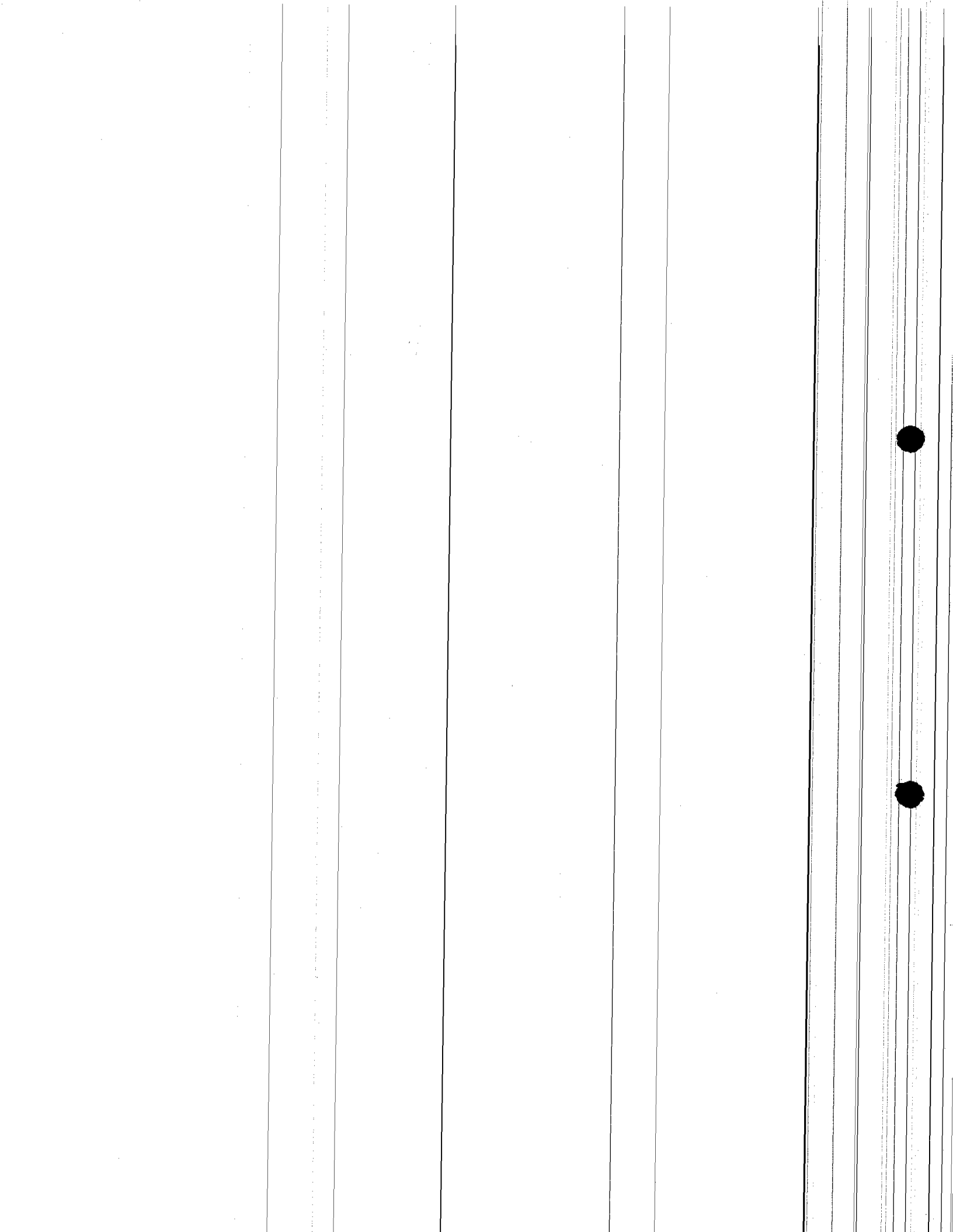


5. Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, worin die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:



5

X	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
CH ₂	1	CO ₂ Et	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	4-Pyridyl	CO ₂ Et	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	CO ₂ H	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	CH ₂ OH	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	CH ₃	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	H	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	CO ₂ Et	4-Pyridyl	2-thienyl-	H	H
CH ₂	1	4-Pyridyl	CO ₂ Et	2-thienyl-	H	H
CH ₂	1	CO ₂ H	4-Pyridyl	2-thienyl-	H	H
CH ₂	1	H	4-Pyridyl	2-thienyl-	H	H
CH ₂	1	CO ₂ Et	4-Pyridyl	5-Cl-2-thienyl-	H	H
CH ₂	1	4-Pyridyl	CO ₂ Et	5-Cl-2-thienyl-	H	H
S	1	CO ₂ Et	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
S	1	4-Pyridyl	CO ₂ Et	4-F-Phenyl	H	H
S	1	CO ₂ H	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
S	1	CH ₂ OH	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
S	1	CH ₃	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
S	1	H	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	2	CO ₂ Et	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	2	4-Pyridyl	CO ₂ Et	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	2	CH ₂ OH	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	2	CH ₃	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	2	H	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	H
CH ₂	1	CO ₂ Et	4-F-Phenyl	4-Pyridyl	H	H
CH ₂	1	4-F-Phenyl	CO ₂ Et	4-Pyridyl	H	H
CH ₂	1	CH ₂ OH	4-F-Phenyl	4-Pyridyl	H	H
CH ₂	1	CH ₃	4-F-Phenyl	4-Pyridyl	H	H
CH ₂	1	H	4-F-Phenyl	4-Pyridyl	H	H
S	2	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	CH ₃	CH ₃
O	2	4-Pyridyl	4-F-Phenyl	H	CH ₃	CH ₃
CH ₂	1	Phenyl	4-F-Phenyl	4-Pyridyl	H	H
CH ₂	1	Phenyl	2,4-Pyrimidyl	CH ₃	H	H
CH ₂	1	4-F-Phenyl	2,4-Pyrimidyl	CH ₃	H	H
CH ₂	1	CH ₃	4-F-Phenyl	2,4-Pyrimidyl	H	H
CH ₂	1	Phenyl	3-Amino-2,4-Pyrimidyl	CH ₃	H	H
CH ₂	1	4-F-Phenyl	3-Amino-2,4-Pyrimidyl	CH ₃	H	H
CH ₂	1	CH ₃	4-F-Phenyl 3-	Amino-2,4-Pyrimidyl	H	H



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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
JIMENA ESCOBAR

ASUNTO	Radicación	04-21424
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	09871
	Folios	007

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	<u>PCT/US02/30135</u>
Fecha de Presentación Internacional.	<u>20/09/2002</u>

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

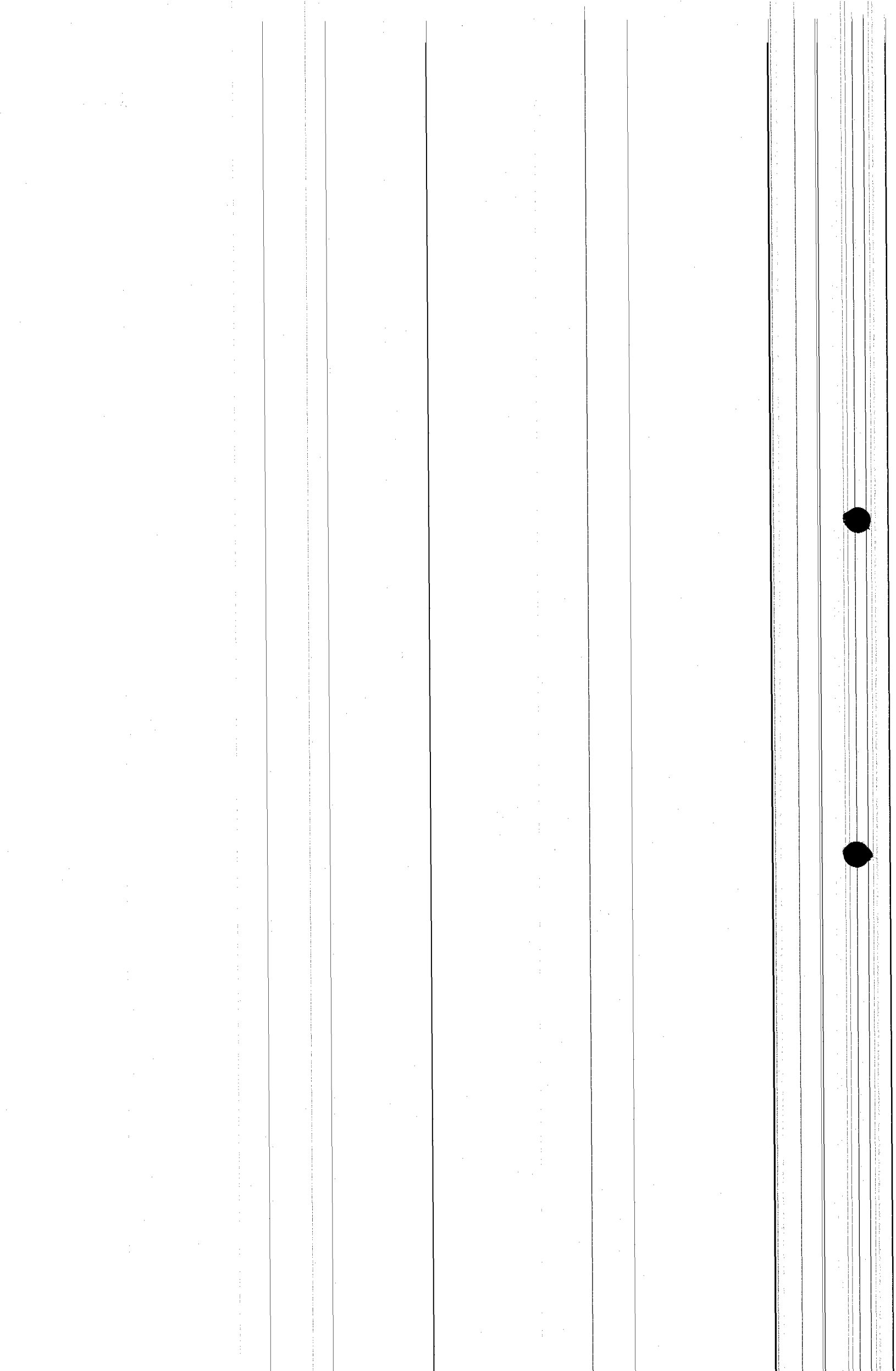
- 1.1. Descripción: Folios: 7 a 115 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios 170 a 184 modificado según respuesta del solicitante
- 1.3. Prioridad: US 60/323,625 del 20/09/2001
- 1.4. Respuesta del solicitante: Folios 164 a 184.

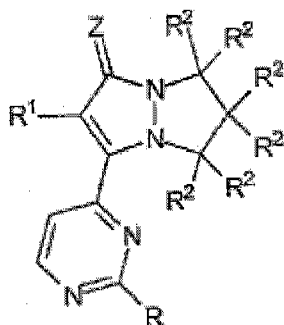
2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: 6,7-DIHIDRO-5H-PIRAZOL(1,2- α)PIRAZOL-1-ONAS QUE CONTROLAN CITOCINAS INFLAMATORIAS.

Objeto de la invención:

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en compuestos de fórmula general (I) y composiciones farmacéuticas de los mismos.





Reivindicaciones 1 a 17: Compuestos de la fórmula (I) y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Reivindicación 18: Una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva de compuestos de la fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

El problema planteado en esta solicitud de patente es la necesidad de proveer compuestos que inhiban la liberación de citocinas inflamatorias y sean útiles en el tratamiento de diversos trastornos mediados por la acción de estas proteínas, entre ellos, la artritis y la osteoartritis.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula general (I) y composiciones farmacéuticas de los mismos.

Se catalogó el objeto de la invención según la IPC en las categorías C07D 487/04, A61K 31/506 y A61P 29/00.

3. De la solicitud de Patente

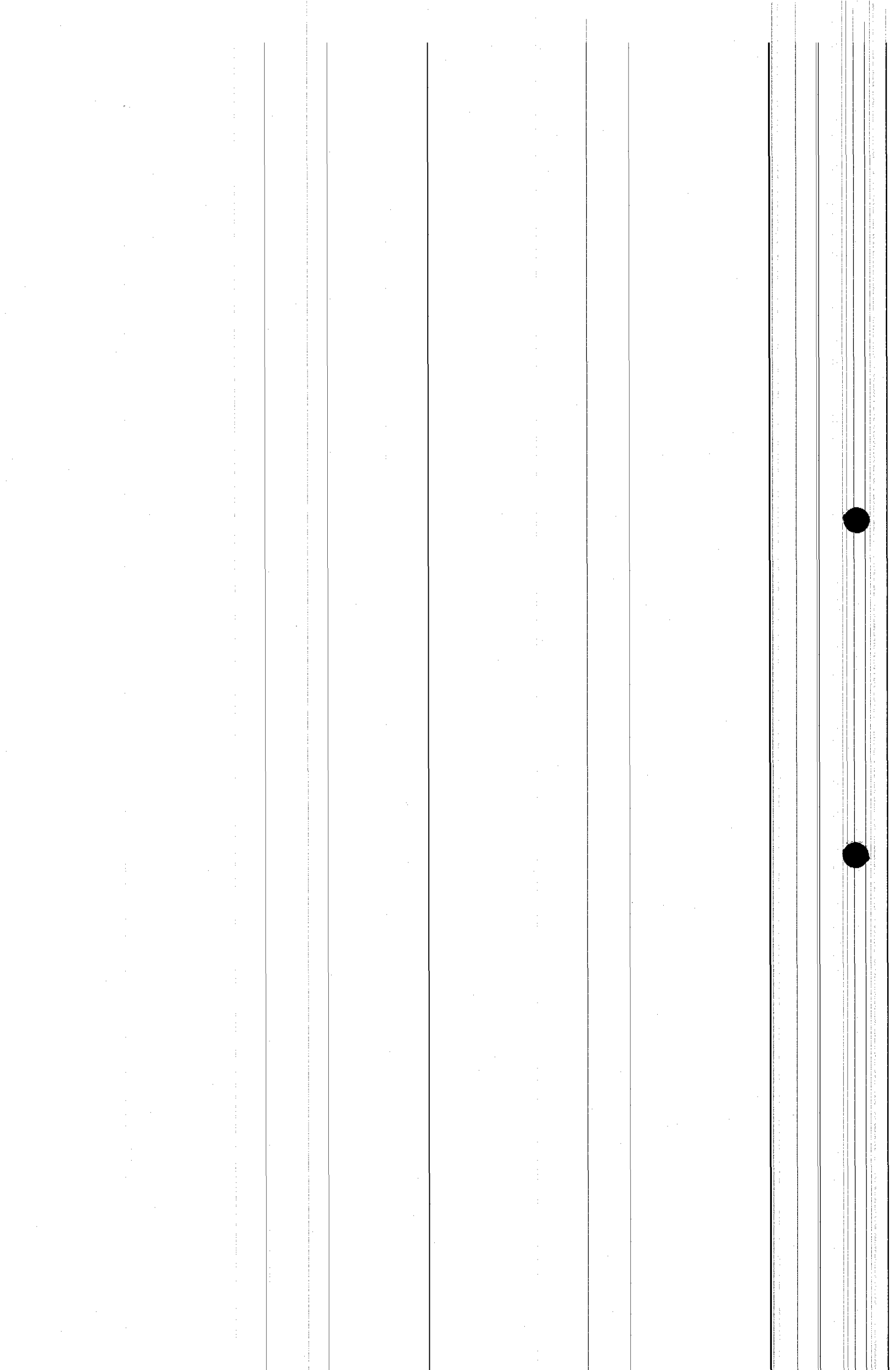
3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En la reivindicación 1 se utilizan términos como *arilo sustituido*, *heteroarilo sustituido*, *cación hidrosoluble* y *heterociclo* que son muy generales y no son concisos. De igual forma, los sustituyentes de la fórmula (I) representan un gran número de compuestos diferentes que pueden generar una gran cantidad de compuestos, con lo cual no se estaría delimitando de manera concisa la materia a proteger en esta solicitud de patente de acuerdo a lo sustentado en la descripción.

4. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 20/09/2001, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 0157042	4-pyridyl-and 2,4-pyrimidinyl-substituted pyrrole derivatives and their use in pharmacy	09/08/2001

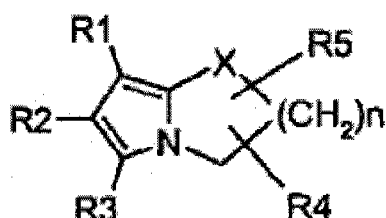


5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

5.1. Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

El estado de la técnica más cercano es el documento D1 el cual describe compuestos de fórmula:



Estos compuestos son moduladores de la actividad de citocinas inflamatorias, por lo que son útiles para el tratamiento de diferentes enfermedades en la cual está implicadas estas proteínas, entre ellas las enfermedades alérgicas e inflamatorias.

Al hacer los respectivos reemplazos de los radicales R1 a R5 de la fórmula de D1, se obtienen compuestos muy similares a las de la presente solicitud, así, al realizar las siguientes sustituciones en la fórmula de D1:

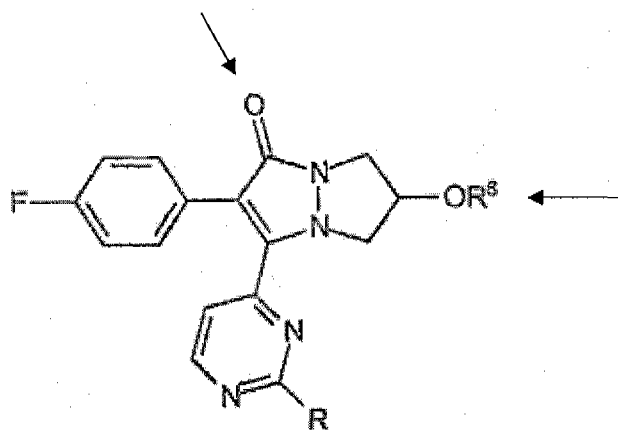
$X=CH_2$

$n=1$

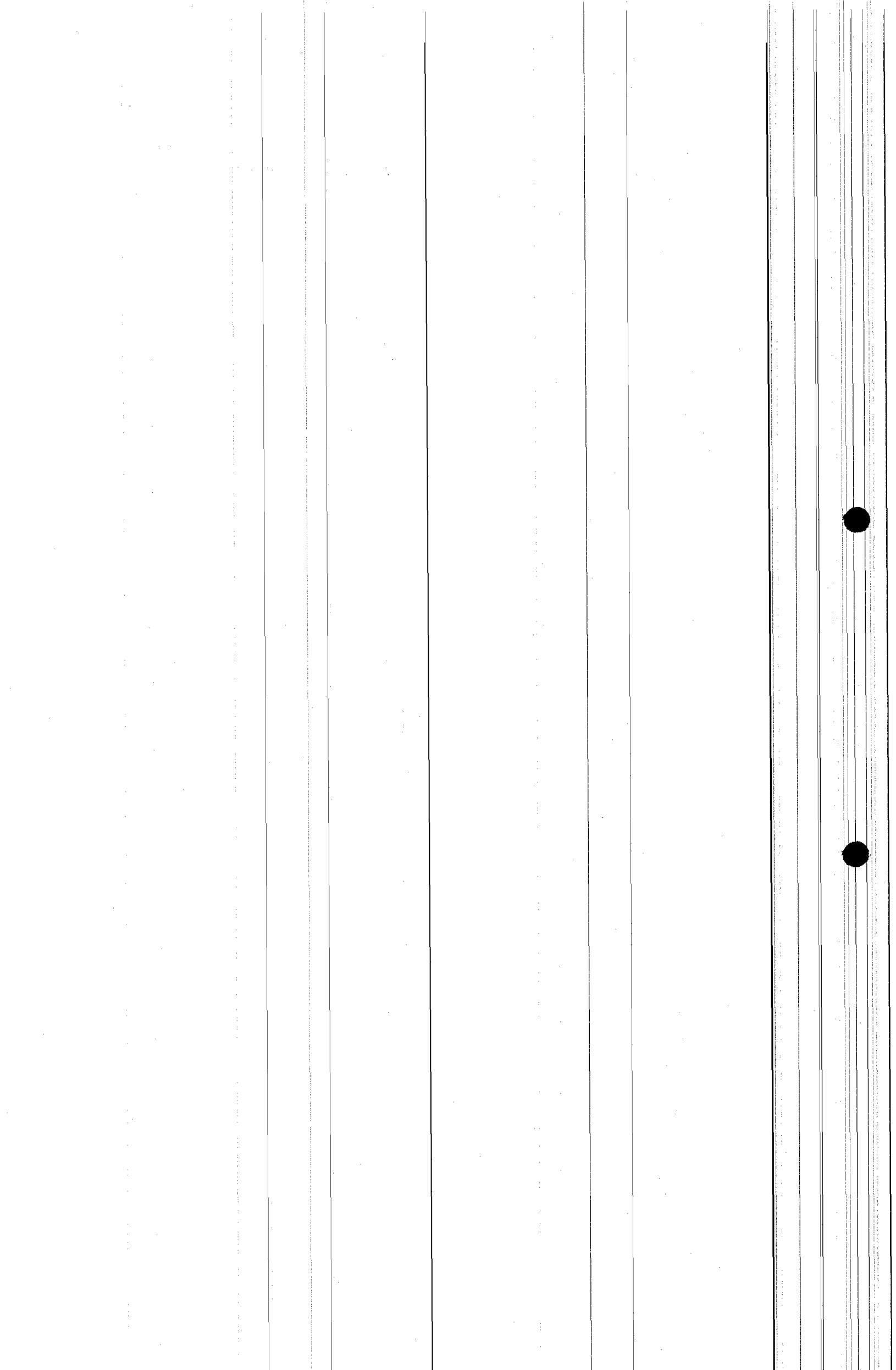
$R_3= 3\text{-amino-2,4-pirimidil}$

$R_2= 4\text{-fluorofenil}$

se obtienen compuestos con estructuras semejantes a los de fórmula (I) de la presente solicitud, tal como los de fórmula:



Como se puede observar, se forman compuestos con el mismo núcleo básico que solo se diferencian en la presencia de un átomo de nitrógeno adicional en los anillos fusionados de cinco miembros y en los sustituyentes de este núcleo básico indicados con la flecha.



Estas diferencias estructurales no parecen concederle a los compuestos reivindicados un efecto técnico inesperado, ventaja o mejora con respecto a los presentes en el estado de la técnica, ya que siguen siendo útiles para el tratamiento de trastornos asociados a la actividad de las citocinas inflamatorias y no se muestran ensayos ni datos que demuestren mayor eficacia de los compuestos reivindicados en la presente solicitud, por lo tanto se les puede considerar compuestos alternativos a los ya conocidos.

Teniendo en cuenta el problema técnico de la presente solicitud, el cual es la necesidad de proveer compuestos que modulen la acción de las citocinas y sean útiles en el tratamiento de diversos trastornos mediados por la acción de estas proteínas, vemos que la información de la anterioridad citada le sugiere al experto en la materia utilizar las enseñanzas de allí indicadas para sintetizar compuestos similares y solucionar así este problema técnico de manera obvia, por lo tanto el objeto reivindicado no tiene nivel inventivo.

Si el solicitante considera que los compuestos de la presente solicitud son superiores a los del estado de la técnica más cercano, debe adjuntar la correspondiente información y los datos que lo demuestren.

6. Conclusión

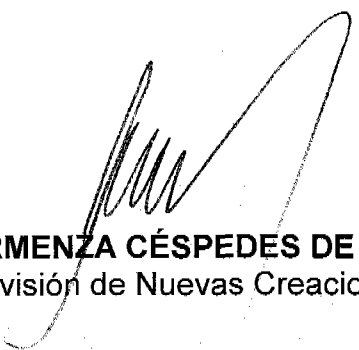
Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 0157042	1 a 18	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 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.

[illegible]

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 N° 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
01 AGO. 2008

CONCEPTO TECNICO No. 1909

EXAMINADOR TECNICO
Código No. 202077

