

Clarke, Modet & Co

COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 04-021427-00015-0000

Fecha 2009-06-10 15 02 32 Dep 2020 NUECREACIONI
Tra 11 PATENTEIYII Eve 379 FASENACIONALI
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios 24

P-1184

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E.

S.

D.

Re: Expediente No. **04-021.427**

Solicitud de patente a nombre de **NOVARTIS AG**

Yo, DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, actuando como apoderada sustituta de acuerdo con la sustitución adjunta, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **NOVARTIS AG.**, domiciliada en Basilea Suiza, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 3186 notificado por fijación en lista el 13 de marzo de 2009, relacionado con el concepto técnico de fondo No. 417, me permito manifestar:

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 que consta de cinco (5) reivindicaciones y en el cual se han realizado las siguientes modificaciones:

1.1 Se limitó el alcance de la invención a los compuestos ejemplificados en la solicitud. Para esto, se especificó dentro de la nueva reivindicación 1 que R es únicamente hidrógeno y X únicamente =CH-.

1.2 Se limitaron los significados para el sustituyente R13 de acuerdo con las modalidades preferidas y los ejemplos realizados en la invención.

1.3 De acuerdo con lo anterior, se introdujo la nueva reivindicación 2 que enuncia específicamente los compuestos revelados en los ejemplos mencionados en las páginas 33 a 280 de la memoria descriptiva.

1.4 Las nuevas reivindicaciones 3 y 4 corresponden a la materia contenida en la antigua reivindicación 6 donde se revela el proceso para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) o una sal o éster del mismo.

1.5 La nueva reivindicación 5 corresponde a la antigua reivindicación 5 que cubre la composición farmacéutica que contiene un compuesto de la reivindicación 1.

El sustento para estas modificaciones se encuentra entre las páginas 2 a 30 y 33 a 280 de la memoria descriptiva y en las antiguas reivindicaciones 1, 3, 5 y 6 anteriormente presentadas.

2 / 482
x2

Sobre este particular nos permitimos manifestar que las anteriores modificaciones no involucran ampliación alguna de la materia originalmente presentada en esta solicitud y se dan como respuesta a las objeciones presentadas por el señor examinador en su concepto técnico No. 417.

Teniendo en cuenta el concepto técnico emitido por el Señor Superintendente Delegado para la propiedad intelectual Gian Carlo Marcenaro Jiménez a la doctora Ana Maria Castro Wey, el cual fue radicado el día 4 de marzo de 2009 bajo el No. 09-012566, no se presenta tasa adicional, toda vez que el nuevo capítulo reivindicatorio no comprende más de 15 reivindicaciones.

2. Claridad de la solicitud

2.1 Reivindicaciones

Es deseo del solicitante manifestar que atendiendo la sugerencia realizada por el señor examinador, se limitó el alcance del nuevo capítulo reivindicatorio a los compuestos de fórmula (I) solicitados de acuerdo con los ejemplificados que corresponden a la invención y que presentan actividad como inhibidores de la catepsina K.

Habiendo atendido cabalmente las objeciones de claridad presentadas por ese despacho, atentamente solicitamos se conceda el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio o si el examinador considera que subsisten razones para objetar la presente invención rogamus expedir otro examen de fondo con los debidos motivos y razones que sustenten su objeción con el fin de que nuestro mandante tenga la posibilidad de exponer sus argumentos con base en la interpretación de los artículos 45 de la Decisión 486 -el cual otorga la facultad al examinador para emitir los exámenes de fondo-, 35 y 59 del Código Contencioso Administrativo que señala que: *"habiéndose dado oportunidad a los interesados para expresar sus opiniones, y con base en las pruebas e informes disponibles, se tomará la decisión que será motivada al menos en forma sumaria si afecta a particulares"* y *"(.) deberá proferirse la decisión definitiva. Esta se motivará en sus aspectos de hecho y de derecho, y en los de conveniencia si es el caso"*, respectivamente (El subrayado es nuestro).

En consecuencia, solicitamos a ese despacho pronunciarse en relación con todos los argumentos presentados en este memorial dando estricta aplicación al principio del debido proceso consagrado en el artículo 29 de la Constitución Nacional

Señor Superintendente,

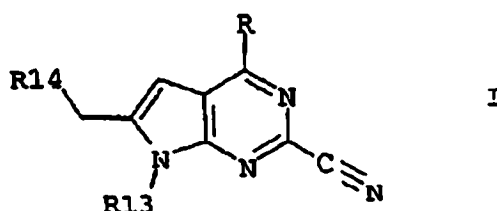


DILIA MARIA RODRIGUEZ
D'ALEMAN
CC. 41.654.882

407
407

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I,



en donde R es H,

R13 es alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 10 átomos de carbono o cicloalquilo de 3 a 10 átomos de carbono-alquilo 1 a 7 átomos de carbono, cada uno de los cuales es independiente y opcionalmente substituido por halo, hidroxilo, CN, NO₂ u opcionalmente mono- ó di-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono amino substituido; y

R14, es H o fenilo opcionalmente substituido, fenilo-W, fenilo-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono-W, cicloalquilo de 3 a 10 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 10 átomos de carbono-W-, N-heterociclilo o N-heterociclilo-W-, (donde N-heterociclilo denota un residuo heterocíclico aromático o saturado que contiene nitrógeno unido por medio de su átomo de nitrógeno que tiene desde 3 a 8 átomos por anillo opcional y adicionalmente conteniendo 1, 2 ó 3 heteroátomos seleccionados de N, NR₆, O, S, -S(O)₂- en donde R₆ es H ó alquilo de 1 a 7 átomos de carbono opcionalmente substituido, fenilo, en donde el N-heterociclilo está opcionalmente fusionado en una estructura bicíclica con un anillo de benceno o piridina y en donde el N-heterociclilo está opcionalmente unido en una estructura espiro con un anillo heterocíclico o cicloalquilo de 3 a 8 átomos de

405
405

carbono, en donde el anillo heterocíclico tiene desde 3 a 10 miembros por anillo y contiene desde 1 a 3 heteroátomos seleccionados de N y S, ftalimida, hidantoina, oxazolidinona, o 2,6-dioxo-piperazina, en donde -W- es -O-, -C(O)-, NH(R6)-, -NH(R6)-C(O)-, NH(R6)-C(O)-O-, (en donde R6 es como se definió anteriormente), -S(O)-, S(O)₂ ó -S-;

en donde R14 es opcionalmente sustituido por R18 que representa desde 1 a 3 sustituyentes seleccionados de halo, hidroxí, CN, NO₂, oxo, amido, carbonil, sulfonamido y dioximetileno o alcoxi de 1 a 7 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilo de 1 a 7 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquenilo de 2 a 7 átomos de carbono, alcoxicarbonilo de 1 a 7 átomos de carbono opcionalmente sustituido, opcionalmente mono- ó di-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono-amino sustituido, fenilo, fenilo-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, aril-alquenilo de 1 a 7 átomos de carbono, N-heterociclilo, N-heterociclilo-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, (en donde N-heterociclilo es como se definió anteriormente) ó N-heterociclilo en donde heterociclilo denota un anillo que tiene desde 3 a 10 miembros por anillo y que contiene desde 1 a 3 heteroátomos, seleccionados de N,O,S ó

R14 comprendiendo un fenilo que contiene un fenilo fusionado con un anillo que contiene heteroátomo y en donde R18 es opcionalmente sustituido por R19, el cual representa de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de halo, hidroxí, CN, NO₂ y oxo, ó alcoxi de 1 a 7 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilo de 1 a 7 átomos de carbono, alkoxi de 1 a 7 átomos de carbono-alquilo de 1 a 7

átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 10 átomos de carbono, alcóxicarbonilo de 1 a 7 átomos de carbono, alquilo de 1 a 7 átomos de carbono-halo, opcionalmente mono ó di-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono amino sustituido, fenilo, alquilcarbonilo de 1 a 7 átomos de carbono, formilo, N-heterociclilo o N-heterociclilo-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono en donde N-heterociclilo es como se definió anteriormente, en donde R19 es opcionalmente sustituido por 1 a 4 sustituyentes seleccionados de halo, hidroxí, CN, NO₂, oxo, opcionalmente mono ó di-alquilo de 1 a 7 átomos de carbono amino sustituido, alquilo de 1 a 7 átomos de carbono y alcoxí de 1 a 7 átomos de carbono o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o una sal o éster farmacéuticamente aceptable del mismo seleccionado de los siguientes compuestos:

Derivados de 6-feniloxi-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carboxamida, que comprenden

6-(6-Cloro-piridin-3-iloximetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Clorhidrato de 7-(2,2-dimetil-propil)-6-(piridin-4-iloximetil)-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(2-difluorometil-piridin-4-iloximetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(6-metoxi-piridazin-3-iloximetil)-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(4-metil-piperazin-1-ilmetil)-fenoximetil]-7H-pirrólo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

407
408

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-metil-piperazin-1-ilmetil)-
fenoximetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-(6-cloro-pirimidin-4-iloximetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-[6-(4-metil-piperazin-1-il)-pirimidin-4-
iloximetil]-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-(6-morfolin-4-il-pirimidin-4-
iloximetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Derivados de 6-fenilamino-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo que comprenden

6-{{[4-Cloro-fenil)-metil-amino]-metil}-7-(2,2-dimetil-propil)-
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-[(4-cloro-pirimidin-2-ilamino)-metil]-7-(2,2-dimetil-propil)-
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
N-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-
6-ilmetil]-4-fluoro-benzamida,

Derivados de 6-fenilsulfanil-7H-pirrolo-[2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo que comprenden

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(piridin-2-ilsulfanilmetil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-ciclopentansulfonilmetil-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-ciclohexansulfonilmetil-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Derivados de 6-azol-7H-pirrolo-[2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo que comprenden

7-(2,2-dimetil-propil)-6-imidazol-1-ilmetil-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-Dimetil-propil)-6-(3-nitro-[1,2,4]triazol-1-ilmetil)-7H-
pirrolo{2,3-d} pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(3-Amino-[1,2,4]triazol-1-ilmetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

N-{1-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-1H-[1,2,4]triazol-3-il}-2-piperidin-1-il-
acetamida,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-tetrazol-2-ilmetil-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-tetrazol-1-ilmetil-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[5-(4-hidroximetil-fenil)-tetrazol-2-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d]pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[5-(4-piperidin-1-ilmetil-fenil)-
tetrazol-2-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Derivados de 6-piperazinil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo que comprenden

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-metoxi-fenil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(4-acetil-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-
propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(5-etil-pirimidin-2-il)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-metil-4-nitro-fenil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d]pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-diraetil-propil)-6-[4-(6-fluoro-piridin-3-il)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

409
401

7-(2,2-dimetil-propil)-6-piperazin-1-ilmetil-7H-pirrolo[2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-fluoro-4-metil-fenil)-piperazin-
1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-fluoro-2-metil-fenil)-piperazin-
1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

4-[2-Ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-
6-ilmetil]-piperazin-1-carboxamidina,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-fluoro-bencil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-butiril-piperazin-1-ilmetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

N-(4-{4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo[2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-piperazin-1-il}-fenil)-
metansulfonamida,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-trifluorometoxi-fenil)-piperazin-
1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-trifluorometil-fenil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-
propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(3,4-dimetil-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-
propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2,6-dimetil-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-
propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-etoxi-fenil)-piperazin-1-
ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

410
40

6-(4-ciclopentil-piperazin-1-ilmetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-etoxi-etil)-piperazin-1-ilmetil] -
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(3-metoxi-propil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-metoxi-etil)-piperazin-1-ilmetil]-
7H-pirrolo [2,3-d]pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-fenil-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-{2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-etoxi-2-fluoro-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[2-fluoro-4-(2-idroxi-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]-pirimidin-2-carbonitrilo,
6-{4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-{4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-{4-[3-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-{4-[2-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-{4-[4-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[3-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[2-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{4-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{3-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{2-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{4-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-propoxi]-fenil}-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{3-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-propoxi]-fenil}-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-[2-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-propoxi]-fenil]-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[4-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[3-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[2-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[4-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[3-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[2-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-piperidin-1-il-etil)-piperazin-1-
ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2-dietilamino-etil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-
propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(1-metil-piperidin-4-il)-piperazin-
1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(4-etoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-isobutil-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-isobutil-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[3-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil]-7-
isobutil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-(4-{4-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-(4-{3-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-isobutil-6-(4-{2-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil}-
piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-(4-[4-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil)-7-isobutil-
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(4-Metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(3-metil-butil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(3-metil-butil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7-(3-metil-butil)-
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Derivados de 6-piperidinilmetil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo que comprenden

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-oxo-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo
[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-hidroxiimino-piperidin-1-ilmetil)-
7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-amino-piperidin-1-ilmetil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(3-imidazol-1-il-propilamino)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Fenilamina del ácido 1-2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-6-ilmetil]-piperidin-4-carboxílico;

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1,1-dioxo-II⁶-tiomorfolin-4-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(3,4,5-trimetoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-[3-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-[2-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-[4-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo.

6-(4-[3-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[2-(2-dietilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

415
A19

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{4-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-
etoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-
2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{3-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-
etoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-{2-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-
etoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-(4-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-
propoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-(3-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-
propoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-(2-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-
propoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[4-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-
piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[3-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-
piperidin-1-ilmetilil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-
carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-{4-[2-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-
piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(2-{3-[4-(2-hidroxi-etil)-piperazin-
1-il]-propoxi}-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

AT 6
416

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1-metil-2,4-dioxo-3-propil-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(3-metil-2,4-dioxo-1-propil-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(3-metil-2,4-dioxol-propil-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1-etil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-3-propil-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrollo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrollo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-7-isobutil-7H-pirrollo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-{4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-7-isobutil-7H-pirrollo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-(4-(3-[2-(4-metil-piperazin-1-il)-etoxi]-fenil)-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrollo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

917

7-isobutil-6-(4-{3-[3-(4-metil-piperazin-1-il)-propoxi]-fenil}-piperidin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-isobutil-6-{4-[4-(2-pirrolidin-1-il-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(3-metil-butil)-6-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro(4.5)dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-(4-metoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil)-7-(3-metil-butil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(4-metoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Derivados de 6-bencil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo que comprenden

6-bencil-7-isobutil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
7-(2,2-dimetil-propil)-6-naftalen-2-ilmetil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-cloro-bencil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-[4-(4-metil-piperazin-1-il)-bencil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-(4-hidroximetil-bencil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-(4-bromometil-bencil)-7-ciclohexil-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-ciclohexil-6-(4-dietilamínometil-bencil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

17

418
A18

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-metoxi-bencil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-etil-piperazin-1-ilmetil)-bencil]-
7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-[1,2,4]triazol-1-ilmetil-bencil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(morfolin-4-carbonil)-bencil]-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

N-{4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-metansulfonamida,

N-{4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-metansulfonamida,

6-(4-amino-bencil)-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(4-pirrol-1-il-bencil)-7H-pirrolo [2,3-
d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Butan-1-ácido sulfónico {4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-
pirrolo [2,3-d] pirimidin-6-ilmetil]-fenil} -amida,

N-{4-[2-(ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-N-metil-metansulfonamida,

N-{4-[2-(ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-acetamida,

N-4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-butiramida,

Ácido N-{4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-succinámico,

Ácido N-{4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d]
pirimidin-6-ilmetil]-fenil}-succinámico

18

419
419

Derivados de hidantoína, oxazolidinona y 2,6-dioxopiperazina que comprenden

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1,3-dioxo-1,3-dihidro-isoindol-2-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

N-{2-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-6-ilmetil]-1,3-dioxo-2,3-dihidro-1H-pirrolo [3,4-c]piridin-5-il}-metansulfonamida,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(3-metil-1,4-dioxo-3,4-dihidro-1H-ftalazin-2-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-[3-(4-cloro-bencil)-2,5-dioxo-imidazolidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,
6-[(R)-3-(4-cloro-bencil)-4-isopropil-2,5-dioxo-imidazolidin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4,8,8-tetraoxo-1-oxa-8 λ ⁶-tia-3-aza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

2,2,2-tricloro-etilester del ácido 3-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-6-ilmetil]-2,4-dioxo-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4,5]decan-8-carboxílico,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(8-etil-2,4-dioxo-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

420
420

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(8-metansulfonil-2,4-dioxo-1-oxa-3,8-diaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(1-metil-2,4-dioxo-8-propil-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-8-propil-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,4-dioxo-8-pirimidin-2-il-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-3-ilmetil)-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

Tert-butiléster del ácido 4-[2-ciano-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-6-ilmetil]-3,5-dioxo-piperazin-1-carboxílico,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,6-dioxo-4-fenilsulfanil-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo[2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-(2,6-dioxo-piperazin-1-ilmetil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

6-[4-(butan-1-sulfonil)-2,6-dioxo-piperazin-1-ilmetil]-7-(2,2-dimetil-propil)-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

7-(2,2-dimetil-propil)-6-[4-(4-fluoro-fenil)-2,6-dioxo-piperazin-1-ilmetil]-7H-pirrolo [2,3-d] pirimidin-2-carbonitrilo,

20

421
421

8-bromometil-9-(2,2-dimetil-propil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-metil-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-bencil-9-(2,2-dimetil-propil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-[4-(4-etoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9-(2,2-dimetil-propil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-{4-[4-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-[4-(4-metoxi-fenil)-piperidin-1-ilmetil]-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-{4-[4-(2-dimetilamino-etoxi)-fenil]-piperidin-1-ilmetil}-9-(2,2-dimetil-propil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-(2,2-dimetil-propil)-8-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-isobutil-8-[4-(3-metoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-{4-[4-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-9-isobutil-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-[4-(2,4-dimetoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9-isobutil-9H-purin-2-carbonitrilo,
9-isobutil-8-(3-metil-2,4-dioxo-1,3,8-triaza-espiro[4.5]dec-8-ilmetil)-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-metil-9-fenil-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-[4-(4-etoxi-fenil)-piperazin-1-ilmetil]-9-fenil-9H-purin-2-carbonitrilo,
8-{4-[4-(2-hidroxi-etoxi)-fenil]-piperazin-1-ilmetil}-9-fenil-9H-purine-2-carbonitrilo,

425 425

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 04 21427
Clasificación Internacional (IPC): C07D 487/04, A61K 31/52 y A61P 19/00.
Concepto Técnico No. 1824

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

No. Sol. Internacional PCT/EP02/09663
Fecha de Presentación Internacional. 29/08/2002

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

Descripción: Folios 6 a 285 como se radicó inicialmente
Reivindicaciones: Folios 404 a 424 modificado según respuesta del solicitante.
Prioridad: Folio 1 GB 0121033.5 del 30/08/2001
Respuesta del solicitante: Folios 401 a 424.

2. Objeto de la invención

Título: PIRROLO PIRIMIDINAS COMO AGENTES PARA LA INHIBICIÓN DE PROTEASAS DE CISTEINA.

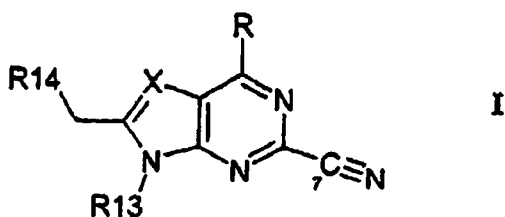
Objeto de la invención:

El objeto de la solicitud consiste en compuestos derivados de pirrolopirimidina de fórmula general (I), sus procesos de preparación y sus composiciones farmacéuticas.

El problema planteado en la solicitud es la necesidad de proveer compuestos inhibidores de la enzima catepsina K que puedan ser utilizados en el tratamiento de enfermedades que involucran niveles elevados de esta enzima, entre las cuales están las enfermedades tumorales y autoinmunes.

Para solucionar este problema técnico, la solicitud proporciona compuestos derivados de pirrolo [2,3-d] pirimidina de fórmula (I) sus procesos de preparación y sus composiciones farmacéuticas.

Reivindicaciones 1 y 2: Compuestos de fórmula general (I).



Reivindicaciones 3 y 4: Procesos para preparar compuestos de fórmula (I).

Reivindicación 5: Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula (I) como un ingrediente activo.

Se catalogó el objeto de la invención según la IPC en las categorías C07D 487/04, A61K 31/52 y A61P 19/00.

3. De la solicitud de patente

Descripción: (artículo 28 D 486)

La descripción divulga de manera clara y completa la invención para que una persona capacitada en la materia técnica pueda ejecutarla, por lo tanto cumple con el requisito de claridad de acuerdo al artículo 28 de la Decisión 486.

Reivindicaciones: (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 son claras, concisas, están enteramente sustentadas en la descripción y cumplen con el requisito de claridad, concisión y sustento en la descripción según el artículo 30 de la Decisión 486.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La solicitud de patente comprende solo una invención y por lo tanto cumple con el requisito de unidad de invención.

5. Es una invención (artículo 15 D 486)

El objeto de la solicitud puede ser considerado como una invención de acuerdo al artículo 15 de la Decisión 486.

6. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D 486)

El contenido de las reivindicaciones 1 a 5 de la solicitud no se encuentra comprendido dentro de las excepciones a la patentabilidad consideradas en el artículo 20 de la Decisión 486.

427
427

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

El contenido de las reivindicaciones 1 a 5, no comprende usos ni segundos usos de acuerdo a los artículos 14 y 21 de la Decisión 486.

8. 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.

Novedad: (artículo 16 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 de la solicitud se refieren a compuestos de fórmula (I), sus procesos de preparación y sus composiciones farmacéuticas.

Se realizó el estudio de novedad comparando elemento por elemento los compuestos, los procesos de síntesis y las composiciones farmacéuticas reivindicadas con las presentes en el estado de la técnica relacionado.

Como resultado de dicho estudio no se encontraron compuestos, ni procesos de síntesis, ni composiciones farmacéuticas idénticas a las de la solicitud, por lo tanto las reivindicaciones 1 a 5 cumplen con el requisito de novedad según el artículo 16 de la decisión 486.

Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

Las reivindicaciones 1 a 5 de la solicitud se refieren a compuestos de fórmula general (I) inhibidores de la enzima catepsina K, sus procesos de preparación y sus composiciones farmacéuticas.

El estado de la técnica revela compuestos monocíclicos tales como pirrolidinas y azetidinas saturadas sustituidas con un grupo CN en el átomo de Nitrógeno, que tienen actividad inhibidora de la enzima catepsina K.

La presente invención describe nuevos compuestos derivados de 7-ciano pirrolopirimidina y sus procesos de síntesis, que presentan grandes diferencias estructurales con respecto al estado de la técnica, ya que corresponden a un sistema bicíclico aromático y que el sustituyente CN se encuentra enlazado al anillo por un átomo de carbono.

Los compuestos de la invención demuestran tener mayor actividad inhibitoria de la enzima catepsina K, dada por valores experimentales de CI_{50} , lo cual evidentemente constituye una ventaja y una solución inesperada nada obvia para un técnico medio versado en el estudio de este tipo de compuestos.