

90

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94 - 76 - Of. 305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tel: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

Escobar, Uribe y Asociados
Carrera 11A No. 94 - 76 - Of. 305
P.O. Box 94948, Bogotá, D.C.
Tel: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889
www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

As: 2694/PCT.

Doctor

GIANCARLO MARCENARO JIMÉNEZ

Superintendente Delegado Para la Propiedad Industrial

EXPEDIENTE: 04-085.802

**ASUNTO: Solicitud de patente a nombre de
Novartis AG.**

Estimado Doctor:

En mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante de la patente de la referencia manifiesto a usted lo siguiente:

1. Mediante memorial radicado en ese despacho el 18 de mayo de 2005, el cual no ha sido resuelto aún, solicité que se realizara el examen de patentabilidad.
2. En vista de que han transcurrido **1 año y 7 meses** sin que se haya atendido dicha solicitud, ruego a usted se sirva dar las instrucciones del caso para que se proceda de inmediato a resolver este asunto.

Cordialmente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
CC 39.779.452 de Usaquén.
T.P. 68228

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 04-085802

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **546** DE

FECHA **30 DE NOVIEMBRE DE 2004** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL **24 DE FEBRERO DEL 2005**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

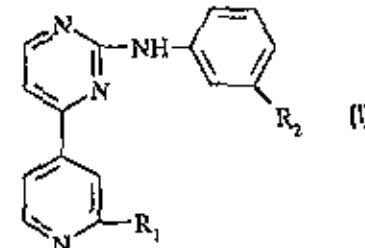
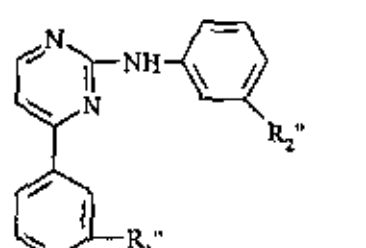
SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO ☒ X _____

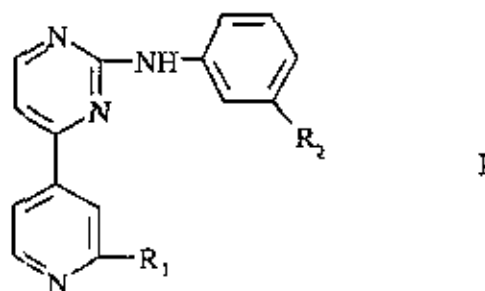


INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ ; C07D 401/04, A61K 31/505	A1	(11) International Publication Number: WO 99/35140 (43) International Publication Date: 15 July 1999 (15.07.99)
(21) International Application Number: PCT/EP99/00060 (22) International Filing Date: 8 January 1999 (08.01.99) (30) Priority Data: 9800522.6 12 January 1998 (12.01.98) GB 9800520.0 12 January 1998 (12.01.98) GB (71) Applicant (for all designated States except AT US): NOVARTIS AG [CH/CH]; Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). (71) Applicant (for AT only): NOVARTIS-ERFINDUNGEN VERWALTUNGSGESSELLSCHAFT MBH [AT/AT]; Brunner Strasse 59, A-1235 Vienna (AT). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): BRINKMANN, Volker [DE/DE]; Sternwaldstrasse 31, D-79102 Freiburg (DE). ETTMAYER, Peter [AT/AT]; Pfaffenbergengasse 7-9/3-12, A-1140 Wien (AT). HEUSSER, Christoph [CH/CH]; Hafenrainstrasse 21, CH-4104 Overwil (CH). WOISETSCHLÄGER, Max [AT/AT]; Binagasse 25, A-1230 Wien (AT).		(74) Agent: BECKER, Konrad; Novartis AG, Patent- und Markenabteilung, Lichtstrasse 35, CH-4002 Basel (CH). (61) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, 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, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With international search report. Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of the receipt of amendments.
(54) Title: PYRIDINYLPYRIMIDINE AMINES AS IMMUNOGLOBULINE E (IgE) SYNTHESIS INHIBITORS		
 (I)  (Ib)		
(57) Abstract Use of the compounds of formula (I) wherein R₁ is halogen, phenyl or alkyl and R₂ is hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy or trifluoromethyl, in free form or salt form, in the treatment of IgE-mediated diseases, including i.a. chronic transplant rejection. The compounds of formula (I) are partly known. A subgroup thereof, namely the compounds of formula (Ib) wherein either R₁'' is halogen of atomic number 17 or 35 and R₂'' is hydrogen or alkoxy, or R₁'' is phenyl or alkyl and R₂'' is hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy or trifluoromethyl, is novel and possesses remarkable cell type specificity. The compounds of formula (Ib) may be prepared e.g. by chlorination or bromination in adjacent position to an N-oxide group or by reaction of the resultant chloro or bromo compound with an organometallic compound.		

Claims:

1. Use of a compound of formula I



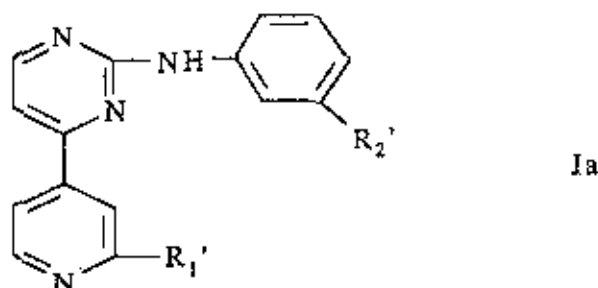
wherein

R₁ is halogen, phenyl or alkyl and

R₂ is hydrogen, halogen, alkyl, alkoxy or trifluoromethyl,

in free form or salt form, in the preparation of a medicament for the therapy of IgE-mediated diseases.

2. Use according to claim 1 of a compound of formula Ia



wherein

R₁' is halogen and

R₂' is halogen, lower alkyl or trifluoromethyl,

in free form or salt form.

3. Use according to claim 2 of a compound of formula Ia in free form or salt form wherein R₁' is halogen and R₂' is halogen or lower alkyl (a compound Iap).


 12

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG


 Anmeldenummer: 89810251.2


 Anmeldetag: 04.04.89


 Int. Cl.⁴: **C 07 D 239/42**

C 07 D 239/47,

C 07 D 405/04,

C 07 D 409/04, C 07 F 9/65,

C 07 D 239/52,

C 07 D 239/56, A 01 N 47/36


 Priorität: 12.04.88 CH 1336/88


 Veröffentlichungstag der Anmeldung:
 18.10.89 Patentblatt 89/42


 Benannte Vertragsstaaten:
 AT BE CH DE ES FR GB GR IT LI LU NL SE


 Anmelder: CIBA-GEIGY AG
 Klybeckstrasse 141
 CH-4002 Basel (CH)


 Erfinder: Rempfer, Hermann, Dr.
 Brückliemattstrasse 16
 CH-4107 Ettingen (CH)

Dürr, Dieter, Dr.
 Brändelstrasse 16
 CH-4103 Bottmingen (CH)

Thummel, Rudolf C.
 Le Borbet
 CH-2892 Courgenay (CH)

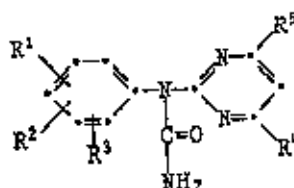
Patentsprüche für folgenden Vertragsstaat: ES.

Die Bezeichnung der Erfindung wurde geändert (Richtlinien für die Prüfung im EPA, A-II, 7.3).


 N-Phenyl-N-pyrimidin-2-yl-Harnstoffe mit herbiziden und pflanzenwuchsregulierender Wirkung.


 Die vorliegende Erfindung betrifft neue N-Phenyl-N-pyrimidin-2-yl-harnstoffe mit herbizider und pflanzenwuchsregulierender Wirkung, agrochemische Mittel, welche diese Substanzen als Wirkstoffe enthalten, die Verwendung der neuen Harnstoffe zur Bekämpfung von Unkräutern oder zur Regulierung des Pflanzenwachses sowie Verfahren zur Herstellung der neuen Verbindungen. Ferner betrifft die Erfindung auch neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren Herstellung.

Die neuen Verbindungen entsprechen der Formel I



(I),

worin

R¹, R², und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff; Halogen; C₁-C₄-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Halogenalkyl; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Alkyl-S(O)_n; Nitro; Cyano; C₁-C₄-Alkoxy-car-

bonyl; C₁-C₄-Alkylcarbonyl; di-(C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl; mono-(C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl; Carbamoyl; C₁-C₄-Halogenalkyl-S(O)_n; oder -PO(O-(C₁-C₄-Alkyl))₂;

R⁴ C₁-C₈-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Alkyl-S(O)_n; C₁-C₄-Halogenalkyl; C₁-C₄-Halogenalkoxy; unsubstituiertes, oder bis zu dreifach gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl; 2-Furanyl; 2-Thienyl; 3-Thienyl; unsubstituiertes oder bis zu dreifach gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl; Cyano; C₂-C₄-Halogenalkenyl; C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl; C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy; oder Halogen-C₁-C₄-alkylhalo;

R⁵ Wasserstoff; C₁-C₈-Alkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl; Halogen; oder C₁-C₈-Halogenalkoxy; und n 0, 1 oder 2

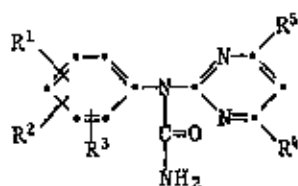
bedeutet, mit der Massgabe, dass, wenn einer der Reste R¹, R² oder R³ Nitro bedeutet, dieser Substituent nicht in 2- oder 6-Stellung des Phenylrings gebunden sein darf.

	Wirkstoff gemäss Herstellungsbeispiel 1	40 %
	Aethylenglykol	10 %
5	Nonylphenolpolyäthylenglykoläther (15 Mol AeO)	5 %
	Na-Ligninsulfonat	10 %
10	Carboxymethylcellulose	1 %
	37%ige wässrige Formaldehyd-Lösung	0,2 %
	Silikonöl in Form einer 75%igen wässrigen Emulsion	0,8 %
15	Wasser	ad 100 %

Der Wirkstoff wird mit den Zusatzstoffen innig vermischt. Man erhält so ein Suspensions-Konzentrat, aus welchem durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration hergestellt werden können.

Patentansprüche

1. Harnstoffe der Formel I



(I).

worin

R¹, R², und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff; Halogen; C₁-C₄-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Halogenalkyl; C₁-C₄-Halogenalkoxy; C₁-C₄-Alkyl-S(O)_n; Nitro; Cyano; C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; di-(C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl; mono-(C₁-C₄-Alkylamino)carbonyl; Carbamoyl; C₁-C₄-Halogenalkyl-S(O)_n; C₁-C₄-Alkylcarbonyl; oder -PO[O-(C₁-C₄)-Alkyl]₂;

R⁴ C₁-C₆-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Alkyl-S(O)_n; C₁-C₄-Halogenalkyl; C₁-C₄-Halogenalkoxy; unsubstituiertes, oder bis zu dreifach gleich oder verschieden durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Phenyl; 2-Furyl; 2-Thienyl; 3-Thienyl; unsubstituierten oder bis zu dreifach gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl; Cyano; C₂-C₄-Halogenalkenyl; C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl; C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkoxy; oder Halogen-C₁-C₄-alkylthio;

R⁵ Wasserstoff; C₁-C₃-Alkyl; C₁-C₃-Halogenalkyl; Halogen; oder C₁-C₃-Halogenalkoxy; und n 0, 1 oder 2

bedeutet, mit der Massgabe, dass, wenn einer der Reste R¹, R² oder R³ Nitro bedeutet, dieser Substituent nicht in 2- oder 6-Stellung des Phenylringes gebunden sein darf, sowie Salze und Additionsverbindungen der Verbindungen der Formel I mit Säuren, Basen und Komplexbildnern.

2. Harnstoffe gemäss Anspruch 1, worin

R¹ Halogen; Cyano; C₁-C₃-Alkoxy; C₁-C₂-Halogenalkoxy; Methyl-S(O)_n; C₁-C₃-Alkyl; C₁-C₂-Halogenalkyl; C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; Carbamoyl; Difluormethylthio oder -PO[O-(C₁-C₂)-Alkyl]₂;

R² Wasserstoff; Fluor; Chlor; Brom; Cyano; Nitro; C₁-C₃-Alkyl; C₁-C₂-Halogenalkyl; oder C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl;

R³ Wasserstoff; Chlor; Fluor; oder C₁-C₃-Alkyl;

R⁴ C₁-C₆-Alkyl; C₁-C₄-Alkoxy; C₁-C₄-Alkylthio; Cyclopropyl; Phenyl; Furan-2-yl; Thiophen-2-yl; Cyano; C₁-C₃-Halogenalkoxy; C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl; C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkoxy; Methylsulfonyl; Methylsulfonyl; oder C₂-C₃-Halogenalkenyl;

R⁵ C₁-C₃-Alkyl; Fluor; Chlor; Brom; C₁-C₃-Halogenalkyl; oder C₁-C₃-Halogenalkoxy; und

n 0, 1 oder 2 bedeutet.

3. Harnstoffe gemäss Anspruch 1 oder 2, worin

R¹ Halogen; Methyl; Trifluormethyl; Trifluormethoxy; Difluormethoxy; C₁-C₃-Alkoxy; Methylthio; Methylsulfonyl; Methylsulfonyl; Cyano; C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl; Carbamoyl; Difluormethylthio; oder

96

96

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
a? **Jimena Escobar**

ASUNTO Radicación 04-085802
 Trámite 011
 Evento 379
 Actuación 430
 Oficio 7033
 Folios 007

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional PCT/EP/00973
Fecha de Presentación Interna. Enero 31 de 2003

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: 09 a 57 (como se radicó inicialmente)
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 58 a 64 (como se radicó inicialmente)
- 1.3. Prioridad: UK 02023810 de Febrero 1 de 2002
 UK 02219533 de Septiembre 20 de 2002

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: AMINAS DE FENILPIRIMIDINA COMO INHIBIDORES IGE.
- El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:
Reivindicaciones 1-5, 8 y 9: Compuestos según la fórmula (I).
Reivindicación 7: Método de tratamiento.
Reivindicaciones 6 y 10: Uso de compuestos.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos inhibidores de inmunoglobulinas, especialmente IGE, útiles en el tratamiento

enfermedades inmunes mediadas por IGE tales como dermatitis atópica, urticaria, asma alérgico, rinitis alérgica, conjuntivitis, etc.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos, usos y métodos.

- La invención se catalogó en la categoría A61K31/505, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

- La reivindicación 7 presenta un método de tratamiento. A la luz de la decisión 486 los métodos terapéuticos no son patentables.
- Por lo anterior, la reivindicación 7 no puede patentarse.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

- Las reivindicaciones 6 y 10 pretenden proteger el uso de compuestos químicos, lo cual no se considera invención y por lo tanto no se le puede otorgar patente.
- Por lo tanto las reivindicaciones 6 y 10 no pueden obtener patente.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria Febrero 1 de 2002

Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

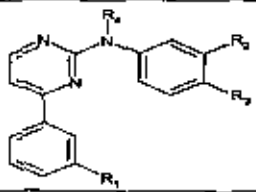
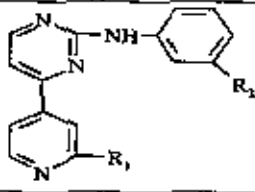
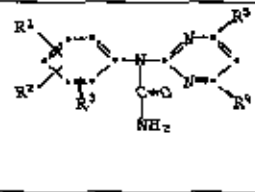
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO9935140	PYRIDINYL PYRIMIDINE AMINES AS IMMUNOGLOBULIN E (IgE) SYNTHESIS INHIBITORS	1999-07-15
D2	EP0337943	N-Phenyl-N-pyrimidin-2-yl-ureas with herbicidal and plant-growth regulating activity.	1989-10-18

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

- En la primera reivindicación se presentan compuestos derivados de la fórmula (I).
- El estado de la técnica representado por D1, el documento más cercano, presenta estructura tri-cíclicas similares, las cuales también tienen actividad inhibidora de IGE, como puede observarse en la tabla a continuación.
- La única diferencia con D1 son algunos sustituyentes, llamados R1 y R3 en la presente solicitud, y la presencia del hetero-átomo en el anillo mono-sustituido. Sin embargo esta diferencia no parece conceder un efecto inesperado ya que continúan teniendo actividad inhibidora de IGE.

CARACTERÍSTICAS TÉCNICAS ESENCIALES		
SOLICITUD	D1	D2 EP0337943
Un compuesto de fórmula (I)	Uso de un compuesto de	Compuestos de fórmula (I)

formula (I)		
		
Donde R1 es X o halo-alquilo (C1-4)	Donde R1 es X, fenilo o alquilo R2 es H, X, alquilo, alcoxi o trifluorometil	Donde R4 ...fenilo sustituido R5 es H, ...
R2 es H, X o halo-alquilo (C1-4) R3 es X o halo-alquilo (C1-4)		R1, R2 y R3 son independientemente H, X, alquilo (C1-4)...

- El problema técnico planteado en esta solicitud ya había sido resuelto mediante los compuestos similares revelados en D1. Adicionalmente los sustituyentes diferentes, ya habían sido sugeridos en D2. Por esta razón se considera que las sustituciones reivindicadas son evidentes para una persona medianamente versada en la materia.
- Una persona conocedora de la materia motivada por tales sugerencias lograría los compuestos de esta solicitud, que son inhibidores IGE. Para una persona medianamente versada en la materia sería obvio combinar estos dos documentos, por lo cual no puede reconocerse Nivel Inventivo.

7. Conclusión:

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

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO9935140	1 a 5, 8 y 9	Nivel inventivo
D2	EP0337943	1 a 5, 8 y 9	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.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única Nº 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

30 MAYO 2009

CONCEPTO TÉCNICO No.1211	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202074
-----------------------------	--