

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-059507- -00009-0000

Fecha: 2010-05-07 16:26:16 Dep: 2020 DIR NUEVASCR
Tra: 11 PATENTEIYII Lve: 379 FASENACIONALII
Act: 444 RESPUESTAREQULE Folios: 7

Señora

Alix Carmenza Céspedes de Vergel

Jefe de División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. _____ S. _____ D. _____

Referencia: Expediente No. 05.059.507

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Derivados de pirrolo-pirazol
sustituídos como inhibidores de quinasa"

Solicitante: Pharmacia Italia S.p.A.

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 7**DEL 08 DE ENERO DE 2010, OFICIO NO. 162 (EXAMEN DE FONDO)**

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término de prórroga solicitado en mi memorial 05-059507-00008-0000 de fecha 25 de marzo de 2010:

1. Objeciones del Examinador y Respuesta del solicitante

El señor Examinador establece que la reivindicación 1 no es clara pues no limita de manera clara los sustituyentes R y R¹ pues al definir arilo utiliza la expresión "*que incluye por ejemplo ... y similares*" y al definir heterociclo incluye la expresión "*...que incluye por ejemplo ejemplo...*", las cuales no son admitidas en las reivindicaciones.

Posteriormente, el señor Examinador concluye que "*subsisten los impedimentos para la concesión, ya que sigue presentando requerimientos, la respuesta dada no fue presentada de tal manera que subsanara todos los requerimientos*"

2997
294

Sobre este particular, me permito manifestar que es deseo del solicitante presentar un nuevo capítulo reivindicatorio en el cual se han eliminado las expresiones “*que incluye por ejemplo*” y “*y similares*”. En este sentido, considero pertinente resaltar que con el fin de establecer límites definidos, el solicitante ha reemplazado la expresión “*que incluye por ejemplo*” por la expresión “*seleccionado de*”. De esta manera, se supera la objeción realizada.

Adicionalmente, en relación con la conclusión aportada por el señor Examinador, me permito señalar que teniendo en cuenta las modificaciones realizadas, se ha dado respuesta a sus objeciones con lo cual ya no persisten las objeciones mencionadas.

3. En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas y como resultado, se otorgue el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

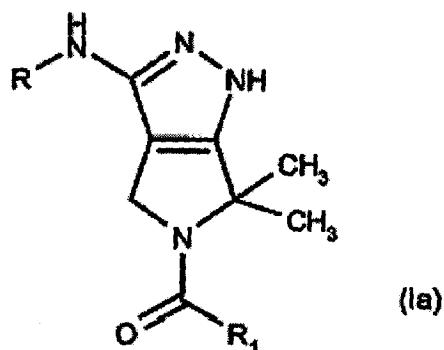
Atentamente,


ALVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexos: Capítulo Reivindicatorio Modificado

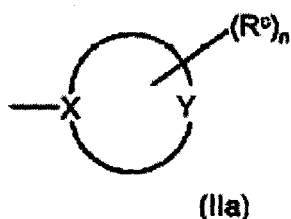
3
300
300REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula (Ia)



En donde **R** es un grupo $-\text{COR}^a$, en donde R^a es hidrógeno o un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ recto o ramificado; cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$; arilo seleccionado de fenilo, bifenilo, α - o β -naftilo, dihidronaftilo, tienilo, benzotienilo, furilo, benzofuranilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, piridilo, pirazínilo, pirimidinilo, piridazinilo, indolilo, isoindolilo, purinilo, quinolilo, isoquinolilo, dihidroquinolinilo, quinoxalinilo, benzodioxolilo, indanilo, indenilo y triazolilo; arilalquilo; heterociclilo seleccionado de pirano, pirrolidino, pirrolino, imidazolino, imidazolidino, pirazolidino, pirazolino, tiazolino, tiazolidino, dihidrofurano, tetrahidrofurano, 1,3-dioxolano, piperidino, piperazino y morfolino; y heterociclilalquilo;

R₁ es un grupo de fórmula (IIa)

4
30/301

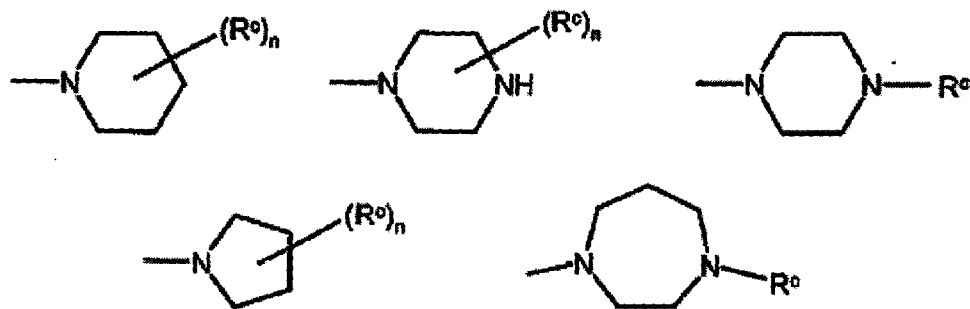
en donde, el ciclo representa un anillo heterocíclico de 5 a 7 miembros en donde X, directamente ligado al resto de la molécula, representa un átomo de carbono o nitrógeno; Y es un átomo de carbono, nitrógeno, oxígeno o azufre o es un grupo NH, siempre y cuando al menos uno de X y Y sea diferente a un átomo de carbono; R^n es, independientemente uno del otro y en una cualquiera de las posiciones libres del anillo heterocíclico de la fórmula (IIa), un grupo opcionalmente sustituido seleccionado de alquilo C_1-C_6 recto o ramificado; cicloalquilo C_3-C_6 ; arilo seleccionado de fenilo, bifenilo, α - o β -naftilo, dihidronaftilo, tienilo, benztienilo, furilo, benzofuranilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, indolilo, isoindolilo, purinilo, quinolilo, isoquinolilo, dihidroquinolinilo, quinoxalinilo, benzodioxolilo, indanilo, indenilo y triazolilo; arilalquilo; heterociclilo seleccionado de pirano, pirrolidino, pirrolino, imidazolino, imidazolidino, pirazolidino, pirazolino, tiazolino, tiazolidino, dihidrofurano, tetrahidrofurano, 1,3-dioxolano, piperidino, piperazino y morfolino; heterociclilalquilo, amino, aminocarbonilo, carboxi, oxo ($=O$),

S
307
302

alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo o aril-C(=O)-; y n es 0 o un entero de 1 a 4;

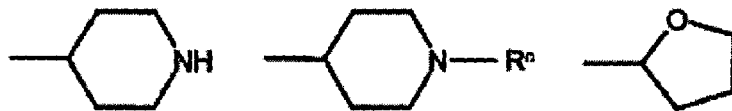
o una sal farmacéuticamente aceptable de estos.

2. Un compuesto de fórmula (Ia) de acuerdo con la reivindicación 1 en donde R_1 es un grupo de fórmula (IIa) seleccionado de:



En donde R, n y R^c son como se definió en la reivindicación 1.

3. Un compuesto de fórmula (Ia) de acuerdo con la reivindicación 1 en donde R_1 es un grupo de fórmula (IIa) seleccionado de:



En donde R, n y R^c es como se definió en la reivindicación 1.

6
303
303

4. Un compuesto, opcionalmente en la forma de una sal farmacéuticamente aceptable, seleccionado del grupo que consiste de:

N-{6,6-dimetil-5-[(2R)-tetrahidrofuran-2-ilcarbonil]-1,4,5,6-tetrahidropirrolo[3,4-c]pirazol-3-il}-4-fluorobenzamida;

N-{6,6-dimetil-5-[(2S)-tetrahidrofuran-2-ilcarbonil]-1,4,5,6-tetrahidropirrolo[3,4-c]pirazol-3-il}-4-fluorobenzamida;

N-{6,6-dimetil-5-[(1-metilpiperidin-4-il)carbonil]-2,4,5,6-tetrahidropirrolo[3,4-c]pirazol-3-il}ciclobutanocarboxamida;

N-{6,6-dimetil-5-[(1-metilpiperidin-4-il)carbonil]-2,4,5,6-tetrahidropirrolo[3,4-c]pirazol-3-il}-4-fluorobenzamida;

N-{6,6-dimetil-5-[(4-metilpiperazin-1-il)carbonil]-2,4,5,6-tetrahidropirrolo[3,4-c]pirazol-3-il}-4-fluorobenzamida;

3-metil-N-[1,4,5,6-tetrahidro-6,6-dimetil-5-[(1-metil-4-piperidinil)carbonil]pirrolo[3,4-c]pirazol-3-il]-butanamida; y

4-Cloro-N-[6,6-dimetil-5-(4-pirrolidín-1-ilmetil-piperidina-1-carbonil)-1,4,5,6-tetrahidro-pirrolo[3,4-c]pirazol-3-il]-benzamida;

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

7
304
304

5. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo de, tal y como se define en la reivindicación 1, y al menos un excipiente, portador y/o diluyente farmacéuticamente aceptable.

BOGEMS-#330707-01-P2005_000018_-_REIVINDICACIONES_MODIFICADAS_05-05-10.DOC

305
305

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación N°05-59507

Clasificación Internacional (IPC): C07D487/00

Concepto Técnico N°

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/EP2003/050942
Fecha de Presentación Internal. 04 de diciembre de 2004

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: 73 a 217 Como se radicó inicialmente.

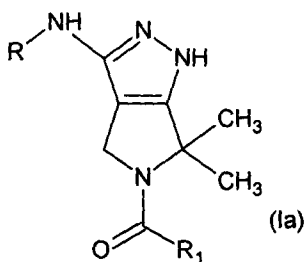
Reivindicaciones: Folios 218 a 233 Como se radicó inicialmente.
Folios 300 a 304 Modificaciones

Prioridad: Folio: 1, US 60/434.952, 19/dic/ 2002

1 Objeto de la invención

Título de la solicitud: DERIVADOS DE PIRROLO-PIRAZOL SUSTITUIDOS COMO INHIBIDORES DE QUINASA.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste ahora en derivados de 3-amino-6,6-dimetil-4,6-dihidropirrolo[3,4-c]pirazole-5(1H)-carbonil de fórmula:



-Reivindicaciones 1-4: compuestos de la fórmula (Ia);

-Reivindicación 5: composición que los comprende.

Se catalogó la invención, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.).
C07D478/00, A61K31/4162

4 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 de la cual se reclama prioridad 19 de diciembre de 2002.

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

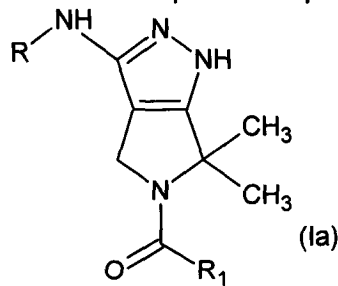
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	WO 0212242	Bicyclo-pyrazoles active as kinase inhibitors, process for their preparation and pharmaceutical compositions comprising them.	14-feb-2002

El análisis de patentabilidad fue hecho solamente para la primera invención.

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486 de la C.A.N.)

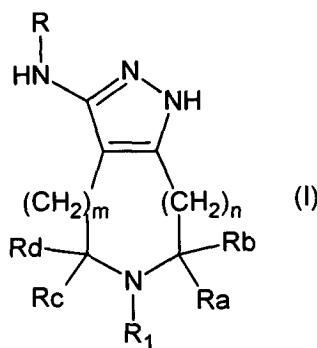
5.1 Novedad (artículo 16 D486)

La solicitud reclama los compuestos que caen bajo el alcance de las formulas:



Dichos compuestos son para el tratamiento de enfermedades como el cáncer asociadas con una alteración del ciclo celular dependiente de la quinasa.

-La anterioridad D1 (WO 2004/056827) describe compuestos de fórmula (I):



Después de la modificación del capítulo reivindicatorio de la solicitud en estudio, no se solapan las materias comprendidas en la anterioridad y la solicitud en estudio por lo tanto la solicitud en estudio cumple con lo exigido en el artículo 16 Decisión 486 de la C.A.N.

6. Nivel inventivo (artículo 18 D 486 de la C.A.N)

La solicitud en estudio ahora se refiere a compuestos derivados de 3-amino-6,6-dimetil-4,6-dihidropirrol[3,4-c]pirazole-5(1H)-carbonil, que comprenden una combinación de sustituyentes que no son derivables de manera evidente desde D1, documento relevante encontrado en el estado de la técnica y señalado como el arte previo más próximo, por lo tanto se considera que la solicitud cumple con el requisito exigido en el artículo 18 D 486 de la C.A.N.

7. Aplicación industrial (artículo 19 D 486 de la C.A.N.)

Los derivados 3-amino-6,6-dimetil-4,6-dihidropirrol[3,4-c]pirazole-5(1H)-carbonil, de tal como son reclamado en la presente solicitud, son susceptibles de ser sintetizados, por los métodos descritos, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que la solicitud cumple con lo dispuesto en el artículo 19 D 486 de la C.A.N.

8 Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 5 (folios: 300 a 304).

Bogotá, D.C., 02 de julio 2010

CONCEPTO TECNICO No. 2490	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202012
---------------------------	--------------------------------------