

144 / 44

BOGOTÁ - COLOMBIA
OFICINA FUNDADA EN 1941
APARTADO AEREO 12304
TEL: 57-1-3264270 57-1-6069700
FAX: 57-1-3264271 57-1-6069701
CABLES: LLOREDA
CALLE 72 No. 5-83 5º. PISO
www.lloredacamacho.com
jlcco@lloredacamacho.com

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-070084- -00005-0000

Fecha: 2007-10-22 16:32:53 Dep. 2020 NUECREACIONE
No. 11 PATENTE/II Eve: 379 FASENACIONALII
Act 538 PETICION Folios: 2

Re: **P1.-ASTRAZENECA AB.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "TIENOPIRIMIDINDIONAS Y SU USO EN LA MODULACIÓN DE LA ENFERMEDAD AUTOINMUNE".- Clase C07D 513/04.-Expediente número 05-070.084.-**

1. Me refiero a mi memorial de 3 de Noviembre de 2005.
2. De conformidad con lo dispuesto en el Artículo 5.2.12 de la Circular Externa No. 03 de 28 de Abril de 2003, y estando dentro del plazo de seis meses contados desde la fecha de la publicación de la solicitud en la Gaceta de la Propiedad Industrial número **575** de 30 de Abril de 2007, solicito a ese Despacho proceder a realizar el examen de patentabilidad de la presente invención.
3. Me permito recordar a usted, que tal como se informó en el Petitorio de la invención, la presente solicitud corresponde a Capítulo II.
4. Anexo me permito acompañar recibo número 07-82.452, expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de la tasa que dicho examen causa.

Señor Superintendente,

ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

148
245

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 82,452
FECHA : OCTUBRE 8 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-070084- -00005-0000

Fecha: 2007-10-22 16:32:53 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTE/II Eve: 379 FASENACIONALII
Act 538 PETICION Folios: 2

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	47999513	08/10/2007	10,026,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILID	202,000.00
		TOTAL :	\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-70084

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **575** DE

FECHA **30 DE ABRIL DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **31 DE JULIO DE 2007**

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

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau



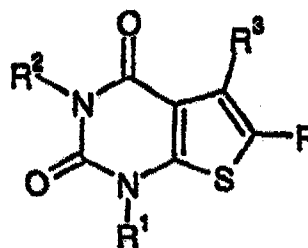
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶ : C07D 495/04, A61K 31/505	A1	(11) International Publication Number: WO 98/54190 (43) International Publication Date: 3 December 1998 (03.12.98)
(21) International Application Number: PCT/SE98/00935 (22) International Filing Date: 18 May 1998 (18.05.98) (30) Priority Data: 9702001-0 28 May 1997 (28.05.97) SE (71) Applicant (for all designated States except US): ASTRA PHARMACEUTICALS LTD. [GB/GB]; Home Park, Kings Langley, Herts. WD4 8DH (GB). (71) Applicant (for MG only): ASTRA AKTIEBOLAG [SE/SE]; S-151 85 Södertälje (SE). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (for US only): CHESHIRE, David [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughborough, Leics. LE11 5RH (GB). COOKE, Andrew [GB/GB]; 8 Lyell Grove, Stewartfield, East Kilbride, Glasgow G74 4RF (GB). COOPER, Martin [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughborough, Leics. LE11 5RH (GB). DONALD, David [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughborough, Leics. LE11 5RH (GB). FURBER, Mark [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughborough, Leics. LE11 5RH (GB). PERRY, Matthew [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughbor-	ough, Leics. LE11 5RH (GB). THORNE, Philip [GB/GB]; Astra Charnwood, Bakewell Road, Loughborough, Leics. LE11 5RH (GB). (74) Agent: ASTRA AKTIEBOLAG; Patent Dept., S-151 85 Södertälje (SE). (81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, GW, HU, ID, IL, 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, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published With international search report.	

(54) Title: NOVEL COMPOUNDS

(57) Abstract

A compound of formula (I), wherein R, R¹, R² and R³ have the meanings given in the description. Compound (I) is useful in the (prophylactic) treatment of autoimmune, inflammatory, proliferative and hyperproliferative diseases and immunologically-mediated diseases including rejection of transplanted organs or tissues and Acquired Immunodeficiency Syndrome (AIDS).



(I)

151

151

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALICIA LLOREDA RICAURTE

ASUNTO	Radicación	05-070084
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	3499
	Folios	9

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

No. Sol. Internacional	PCT/SE2004/000052
Fecha de Presentación Internal.	Enero 15 de 2004

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

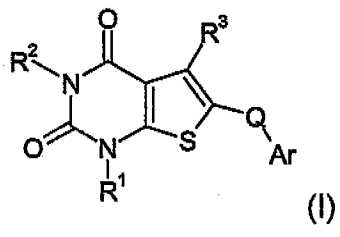
- | | | | | |
|------|-------------------|--------------------------------------|-----------|-----------------------------|
| 1.1. | Descripción: | Folios: | 33 a 108 | como se radicó inicialmente |
| 1.2. | Reivindicaciones: | Folios: | 109 a 118 | como se radicó inicialmente |
| | | Folios: | 131 a 140 | modificadas |
| 1.3. | Prioridad: | SE 0300119-5 del 17 de Enero de 2003 | | |

2. Objeto de la invención

- Título: "TIENOPIRIMIDINDIONAS Y SU USO EN LA MODULACION DE LA ENFERMEDAD AUTOINMUNE"

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

- Reivindicaciones 1 a 12: Un compuesto de fórmula (I):



- Reivindicación 13: Composición farmacéutica
- Reivindicación 14: Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I).

El problema planteado en la presente solicitud es proporcionar o revelar Tienopirimidindionas, las cuales se usan en Terapia de inmunosupresión.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I), su composición farmacéutica y un proceso para la preparación del mismo.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/519

3. De la solicitud de Patente

3.1 Titulo

Se recomienda no mencionar los usos en el titulo, ya que los mismos no son patentables. Favor realizar el cambio pertinente.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1 no es concisa, porque los radicales tienen muchos significados y sustituciones; y si, amplían el número de compuestos posibles reclamados bajo las características esenciales del compuesto de fórmula estructural (I). De otra parte, en la descripción no se encuentra en ninguna parte la formación de solvatos. Los radicales que están soportados en los ejemplos son:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R ¹	Alquilo
R ²	Alquilo
Q	Metilo
Ar	Pirazole, Benzotriazol, Imidazol, Pirrolo-piridina, Quinolina, Triazole, Piridinil-pirazol, Benceno, Tieno
R ³	Carbonilo con isoxazolidina

- En las Reivindicaciones 1, 6 a 8 y 14: debe precisarse con exactitud el nombre químico de "Ar".
- La Reivindicación 12; está caracterizando un compuesto no por su estructura química, sino por su uso. La misma no se acepta.

- 153
- La Reivindicación 14; en esta se desean proteger, procesos para la preparación de un compuesto de fórmula (I), los cuales están descritos de forma general y en los cuales simplemente se mencionan reacciones en la que los radicales de las fórmulas involucradas no se encuentran inequívocamente definidos. De igual manera, no es claro cuando se menciona "derivados protegidos (cuáles?), ... y opcionalmente después de a), b), c), d), e) o f) convertir el compuesto de la fórmula (I) en un compuesto adicional (cuál y Cómo?), ... solvatos (en la descripción no se encuentra en ninguna parte la formación de un solvato)". Hacer las aclaraciones correspondientes.
 - Las Reivindicaciones 1, 6, a 3 y 14: las palabras y/o expresiones: "opcionalmente", "uno o más", "derivados protegidos", "compuesto adicional"; no son concisas; por tanto no permiten delimitar la materia, allí a proteger.

Por lo anteriormente expuesto, es preciso requerir al interesado para que señale el alcance de su invención.

4. Determinación del Estado de la Técnica

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

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: Enero 17 de 2003

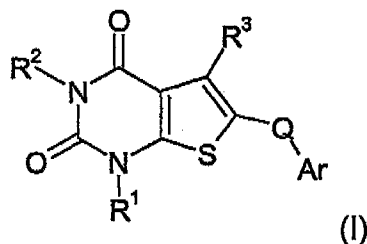
Teniendo en cuenta la fecha indicada se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud; aclarando, que esta búsqueda se realizó únicamente para aquellas partes que parecen ser claras y/o concisas:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 98/54190	NOVEL COMPOUNDS	Diciembre 03 de 1998

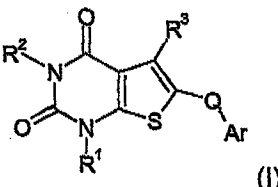
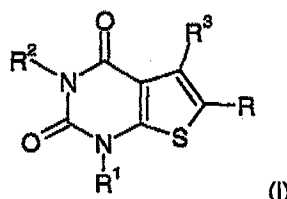
5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1 Nivel inventivo (artículo 18 D486)

- Reivindicación 1: Un compuesto de fórmula (I):



- Reivindicación 13: Composición farmacéutica

CARACTERISTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 05-070084	D1 = WO 98/54190
Un compuesto de fórmula (I):  (I)	Un compuesto de fórmula (I):  (I)
Donde:	Donde:
R1= Alquilo C1-6	R1= Alquilo C1-6
R2= Alquilo C1-6	R2= Alquilo C1-6
Q= CH2	R= -C(R4)(R5)Ar', donde: R4 y R5= Hidrógeno
Ar= sistema de anillo aromático de 5-10 miembros, donde hasta 4 átomos del anillo pueden ser heteroátomos seleccionados independientemente de N, O y S. Opcionalmente sustituidos.	Ar'= Nafilo, quinolina, isoquinolina, indolyl, benzofuranil y benzotienil. Opcionalmente sustituidos.
R3= -COG, donde: G= Es un anillo de 5 ó 6 miembros que contiene un átomo de N y un segundo heteroátomo seleccionado de O y S adyacente al N.	R3= X-R9, Donde: X= C(O)NR10 En donde R9 y R10 junto con el átomo de N al cual estan unidos, pueden formar un anillo heterocíclico de 4 a 7 miembros.
Una composición farmacéutica	Págs. 99 a 100 del Documento Una composición farmacéutica Pág. 111 del Documento

Un Compuesto de fórmula (1):

El estado de la técnica más cercano es D1, ya que divulga derivados de Tienopirimidindionas, las cuales se usan en Terapia de inmunosupresión.

La solicitud se diferencia de D1, en que G corresponde a un anillo de 5 ó 6 miembros que contiene un átomo de N y un segundo heteroátomo seleccionado de O y S adyacente al N, mientras que el análogo en D1 N-R9R10 corresponde a un anillo heterocíclico de 4 a 7 miembros.

No hay evidencia de una ventaja técnica, por el cambio del Carbono por el Oxígeno.

El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud es proporcionar nuevos derivados de Tienopirimidindionas con actividad inmunosupresora.

Por tal razón para un experto en la materia que conoce los compuestos de D1, era obvio el cambio en G para lograr estos compuestos que son inmunosupresores como los reivindicados. Por tanto los compuestos de fórmula (I) y sus composiciones farmacéuticas no tienen Nivel Inventivo.