

CAVELIER
ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72
BOGOTA 8, COLON

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-128686- -00004-0000

Fecha 2007-08-21 16:30:27 Dep 2020 NUECREACIONE
Tra 11 PATENTE IYII Eve 378 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios 2

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 05.128.686
Asunto : Solicitud de Patente para **TRIAZOLOPIRIMIDINAS**
Solicitante : **BAYER CROSCIENCE AG**
Clase : A01N 043/090, A01N 43/90
Publicada en : La Gaceta No. 573 Del 28 de febrero de 2007
Fecha de Solicitud : 21 de diciembre de 2005

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado en el asunto de la referencia, atentamente, solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia presentada de acuerdo con el Capítulo I del PCT y según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo por valor de \$404.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 36155 de 28 de diciembre de 2006.

2. Ruego atentamente a la Señora Jefe se sirva ordenar que se anexe este recibo para que se efectúe dicho examen y se continúe con el trámite de la solicitud.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 13549 841 041 8
SCTV\ASG\ID-105845\WPC13549
No. M-2007-105845\SCT

151

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y COMERCIO



Nº 05-128686-00004-0000

Fase 2: 07-08-21 18:30:27 Dep 2020 NUECREACIONE
rs 11 PATENTEIYI Eve 378 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 61,624
FECHA : JULIO 31 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	63769915	31/07/2007	55,200,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	404,000.00
TOTAL :			\$ 404,000.00

SON: CUATROCIENTOS CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

010 13549-841-041-8

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05 128686

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **573** DE

FECHA **28 DE FEBRERO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL **30 DE MAYO 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** _____



US00593996A

153

United States Patent [19]**Pees et al.**[11] **Patent Number:** **5,593,996**[45] **Date of Patent:** **Jan. 14, 1997**[54] **TRIAZOLOPYRIMIDINE DERIVATIVES**[75] Inventors: **Klaus-Jurgen Pees, Mainz; Guido Albert, Hackenheim, both of Germany**[73] Assignee: **American Cyanamid Company, Madison, N.J.**[21] Appl. No.: **412,401**[22] Filed: **Mar. 28, 1995****Related U.S. Application Data**

[63] Continuation-in-part of Ser. No. 276,384, Jul. 18, 1994, abandoned, which is a continuation of Ser. No. 998,113, Dec. 29, 1992, abandoned

[30] **Foreign Application Priority Data**

Dec. 30, 1991 [EP] European Pat. Off. 9112422

[51] Int. Cl.⁶ **C07D 487/04; A01N 43/50**[52] U.S. Cl. **514/258; 514/183; 514/212; 514/227.5; 514/234.2; 540/481; 540/600; 544/56; 544/118; 544/263**[58] Field of Search **544/263, 118; 514/234.2, 258**[56] **References Cited****U.S. PATENT DOCUMENTS**

4,036,840 7/1977 O'Brien et al. 546/263
 4,189,483 2/1980 Snowling 514/258
 4,199,584 4/1980 Cox et al. 514/258
 4,567,263 1/1986 Eicken et al. 544/263
 4,617,303 10/1986 Eicken et al. 544/263
 5,250,530 10/1993 Giencke et al. 514/256

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

0071792 2/1983 European Pat. Off. 544/263

550113 7/1993 European Pat. Off. 544/263
 1148629 4/1969 United Kingdom .
 94-20501 9/1996 WIPO 514/263

OTHER PUBLICATIONS

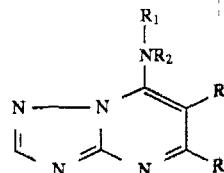
Tenor et al. Chem Abstr vol. 70 entry 47491w (1968).

Primary Examiner—Donald G. Daus*Attorney, Agent, or Firm*—Joseph M. Mazzaresse

[57]

ABSTRACT

This invention relates to certain triazolo-pyrimidine derivatives of formula I



wherein R₁ represents an optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, alkadienyl, cycloalkyl, bicycloalkyl or heterocyclyl group; R₂ represents a hydrogen atom or an alkyl group; or R₁ and R₂ together with the interjacent nitrogen atom represent an optionally substituted heterocyclic ring; R₃ represents an optionally substituted aryl group; and R₄ represents a hydrogen or halogen atom or a group —NR₅R₆ where R₅ represents a hydrogen atom or an amino, alkyl, cycloalkyl or bicycloalkyl group and R₆ represents a hydrogen atom or an alkyl group; processes for their preparation; compositions containing such compounds and their use as fungicides.

13 Claims, No Drawings

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
10 January 2002 (10.01.2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/02563 A2

- (51) International Patent Classification⁷: **C07D 487/00**
- (21) International Application Number: PCT/US01/20672
- (22) International Filing Date: 28 June 2001 (28.06.2001)
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data:
60/215,585 30 June 2000 (30.06.2000) US
- (71) Applicant: **AMERICAN HOME PRODUCTS CORPORATION** [US/US]; Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940 (US).
- (72) Inventors: **SCHMITT, Mark, R.**; 107 Kensington Avenue, Trenton, NJ 08618 (US). **KIRSCH, Donald, R.**; 152 Terhune Road, Princeton, NJ 08540 (US). **HARRIS, Jane, E.**; 19 Meadow Lane, Pennington, NJ 08534 (US). **BEYER, Carl, F.**; 32 Hambletonian Road, Chester, NY 10918 (US). **PEES, Klaus-Juergen**; Soonwaldstrasse 9, 55129 Mainz (DE). **CARTER, Paul**; Amriswilstrasse 7, 88400 Biberach an der Riss (DE). **PFRENGLE, Walde-mar**; Junkermuehle 1, 55444 Siebersbach (DE). **ALBERT, Guido**; Volxheimerstrasse 4, 55546 Hackenheim (DE).
- (74) Agents: **BERG, Egon, E.**; American Home Products Corporation, Patent Law Department, Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940 et al. (US).
- (81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, 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, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, 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, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Published:**
— *without international search report and to be republished upon receipt of that report*
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.*

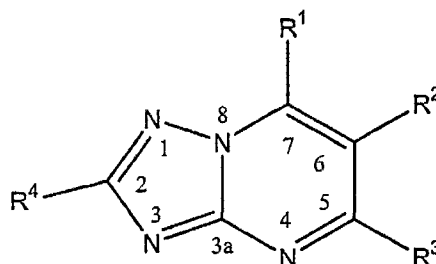
(54) Title: SUBSTITUTED-TRIAZOLOPYRIMIDINES AS ANTICANCER AGENTS

(57) Abstract: The invention provides a method of treating or inhibiting the growth of cancerous tumour cells and associated diseases in a mammal in need thereof which comprises administering to said mammal an effective amount of a substituted triazolopyrimidine derivative or a pharmaceutically acceptable salt thereof and further provides a method of treating or inhibiting the growth of cancerous tumour cells and associated diseases in a mammal in need thereof by interacting with tubulin and microtubules and promoting microtubule polymerization which comprises administering to said mammal an effective amount of a substituted triazolopyrimidine derivative or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

WO 02/02563 A2

A third object of the present invention is to provide a method of treating or inhibiting the growth of cancerous tumour cells and associated diseases in a mammal in need thereof by administering to said mammal an effective amount of a compound of Formula (I):

5



(I)

wherein:

- 10 is selected from the group consisting of halogen, an optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkynyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkadienyl of 4 to 12 carbon atoms, alkoxy of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, -CN, hydroxy,
- 15 halogen, carbamoyl, carboxy, alkoxycarbonyl of 2 to 12 carbon atoms, heterocyclyl, optionally substituted bicycloalkyl of 5 to 10 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, thiophene, optionally substituted cycloalkenyl of 5 to 10
- 20 carbon atoms in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, -S-aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, -S-alkyl of 1 to 12 carbon atoms, -S-cycloalkyl of 3 to 8

156
156

carbon atoms, -S-alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, -SO₂aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, -SO₂cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms, -SO₂alkyl of 1 to 12 carbon atoms, -O-aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, and the moiety -NR^aR^b;

- 5 R^a is H, optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkynyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkadienyl of 4 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl
- 10 group of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkenyl of 5 to 10 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted bicycloalkyl of 5 to 10 carbon atoms, optionally substituted tricycloalkyl, haloalkyl of 1 to 10 carbon atoms, aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms,
- 15 heterocyclyl, benzyl, optionally substituted benzyl, cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms or a 3- to 6-membered heterocyclyl ring, optionally ortho-fused with an optionally substituted phenyl ring;

- R^b is H, an optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, optionally
- 20 substituted alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkynyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkadienyl of 4 to 12 carbon atoms, optionally substituted aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, optionally substituted bicycloalkyl of 5 to 10 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 10 carbon atoms in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or

157
157

-NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkenyl of 5 to 10 carbon atoms in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, -S-aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, -S-alkyl, -S-alkenyl,
 5 -SO₂aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, -SO₂cycloalkyl, -SO₂alkyl, -O-aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, heterocyclyl, benzyl, optionally substituted benzyl, cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms or a 3- to 6-membered heterocyclyl ring, optionally ortho-fused with an optionally substituted phenyl ring ;

R^aR^b together with the nitrogen atom to which each is attached represent an
 10 optionally substituted saturated or unsaturated heterocyclyl ring from 3 to 12 ring atoms in which optionally, at least one -CH₂- may optionally be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, said saturated or unsaturated heterocyclyl ring may optionally be aryl or cycloalkyl fused;

15 R^a is H, optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, amino, hydroxy, alkylthio of 1 to 12 carbon atoms, cyano, carbamoyl, optionally substituted alkoxy of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 8 carbon atoms, optionally substituted aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms,
 20 carboxy, alkoxycarbonyl of 2 to 12 carbon atoms, aryloxy, benzyloxy, thienyl, heterocyclyl or halogen;

R^b is H, halogen, alkyl of 1 to 12 carbon atoms, alkoxy of 1 to 12 carbon atoms, aryloxy, -NR^cR^d, benzyloxy, aralkyloxy, haloalkoxy of 1 to 12 carbon
 25 atoms, alkylthio of 1 to 12 carbon atoms, heterocyclyl, aryl, hydroxy, carbamoyl, carboxy, alkoxycarbonyl of 2 to 12 carbon atoms, cyano, amino, alkylamino of 1 to 12 carbon atoms, dialkylamino of 1 to 12 carbon atoms, or, -N₃;

188
158

R^c is H, amino, optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, haloalkyl of 1 to 10 carbon atoms, optionally substituted alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkynyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkadienyl of 4 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 10 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms optionally substituted cycloalkenyl of 5 to 10 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted bicycloalkyl of 5 to 10 carbon atoms, aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, benzyl, optionally substituted benzyl, or heterocyclyl;

R^d is H, amino, optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, haloalkyl of 1 to 10 carbon atoms, optionally substituted alkenyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkynyl of 2 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkadienyl of 4 to 12 carbon atoms, optionally substituted cycloalkyl of 3 to 10 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms optionally substituted cycloalkenyl of 5 to 10 carbon atoms, in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or an alkyl group of 1 to 12 carbon atoms optionally substituted bicycloalkyl of 5 to 10 carbon atoms, aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, benzyl, optionally substituted benzyl, or heterocyclyl;

25

R^cR^d together with the nitrogen atom to which each is attached represent an optionally substituted heterocyclyl ring from 3 to 8 ring atoms optionally substituted in which one -CH₂- may also be replaced by -O-, -S-, or -NR' where R' is H or alkyl of 1 to 12 carbon atoms;

30

159
159

R¹ is H, optionally substituted alkyl of 1 to 12 carbon atoms, optionally substituted alkoxy of 1 to 12 carbon atoms, amino, alkyl amino of 1 to 12 carbon atoms, dialkylamino of 1 to 12 carbon atoms, alkylthio of 1 to 12 carbon atoms, halogen, cyano, carboxy, alkoxycarbonyl of 2 to 12 carbon atoms, heterocyclyl, halogen, carbamoyl, optionally substituted aryl of 6, 10 or 14 carbon atoms, or -CF₃;

provided that when: a) R¹ is diethylamino, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 4-trifluoromethylphenyl, 3,4-dichlorophenyl, 4-chlorophenyl, 3-chloro-4-methoxyphenyl; b) R¹ is diethylamino, R³ is bromo, R⁴ is hydrogen, R² is not 4-trifluoromethylphenyl; c) R¹ is isopropylamino, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 2-benzyloxyphenyl or 3,4,5-trimethoxyphenyl; d) R¹ is cyclopentylamino, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 3,4,5-trimethoxyphenyl, 2-naphthyl or 2-stilbene; e) R¹ is 2-amino-bicyclo(2.2.1.)heptyl, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 3,4,5-trimethoxyphenyl and f) R¹ is diethylamino, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 4-trifluoromethylphenyl and g) R¹ is 1,1,1-trifluoroethoxy, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 2-chloro-6-fluorophenyl h) R¹ is -SO₂ethyl or -SO₂cyclopentyl, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R² is not 2-chloro-6-fluorophenyl; i) R⁴ is hydrogen, R² is 2-chloro-6-fluorophenyl, R¹ and R³ are not 1,2,4-triazole; j) R¹ is cyclohexyl, R⁴ is hydrogen, R² is 2,4,6-trifluorophenyl, and R³ is not -OCH₂O₂C(CH₃)₃; k) R¹ is 2-thienyl, R⁴ is ethyl, R³ is hydrogen and R² is not 2-methoxyphenyl, 4-methoxyphenyl, and 4-trifluorophenyl; l) R² is phenyl, R³ is chloro, R⁴ is hydrogen, R¹ is not (2E)-,7-dimethyl-2,6-octadienyl

or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

A fourth object of the present invention is to provide a method of treating or inhibiting the growth of cancerous tumour cells and associated diseases in a mammal in need thereof by interacting with tubulin and microtubules by promotion of microtubule polymerization which comprises

160
100

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	05128686
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	12 12273

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional: PCT/EP2004/006368

Fecha de Presentación Internacional: 14 de Junio 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:

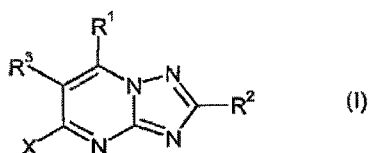
1. Documentos estudiados

- 1.1. Capítulo descriptivo: Folios 48 a 105 tal y como fueron presentados.
- 1.2. Capítulo reivindicatorio: Folios 106 a 119 tal y como fueron presentados.
- 1.3. Prioridad: folio 1 DE 103281711 24 de Junio de 2003.

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Triazolopirimidinas. Folio 2.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a nuevas triazolopirimidinas de la fórmula (I).



El problema técnico planteado en la presente solicitud indica que las triazolopirimidinas del arte previo presentan una actividad que deja mucho que desear en algunos casos. Por lo tanto existe la necesidad de nuevas triazolopirimidinas que tengan propiedades mejoradas. Para solucionar este problema técnico la solicitud plantea nuevas triazolopirimidinas de fórmula (I) que presentan una potente actividad fungicida.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A01N 43/90.

De la solicitud de Patente

2.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En el capítulo reivindicatorio se presentan términos tales como “alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclilo, halógeno, alquisulfonilo, alquilsulfinilo, alquiltio, halógeno-alquilo, en caso dado” que son imprecisos y no definen la materia de la invención, sírvase suprimirlos ó reemplazarlos.

Igualmente la frase “en caso dado substituido” de las reivindicaciones 1 y 9 no indica cuales son las sustituciones que tiene cada radical, de modo tal que la materia de la invención es cada mayor y no se encuentra específicamente definida. Más aún la gran cantidad de sustituyentes y la ambigüedad para definirlos conllevan a un gran número de posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I). Por lo tanto el capítulo reivindicatorio se considera muy amplio y no cumple con el requisito de concisión.

Es importante anotar que son tantas y tan variadas las posibles estructuras resultantes del compuesto de la fórmula (I) de la reivindicación 1, que la descripción no divulga de manera suficientemente clara y completa la materia divulgada en dicha reivindicación; es más la descripción solo presenta ensayos y resultados con compuestos específicos y de esta forma la reivindicación 1 sólo presenta una generalización a partir de resultados puntuales. En consecuencia la reivindicación 1 no solo es demasiado amplia sino que no se encuentra debidamente sustentada en la descripción.

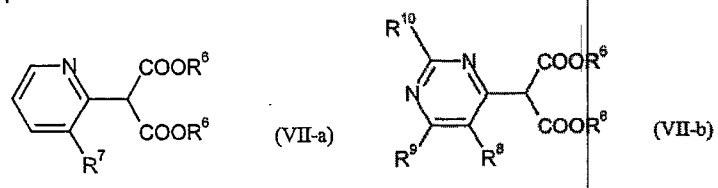
Las reivindicaciones 4, 12, 14 y 16 presentan procedimientos de síntesis; sin embargo las etapas presentadas en cada caso, son enunciadas de forma muy general y solo corresponden a reacciones comunes en química. Dichos procedimientos no presentan ninguna condición que defina específicamente el proceso. Por ejemplo las frases “hacer reaccionar, en caso dado, diluyente, aceptor de ácido” no definen un procedimiento, de hecho la expresión “en caso dado” no define ningún tipo de condición ya sea tiempo, concentración, solvente etc. En consecuencia estas reivindicaciones no resultan ser claras. Se le sugiere al solicitante que limite el objeto de la invención y especifique cual es la estructura de interés.

En conclusión, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión, claridad y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486 o art.22 Tratado PCT.

3. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Los posibles compuestos de fórmula (I) son estructuralmente diferentes, debido a que cada uno de los significados de los radicales R^1 , R^2 , R^3 y X pueden estar sustituidos a su vez y la reivindicación 1 ni siquiera expone cuales son estos segundos sustituyentes. La naturaleza química de estos sustituyentes es muy variada y por lo tanto los compuestos resultantes pueden ser estructural y funcionalmente diferentes. En contraste las reivindicaciones 2 y 3 indican ampliamente las múltiples sustituciones que puede tener el compuesto de fórmula (I) de modo tal que dicha fórmula no resulta representativa de la materia de la invención y no se distingue como una estructura que relacione un mismo concepto común inventivo.

Por otra parte los compuestos de fórmulas (VII-a) y (VII-b) resultan ser estructuralmente diferentes al compuesto de fórmula (I) de modo tal que no comparten un mismo concepto común inventivo, como tampoco lo comparten los procedimientos para su obtención.



En conclusión el capítulo reivindicatorio no presenta un mismo concepto común inventivo y no cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo al art. 25 de la Decisión 486.

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

Las reivindicación 6 hace referencia al uso de las triazolopirimidinas. Lo cual de acuerdo con el artículo 14 no es patentable pues no corresponde a una invención de producto ni de procedimiento.

Asimismo el método de la reivindicación 7 no divulga un método propiamente dicho. Pues un método ó proceso es definido por una secuencia lógica de etapas ó pasos que conducen a la fabricación de un producto que reviste una forma tangible. Y resulta evidente que la llamada etapa de “aplicación” no conduce a la fabricación de un producto con una forma tangible. Más bien el método reivindicado se refiere al uso de las triazolopirimidinas para el control de microorganismos indeseados. Lo cual no es patentable a partir del artículo 21 de la Decisión 486.

5. Determinación del Estado de la Técnica

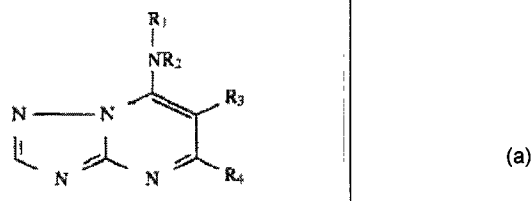
Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 24 de Junio de 2003, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US5593996	Traizolopyrimidine derivatives	1997-01-14
D2	W00202563	Substituted-triazolopyrimidines as anticancer agents	2002-01-10

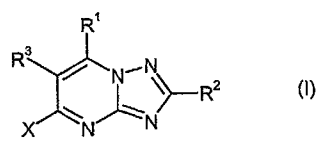
6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

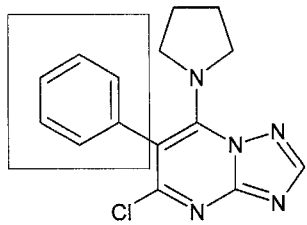
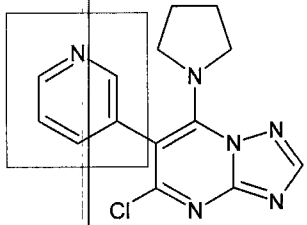
El documento D1 divulga derivados de triazolopirimidinas de la fórmula (a) y su aplicación como fungicida:



La solicitud de patente en estudio presenta triazolopirimidinas de la fórmula (I)



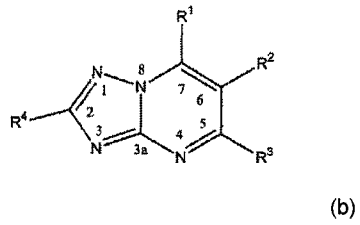
Cuando se comparan las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (I) de la presente solicitud con las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (a) de D1 se obtienen estructuras **muy cercanas**. A continuación se presentara un ejemplo con el fin de ilustrar la similitud de las estructuras.

Cuando en la solicitud	Cuando en la anterioridad D1
R ¹ es heterociclo.	R ₁ y R ₂ forman un anillo heterocíclico con el átomo de N.
R ² es H.	H.
R ³ es heterociclo.	R ₃ es un grupo arilo (diferencia)
X es halógeno	R ₄ es halógeno
Se tendrían las siguientes estructuras	
	

Es evidente que el compuesto de la fórmula (I) de la presente solicitud, resulta novedoso respecto a D1 debido al radical R³. Sin embargo D1 ya había divulgado claramente un núcleo central de triazolopirimidina que presenta una actividad fungicida.

De este modo un técnico medio en la materia a partir de las enseñanzas de D1, podría fácilmente modificar la estructura planteada en D1 reemplazando algunos sustituyentes y seguir esperando una actividad fungicida que evidentemente se deriva de la actividad planteada D1.

Más aún D2 ya había divulgado estructuras tipo triazolopirimidina de fórmula (b) que incluyen muchas de la estructuras contempladas en la esta solicitud.



Específicamente se obtienen estructuras iguales cuando:

Cuando en la solicitud	Cuando en la anterioridad D2
R ¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, heterociclilo.	R ¹ es alquilo, alquenilo, alquinilo, heterociclilo, cicloalquilo, cicloalquenilo.
R ² es halógeno, H, alquilo.	R ⁴ es H, alquilo, halógeno.
R ³ es heterociclilo	R ² es heterociclilo.
X es halógeno, ciano alquilo, alcoxi, alquiltio	R ³ es halógeno, alquilo, alcoxi, alquiltio, ciano
Se obtienen las mismas estructuras	

Así las cosas, D2 ya había sugerido triazolopirimidinas como las presentadas en la solicitud en estudio. De hecho D2 afecta directamente la novedad de muchas de estas estructuras.

En consecuencia un técnico medio en la materia no solo a partir de las enseñanzas de D1, sino combinando las enseñanzas de D1 y D2 hubiera podido presentar un compuesto de estructura (I) (como los divulgados en D2) y esperar una actividad fungicida (como la divulgada en D1). De modo tal que el compuesto de fórmula (I) no representa un salto cualitativo en la técnica, se deriva de manera obvia del arte previo y definitivamente carece de nivel inventivo. Del mismo modo los compuestos de las reivindicaciones 9, 11, 13 y 15 se derivan del arte previo y carecen de nivel inventivo, al igual que sus procedimientos de obtención (reivindicaciones 4, 12, 14, 16).

Es importante aclarar varios puntos:

- i. Se demostró que la fórmula Markush (I) de la reivindicación 1 no es nueva ni inventiva y por lo tanto no se puede considerar como concepto común inventivo.
- ii. Debido a que el derivado de triazolopirimidina de la fórmula (I) no es inventivo, su proceso de obtención tampoco es inventivo. Dicho procedimiento es descrito de forma muy general y simplemente ilustra reacciones comunes en química orgánica, mas aún la descripción no divulga un efecto técnico sorprendente ó una mejora en el proceso planteado.
- iii. Los compuestos intermediarios al igual que sus procedimientos de síntesis también carecen de nivel inventivo. Además se consideran derivados que no están enteramente sustentados en la descripción. Pues allí no se demostró una actividad específica para ellos. Se le recomienda al solicitante que retire estas reivindicaciones.
- iv. Por último tanto el agente para la lucha contra microorganismos como su procedimiento de obtención (reivindicaciones 5 y 8) carecen de nivel inventivo; pues solo presenta la posibilidad de combinar el compuesto de fórmula (I) con extendedores y productos tensoactivos, lo cual corresponde a la práctica común en el arte de formular agroquímicos. Así como "el procedimiento de la mezcla" corresponde a un proceso universalmente conocido. Se le recomienda al solicitante que retire estas reivindicaciones.

185 165

6. Conclusión

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US5593996	1-16	Nivel Inventivo
D2	W00202563	1-16	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 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

03 OCT. 2008

CONCEPTO TÉCNICO No. 2591	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202085
---------------------------	--