

224

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



No. 06-002635- -00007-0000

Fecha: 2009-09-14 16:49:07 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 449 RESPUESOPOSICI Folio: 402

1

As. 100.080

Señora

JEFE DE DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF: Expediente No. 06 002 635 – solicitud de patente de invención a favor de FERRER INTERNACIONAL S.A.

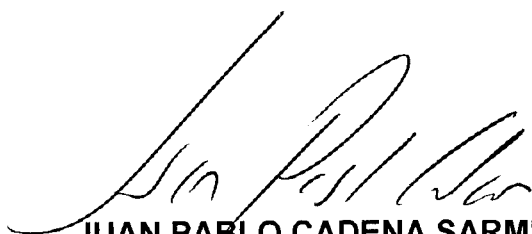
Respuesta al oficio No. 6834 del 12 de junio de 2009

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO, portador de la tarjeta profesional No. 57.492 del C.S.J., obrando como apoderado de la sociedad FERRER INTERNACIONAL S.A., según lo acredita el documento de poder presentado ante esa División, me permito dar respuesta a las observaciones de carácter técnico y jurídico, relacionadas con la patentabilidad, para la concesión de la patente de acuerdo con la Decisión 486 según el concepto técnico No. 1552 notificado por fijación en lista de fecha 12 de junio de 2009.

En primer lugar, se adjunta un nuevo capítulo reivindicatorio de 1-35 reivindicaciones que atiende todos los requerimientos de concisión y claridad realizados por el Señor Examinador. Para lograr esto, se hizo una limitación de las posibilidades de sustitución para los radicales R_1 - R_3 , una definición clara de los términos aril y heteroaril, además de aclaraciones de los sustituyentes utilizados en los compuestos reivindicados. Adicionalmente, fueron suprimidas las reivindicaciones referentes a usos y métodos de tratamiento para cumplir con todos los requerimientos necesarios.

En vista de lo anterior, respetuosamente solicitamos el retiro de las objeciones de la presente solicitud, ya que en opinión del solicitante cumple con todos los requisitos establecidos en la decisión 486.

De la señora Jefe,



JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

C.C. No. 80.410.337 de Usaquén

T.P. No. 57492 del C.S.J.

Calle 70A No. 4-41

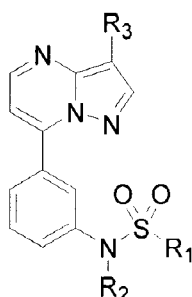
Bogotá, 11 de septiembre de 2009

MXB/NFA

Anexo

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

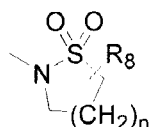
Y sus sales farmacéuticamente aceptables; donde:

R₁ se selecciona entre alquil(C₁-C₆), alquenil(C₂-C₆), ω,ω,ω-trifluoroalquil(C₁-C₆), cicloalquil(C₃-C₆), cicloalquil(C₃-C₆)alquil(C₁-C₆), -O-alquil(C₁-C₆), -NH-alquil(C₁-C₆), -N(dialquil(C₁-C₆)), alquil(C₁-C₆)-O-alquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-NH-alquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-N(dialquil(C₁-C₆)), fenil, fenil monosustituido por cloro, -CN o -NO₂, fenil disustituido por cloro, fenilaquil(C₁-C₆), fenilalquenil(C₂-C₆), furil, furil sustituido por 1 o 2 sustituyentes seleccionados entre alquil(C₁-C₆) y -CF₃, isoxazolil, isoxazolil sustituido por 1 o 2 alquil(C₁-C₆), pirazolil, pirazolil sustituido por 1, 2 o 3 alquil(C₁-C₆), tienil, tiazolil, tiazolil sustituido por 1 o 2 alquil(C₁-C₆), piridil y piridil sustituido por 4-morfolinil;

R₂ se selecciona entre hidrógeno, alquil (C₁-C₆), alquenil(C₂-C₆), alquinil(C₂-C₆) y cicloalquil(C₃-C₆);

O bien

R₁ y R₂ forman un ciclo de estructura:



Donde n es un entero 1,2 o 3;

R₃ se selecciona a partir del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, alquil(C₁-C₆), cicloalquil(C₃-C₆), alquenil(C₂-C₆), alquinil(C₂-C₆), -O-

alquil(C₁-C₆), halo-alquil(C₁-C₆), -CN, -SO₂-R₄, -NH-R₄, -NR₄R₅, -COR₆, -CO-NHR₆, COOR₆, -C(NR₇)R₆, fenil, [1,2,4]oxadiazolil y [1,2,4]oxadiazolil sustituido por alquil(C₁-C₆);

R₄ y R₅ se seleccionan independientemente del grupo que consiste de alquil(C₁-C₆) y cicloalquil(C₃-C₆);

R₆ se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, alquil(C₁-C₆), alquenil(C₂-C₆), alquini(C₂-C₆), cicloalquil(C₃-C₆), fenil, fenil sustituido por 1 sustituyente seleccionado entre flúor, alquil(C₁-C₆) y -O-alquil(C₁-C₆), furil, tienil, tiazolil y piridil;

R₇ se selecciona a partir del grupo que consiste de alquil(C₁-C₆), cicloalquil(C₃-C₆), -OH, -O-alquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-O-alquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-NH-alquil(C₁-C₆), alquil(C₁-C₆)-N(dialquil(C₁-C₆)), fenil, furil, tienil, tiazolil y piridil; y

R₈ es hidrógeno;

Con la condición de que simultáneamente:

R₁ no puede ser p-tolil y R₂ metil y R₃ benzoil; y

R₁ no puede ser p-tolil y R₂ etil y R₃ furil-2-carbonil.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R₁ y R₂ son grupos independientes y tienen los significados definidos en la fórmula (I) y R₃ es un grupo ciano.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 donde R₁ se selecciona entre metil, etil, n-propil, i-propil n-butil, fenil y 4-metoxi-fenil; y R₂ se selecciona entre metil, etil, n-propil, i-propil, n-butil, ciclopropil y 2-propinil.
4. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 donde R₁ y R₂ forman conjuntamente un grupo 1,3-propileno.

5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tienen los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo tiofen-2-carbonil.
6. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5, donde R_1 se selecciona entre metil, etil, n-propil, i-propil, n-butil, 2-feniletetil, 2,2,2-trifluoroetil, fenil, 2-clorofenil, 3-clorofenil, 4-clorofenil, 2,4-diclorofenil, 3,4-diclorofenil, 2-cianofenil, 3-cianofenil, 4-cianofenil, 4-metoxifenil, 3-nitrofenil, 4-nitrofenil, 2-tienil, 5-metil-4-isoxazolil, 5-metil-2-trifluorometil-3-furil, 4-(4-morfolinil)-3-piridil, 2,4-dimetil-5-tiazolil, ciclopropil, bencíl, vinil, 3,5-dimetil-4-isoxazolil, 1,3,5-trimetil-4-pirazolil y ciclopentilmetil; y R_2 se selecciona entre hidrógeno, metil, etil, n-propil, i-propil, n-butil, ciclopropil y 2-propinil.
7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5 donde R_1 y R_2 forman conjuntamente un grupo 1,3-propileno.
8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo benzoil.
9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
10. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (1) y R_3 es un grupo fluorobenzoil.
11. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 10 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
12. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo 4-metilbenzoil.

13. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 12 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 Se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
14. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo 4-metoxibenzoil.
15. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 14 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
16. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo 5-metil-1,2,4,-oxadiazol-3-il.
17. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 16 donde R_1 es metil y R_2 se selecciona de hidrógeno y etil.
18. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo piridil-2-carbonil.
19. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 18 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
20. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde R_1 y R_2 son grupos independientes y tiene los significados definidos en la fórmula (I) y R_3 es un grupo piridil-4-carbonil.
21. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 20 donde R_1 se selecciona entre metil y etil; y R_2 se selecciona entre metil, etil y 2-propinil.
22. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 4 y 5, donde dicho compuesto se selecciona entre el grupo consistente en:

N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-metil-metansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-etil-metansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-metil-bencenosulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-etil-bencenosulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-prop-2-inil-metansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-propil-etansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-etil-etansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-prop-2-inil-propan-2-sulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-metil-etansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-butil-etansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-metil-2-propansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-etil-2-propansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-butil-2-propansulfonamida;
N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-propil-2-propansulfonamida; y
N-[3-(3-clano-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il)-fenil]-N-prop-2-inil-etansulfonamida.

23. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 donde dicho compuesto es 7-(3-(2-isotiazolidinil-1,1-dioxido)-fenil)-3-ciano-pirazolo[1,5-a]pirimidina.

24. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 5 y 6 donde dicho compuesto se selecciona entre el grupo consistente en:

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;
N-etil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
bencenosulfonamida;
N-etil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
bencenosulfonamida;
N-prop72-inil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
metansulfonamida;
N-propil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
etansulfonamida;
N-etil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
etansulfonamida;
N-prop-2-inil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
propansulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
etansulfonamida;
N-butil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-
etansulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
propansulfonamida;
N-etil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
propansulfonamida;
N-propil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
propansulfonamida;
N-butil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
propansulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
feniletenesulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2,2,2-
trifluoroetansulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-
clorobencenosulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-3-
clorobencenosulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-4-
clorobencenosulfonamida;
N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2,4-
diclorobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-3,4-diclorobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-cianobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-3-cianobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-4-cianobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-3-nitrobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-4-nitrobencenosulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-tiofensulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-5-metil-4-isoxazolil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2-trifluorometil-5-metil-3-furil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-6-(morfolin-4-il)-3-piridil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-2,4-dimetil-5-tiazolil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-ciclopropilsulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-bencilsulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-vinilsulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-3,5-dimetil-4-isoxazolil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-1,3,5-trimetil-4-pirazolil-sulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-propansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-butansulfonamida; y

N-metil-N-{3-[3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-ciclopentilmetansulfonamida.

25. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7 donde dicho compuesto es 7-(3-(2-isotiazolidinil-1,1-dioxido)-fenil)-3-(tiofen-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a] pirimidina.

26. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 8 Y 9 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(benzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

27. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 10 y 11 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(fluorobenceno-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

28. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 12 y 13 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(4-metilbenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

29. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 14 y 15 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(4-metoxibenzoil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

30. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 16 y 17 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-{3-[3-(5-metil-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida; y

N-etil-N-{3-[3-(5-metil-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

31. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 18 y 19 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-metil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(piridin-2-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida.

32. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 20 y 21 donde dicho compuesto se selecciona entre:

N-metil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida;

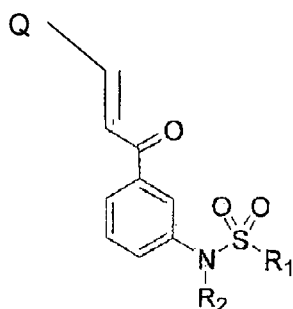
N-metil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-etil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida;

N-prop-2-inil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-etansulfonamida; y

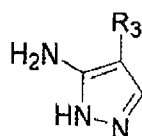
N-prop-2-inil-N-{3-[3-(piridin-4-carbonil)-pirazolo[1,5-a]pirimidin-7-il]-fenil}-metansulfonamida.

33. Un procedimiento para la obtención del compuesto de fórmula (I) y de sus sales farmacéuticamente aceptables según la reivindicación 1, caracterizado por la reacción del intermedio (II):



(II)

donde R₁ y R₂ tienen igual significado que en (I) y Q es un grupo saliente adecuado seleccionado entre N (dialquil (C1-C6), alquiltio (C1-C6) y alcoxi (C₁-C₆), con el intermedio (III) :



(III)

donde R₃ tiene igual significado que en (I) y opcionalmente, tratamiento de los compuestos de la reivindicación 1 en forma de base libre con un ácido para formar la sal correspondiente.

34. Un procedimiento según la reivindicación 33 caracterizado porque se utiliza el intermedio de fórmula (II) donde Q se selecciona entre dimetilamino, metiltio metoxi.

35. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de la reivindicación 1 en asociación con excipientes terapéuticamente inertes.

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

Radicación No. 06002635

Clasificación Internacional (IPC): C07D487/04, A61K31/505 , A61P25/00

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:

Documentos estudiados

Descripción: Folios: 136 a 179 (como se radicó inicialmente)

Reivindicaciones: Folios: 180 a 194 (como se radicó inicialmente)
Folios: 226 a 236 Modificado.

Prioridad: Folio (24-07-2003, ES200301746).
(12-07-2004, ES200401697).

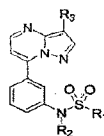
Respuesta del solicitante : Folios : 224 a 225

Se acepta para estudio el capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236

Objeto de la invención

Título de la solicitud : N-[3-(3-SUSTITUIDAS-PIRAZOLO [1,5a] PIRIMIDIN-7-IL)-FENIL]-SULFONAMIDAS Y COMPOSICIONES Y METODOS RELACIONADOS.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en :
Compuestos derivados de pirazolo[1,5a]-pirimidinas.



Reivindicaciones 1-32 : Un compuesto de fórmula I. (I)
Reivindicaciones 33-34: Un proceso para prepararlo.
Reivindicación 35 : Una composición que lo contiene.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad proporcionar nuevos compuestos derivados de pirazolo[1,5a]-pirimidinas, activos frente al receptor GABA_A y en concreto frente a las subunidades $\alpha 1$ y $\alpha 2$ de dicho receptor.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona los compuestos derivados de N-[3-(3-sustituidas-Pirazolo[1,5a]pirimidin-7-IL)-fenil]-sulfonamidas, composiciones farmacéuticas que los contienen y procedimientos para prepararlos.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC): C07D487/04, A61K31/505 , A61P25/00

De la solicitud de Patente

Descripción (artículo 28 D. 486)

La descripción de los folios 136 a 179 cumple con el requisito de claridad o comprensión .

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Para el capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236, encontramos que las reivindicaciones 1 a 35 según los requerimientos establecidos en el artículo 30 son claras y concisas y además están lo suficientemente sustentadas por la descripción .

Unidad de invención (artículo 25 D 486)

El capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236 para las reivindicaciones 1 a 35 cumple con el requisito de unidad de invención.

No es una invención (artículo 15 D 486 literal a)-f))

El capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236 para las reivindicaciones 1 a 35 sí es una invención.

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

El capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236 para las reivindicaciones 1 a 35 sí es patentable.

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

El capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236 para las reivindicaciones 1 a 35 sí es una invención.

Análisis de la(s) Oposición(es): (artículo 43 D. 486):

No se presentaron oposiciones.

Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 24-07-2003, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior: No se encontró documento alguno que afecte la patentabilidad del objeto de la presente solicitud.

Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

Las reivindicaciones 1 a 35 se refieren a compuestos N-[3-(3-sustituidas-Pirazolo[1,5a]pirimidin-7-IL)-fenil]-sulfonamidas activos frente al receptor GABA_A y en concreto frente a las subunidades $\alpha 1$ y $\alpha 2$ de dicho receptor, composiciones farmacéuticas que los contienen y sus procedimientos para prepararlos.

Se realizó el estudio de novedad comparando elemento por elemento las características técnicas de los compuestos de la presente solicitud con las presentes en el estado de la técnica relacionado.

Como resultado de dicho estudio se encontró que los compuestos actualmente reclamados se diferencian con respecto al estado de la técnica, en la sustitución en el grupo fenilo por un grupo sulfonamida; por lo tanto las reivindicaciones 1 a 35 cumplen con el requisito de novedad de acuerdo con el artículo 16 de la decisión 486.

Nivel inventivo (artículo 18 D486)

Las reivindicaciones 1 a 35 se refieren a compuestos N-[3-(3-sustituidas-Pirazolo[1,5a]pirimidin-7-IL)-fenil]-sulfonamidas activos frente al receptor GABA-A y en concreto frente a las subunidades $\alpha 1$ y $\alpha 2$ de dicho receptor y composiciones farmacéuticas que los contienen y sus procedimientos para prepararlos.

El estado de la técnica revela compuestos derivados de pirazolo[1,5a]-pirimidinas, composiciones que los contienen y sus procedimientos de preparación caracterizados por ser activos frente al receptor GABA_A y en concreto frente a las subunidades $\alpha 1$ y $\alpha 2$ de dicho receptor en donde el grupo fenilo se encuentra sustituido por un grupo amida

Los compuestos de la presente invención, en especial los más cercanos estructuralmente al divulgado en el estado de la técnica y que corresponden a los ejemplos 2 (N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5a]pirimidin-7-il)fenil]-N-metil-metansulfonamida) y 5 (N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5a]pirimidin-7-il)fenil]-N-etil-metansulfonamida), demuestran tener una mejor afinidad por la subunidad $\alpha 1$ del receptor GABA_A (K_i 74,5nM y 13.4nM respectivamente), una mejor afinidad por la subunidad $\alpha 2$ del receptor GABA_A (K_i 831,3nM y 290,2nM respectivamente) y un porcentaje mayor en la inhibición de la actividad motora (71.39% 80.91%), en comparación con el compuesto del estado de la técnica "Zaleplón" (N-[3-(3-ciano-pirazolo[1,5a]pirimidin-7-il)fenil]-N-etilacetamida) el cual muestra una afinidad por la subunidad $\alpha 1$ del receptor GABA_A con un (K_i 198,9 nM), una afinidad por la subunidad $\alpha 2$ del receptor GABA_A con un (K_i 1302.5 nM) y un porcentaje en la inhibición de la actividad motora del 47.17%), lo cual evidentemente constituye una ventaja y una solución inesperada nada obvia para una persona medianamente versada en la materia.

Aplicación industrial (artículo 18 D 486)

- El capítulo reivindicatorio de los folios 226 a 236 para las reivindicaciones 1 a 35 sí tiene aplicación industrial.

Respuesta a los argumentos del solicitante:

Los argumentos expuestos por el solicitante en los folios 224 a 225 son aceptados como respuesta al artículo 45 de los folios 213 a 215, en donde se corrigen las deficiencias por claridad y concisión.

Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** el privilegio solicitado para las reivindicaciones: 1 a 35 (folios: 226 a 236)

Con base en las reivindicaciones 1 a 35, este despacho expresa el título de la solicitud en los siguientes términos: "Compuestos derivados de N-[3-(3-SUSTITUIDAS-PIRAZOLO [1,5a] PIRIMIDIN-7-IL)-FENIL]-SULFONAMIDAS caracterizados por ser activos frente a las subunidades $\alpha 1$ y $\alpha 2$ del receptor GABA_A".

CONCEPTO TECNICO No.
3199

EXAMINADOR TECNICO
Código No.202075