

CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

107
Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 540 0860
Fax in U.S.A.: (1-305) 381 9660

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-032147- -00002-0000
Fec: 2007-02-14 16:44:55 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 378 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios: 2

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación: 538

Referencia : Expediente No. 06.032.147
Asunto : Solicitud de patente para **NUEVOS DERIVADOS DE
PIRIMIDIN-2-AMINA**
Solicitante : **ALMIRALL PRODESFARMA, S.A.**
Publicada en : La Gaceta No. 569 Del 31 de octubre de 2006.
Fecha de Solicitud : 31 de marzo de 2006

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 11194 841 005 0
SCT/ASG/ID-000235/WPC11194
Cns M-2007-00002067

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 6,333
FECHA : ENERO 22 DE 2007

105
108

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-032147- -00002-0000
Fec: 2007-02-14 16:44:55 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEIYII
Eve: 378 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios: 2

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55272336	22/01/2007	33,114,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		*** MODIF O LIMITACION AL ALCANCE DE	404,000.00
		TOTAL :	404,000.00

SON: CUATROCIENTOS CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

COLO 1194 841 005 0

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-32147

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 569 DE

FECHA 31 DE OCTUBRE DE 2006 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL 01 DE FEBRERO 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

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003年5月1日 (01.05.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/035639 A1

(51) 国際特許分類: C07D 401/04, 405/14,
409/14, A61K 31/506, A61P 1/00, 1/10, 3/04, 3/10, 9/12,
11/06, 13/02, 19/10, 25/16, 25/28, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/10952

(22) 国際出願日: 2002年10月22日 (22.10.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2001-324018
2001年10月22日 (22.10.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザ
イ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒112-8088 東
京都 文京区 小石川 4 丁目 6 番 1 0 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 原田 均
(HARADA, Hitoshi) [JP/JP]; 〒300-1232 茨城県 牛
久市 上柏田 2-2 4-2 7 Ibaraki (JP). 浅野 修
(ASANO, Osamu) [JP/JP]; 〒300-1232 茨城県 牛
久市 上柏田 3-6 9-2 1 Ibaraki (JP). 上田 正人
(UEDA, Masato) [JP/JP]; 〒305-0061 茨城県 つく
ば市 稲荷前 9-7-4 0 2 Ibaraki (JP). 宮澤 修平
(MIYAZAWA, Shuhei) [JP/JP]; 〒302-0127 茨城県
守谷市 松ヶ丘 2-3 9-2 6 Ibaraki (JP). 小竹 良
彦 (KOTAKE, Yoshihiko) [JP/JP]; 〒300-0832 茨城県
土浦市 桜ヶ丘町 3 9-1 3 Ibaraki (JP). 樺沢 靖弘
(KABASAWA, Yasuhiro) [JP/JP]; 〒371-0105 群馬県
勢多郡 富士見村 石井 7 4-2 Gunma (JP). 安田 昌弘
(YASUDA, Masahiro) [JP/JP]; 〒305-0035 茨城県 つ
くば市 松代 4-2 1-2-2-4 0 1 Ibaraki (JP). 安
田 信之 (YASUDA, Nobuyuki) [JP/JP]; 〒300-0065 茨

城県 土浦市 常名 8 2 0-1 Ibaraki (JP). 飯田 大介
(IIDA, Daisuke) [JP/JP]; 〒305-0005 茨城県 つくば市
天久保 2-2 3-5 メゾン学園 2 0 8 Ibaraki (JP). 永
川 純一 (NAGAKAWA, Junichi) [JP/JP]; 〒300-0845
茨城県 土浦市 乙戸南 1-2 2-8 Ibaraki (JP). 広
田 和雄 (HIROTA, Kazuo) [JP/JP]; 〒300-0845 茨城
県 土浦市 乙戸南 1-1 3-8 Ibaraki (JP). 中川 誠
(NAKAGAWA, Makoto) [JP/JP]; 〒300-2436 茨城県 筑
波郡 谷和原村 綱の台 6-1 8-2 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 古谷 馨, 外 (FURUYA, Kaoru et al.); 〒103-
0007 東京都 中央区 日本橋浜町 2-1 7-8 浜町花長
ビル 6 階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): 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, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

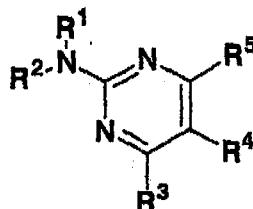
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ
特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR,
GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI 特
許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR,
NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PYRIMIDINE COMPOUND AND MEDICINAL COMPOSITION THEREOF

(54) 発明の名称: ピリミジン化合物及びその医薬組成物



(I)

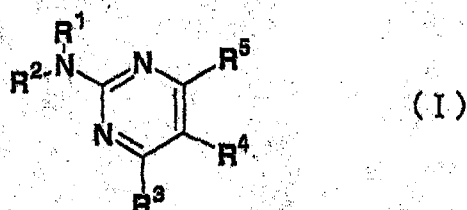
an optionally substituted C₆₋₁₄ aromatic hydrocarbon ring group or optionally substituted 5- to 14-membered aromatic heterocyclic group.

(57) Abstract: A novel pyrimidine compound having an excellent an-
tagonistic activity against adenosine receptors (A₁, A_{2A}, and A_{2B} recep-
tors). Specifically, it is a compound represented by the following for-
mula, a salt of the compound, or a solvate of either. (I) In the formula, R¹
and R² are the same or different and each represents hydrogen, option-
ally substituted C₁₋₆ alkyl, etc.; R³ represents hydrogen, halogeno, etc.;
R⁴ represents an optionally substituted C₆₋₁₄ aromatic hydrocarbon ring
group, optionally substituted 5- to 14-membered nonaromatic hetero-
cyclic group having at least one unsaturated bond, etc.; and R⁵ represents

[続葉有]

請求の範囲

1. 下記式 (I) で表わされる化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物。



式中、 R^1 及び R^2 は同一又は相異なって水素原子、置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルケニル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルキニル基、置換基を有していてもよい C_{3-8} シクロアルキル基、置換基を有していてもよい C_{3-8} シクロアルケニル基、置換基を有していてもよい 5 乃至 14 員非芳香族複素環式基、置換基を有していてもよい C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、置換基を有していてもよい 5 乃至 14 員芳香族複素環式基、置換基を有していてもよい C_{1-6} アシル基、又は置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキルスルホニル基を示し； R^3 は水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルケニル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルキニル基、置換基を有していてもよい C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、置換基を有していてもよい 5 乃至 14 員芳香族複素環式基、置換基を有していてもよい窒素原子、置換基を有していてもよい酸素原子、又は置換基を有していてもよい硫黄原子を示し； R^4 は、置換基を有していてもよい C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基、置換基を有していてもよい 5 乃至 14 員芳香族複素環式基、置換基を有していてもよい少なくとも 1 以上の不飽和結合を有している 5 乃至 14 員非芳香族複素環式基； R^5 は置換基を有していてもよい C_{6-14} 芳香族炭化水素環式基又は置換基を有していてもよい 5 乃至 14 員芳香族複素環式基を示す。

2. R^1 及び R^2 は、同一又は相異なって水素原子、置換基を有していてもよい C_{1-6} アルキル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルケニル基、置換基を有していてもよい C_{2-6} アルキニル基、置換基を有していてもよい C_{3-8} シクロアルキル基、置換基を有していてもよい C_{3-8} シクロアルケニル基、置換基を有していても

A2
112

化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物。

17. R^5 が置換基を有していてもよいフェニル基及びナフチル基である請求項1乃至5記載の化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物。

18. R^5 がそれぞれ置換基を有していてもよいピロリル基、ピリジル基、ピリダジニル基、ピリミジニル基、ピラジニル基、チエニル基、チアゾリル基、フリル基、キノリニル基、イソキノリニル基、フタラジニル基、ナフチリジニル基、インドリル基又はイソインドリル基である請求項1乃至16記載の化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物。

19. 請求項1乃至18記載の化合物もしくはその塩、又はそれらの溶媒和物を含有してなる医薬組成物。

20. アデノシン受容体が関与する疾患の治療剤又は予防剤である請求項19記載の組成物。

21. アデノシン A_2 受容体が関与する疾患の治療剤又は予防剤である請求項19記載の組成物。

22. アデノシン A_{2A} 受容体が関与する疾患の治療剤又は予防剤である請求項19記載の組成物。

23. アデノシン A_{2B} 受容体が関与する疾患の治療剤又は予防剤である請求項19記載の組成物。

24. アデノシン受容体拮抗剤である請求項19記載の組成物。

25. アデノシン A_2 受容体拮抗剤である請求項19記載の組成物。

26. アデノシン A_{2A} 受容体拮抗剤である請求項19記載の組成物。

27. アデノシン A_{2B} 受容体拮抗剤である請求項19記載の組成物。

28. パーキンソン病治療薬、抗うつ剤である請求項19乃至請求項22、請求項24乃至請求項26のいずれかに記載の組成物。

29. 排便促進剤である請求項19乃至請求項21、請求項23乃至請求項25、および請求項27のいずれかに記載の組成物。

30. 便秘症の治療剤、予防剤又は改善剤である請求項19乃至請求項21、請求項23乃至請求項25、および請求項27のいずれかに記載の記載の組成物。

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

113
13

2020

Bogotá, D.C.,

Abogado

EMILIO FERRERO

ASUNTO

Radicación 06-032147
Trámite 002
Evento 001
Actuación 430
Oficio 8755
Folios 8

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (fase nacional)

☒

Cap. I

☒

Cap. II

☐

No. Sol. Internacional

PCT/EP2004/010644

Fecha de Presentación Internal.

Septiembre 22 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: 52 a 90 como se radicó inicialmente
1.2. Reivindicaciones: Folios: 91 a 99 como se radicó inicialmente
1.3. Prioridad: ES P20032275 del 02 de Octubre de 2003

2. Objeto de la invención

- Título: "NUEVOS DERIVADOS DE PIRIMIDIN 2-AMINA"

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

- Reivindicaciones 1 a 15 y 17: Compuesto de fórmula (I)
- Reivindicación 16: Proceso Para producir compuesto de fórmula (I)
- Reivindicación 18: Composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I)
- Reivindicaciones 19 a 20: Usos
- Reivindicaciones 21 a 22: Método de Tratamiento

El problema planteado en la presente solicitud se refiere a nuevos antagonistas del receptor de adenosina A2B; útiles en el tratamiento, prevención o supresión de enfermedades y trastornos como asma, enfermedades alérgicas, inflamación, arterosclerosis, hipertensión, trastornos del tracto gastrointestinal, trastornos de proliferación celular, diabetes mellitus y enfermedades autoinmunes.

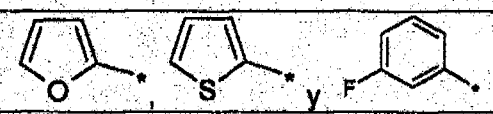
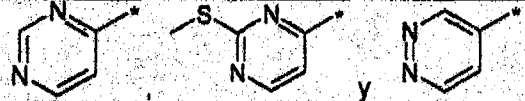
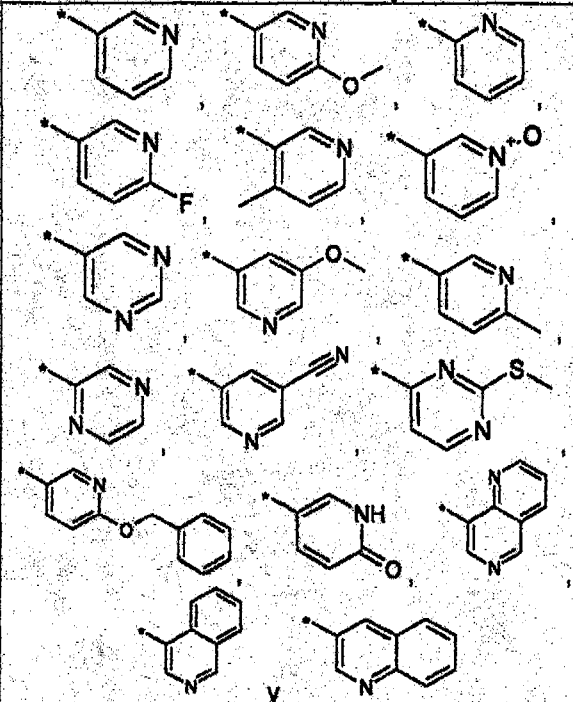
Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (I), un procedimiento para su preparación y su composición farmacéutica.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/506

3. De la solicitud de Patente

3.1 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La Reivindicación 1 no esta inequívocamente definida, porque los radicales tienen muchos significados y sustituciones de sustituciones; y amplían el número de compuestos posibles reclamados bajo las características esenciales del compuesto de fórmula (I). Los radicales que están soportados en los ejemplos son:

RADICAL	SOPORTE DE LOS EJEMPLOS PRESENTADOS
R ¹	
R ²	
R ³	

- Las Reivindicaciones 2 a 14, no son concisas, ya que no están definiendo de manera inequívoca cada uno de los radicales que están definiendo.

- La Reivindicación 16; presenta falta de definición, porque los radicales de los compuestos de fórmulas (IX) y (III) tienen diferentes significados y sustituciones; solicitando un número grande de compuestos posibles para cada una de ellas; por lo tanto las mismas no se encuentran inequívocamente definidas ni están definiendo el proceso de preparación objeto de la reivindicación de manera clara y concisa; ya que los procesos se definen por las etapas que en él intervienen, por tanto si una etapa de estas no esta definida inequívocamente el proceso carece de definición; y así un experto en la materia cuando lo lleve a la práctica obtenga el producto correspondiente; se requiere al solicitante realizar los cambios pertinentes.
- La Reivindicación 17; esta definiendo un compuesto por su uso y no por su estructura química. La misma no se acepta.
- Las Reivindicaciones 1 a 12 y 14; las palabras y/o expresiones: "arilo", "heteroarilo", "opcionalmente"; no son concisas; por tanto no delimitan de manera inequívoca la materia a proteger.

Debido a que la materia solicitada no es clara, concisa y no tiene alcance plenamente definido y no esta soportada por los resultados de actividad biológica para todos y cada uno de los ejemplos presentados en el capítulo descriptivo; es necesario que el solicitante concrete su solicitud acorde a los ejemplos que sustenten actividad como antagonistas del receptor de adenosina A2B.

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

Las Reivindicaciones 21 a 22 reclaman método de tratamiento, y de acuerdo con la legislación Colombiana, éstos no se consideran para protección por patente.

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

Las Reivindicaciones 19 a 20 reclaman uso, y de acuerdo con la legislación Colombiana, el uso reclamado no se considera para protección por patente.

6. 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: Octubre 02 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 realizo únicamente para aquellas partes que parecen ser claras y/o concisas:

116

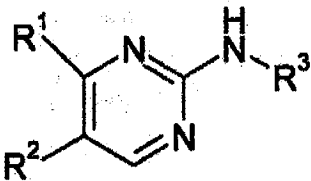
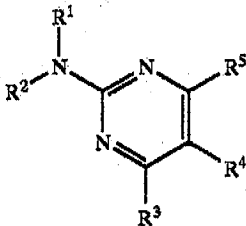
146

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 03/035639	PYRIMIDINE COMPOUND AND MEDICINAL COMPOSITION THEREOF	Mayo 01 de 2003

7. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

7.1 Novedad (artículo16 D486)

- Reivindicación 1: Compuesto de fórmula (I)
- Reivindicación 18: Composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I)

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 06-032147	D1 = WO 03/035639
Un compuesto de fórmula (I):	Un compuesto de fórmula (I):
 (I)	 (I)
Donde:	Donde:
Hidrógeno	R1= Hidrógeno
R3= Grupo heteroarilo	R2= Heterociclo aromático
Hidrógeno	R3= Hidrógeno
 R2=	R4= Heterociclo aromático
R1= Arilo	R5= Hidrocarburo aromático
Composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I)	Pág.161 del Documento Una composición farmacéutica del compuesto de fórmula (I) Pág. 169 del Documento

Teniendo en cuenta el objeto de la invención y la materia descrita en la anterioridad D1, esta dependencia se permite señalar que existe afectación al requisito de Novedad para la reivindicación independiente 1 y sus dependientes y para la reivindicación 18; ya que no son nuevos los compuestos de fórmula (I) de la solicitud ni sus composiciones farmacéuticas.

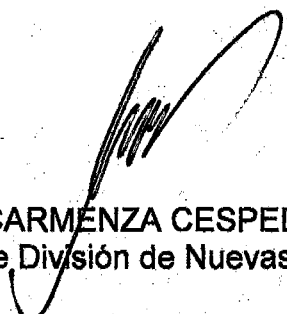
8. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03/035639	1 a 15, 17 y 18	Novedad

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 artículo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001, advirtiéndole que contra él no procede recurso alguno en la vía gubernativa.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
31 JUL. 2009

CONCEPTO TÉCNICO No. 2384	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202080
---------------------------	---