

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-189881- -6	FECHA: 2013-11-07 18:00:07
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 10
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 12-189881- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 21087
 Folios: 10

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2011/033614				
Fecha de Presentación Internacional	22/04/2011				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000	Octubre 24 de 2012
Reivindicaciones	Radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000	Octubre 24 de 2012
Prioridad:	US 61/327,597	Abril 23 de 2010
	US 61/412,299	Noviembre 10 de 2010

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

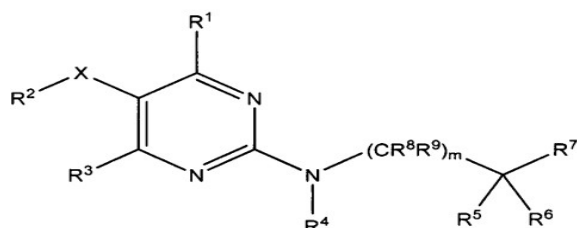
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Las reivindicaciones 1 a 43 se aceptan para ser estudiadas en su totalidad, porque se registra el pago por las reivindicaciones adicionales 11 a 43, de acuerdo con los recibos presentes en el radicado N° 12 – 189881 – 00003 – 0000.

Título de la solicitud: “Ciertas amino – pirimidinas, composiciones de las mismas y métodos para el uso de los mismos”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de nuevos compuestos que logren modular la contracción de músculo esquelético, para el tratamiento de patologías relacionadas con atrofas musculares.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos derivados de amino pirimidina, como moduladores de la contracción de músculo esquelético, para el tratamiento de patologías relacionadas con atrofas musculares.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4965.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486, literal d)

El objeto de las reivindicaciones 39 y 40 no es patentable, de acuerdo con el artículo citado.

5. Reivindicaciones relativas al uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 41 a 43 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14.

6. De la Solicitud de la Patente

Título

El título de la presente invención se considera ambiguo y muy general, porque al mencionar “Ciertas amino pirimidinas”, se incluye una cantidad infinita de compuestos que no hacen parte del objeto de la presente invención. Se solicita modificar el título de tal manera que en este se ilustre de manera detallada el objeto de la invención. Además, se solicita omitir cualquier idea relacionada con el uso de los compuestos de la invención.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no se considera concisa, porque se mencionan sustituyentes no definidos en la estructura la Fórmula I (R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g , R^h , R^i , R^j , R^k), que corresponden a sustituyentes secundarios a los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y X contenidos en la estructura de la Fórmula I; todos los sustituyentes anteriormente mencionados están definidos mediante expresiones muy generales tales como alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, alquenilo C1-6, alquinilo C2-6, cicloalquilo C1-8, cicloalquenilo C3-8, heterocicloalquilo de 3 a 8 miembros, heterocicloalquenilo de 3 a 8 miembros, arilo C6-10, arilalquilo C7-11, heteroarilo de 5 a 10 miembros, e inclusive en aquellos sustituyentes tales como

Sustituyente	Soportado en la descripción
R ¹	H,
R ²	
R ³	H, CF ₃ ,
R ⁴	H,
R ⁵	CH ₃
R ⁶	CH ₃
R ⁵ + R ⁶	
R ⁷	
R ⁸	H
R ⁹	H
n	0, 1
X	Enlace, COO, CONH,
X-R ² + R ³	Sustituidos por halógeno, CH₃, COCH₃, SO₂CH₃, CONH₂, COCONH₂.

1er Art 45

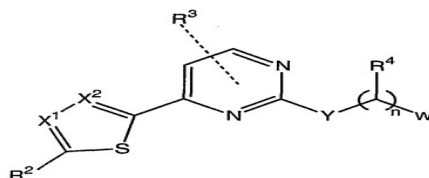
Para la reivindicación 37 no es correcto referirse a objetos o párrafos existentes en el capítulo descriptivo. Se solicita incluir dentro de prosa de esta reivindicación los nombres y/o estructuras de los compuestos específicos que desea proteger el inventor.

7. Determinación del Estado de la Técnica

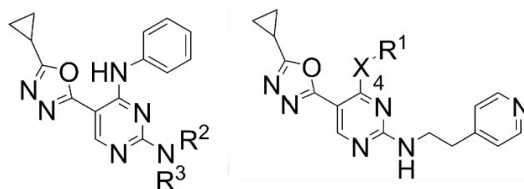
El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 23 de abril de 2010. Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006066172	"Aminopyrimidine compounds and methods of use"	Junio 22 de 2006
D2	<i>Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters</i> . 2008 ; 18: 5472 – 5477	"Novel and orally active 5 – (1,3,4 – oxadiazol – 2 – yl) pyrimidine derivatives as selective FLT3 inhibitors"	Septiembre 11 de 2008
D3	<i>Short Communications</i> . 1960 ; 33 (10): 1471 – 1472	"Synthesis of Isokineticin, 2 – N – furfuryl aminopurine and its Leaf-growth activity"	Octubre 31 de 1960
D4	<i>Journal of Medicinal Chemistry</i> . 2008 ; 51: 1681 – 1694	"Structure – Guided Design of Aminopyrimidine Amides as Potent, Selective Inhibitors of Lymphocytes Specific Kinase: Synthesis. Structure – Activity Relationships, and Inhibition of in vivo T Cell Activation"	Junio 3 de 2008
D5	<i>Journal of Medicinal Chemistry</i> . 2000 ; 43: 4135 – 4150	"Adenosine Analogues as Inhibitors of <i>Trypanosoma brucei</i> Phosphoglycerate Kinase: Elucidation of a Novel Binding Mode for a 2 – Amino – N ⁶ – Substituted Adenosine"	Diciembre 10 de 2000

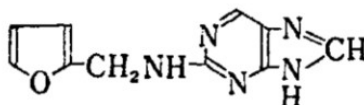
El documento D1¹ divulga compuestos derivados de amino pirimidina con actividad inhibidora de PLK-1 kinasa, para el tratamiento de enfermedades proliferativas celulares



El documento D2² divulga compuestos derivados de 5 – (oxadiazol – 2 – il) pirimidina con actividad antitumoral



El documento D3³ divulga el compuesto Isokineticina, como inhibidor del crecimiento celular

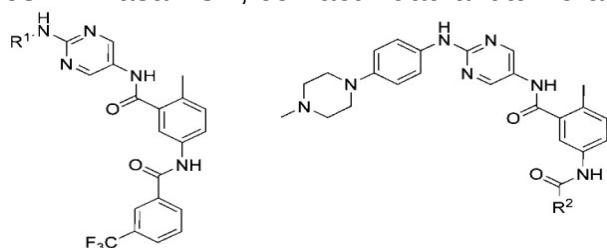


1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=9323418A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=19931125&DB=&locale=en_EP

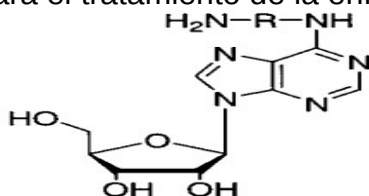
2 <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0960894X08010895>

3 https://www.jstage.jst.go.jp/article/bcsj1926/33/10/33_10_1471/_article

El documento D4⁴ divulga compuestos derivados de amino pirimidina como inhibidores de la Tirosin Kinasa LCK, con actividad antitumoral



El documento D5⁵ divulga compuestos análogos de Adenosina como inhibidores de Fosfoglicerato Kinasa, para el tratamiento de la enfermedad de Chagas



8. Examen de Patentabilidad.

Novedad (Art 16 D 486)

La reivindicación 1 divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable el mismo, en la que... (Páginas 152 a 156 del radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D1
Compuesto de la fórmula I	Compuesto de la Fórmula I
R¹ es H	
X – R ² ; donde X es un enlace; R ² es heterocicloalquilo de 3 a 8 miembros, arilo C ₆ -10, heteroarilo de 5 a 10 miembros, opcionalmente sustituidos	R ³ es arilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos
R ³ es heteroarilo de 5 a 10 miembros, opcionalmente sustituido	Donde X¹ y X² son CR¹ o N (R¹ y R² son H u otros sustituyentes)
N – R ⁴ , donde R ⁴ es H o alquilo C ₁₋₆	Y es NR ⁷ , donde R ⁷ es H o alquilo C ₁₋₆
Donde m es 0, 1, 2; R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son H o alquilo C₁₋₆	Donde n oscila entre 1 a 6, R⁴ es H o alquilo C₁₋₆
R ⁷ es heteroarilo de 5 a 10 miembros, sustituidos por oxo, H, alquilo C ₁₋₆ , cicloalquilo C ₃₋₈ , heterocicloalquilo de 5 a 8 miembros, arilo C ₆₋₁₀ , heteroarilo de 5 a 10 miembros	W es Donde X³ es CH o N; R⁷ es H o alquilo C₁₋₆; R⁵ y R⁶ son H, alquilo C₁₋₆, arilo, heteroarilo, cicloalquilo o heterocíclico

⁴<http://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/jm7010996>

⁵<http://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/jm000287a>

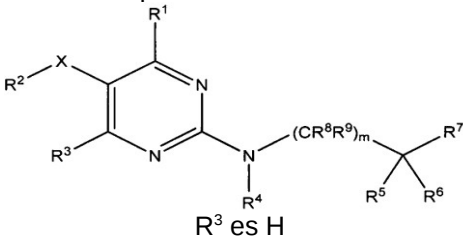
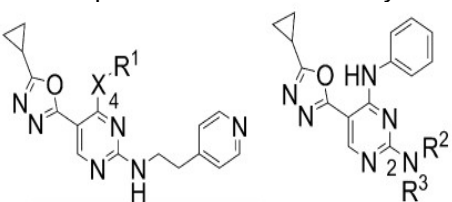
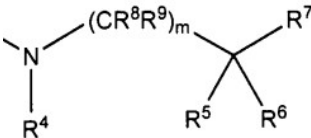
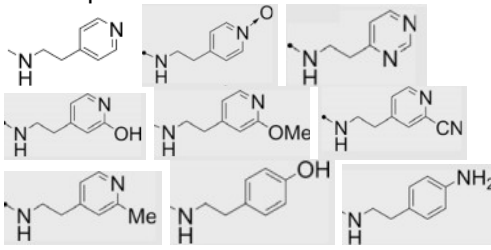
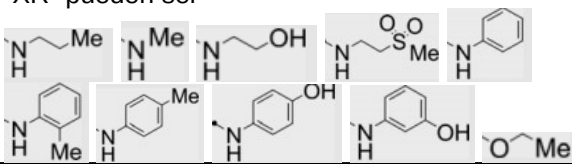
Las características técnicas esenciales de la invención definida de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D1 (D1: Páginas 2 a 4, párrafos [0007], [0008]), donde se mencionan compuestos derivados de 2 – amino pirimidina, con actividad inhibidora de la Kinasa PLK-1, para el tratamiento de enfermedades cito proliferativas, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior, teniendo en cuenta que la formula I de la presente invención constituye una generalidad muy amplia, donde se incluyen muchas características definidas en la fórmula I de los compuestos divulgados en D1

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D1, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2 a 6, 18, 19, 22 a 34 y 36 a 38, dependientes de la reivindicación 1, no aportan características adicionales que otorguen novedad a lo propuesto en la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable el mismo, en la que... (Páginas 152 a 156 del radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D2
Compuesto de la fórmula I  R³ es H	Compuestos de las Tablas 1 y 2 
X – R²; donde X es un enlace; R² es heteroarilo de 5 a 10 miembros, opcionalmente sustituido por cicloalquilo C₃₋₈	 Como sustituyente en la posición 5 del anillo de pirimidina
 Donde R⁴ es H, m es 1; R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son H; R⁷ es arilo C₆₋₁₀ o heteroarilo de 5 a 10 miembros, opcionalmente sustituido por OR^a (R^a es H o alquilo C₁₋₆), CN o NR^bR^c (R^b y R^c son H)	NR²R³ pueden ser 
R¹ es NR^bR^c, donde R^b y R^c son H, alquilo C₁₋₆ y arilo C₆₋₁₀ sustituidos; R¹ puede ser OR^a (R^a es alquilo C₁₋₆)	XR¹ pueden ser 

Las características técnicas esenciales de la invención definida de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D2 (D2: Página 5472, Figura 1, compuestos FLT3 1 y FLT3 2; página 5474, tablas 1 y 2, compuestos 2, 7a, 7b, 7c, 7d, 7e, 7f, 7g, 7h, 7i, 7j, 7k, 7l, 7m, 7n, 7o, 7p y 7q; página 5475, tablas 3 y 4, compuestos 21a, 23a, 23b, 23c, 23d, 23e, 23f, 23g, 23h, 23i, 23j, 23k, 23l, 23m, 23n, 23o, 23p, 23q y 23r), donde se mencionan compuestos derivados de 5 – (1, 3, 4 – oxadiazol – 2 – il) – 2 – amino pirimidina, con actividad inhibidora de Tirosin

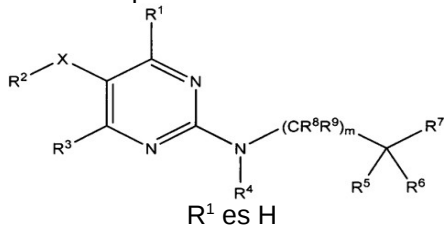
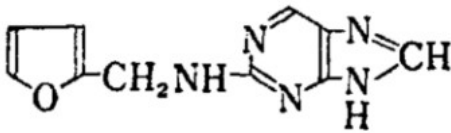
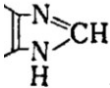
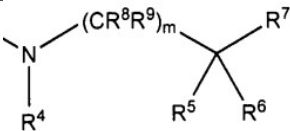
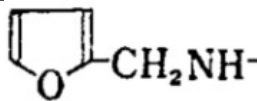
kinasa, con actividad antitumoral, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D2, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2 a 6, 18, 19, 22 a 31 y 35 a 38, dependientes de la reivindicación 1, no aportan características adicionales que otorguen novedad a lo propuesto en la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable el mismo, en la que... (Páginas 152 a 156 del radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D3
Compuesto de la fórmula I  R¹ es H	Compuesto Isokinetin 
X – R² y R³ conjuntamente forman un anillo de 5 – 6 miembros que contiene uno varios atomos de N, uno o varios dobles enlaces	 Se fusiona con el anillo de pirimidina en las posiciones 4 y 5
 Donde R⁴ es H, m es 1; R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son H; R⁷ es heteroarilo de 5 a 10 miembros, opcionalmente sustituido	 Como sustituyente en la posición 2 del anillo de pirimidina

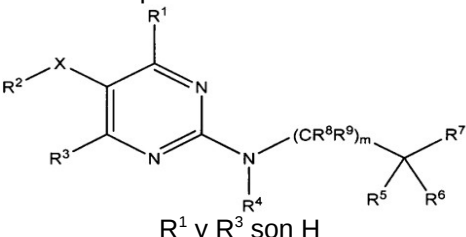
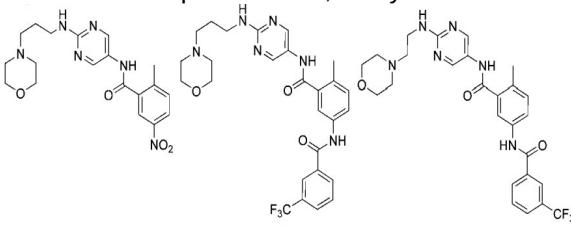
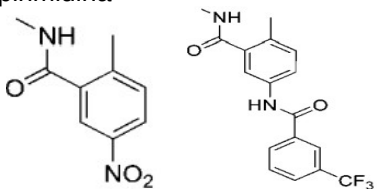
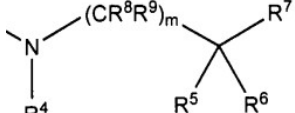
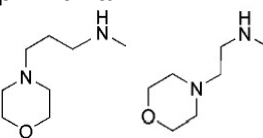
Las características técnicas esenciales de la invención definida de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D3 (D3: Página 1471, compuesto [VI]), donde se mencionan 6 – (furanil – 2 – ilmetilamino) imidazo [4,5-d] pirimidina (Isokinetina), con actividad inhibidora del crecimiento celular, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D3, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2, 4, 19, 22, 23, 32, 33 y 36 a 38, dependientes de la reivindicación 1, no aportan características adicionales que otorguen novedad a lo propuesto en la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable el mismo, en la que... (Páginas 152 a 156 del radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D4
Compuesto de la fórmula I  R¹ y R³ son H	Compuestos 12c, 13c y 13e 
X es – (CH₂)_pCONR^d(CH₂)_p –, donde p es 0, R^d es H; R² es arilo C₆₋₁₀ opcionalmente sustituido por alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, NO₂	Como sustituyentes en la posición 5 del anillo de pirimidina 
 Donde R⁴ es H, m es 1 ó 2; R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son H; R⁷ es arilo C₆₋₁₀ o heterocicloalquilo de 3 a 8 miembros	Como sustituyentes en la posición 2 del anillo de pirimidina 

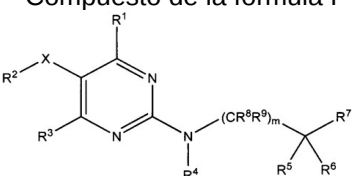
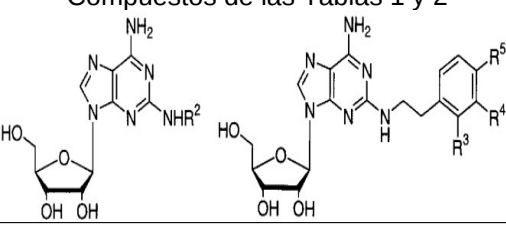
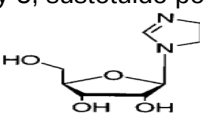
Las características técnicas esenciales de la invención definida de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D4 (D4: Páginas 1683, compuestos 12c y 13c; página 1684, compuesto 13e), donde se mencionan compuestos derivados de N – (2 – amino pirimidin – 5 – il) benzamida, como inhibidores de la Kinasa Linfocitica específica (LCK), para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

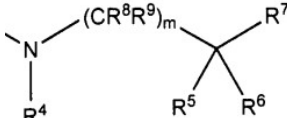
En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D4, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2 a 4, 19, 23, 24 y 32 a 38, dependientes de la reivindicación 1, no aportan características adicionales que otorguen novedad a lo propuesto en la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Novedad.

La reivindicación 1 divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable el mismo, en la que... (Páginas 152 a 156 del radicado N° 12 – 189881 – 00000 – 0000)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Solicitud	D5
Compuesto de la fórmula I  R¹ es NR^bR^c (R^b y R^c son H)	Compuestos de las Tablas 1 y 2 
X – R² y R³ conjuntamente forman un anillo de 5 – 6 miembros que contiene uno varios atomos de N, uno o varios dobles enlaces, opcionalmente sustituido por R^f (R^f es heteroarilo de 5 a 8 miembros)	Se fusiona con el anillo de pirimidina en las posiciones 4 y 5, sustotuido por un grupo ribofuranil 

 Donde R⁴ es H, m es 0, 1 ó 2; R⁵, R⁶, R⁸ y R⁹ son H; R⁷ es cicloalquilo C₃₋₈, arilo C₆₋₁₀, opcionalmente sustituido por alquilo C₁₋₆, NO₂, OR^a (R^a es H o alquilo C₁₋₆)	R² puede ser CH₂ – ciclohexil, tetrahidrofurfuril, furfuril, CH₂C₆H₅, CH(CH₃)C₆H₅, CH₂(o-CH₃-C₆H₄), CH₂(m-CH₃-C₆H₄), CH₂(p-CH₃-C₆H₄), CH₂(o-Cl-C₆H₄) CH₂(m-CH₃-C₆H₄), CH₂(p-CH₃-C₆H₄), CH₂(o-OCH₃-C₆H₄), CH₂(p-OCH₃-C₆H₄), CH₂CH₂C₆H₅, CH₂CH(CH₃)C₆H₅, CH₂CH₂CH₂C₆H₅, CH₂-naftalen. R³, R⁴ y R⁵ pueden ser H, OH, CH₃, OCH₃, NH₂, NO₂
---	--

Las características técnicas esenciales de la invención definida de acuerdo con la reivindicación 1, han sido divulgadas previamente en D5 (D5: Página 4138, tablas 1 y 2, compuestos 23c, 26c a 43c y compuestos 44c a 59c), con actividad inhibidora de fosfoglicerolato Kinasa del *Tripanosoma brucei*, para el tratamiento de la enfermedad de Chagas, con las características técnicas esenciales descritas en la tabla anterior.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D5, carece de Novedad.

Las reivindicaciones 2 a 4, 18, 22, 23, 32 a 34 y 36 a 38, dependientes de la reivindicación 1, no aportan características adicionales que otorguen novedad a lo propuesto en la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones, también carecen de Novedad.

9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de esta solicitud se ven afectados de la siguiente manera:

Item	Documento	Reivindicaciones	Requisitos que afecta
D1	WO2006066172	1 a 6, 18, 19, 22 a 34 y 36 a 38	Novedad
D2	<i>Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters</i> . 2008 ; 18: 5472 – 5477	1 a 6, 18, 19, 22 a 31 y 35 a 38	Novedad
D3	<i>Short Communications</i> . 1960 ; 33 (10): 1471 – 1472	1, 2, 4, 19, 22, 23, 32, 33 y 36 a 38	Novedad
D4	<i>Journal of Medicinal Chemistry</i> . 2008 ; 51: 1681 – 1694	1 a 4, 19, 23, 24 y 32 a 38	Novedad
D5	<i>Journal of Medicinal Chemistry</i> . 2000 ; 43: 4135 – 4150	1 a 4, 18, 22, 23, 32 a 34 y 36 a 38	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 (60) días contados a partir del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-11-12

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza