

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-3185- -4	FECHA: 2014-01-24 11:05:33
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

Asunto: Radicación: 13-3185- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 679
 Folios: 7

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/EP2011/061305				
Fecha de Presentación Internacional	05/07/2011				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado N°13-003185-00000-0000	Enero 9 de 2013
Reivindicaciones	Radicado N°13-003185-00000-0000	Enero 9 de 2013
Prioridad:	DE 101210031149.9	Julio 9 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

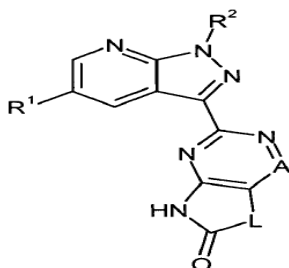
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud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

Por lo tanto, las reivindicaciones 1 a 16 del Radicado N°13-003185-00000-0000 son aceptadas para ser estudiadas, porque se registra el pago por las reivindicaciones adicionales 11 a 16, de acuerdo con el recibo presente en la página 254 del radicado N°13-003185-00000-0000.

Título de la solicitud: "Pirimidinadas y triazinas condensadas y su uso"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la obtención de compuestos alternativos, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos derivados de pirimidina y triazina, como estimulantes de la producción de cGMP, con actividad vasodilatadora, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/519; A61K31/522; A61P9/00; C07D487/04

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

El objeto de la reivindicación 8-10 y 16 no es patentable, de acuerdo con el artículo citado.

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

El uso de las reivindicaciones 11,12 y 15 no es patentable, de acuerdo con el Art 14

6. De la Solicitud de la Patente

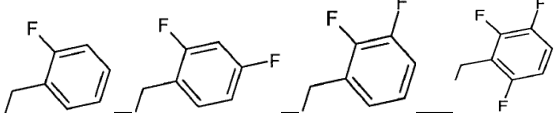
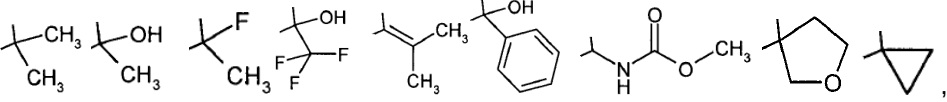
Título

El título de la presente solicitud se considera muy general y ambiguo, porque al mencionar "pirimidinas y triazinas", se incluyen muchísimos compuestos que cumplen con estas características pero no están incluidos en el objeto de la presente invención. Se observa que los compuestos de la presente invención son derivados de 6 - [1 - (2 - fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin - 3 - il] pirrolo [4,5-e] pirimidin - 2 - ona o derivados de 6 - [1 - (2 - fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin - 3 - il] pirrolo [4,5-e] [1,2,4] triazin - 2 - ona. Se solicita modificar el título de esta solicitud, de acuerdo con las observaciones mencionadas anteriormente.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa, porque se mencionan sustituyentes, los cuales a pesar de ser la restricción de una generalidad, se considera amplios tales como "alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄ carbonilo, carbociclo de 3 a 6 miembros, heterociclo de 4 a 6 miembros", además se mencionan sustituyentes no evidentes en la estructura de la fórmula I (R^{4A}, R^{4B}, R^{5A}, R^{5B}), los cuales se definen de manera amplia, de tal forma que a partir del empleo de los sustituyentes mencionados anteriormente, se obtiene una cantidad amplia de posibles compuestos y por lo tanto la complejidad de la solicitud es demasiado alta y por lo tanto no es posible

establecer el verdadero alcance de lo que se desea proteger. Se solicita realizar una restricción más razonable y específica de los sustituyentes, que sean mencionados en función de los sustituyentes principales, de forma tal que a partir de los mismos se obtengan los compuestos de real interés para el inventor y que constituyen la solución al problema técnico objetivo planteado en la presente invención. El objetivo es que el solicitante mencione estructuras específicas de cada sustituyente posible dentro de la prosa de la reivindicación (esto quiere decir que en vez de mencionar alquilo C₁₋₄, se mencione metil, etil, propil; en vez de mencionar heterociclo de 4 a 6 miembros, mencionar si es azetidina, oxetan, piridina, furano, tiofeno, pirrol, tiazol, oxazina, así sucesivamente con los demás sustituyentes definidos en la reivindicación 1). Es cierto que el inventor está en su legítimo derecho de proteger su invención en la extensión que lo estime conveniente siempre y cuando se conserve el mismo concepto inventivo, sin embargo, de acuerdo al artículo 30 de la decisión 486, las reivindicaciones que detallan el objeto de la invención deben ser claras, concisas y debidamente soportadas dentro del capítulo descriptivo. Se sugiere respetuosamente al solicitante que utilice como referencia para realizar la restricción de los sustituyente más detallada y específica, de acuerdo a lo mencionado en el capítulo descriptivo y divulgado en la siguiente tabla, de tal manera que no se considere como una obligación, sino como una guía:

Sustituyente	Soportado en la descripción
R ¹	H, F
R ²	
A	CH, C(CH ₂ CF ₂), C(ciclopropil), N
L	 CH ₂ , -C(CH ₃)-CH ₂ -, -C(CF ₃)-CH ₂ -, C=O,

La reivindicación 5 no es concisa, porque se mencionan reactivos de manera muy general tales como “disolvente inerte, base adecuada, equivalente de yodo, catalizador de metal de transición, entre otros”, dado que en el estado de la técnica se conoce un sinnúmero de reactivos que cumplen con estas funciones, pero que no se utilizan para la síntesis de los compuestos de la presente invención. Por lo tanto, se solicita mencionar de manera específica que disolventes inertes, bases y catalizadores son los utilizados en la invención, así como mencionar las condiciones en las que desarrollaron todos los pasos de la síntesis. Además, se solicita especificar los sustituyentes de cada uno de los compuestos intermediarios, de acuerdo con el requerimiento realizado para la reivindicación 1.

Para las reivindicaciones 6 y 7, se solicita realizar la misma restricción para todos los sustituyentes, de acuerdo a lo requerido dentro de la reivindicación 1, de tal manera que estos sean mucho más específicos con respecto a lo mencionado en la reivindicación principal.

Para las reivindicaciones 13 y 14, sírvase modificar el término “medicamento” por el término “composición farmacéutica”, el cual constituye el término técnico mas preciso para esta modalidad de la invención.

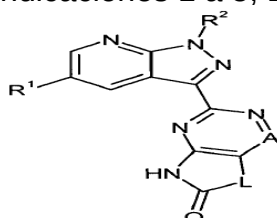
La reivindicación 14 no es concisa, porque se mencionan combinaciones con sustancias definidas en su acción farmacoterapéutica tales como “nitratos organicos, inhibidores de cGMP, antitromboticos, antihipertensivos, modificadores de metabolismo lipidico, entre otros”, potque existe una cantidad muy amplia de

compuestos farmacológicamente activos que cumplen con alguna acción terapéutica mencionada, pero no todas estas son de interés para que el inventor desarrolle las combinaciones farmacéuticas de la invención. Se solicita mencionar los compuestos específicos para desarrollar las combinaciones (por ejemplo, para bitratos orgánicos, mencionar si es nitroglicerino, mono o dinitrato de isorsobide; para agentes antitrombóticos, mencionar si es ASA, Warfarina; así sucesivamente con los otros grupos farmacoterapéuticos.

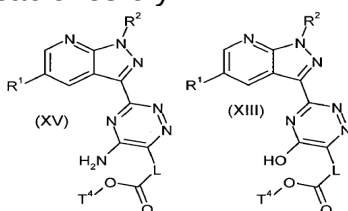
7. Unidad de invención (Art 45 D 486)

La presente solicitud no cumple con el requisito de Unidad de Invención, dado que han identificado 2 Grupos Inventivos diferentes, los cuales no contemplan un concepto inventivo común, que son los siguientes:

- Grupo Inventivo I: Compuestos de la fórmula I, derivados de 6 – [1 – (2 – fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin – 3 – il] pirrolo [4,5-e] pirimidin – 2 – ona y de 6 – [1 – (2 – fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin – 3 – il] pirrolo [4,5-e] [1,2,4] triazin – 2 – ona según las reivindicaciones 1 a 5, 13 y 14



- Grupo Inventivo II: Compuestos de las fórmulas XV y XIII, derivados de 3 – {3 – [1 – (fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin – 3 – il] [1,2,4] triazin – 6 – il} propanoato de alquilo, según las reivindicaciones 6 y 7.



Los compuestos de fórmula XV y XIII son intermediarios de la síntesis de los compuestos de la Fórmula I, de acuerdo a lo mencionado en la reivindicación 5. Además, en el capítulo descriptivo no se evidencia actividad farmacológica para estos compuestos. Por esta razón, se consideran como invenciones diferentes.

Por lo tanto, se solicita presentar las respectivas Solicitudes Divisionales para cada uno de los Grupos Inventivos anteriormente mencionados, o se solicita restringir la presente solicitud a un solo Grupo Inventivo, de tal manera que los demás Grupos Inventivos sean eliminados de la misma.

8. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de solicitud de prioridad: El 9 de julio de 2010 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud

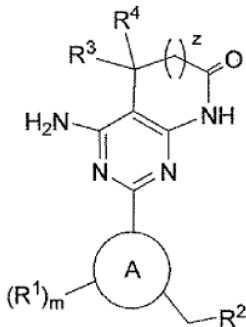
Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2010065275	“Soluble guanilate cyclase activators”	Junio 10 de 2010
D2	US6743798	“Substituted pyrazole derivatives condensed with six membered heterocyclic rings”	Junio 1 de 2004

El documento D1¹ divulga compuestos activadores de la guanilato ciclasa, para el

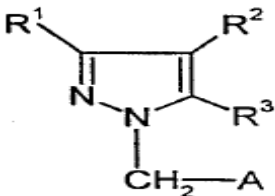
¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2010065275A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20100610&DB=&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2010065275A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20100610&DB=&locale=en_EP

tratamiento de enfermedades cardiovasculares



El documento D2² divulga compuestos derivados de pirazol, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares

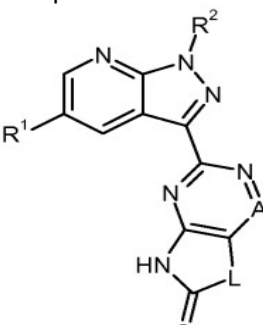
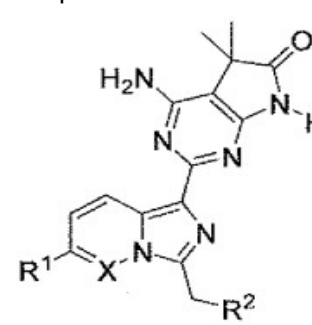
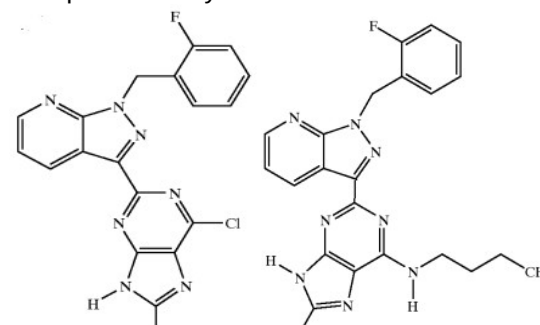


9. Examen de Patentabilidad.

Nivel Inventivo (Art 18 D 486)

Para el Grupo Inventivo I

La reivindicación 1 divulga un compuesto de fórmula I, en donde... (Página 10 a 14 del capítulo reivindicatorio del radicado N° 13-003185-00000-0000)

Solicitud	D1	D2
Compuesto de la Fórmula I  A es CR3	Compuestos Tabla 3  X es CH ó N	Compuestos 42 y 74 
R ¹ es H o F	R ¹ es H, F, Cl	H en posición 5 del anillo de pirazolo [4,5-b] piridina
R ² es bencil, sustituido por 1 a 3 átomos de F	R ² es 2, 3, 6 – trifluorofenil 2, 3 – difluorofenil, 2 – fluorofenil	2 – fluorobencil en posición 1 del anillo de pirazolo [4,5-b] piridina
R ³ es H, D, F, CHF ₂ , CF ₃ , alquilo C ₁₋₄	NH ₂ en posición 4 del anillo de pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona	Cl, NH(CH ₂) ₃ CH ₃
L es –CR ^{4A} CR ^{4B} –(CR ^{5A} CR ^{5B}) _p – Donde p es 0; R ^{4A} y R ^{4B} son alquilo C ₁₋₄ ó R ^{4A} y R ^{4B} forman un carbociclo de 3 a 6 miembros	Dimetil posición 3 del anillo pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona (En la página 68 se menciona que R ³ y R ⁴ son alquilo C ₁₋₆ o en conjunto conforman un cicloalquilo)	No se menciona

D1 es considerado el Estado de la Técnica más cercano a la presente invención definida en la reivindicación 1, porque se divulgan compuestos derivados de 6 – [4

2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?
 CC=US&NR=6743798B1&KC=B1&FT=D&ND=4&date=20040601&DB=worldwide.espacenet.com&
 locale=es_LP

– (2 – fluorobencil/2, 3 - difluorobencil) imidazo [3,4-b] piridazin – 1 – il] – 4 – amino pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona, como agentes estimulantes de la guanilato Ciclasa, como mecanismo para incrementae el cGMP, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares (D1: página 57, tabla 3; páginas 66 y 67, reivindicación 1).

La diferencia entre los compuestos divulgado en la presente invención con respecto a los definidos en D1, consiste en que los compuestos de la presente invención el sustituyente en posición 6 del pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona es un grupo pirazolo [4,5-b] piridina, mientras que para los compuestos de D1, el sustituyente en posición 6 del mismo anillo es un grupo imidazo [3,4-b] piridazina.

Esta diferencia al parecer no concede ningún efecto técnico ventajoso o inesperado a los compuestos de la presente invención con respecto al divulgado en D1.

El problema técnico Objetivo que se pretende resolver es el siguiente: Como modificar los compuestos divulgado en D1 para obtener compuestos alternativos derivados de 6 – [1 – (2 – fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridin – 3 – il] pirrolo [4,5-e] pirimidin – 2 – ona como estimulantes de la producción de cGMP, para el tratamiento de enfermedades cardiovasculares?

D1 divulga en la columna 64, ejemplo 42 y en la columna 73, compuesto 74, compuestos heterocíclicos para el tratamiento de enfermedades cardiovascules, que contienen como sustituyente el grupo 1 – (2 – fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridina.

Por lo tanto, una persona medianamente versada en la materia y conocedora de los conceptos divulgados en D1 y D2, sin un mayor esfuerzo reemplazaria el sustituyente en posición 6 del anillo pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona presente en D1 y de acuerdo a lo sugerido en D2, acoplando el grupo 1 – (2 – fluorobencil) pirazolo [4,5-b] piridina, donde de acuerdo a lo mencionado en D, el fluorobencilo puede contener mas atomos de F y la persona versada en la materia lograría además modificar los sustituyentes en posición 3 del pirrolo [4,5-e] piridin – 2 – ona , para obtener de esta forma los compuestos propuestos en la presente invención, de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 1 de acuerdo a lo divulgado en D1 y D2, carece de Nivel Inventivo

Las reivindicaciones 2, 3, 5, 13 y 14, dependientes de la reivindicación 1, no mencionan características inventivas adicionales para los compuestos de la reivindicación 1. Por lo tanto, estas reivindicaciones también carecen de Nivel Inventivo.

10. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2010065275	1 a 3, 5, 13 y 14	Nivel Inventivo
D2	US6743798	1 a 3, 5, 13 y 14	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 (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 2014-01-28

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