

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

2020
Bogotá, D.C.

Abogado
Carlos Olarte

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-039102- -00002-0000

Fecha: 2009-09-03 13:29:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	07-39102
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	10187
	Folios	005

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/IB2005/003255

Fecha de Presentación Internal. Octubre 10 de 2005

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. | <u>Descripción:</u> | Folios: 30 a 45 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios: 46 a 49 | (como se radicó inicialmente) |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | <u>US 60/621.559 de Octubre 22 de 2004.</u> | |

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "PROCEDIMIENTO PARA PREPARACIÓN DE COMPUESTOS DE PURINA", folio 1, campo 54.
- El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:
 - Reivindicaciones 1-10: Procesos para preparación de compuestos derivados de la fórmula (I).
 - Reivindicaciones 11-12: Compuestos derivados de la fórmula (1g).

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de procedimientos alternativos para producción de purinas más rentables y más seguros para el ambiente.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un procedimiento mejorado para preparar compuesto de fórmula (I) y compuestos.

- La invención se catalogó en la categoría A61K31/52, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria Octubre 22 de 2004.

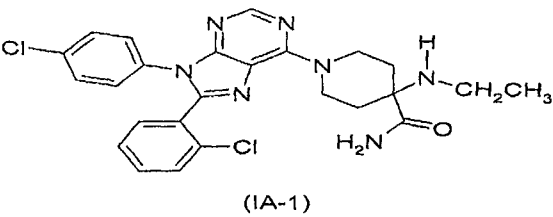
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US2004/092520	Purine compounds and uses thereof	2004-05-13

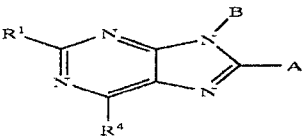
4. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

4.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

- En la primera reivindicación se presenta procedimiento de preparación del compuesto de fórmula (IA-1) por reacción de (I-1e) con (I-1f) para formar (I-1g), el cual en medio prótico se somete a ciclización.



- El estado de la técnica representado por D1, presenta un procedimiento similar (esquema 1, página 13) el cual involucra ciclización del compuesto 1(b) en presencia de un ácido como el acético o sulfúrico para obtener 1(d), u con el uso de oxiclورو fosforoso para obtener 1(c). A continuación se trata 1(c) con un derivado de piperidinas de fórmula IA para así obtener el compuesto I.



- La única diferencia con D1 es que esta solicitud menciona primero el tratamiento de 1b con el derivado de piperidina, seguido del paso de ciclización. Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado porque el resultado final continúan siendo purinas.
- El problema técnico en esta solicitud, la provisión de un método alternativo para la preparación de los compuestos de fórmula (I), se había resuelto previamente mediante el mismo tipo de proceso ya conocido. Por esta razón se considera que la inversión de los pasos es evidente para una persona

medianamente versada en la materia, por lo cual no puede reconocerse Nivel Inventivo.

5. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2004/092520	1 y dependientes (2 a 12)	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
04 SEI. 2009

CONCEPTO TÉCNICO No.3005	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202074
------------------------------------	---



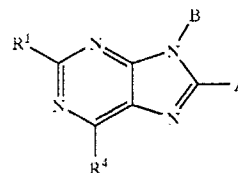
US 20040092520A1

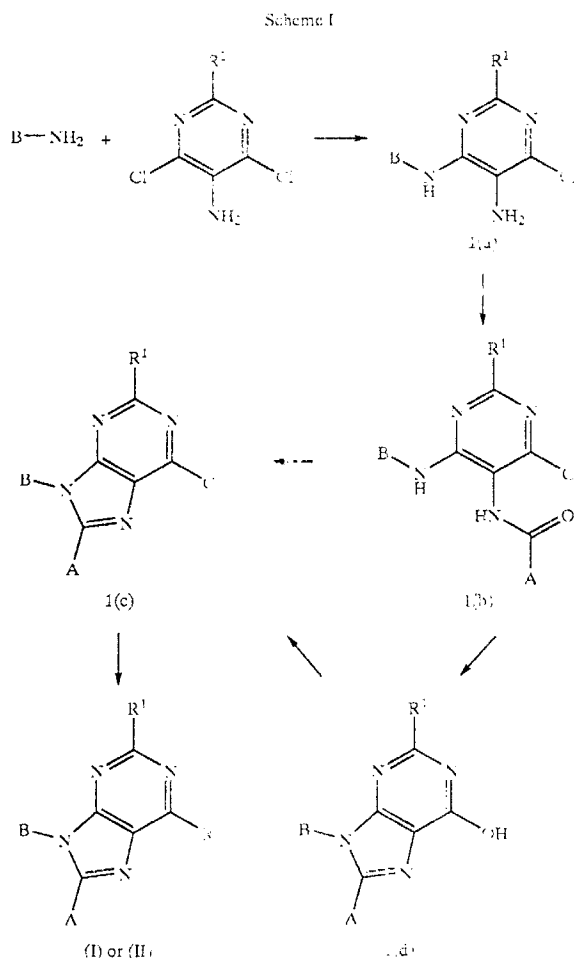
71

51

(19) **United States**(12) **Patent Application Publication**
Griffith(10) **Pub. No.: US 2004/0092520 A1**(43) **Pub. Date: May 13, 2004**(54) **PURINE COMPOUNDS AND USES THEREOF**(52) **U.S. Cl. 514/242; 514/252.16; 514/263.21;
514/263.22; 544 277**(75) **Inventor: David A. Griffith, Old Saybrook, CT
(US)****Correspondence Address:****PFIZER INC.
PATENT DEPARTMENT, MS8260-1611
EASTERN POINT ROAD
GROTON, CT 06340 (US)**(57) **ABSTRACT**

Compounds of Formula (1) that act as cannabinoid receptor ligands and their uses in the treatment of diseases linked to the mediation of the cannabinoid receptors in animals are described herein.

(73) **Assignee: Pfizer Inc.**(21) **Appl. No.: 10/689,381**(22) **Filed: Oct. 20, 2003****Related U.S. Application Data**(60) **Provisional application No. 60-421,874, filed on Oct. 28, 2002.****Publication Classification**(51) **Int. Cl.⁷ A61K 31/53; A61K 31/52;
C07D 473 00**



[0120] Intermediate 1(a) may be prepared by reacting the desired amino compound ($B-NH_2$, where B is as defined above) with 4,6-dichloro-5-aminopyrimidine (available from Sigma-Aldrich, St. Louis, Mo.) in refluxing aqueous hydrochloric acid (A. Miyashita et al. in *Chem. Pharm. Bull.*, 46, 390-399 (1998)) or ethoxyethanol at elevated temperatures. Suitable amino compounds ($B-NH_2$) include those compounds where B is aryl (e.g., aniline) or substituted aryl (e.g., 2-chloroaniline, 2-fluoroaniline, 2,4-dichloroaniline, 2-fluoro-4-chloroaniline, 2-chloro-4-fluoroaniline, 2,4-difluoroaniline, and other substituted arylamines). Other commercially available derivatives of 4,6-dichloro-5-aminopyrimidine may be used as a starting material for those compounds of Formula (I) or (II) where R^1 is other than hydrogen (e.g., 2-n-ethyl-4,6-dichloro-5-aminopyrimidine and 2-ethyl-4,6-dichloro-5-aminopyrimidine). For representative literature syntheses of 4,6-dichloro-5-aminopyrimidine derivatives see: A. Albert et al. in *J. Chem. Soc.*, 3832 (1954) and W. E. Hymans in *J. Heterocycl. Chem.*, 13, 1141 (1976).

[0121] Intermediate 1(a) can then be acylated using conventional chemistry well-known to those skilled in the art. For example, intermediate 1(a) may be reacted with the desired aroyl or heteroaryl chloride in a basic solvent (e.g.,

pyridine) to produce intermediate 1(b). Alternatively, intermediate 1(a) may be reacted with the desired aroyl or heteroaryl chloride in a reaction inert solvent (e.g., tetrahydrofuran, methylene chloride, N,N-dimethylacetamide). The addition of a suitable base (e.g., triethylamine, diisopropylethylamine) may help facilitate the reaction. Suitable aroyl chlorides include benzoyl chloride, o-chlorobenzoyl chlorides, o-fluorobenzoyl chloride, p-chlorobenzoyl chloride, p-fluorobenzoyl chloride, 2,4-dichlorobenzoyl chloride, 2,4-difluorobenzoyl chloride, and the like.

[0122] Intermediate 1(b) may then be cyclized to the 6-chloro-purine intermediate 1(c) by treatment with a condensation agent using analogous procedures and conditions described in U.S. Pat. No. 4,728,644, incorporated herein by reference. In a preferred method, intermediate 1(b) can be refluxed in a weak acid (e.g., acetic acid) or sulfuric acid in an appropriate solvent (e.g., isopropyl alcohol, toluene) to provide the hydroxy purine intermediate 1(d) followed by refluxing in phosphorous oxychloride, toluene in the presence of phosphorous oxychloride and triethylamine, or 2,6-lutidine in phosphorous oxychloride to give intermediate 1(c). In another preferred method, 1(b) may be directly converted to 1(c) by refluxing in phosphorous oxychloride; an appropriate co-solvent (e.g., toluene) and/or base (e.g., pyridine, triethylamine) may be added to aid in the condensation.

[0123] Finally, the R^4 group can be introduced by displacing the chloride on the purine ring at the 6 position.

[0124] For compounds of Formula (I) and (II) where R^4 is an amino group, intermediate 1(c) is generally stirred with the desired amine (e.g., substituted or unsubstituted aryl(C_1-C_3)alkylamine, substituted or unsubstituted 2-indanyllamine, substituted or unsubstituted cyclohexylamine, substituted or unsubstituted cyclopentylamine, substituted or unsubstituted norboranyllamine, hydroxy(C_1-C_6)alkylamine, substituted or unsubstituted heteroarylamine, heteroaryl(C_1-C_3)alkylamine, and substituted or unsubstituted 5- to 6-membered heterocyclic amine (i.e., an amine of Formula (Ia) defined above)). The amine may act as the solvent or a solvent (e.g., ethanol, methylene chloride, etc.) may be added to assist in solubilization of the reactants and/or provide a media having the appropriate refluxing temperature to complete the substitution. The reaction may be heated to accelerate the process. In addition, a suitable base such as triethyl amine may be employed to quench the acid produced in the process. Suitable amino compounds can be either purchased commercially or easily prepared using standard procedures well-known to those skilled in the art.

[0125] Compounds of Formula (I) above where R^4 is a primary or secondary amine can be alkylated, sulfonated and/or acylated to provide additional derivatives (e.g., alkylamines, dialkylamines, sulfonamides, amides, carbamates, ureas, etc.) using standard procedures well-known to those skilled in the art.

[0126] Compounds of Formula (I) above where R^4 is an amino acid may be prepared as described by A. M. Shalaby et al. in *J. Chem. Res.*, 134-135 (1998). These materials may be further elaborated to amides and esters using standard procedures well-known to those skilled in the art.

[0127] Numerous amine compounds of Formula (IA) are available from commercial sources or prepared by known