

364
367
2

SEÑORES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S.



Ref.: Expediente N° 07-070.607

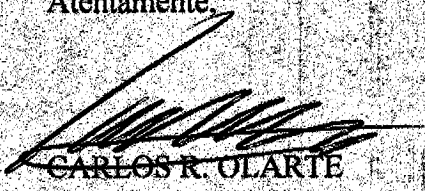
Solicitud de Patente de Invención Titulada: "DERIVADOS DE PURINA QUE ACTUAN COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR A2A."

Solicitante: NOVARTIS AG

SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 582

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad de la referencia, respetuosamente me permito solicitar que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina. Adjunto recibo por el monto de \$420.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 44372 de 26 de diciembre 2007.

Atentamente,


CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Recibo por \$420.000 pesos

365
~~368~~
R

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 8,777
FECHA : FEBRERO 1 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-070607- -00001-0000

Fecha: 2008-02-01 16:54:21 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios: 3

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2661940	01/02/2008	11,577,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILID	210,000.00
TOTAL :			\$ 210,000.00

SON: DOSCIENTOS DIEZ MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800174000-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 8.778
FECHA : FEBRERO 1 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



NO. 07 070007-00000-0000

RECIBO OFICIAL DE CAJA - Dep. 2021 NULCREACIONE
Tr. 11 PATEN. ERYU Ene. 378 PASNACIONALI
Act. 538 PERICION Folios: 3

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	VAL. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2661940	01/02/2008	11,577,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		114 PTE CAP-11 EXAMEN DE PATENTABILIDAD	216,000.00
		TOTAL :	216,000.00

SON: DOSCIENTOS DIEZ MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

366



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 07-70607

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 582 DE

FECHA 30 DE NOVIEMBRE DE 2007 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL 27 DE FEBRERO DE 2008

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** _____

371 367

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
21 March 2002 (21.03.2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/22630 A1

- (51) International Patent Classification: C07H 19/16, Pfizer Global Research and Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).
A61K 31/7076, A61P 11/00
- (21) International Application Number: PCT/IB01/01612 (74) Agents: WOOD, David, J. et al.; Pfizer Limited, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).
- (22) International Filing Date: 3 September 2001 (03.09.2001) (81) Designated States (national): 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, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data: 0022695.1 15 September 2000 (15.09.2000) GB
- (71) Applicant (for GB only): PFIZER LIMITED [GB/GB]; Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).
- (71) Applicant (for all designated States except GB, US): PFIZER INC. [US/US]; 235 East 42nd Street, New York, NJ 10017 (US).
- (84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (for US only): MANTELL, Simon, John [GB/GB]; Pfizer Global Research and Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB). STEPHENSON, Peter, Thomas [GB/GB];
- Published:
— with international search report
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 02/22630 A1

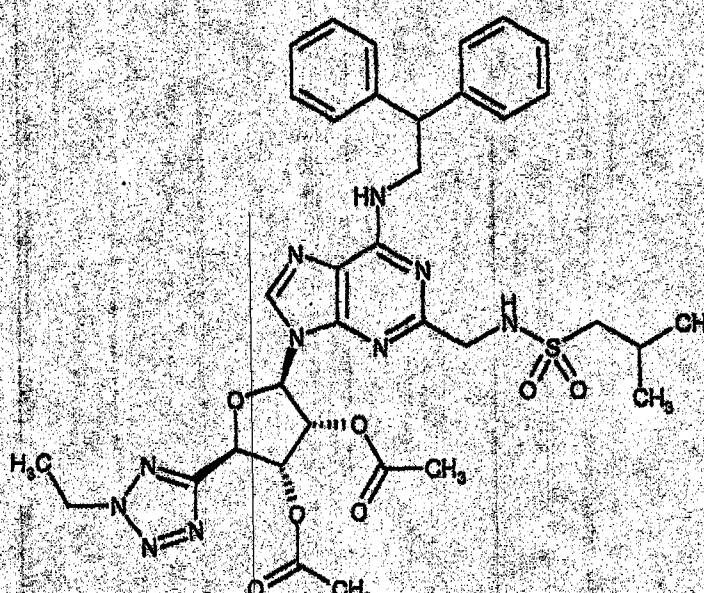
(54) Title: PURINE DERIVATIVES

(57) Abstract: The present invention relates to compounds of formula (I) and pharmaceutically acceptable salts and solvates thereof, to processes for the preparation of, intermediates used in the preparation of, and compositions containing such compounds and the uses of such compounds as adenosine A2a receptor agonists.

372/368

PREPARATION 26

(2R,3R,4R,5R)-4-(Acetyloxy)-2-(6-[(2,2-diphenylethyl)amino]-2-
 [(isobutylsulphonyl)amino]methyl)-9H-purin-9-yl)-5-(2-ethyl-2H-tetrazol-5-
 yl)tetrahydro-3-furanyl acetate



5

A suspension of *N*-({6-[(2,2-diphenylethyl)amino]-9*H*-purin-2-yl)methyl}-2-methyl-1-propanesulphonamide hydrochloride (Preparation 8) (0.2 g, 0.40 mmol) in 1,1,1-trichloroethane (10 ml) was treated with *N,O*-bis(trimethylsilyl)acetamide) (0.6 ml, 2.45 mmol) and the mixture was heated under reflux for 2 hours. The solvent was removed under reduced pressure and the residue was twice azeotroped with toluene. The residue was dissolved in toluene (5 ml) and treated sequentially with a solution of (2*R*,3*R*,4*R*)-4,5-bis(acetyloxy)-2-(2-ethyl-2*H*-tetrazol-5-yl)tetrahydro-3-furanyl acetate (WO-A-9967265) (0.165 g, 0.48 mmol) 15 In toluene (5 ml) and then trimethylsilyltriflate (0.09 ml, 0.49 mmol). The mixture was heated under reflux for 3 hours and then allowed to stand at room temperature overnight. The solution was diluted with ethyl acetate (40 ml), washed sequentially with saturated aqueous sodium hydrogen carbonate solution (20 ml) and brine (20 ml), dried (anhydrous magnesium sulphate) and 20 evaporated under reduced pressure. The residue was purified by column chromatography on silica gel eluting with a gradient system of dichloromethane :

ethyl acetate (4 : 1 by volume) gradually changing to dichloromethane : ethyl acetate (2 : 1 by volume) to afford the title compound (0.24 g).

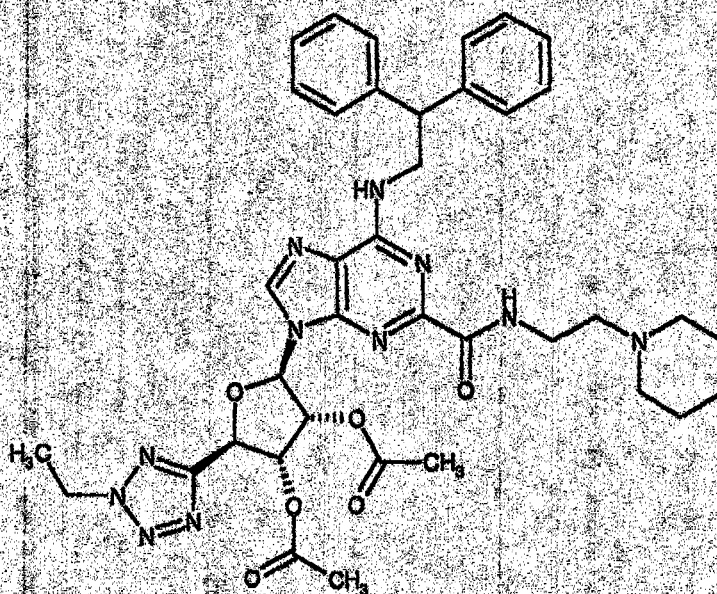
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃) δ : 8.10 (1H, s), 7.35-7.20 (10H, m), 6.30 (1H, m), 6.20 (1H, m), 6.05 (1H, m), 5.85 (1H, br s), 5.75 (1H, br s); 5.55 (1H, d), 4.70 (2H, q), 4.45-4.20 (5H, m), 2.95 (2H, d), 2.30 (1H, m), 2.20 (3H, s), 2.10 (3H, s), 1.65 (3H, t), 1.05 (6H, d).

LRMS (thermospray) : m/z [MH⁺] 747.

10

PREPARATION 27

(2R,3R,4R,5R)-4-(Acetyloxy)-2-[6-[(2,2-diphenylethyl)amino]-2-[(1-piperidinyl)ethyl]amino]carbonyl-9H-purin-9-yl]-5-(2-ethyl-2H-tetrazol-5-yl)tetrahydro-3-furanyl acetate



15

A suspension of 6-[(2,2-diphenylethyl)amino]-N-[2-(1-piperidinyl)ethyl]-9H-purine-2-carboxamide (Preparation 11) (0.2 g, 0.42 mmol) in 1,1,1-trichloroethane (10 ml) was treated with *N,O*-bis(trimethylsilyl)acetamide) (0.65 ml, 2.65 mmol) and the mixture was heated under reflux for 2 hours. The solvent was removed under reduced pressure and the residue was twice azeotroped with toluene. The residue was dissolved in toluene (5 ml) and treated sequentially with a solution of

20

370
214

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

2020

Bogotá, D.C, 11 de Febrero de 2011

Abogado
CARLOS OLARTE

ASUNTO

Radicación 07 070 607
Trámite 011
Evento 3798
Actuación 411
Oficio
Folios 8

05146

Patente de Invención

☒

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Via Nacional

☐

Via PCT (fase nacional)

☐

Cap. I

☒

Cap. II

☐

No. Solicitud Internacional PCT/EP2006/000217

Fecha de Presentación Internacional 12/Enero/2006

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios 150 a 336 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 337 a 360 como se radicó inicialmente

Prioridad: 0500785.1 de 14 de Enero de 2005.

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

Título de la solicitud: "Derivados de purina que actúan como antagonistas del receptor α_2 ".

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de sintetizar compuestos derivados de purina útiles para el tratamiento de las condiciones mediadas por activación del receptor A2 de adenosina

Expediente 07 070 607

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona, un compuesto de formula I y el proceso mediante el cual se obtiene, así como sus intermediarios de síntesis.

Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 61P11/08 , A 61 K 3 1/52 , CO7D473/00.

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

El uso de las reivindicaciones 11-12 no es patentable de acuerdo con los Art citados.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1-6 no son concisas ya que los radicales R1- R6 no se encuentran claramente definidos, abarcando de la forma presentada géneros funcionales sin definir la clase de grupos que fueron objeto de sustento en la descripción.

Las reivindicaciones 9 y 10 no son claras ya que hacen referencia a ejemplos dentro de la descripción, el compuesto debe ser caracterizado por su estructura.

La reivindicación 13 no es clara ya que en ella se esta reivindicando un método de preparación de un compuesto I, pero aunque lo presenta como una secuencia lógica de pasos no define las condiciones ni reactivos necesarios para realizar las diferentes reacciones en los pasos A,B,C, D, E. F. G. H. I, Se sugiere reemplazarlo por las características esenciales del método que contribuyen a sintetizar el compuesto de formula I y sus intermediarios de síntesis.

Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la

Fecha de Presentación Internacional: Diciembre 21 de 2005

y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO02/22630	Purine derivatives	21/marzo/2002

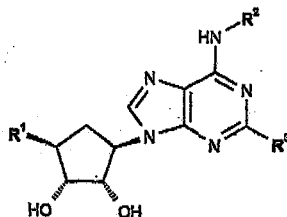
El documento D1 divulga (pagina 1, 96 y 97) Compuestos derivados de la purina y su proceso para la preparación de los compuestos y sus intermediarios, donde el derivado de purina, es agonistas del receptor A2 usados como antiinflamatorio. Los derivados de purina, son compuestos del tipo heteroariltetrahidrofuranyl purina

12. Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

Expediente 07 070 607

La reivindicación 1 consiste en un compuesto formula I caracterizado, que tiene R1 que consiste en un heterociclo, R2 que consiste en un alquilo o alquenilo y un R3 que consiste en un alquilo, alquenilo, amino-carbonilo, heterociclo o carbociclo.



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

Características esenciales	D1
Un compuesto formula I caracterizado que tiene R1 que consiste en: • un heterociclo	-
Un compuesto formula I caracterizado que tiene R2 que consiste en: • Alquilo opcionalmente sustituido	-
Un compuesto formula I caracterizado que tiene R3 que consiste en: • Hidrógeno • Alquenil • Alquinil • amino sustituido • aminocarbonil opcionalmente sustituido • heterocíclicos	-

Comparando las características esenciales de la reivindicación 1 con lo divulgado en el documento D1 se considera novedosa por cuanto los radicales correspondientes a R1,R2 y R3 no habían sido descritos en dicho documento D1.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga compuestos derivados de la purina y su proceso para la preparación de los compuestos ,donde los derivados de purina, son compuestos del tipo heteroariltetrahidrofuranil purina

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el compuesto de D1 consiste en que el derivado de purina tiene un grupo ciclopentano hidroxilado y se incluyen allí los radicales 1 ,2 y 3 para obtener el compuesto de la reivindicacion 1.

El efecto técnico que logra el incluir los radicales R1, R2 y R3 dentro de la estructura del compuesto de la reivindicacion 1, es que se consiguen compuestos útiles para tratar las condiciones mediadas por activación del receptor A2.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular cómo modificar el compuesto conocido en D1 para obtener compuestos compuestos útiles para tratar las condiciones mediadas por activación del receptor A2.

No existe indicación en el Estado de la Técnica de que a través de la introducción de los radicales R1, R2 y R3. Para obtener los compuestos tipo I dentro de su estructura, se obtengan compuestos útiles para tratar las condiciones mediadas por activación del receptor A2

377 373

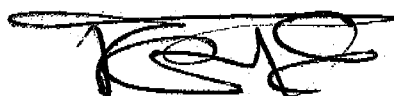
De manera que el Estado de la Técnica no sugiere al Experto en la Materia la forma en que se resuelve el problema en esta reivindicación. Por lo cual no se considera obvia

7. Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16),), y con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

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 60 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.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
_____ 17 8 MAR 2001

CONCEPTO TÉCNICO No.496	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202099
-----------------------------------	---