

182
179

CAVELIER
ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier-abogados.com
E-MAIL: cavelier@colomsat.net.co

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

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

TRAMITE:02 - EVENTO:01 - ACTUACION:08

Referencia : Expediente No. 00.001.265
Solicitante : **BASF AKTIENGESSELLSCHAFT**
Asunto : Solicitud de patente para: **COMPUESTOS
DE TRIAZOL Y SU UTILIZACION**
Fecha de la solicitud : 12 de enero de 2000

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al auto número 0040, notificado por estado del 27 de enero de 2000. Para atender a la providencia anterior solicité un plazo por medio de mi memorial número 00001265 00000001 radicado el 08 de marzo de 2000.

2. Mediante el auto número 0040 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por ese Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. En la descripción. Se dice por parte de su Despacho que se debe corregir la forma de indicar y separar los sustituyentes. Por esta razón presento junto con este escrito nuevas páginas 3, 4 y 5, correspondientes a la

descripción, en donde se han hecho modificaciones a los signos de puntuación para hacer más claro cada uno de los sustituyentes. Entonces, por ejemplo, expresiones tales como:

"R¹ representa H, alquilo C₁-C₆, sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC₁-C₆, halógeno o fenilo, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;"

Se han modificado por:

"R¹ representa H, alquilo C₁-C₆ sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC₁-C₆, halógeno o fenilo; cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;"

Como se puede ver la coma que aparecía antes de la expresión "opcionalmente sustituido" ha desaparecido con el fin de mostrar, más claramente, que la dicha expresión hace referencia al "alquilo C₁-C₆" y no al "R¹". Además, luego de la expresión "halógeno o fenilo" se ha cambiado la coma (",") por punto y coma (";") para mostrar más claramente que los opcionales sustituyentes del "alquilo C₁-C₆" terminan en ese punto y coma (";") y, por lo tanto, el "cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo", son nuevas definiciones de "R¹" y no opcionales sustituyentes de "alquilo C₁-C₆". De manera análoga se ha procedido a lo largo del texto con el fin de aclarar más los respectivos sustituyentes.

2.2. En las reivindicaciones. Presento junto con este escrito nuevo capítulo reivindicatorio en el cual se han atendido todos los requerimientos planteados por ese Despacho y se han hecho similares precisiones que en la descripción en cuanto a la forma de separar los sustituyentes.

En cuanto a la reivindicación 5, le ruego por favor que note que esta reivindicación no menciona el sustituyente "OH" para R². En la reivindicación 5, R² se define como un

resto aromático que no está sustituido o que tiene uno o dos sustituyentes. Estos sustituyentes se seleccionan entre otros de "OH". De acuerdo con la reivindicación 1, R2 puede ser un resto aromático. Este resto aromático puede tener uno o dos sustituyentes. De cualquier forma se ha advertido que dicho radical "OH" no se menciona en la reivindicación 1 como eventual sustituyente para el dicho resto aromático y por lo tanto se ha eliminado de la reivindicación 5.

En cuando a la reivindicación 8 en referencia a los radicales R⁶ y R⁷, el radical "alquiltio C₁-C₆-alquilo" se ha eliminado con el fin de hacer acorde la reivindicación 8 con la 1.

Con relación a la reivindicación 9, le rogamos que note que el "CF₃" es un alquilo que contiene halógeno. De acuerdo con la definición en la reivindicación 1, R₆ y R₇ pueden ser entre otros alquilo C₁-C₆ que puede ser sustituido por halógeno, es decir, que puede ser un alquilo que contiene halógeno tal como CF₃. Por lo tanto, la definición de R⁶ y R⁷ en la reivindicación 9 está de conformidad con la definición de R⁶ y R⁷ en la reivindicación 1.

Con relación al método que se anunciaba en la reivindicación 5, este correspondía a un error de transcripción. Por lo tanto dicha reivindicación se ha corregido y corresponde en el nuevo capítulo reivindicatorio a una reivindicación de compuesto. De esta manera se ha atendido su requerimiento.

En referencia a la reivindicación 11, originalmente de uso, se ha modificado de acuerdo con su solicitud.

Finalmente se presentan nuevas fórmulas a y b las cuales presentaban errores.

185
182

2.3. Extracto. Adjunto a este memorial presento nuevo extracto y nueva tarjeta temática (Formas P-103 y P-104), los cuales están en conformidad con las modificaciones hechas al pliego reivindicatorio. Igualmente presento nuevo formato de solicitud de patente (forma P-102) en el cual se ha corregido un error en las direcciones de los inventores).

2.4. Arte Final. Adjunto a este memorial presento los artes finales de acuerdo con lo requerido.

2.5. Copia Certificada. La copia certificada No. 199 00 811.6 del 12 de enero de 1999 se presentó, junto con su traducción, con el memorial 00001265 00000002 del 07 de abril de 2000.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por ese Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, 18 ABR 2000
Señora Jefe,



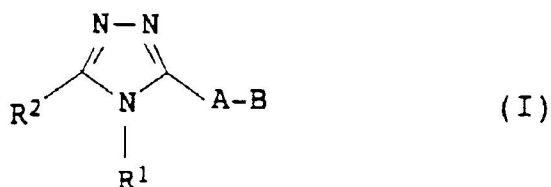
EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 00361-801-173-2
RCB-2336

pero no sus efectos colaterales neurológicos transmitidos por los receptores D_2 de la dopamina (P. Sokoloff y col., "Localization and Function of the D_3 Dopamine Receptor", *Arzneim. Forsch./Drug Res.* 42(1), 224 (1992); P. Sokoloff y col., "Molecular Cloning and Characterization of a Novel Dopamine Receptor (D_3) as a Target for Neuroleptics", *Nature* 347, 146 (1990)).

Sorprendentemente se halló ahora que determinados compuestos de triazol presentan una gran afinidad por el receptor D_3 de la dopamina y una reducida afinidad por el receptor D_2 . Se trata por lo tanto de ligando selectivos con respecto a D_3 .

Objeto de la presente invención son por lo tanto los compuestos de la Fórmula general I:



en donde:

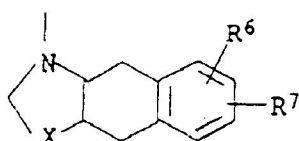
- R^1 representa H, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC_1-C_6 , halógeno o fenilo; cicloalquilo C_3-C_6 o fenilo;
- R^2 representa H, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC_1-C_6 , halógeno o fenilo; alcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , alquencilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 ,

cicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, CN, $COOR^3$, $CONR^3R^4$, NR^3R^4 , SO_2R^3 , $SO_2NR^3R^4$, o un resto aromático seleccionado entre fenilo, naftilo y un resto heterocíclico de 5 o 6 miembros con 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados independientemente uno de otro entre O, N y S; pudiendo presentar el resto aromático uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro entre alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC_1-C_6 , halógeno o fenilo; alcoxi C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, CN, COR^3 , NR^3R^4 , NO_2 , SO_2R^3 , $SO_2NR^3R^4$ y fenilo sustituido opcionalmente por uno o dos restos seleccionados independientemente uno de otro entre alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , NR^3R^4 , CN, CF_3 , CHF_2 o halógeno;

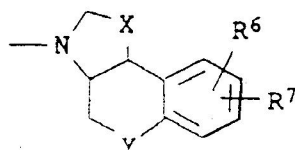
R^3 y R^4 representan independientemente uno de otro H, alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente por OH, alquilo OC_1-C_6 , halógeno o fenilo; o fenilo;

A representa alquileno C_4-C_{10} o alquileno C_3-C_{10} , que comprende por lo menos un grupo Z, seleccionado entre O, S, $CONR^3$, COO, CO, cicloalquilo C_3-C_6 y un enlace doble o triple;

B significa un resto de las Fórmulas (a) o (b) siguientes:



(a)



(b)

en donde:

X representa CH_2 o CH_2CH_2 ;

Y representa CH_2 ó O;

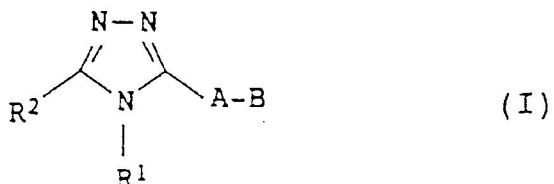
R^6 , y R^7 son seleccionados independientemente uno de otro entre H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, opcionalmente sustituido por halógeno; OH, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, halógeno, CN, NO_2 , SO_2R^3 , $\text{SO}_2\text{NR}^3\text{R}^4$, CONR^3R^4 , NHSO_2R^3 y NR^3R^4 ;

así como también sus sales con ácidos fisiológicamente compatibles.

Los compuestos de acuerdo con la invención son ligandos selectivos de los receptores D_3 de la dopamina que atacan en forma regioselectiva el sistema límbico y debido a su reducida afinidad con respecto al receptor D_2 tienen menos efectos colaterales que los neurolépticos clásicos, que son antagonistas de los receptores D_2 . Los compuestos se pueden usar por lo tanto para el tratamiento de enfermedades que responden a los ligandos de la dopamina D_3 , es decir, son útiles para el tratamiento de enfermedades en las cuales una

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de triazol de la Fórmula general I:

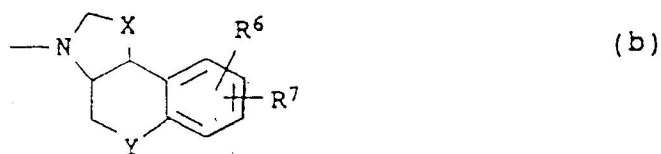
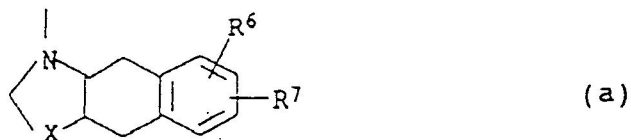


en donde

- R^1 representa H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, sustituido opcionalmente por OH, alquilo $\text{OC}_1\text{-C}_6$, halógeno o fenilo; cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ o fenilo;
- R^2 representa H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ sustituido opcionalmente por OH, alquilo $\text{OC}_1\text{-C}_6$, halógeno o fenilo; alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquiltio $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, halógeno, CN, COOR^3 , CONR^3R^4 , NR^3R^4 , SO_2R^3 , $\text{SO}_2\text{NR}^3\text{R}^4$, o un resto aromático seleccionado entre fenilo, naftilo y un resto heterocíclico de 5 o 6 miembros con 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados independientemente uno de otro entre O, N y S; pudiendo presentar el resto aromático uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro entre alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ sustituido opcionalmente por OH, alquilo $\text{OC}_1\text{-C}_6$, halógeno o fenilo; alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, halógeno, CN, COR^3 , NR^3R^4 , NO_2 , SO_2R^3 , $\text{SO}_2\text{NR}^3\text{R}^4$ y fenilo sustituido opcionalmente por uno o dos restos seleccionados independientemente uno de otro entre alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, NR^3R^4 , CN, CF_3 , CHF_2 o halógeno;
- R^3 y R^4 representan independientemente uno de otro H, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ sustituido opcionalmente por OH, alquilo $\text{OC}_1\text{-C}_6$, halógeno o fenilo; o fenilo;

A representa alquileno C_4-C_{10} o alquileno C_3-C_{10} , que comprende por lo menos un grupo Z, seleccionado entre O, S, $CONR^3$, COO , CO , cicloalquilo C_3-C_6 y un enlace doble o triple;

B significa un resto de las Fórmulas (a) o (b) siguientes:



X representa CH_2 o CH_2CH_2 ;

Y representa CH_2 u O;

R^6 y R^7 son seleccionados independientemente uno de otro entre H, alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido por halógeno; OH, alcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , halógeno, CN, NO_2 , SO_2R^3 , $SO_2NR^3R^4$ y $CONR^3R^4$;

Así como también sus sales con ácidos fisiológicamente compatibles.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 de la Fórmula I, en donde X y/o Y representan $-CH_2-$.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 de la Fórmula I, en donde A representa alquileno C_4-C_{10} o alquileno C_3-C_{10} , que comprende por lo menos un grupo Z, seleccionado entre O, S, COO , CO , un enlace doble o triple y cicloalquilo C_3-C_6 .

4. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes de la Fórmula I, en donde A representa alquileno C_4-

C₁₀ o alquileo C₃-C₁₀ que comprende por lo menos un grupo Z, seleccionado entre O, S, un enlace doble y ciclohexilo.

5. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes de la Fórmula I, en donde R² representa un resto aromático no sustituido o que presenta uno o dos sustituyentes, seleccionados independientemente entre alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo, CN y halógeno.
6. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes de la Fórmula I, en donde R² representa H, alquilo C₁-C₆, fenilo, tienilo, furanilo, piridilo, pirrolilo, tiazolilo o pirazinilo.
7. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes de la Fórmula I, en donde R¹ representa H, alquilo C₁-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆.
8. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones precedentes de la Fórmula I, en donde R⁶ y R⁷ independientemente uno de otro son seleccionados entre H, alquilo C₁-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, halógeno, CN, NO₂, SO₂R³, SO₂NR³R⁴ y CONR³R⁴.
9. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 de la Fórmula I, en donde:

R ¹	representa H, alquilo C ₁ -C ₆ o fenilo,
R ²	representa H, alquilo C ₁ -C ₆ , fenilo, tienilo, furanilo, tetrazolilo, pirrolilo, tiazolilo o pirazinilo,
A	representa alquileo -SC ₃ -C ₁₀ , que puede comprender

opcionalmente un enlace doble, y
 R^6 y R^7 son seleccionados entre H, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 ,
halógeno, $SO_2NR^3R^4$, CN, NO_2 y CF_3 .

10. Producto farmacéutico que contiene por lo menos un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 9, opcionalmente junto con vehículos y/o sustancias auxiliares fisiológicamente aceptables.

11. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 9 utilizados para la preparación de un producto farmacéutico para el tratamiento de enfermedades que responden a la acción de los agonistas y/o antagonistas de los receptores D_3 de dopamina.

COLO 00361 801 173-2
RCB/jag.
2292.

190 1910



SOLICITUD DE
PATENTE DE
INVENCION
TRAMITE: 02 EVENTO: 01 ACTUACION: 01

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

No.de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

Alemania

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad

67056 Ludwigshafen

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

EMILIO FERRERO

Dirección y Domicilio

Carrera 4 No. 72-35 Piso 4o.

Ciudad

BOGOTA, COLOMBIA

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

- 1- Dr.Dorothea STARCK
2- Dr. Hans Jörg TREIBER
3- Dr. Liliane UNGER
4- Dr. Barbara NEUMANN-SCHULTZ
5- Dr. Kai BLUMBACH
6- Dr. Dietmar SCHÖBEL

Identificación

Dirección

Ciudad

- 1 -Kaiser-Wilhelm-Str.31, 67059 Ludwigshafen
2 -Sperberweg 1, 68782 Brühl, Alemania.
3 -Wollstr. 129. 67065 Ludwigshafen.
4 -Rheingastr. 42, 68526 Ladenburg, Alemania
5 -Katharinenberg 26, 97337 Dettelbach, alemania..
6 -Weißbuchenweg 9, 68167 Mannheim, alemania

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

COMPUESTOS DE TRIAZOL Y SU UTILIZACION

PRIORIDAD REIVENDICADA SI ☐ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☐

(33) País
DE.

Fecha
12 de Enero de 1999

No. Solicitud
19900811.6

Convención de París.

Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud
Colo: 0361-801-173-2
RCB/mrm-Id-2241

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

FORMATO DE DIGITALIZACION **RELACION DE ANEXOS**



191

Expediente No		No de Folio	
Item		No de unidades	
1	CD	00001265	
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: *Arte Final*

Auto fund
Exp. # 00.001.265
Bank No.

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

2002-03-
372

Folio 200

Radicación no 00-1265

Concepto Técnico no 329

Clasificación Internacional de Patentes A61K 31/41 // 31/419

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI ☒ NO ☐ Contiene un resumen de la invención (Art.26-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción de la invención (Art.26-b).
- SI ☒ NO ☐ NO ES APLICABLE ☐ Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-l).
- SI ☐ NO ☒ La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-j).
- SI ☒ NO ☐ La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI ☒ NO ☐ **CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☐ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

1. Anexa nuevas páginas 3, 4 y 5 (folios 186 a 188) en donde se han hecho modificaciones a los signos de puntuación de los sustituyentes.
2. Anexa nuevo capítulo reivindicatorio (folios 189 a 192) con las correcciones sugeridas en el 1er examen de forma.
3. Adjunta nuevo extracto para publicación (folio 195), tarjeta temática (folios 193 y 194), nuevo formato de solicitud de patente (196) en el cual se corrigen las direcciones de los inventores y arte final (folio 197).
4. Se sugiere nueva IPC A61K 31/41 // 31/4196.

EXAMINADOR TÉCNICO

202039

Bogotá D. C., 6 marzo /02



193

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Folio 201

2002-04-29
46

2020
Bogotá, D.C.

Doctor(a)
EMILIO FERRERO
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación No.	00-1265
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	466
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la comunidad andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase

Dado en Bogotá, D.C., a los **08 MAR. 2002**

ALIX CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, D.C., **13-07-04** El extracto de esta solicitud fue publicado en el número **515** de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha **29-04-02**. El término hábil señalado por la ley expiró el **29-07-02** y SI ☐ NO ☒ se presentaron oposiciones por parte de terceros.

202039

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 382 2695
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia