

334

glt

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00032520 00000004 Folios: 19
Fecha (AMU): 2005-08-19 17:05:57
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 RESPUESTA
Dependencia: 2004 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S.

Re: Expediente No. 00.032.520

Solicitud de patente titulada: "COMPUESTOS DE BENZOLACTAMA
SUSTITUIDOS"

Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC.

RESPUESTA AL OFICIO No. 12573 NOTIFICADO POR FIJACION EN LISTA No. 134,
DE FECHA 14 DE ABRIL DE 2005, (EXAMEN DE FONDO).

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del término de prórroga solicitado en mi memorial de fecha 6 de Julio de 2005:

1. a- El Examinador objeta las Reivindicaciones 1, 5, 7 y 9 con base el artículo 20d de la decisión 486, el cual establece que no serán patentables: "los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales."

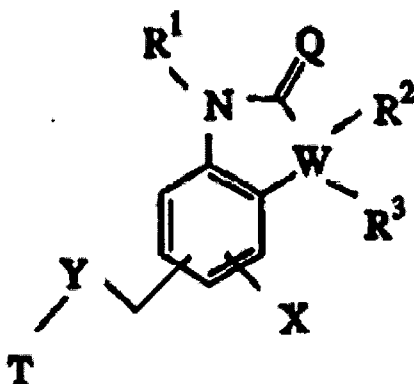
b- Me permito **DESISTIR** de las Reivindicaciones 1, 5, 7 y 9, con el propósito de superar la objeción del Examinador. En consecuencia, adjunto un Capítulo Reivindicatorio Modificado, al igual que el recibo de pago correspondiente a la tasa de modificación de la solicitud en trámite.

335. *[Handwritten signature]*
[Handwritten signature]

De ese modo, el nuevo capítulo Reivindicatorio es el siguiente:

Capítulo Reivindicatorio Anterior.	Capítulo Reivindicatorio Modificado.
Reivindicación 1	DESISTIDA
Reivindicación 2	Reivindicación 1
Reivindicación 3	Reivindicación 2
Reivindicación 4	Reivindicación 3
Reivindicación 5	DESISTIDA
Reivindicación 6	Reivindicación 4
Reivindicación 7	DESISTIDA
Reivindicación 8	Reivindicación 5
Reivindicación 9	DESISTIDA
Reivindicación 10	Reivindicación 6
Reivindicación 11	Reivindicación 7
Reivindicación 12	Reivindicación 8

2. a- El Examinador cita el documento WO9703066 como arte previo que afecta la novedad de la presente invención. El Examinador señala que, “*La publicación WO9703066 se relaciona con compuestos de benzolactama sustituidos de formula (I), cuyos sustituyentes se revelan en la descripción y son antagonistas de la sustancia P, que son útiles en desordenes del SNC.*”. De acuerdo con el Examinador, “*Comparando elemento por elemento, los compuestos y las composiciones de las reivindicaciones 1-12 son iguales a los de los documentos citados y pueden afectar la novedad de la presente solicitud*”.



Formula (I)
WO9703066

336 B-344

3. Respetuosamente me permito manifestar mi desacuerdo con el Examinador, con base en los siguientes argumentos:

a- Como ilustran las tablas a continuación, la Reivindicación 1 (antes Reivindicación 2) se refiere a compuestos de formula (I) donde los radicales Y, T, R2 y R3 hacen que los compuestos descritos por la presente invención sean diferentes a los compuestos descritos por la anterioridad WO9703066.

Radical "Y"	
Presente invención	WO9703066
<u>Y es -NH-</u> <u>Es decir, R-NH-R'</u>	<u>Y es imino</u> <u>Es decir R-C(=NH)-R o R-C(-H)=N-R</u>

Las formas amino e imino difieren por un cambio espontáneo de un protón entre el N y el C adyacente; por tanto, aunque la formula molecular es la misma, la configuración de los enlaces entre los átomos es diferente. Consecuentemente, estas diferencias hacen que toda la estructura sea diferente, incluso en los casos en que hay coincidencias en otros sustituyentes.

De cualquier manera, en las siguientes dos tablas mostramos otras diferencias que existen entre la presente invención y el estado del arte, pero de igual forma, hay que tener en cuenta que con la diferencia en la configuración de los enlaces del amino de la presente invención en "Y" y el imino en la misma posición en la anterioridad citada, ya no existe posible coincidencia entre las dos fórmulas Markush.

Radical "T"	
Presente invención	WO9703066
T es (2S, 3S)-2-difenilmetilquinuclidin-3-ilo, (2S,3S)-2-difenilmetil-1- azanorbornan-3-ilo; o (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo, <u>estando el grupo fenilo de dicho (2S, 3S) 2-fenilpiperidin -3-ilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, preferiblemente de cero a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C1-C6) opcionalmente sustituido con de uno a siete átomos de fluor, alcoxi-(C1-C6) opcionalmente sustituido con de uno a siete átomos de fluor, amino, ciano, nitro, alquil (C1-C6)-amino y di [alquil (C1-C6)] amino</u>	T es (2S, 3S)-2-difenilmetilquinuclidin-3-ilo, (2S,3S)-2-difenilmetil-1- azanorbornan-3-ilo; o (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo

Las características señaladas arriba (subrayadas y en cursiva) harían que los compuestos de la presente invención fueran diferentes a aquellos revelados por WO9703066. Aunque es claro que estas sustituciones son opcionales, todos los compuestos que las exhibieran serían nuevos a la luz de lo revelado por WO9703066.

337 795

Radicales R2 y R3	
Presente invención	WO9703066
R1, R2 y R3 son independientemente hidrogeno, alquilo C1-C3, alcoxi C1-C3-alquilo C1-C3 o halo-alquilo C1-C3, con la condición de que cuando W es metileno, ni R2 ni R3 sean hidrogeno; <i>o uno R2 o R3 puede ser hidroxí</i>	R1, R2 y R3 son independientemente hidrogeno, alquilo C1-C3, alcoxi C1-C3-alquilo C1-C3 o halo-alquilo C1-C3, con la condición de que cuando W es metileno, R2 y R3 no son hidrogeno;

Siempre que R2 o R3 sean hidroxí, el compuesto resultante será diferente a cualquiera otro revelado por WO9703066.

Todo lo anterior aplica también para la Reivindicación 4 (antes Reivindicación 6), la cual describe “Una composiciones farmacéutica (...) que comprenden una cantidad de un compuesto de fórmula I, o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo (...) y un vehículo farmacéuticamente aceptable”.

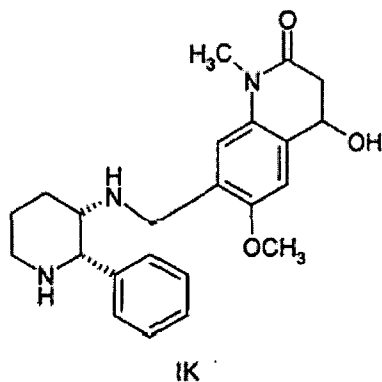
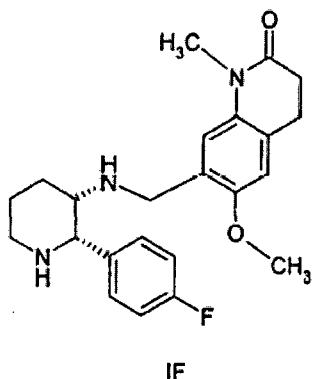
b- Usando el mismo análisis para la Reivindicación 2 (antes Reivindicación 3), es aun más evidente la diferencia que hay entre los compuestos revelados por la presente invención y la anterioridad WO9703066, ya que el radical “Y” sólo puede ser -NH- (y no oxi):

Radical “Y”	
Presente invención	WO9703066
<i>Y es -NH-</i> <i>Es decir, R-NH-R’</i>	<i>Y es imino</i> <i>Es decir R-C(=NH)-R o R-C(-H)=N-R</i>

Esto es cierto tambien para las Reivindicaciones 5 y 6 (antes Reivindicaciones 8 y 10) las cuales se refieren a composiciones farmacéuticas que comprenden una cantidad de un compuesto de acuerdo a la Reivindicación 2 (antes Reivindicación 3) y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

c- Adicionalmente, la Reivindicación 3 (antes Reivindicación 4) revela modalidades preferidas de la Reivindicación 2 (antes Reivindicación 3), donde se describen compuestos que no habían sido revelados previamente por el documento WO9703066. Por ejemplo, el compuesto descrito como **IF** exhibe un radical “T” que corresponde a un (2S, 3S) 2-fenilpiperidin -3-ilo sustituido con fluor, mientras que en el compuesto denominado **IK**, el radical R2 (o el radical R3) es hidroxí.

Estas representaciones de los radicales "T", R2 y R3 de la presente invención, no habían sido descritas de esta manera en la anterioridad WO9703066.



Finalmente, las Reivindicaciones 7 y 8 (antes Reivindicaciones 11 y 12) describen compuestos de formula I', los cuales no están incluidos en los compuestos descritos por WO9703066. En efecto, las Reivindicaciones 7 y 8 de la presente invención describen compuestos donde el grupo -C-Y-T (de la formula I) representa -CHO y no hay manera de que la anterioridad WO9703066 incluya este tipo de compuestos (considerando que el radical "T" siempre está presente en la formula I revelada por WO9703066 y que el significado de "T" en esta anterioridad sólo puede ser (2S, 3S)-2-difenilmetilquinuclidin-3-ilo, (2S,3S)-2-difenilmetil-1-azanorbornan-3-ilo; o (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo).

Formula (I) WO9703066	Formula I' Presente invención
Y es, imino o es oxi T es, (2S, 3S)-2-difenilmetilquinuclidin-3-ilo, (2S,3S)-2-difenil metil-1- azanorbornan-3-ilo; o (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo).	Descrita en las Reivindicaciones 7 y 8.

d- El Artículo 16 de la Decisión 486 claramente establece que, "una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica". Para argumentar en contra de la novedad de la presente invención, es necesario señalar un documento del estado de la técnica que revele exactamente la misma materia revelada por la presente invención.

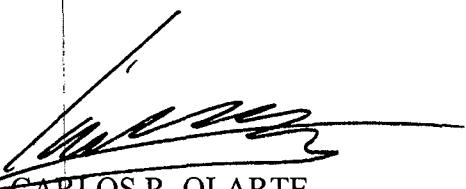
339 6 JTA

Por su parte, El Tribunal Andino de Justicia ha establecido que para afectar la novedad, cualquier divulgación previa “Esta divulgación debe ser detallada y, en todo caso, suficiente para que una persona del oficio pueda utilizar esa información para ejecutar o explotar la invención.”¹

Es decir, para que la novedad de una invención se desvirtúe, no sólo debe existir una divulgación anterior a la fecha de presentación de la solicitud (o de su prioridad reclamada) sino que también dicha divulgación debe ser detallada de tal forma que una persona medianamente versada en el arte pueda reproducirla y explotarla de la manera en que fue divulgada, y que dicha divulgación comprenda la invención a la cual se le pretende desvirtuar su novedad en su totalidad.

4. Con lo anterior, considero se han resuelto las objeciones presentadas por el Examinador y se ha demostrado que **los compuestos y composiciones reveladas por la presente invención son novedosos**. Sin embargo, si el Examinador considera que existen nuevas objeciones o continúan algunas pendientes, le ruego emita un segundo examen de fondo con el fin de permitir al solicitante proporcionar una mayor aclaración.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexos: Capítulo Reivindicatorio Modificado.
Recibo de Pago.

¹ Proceso 6-IP-89 (G. O. N° 50 de 17 de Nov. de 1989).

340

[Handwritten signature]

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00002520 00000004
Fecha (RAD): 2005-08-19 17:05:57
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REMUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 19

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 05 - 62,551
FECHA : AGOSTO 19 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEGR	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	27552608	19/08/2005	25,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	25,000.00
		TOTAL :	\$ 25,000.00

SON: VEINTICINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

341

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Adicacion: 00032520 00000000
Fecha (ARO): 2005-08-19 17:05:57 Folios: 19
Ramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REMUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 58,053
FECHA : AGOSTO 4 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEGR	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	36579837	03/08/2005	2,341,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08	PRORROGA DE TERMINOS	31 PRORROGA DE TERMINOS
			66,000.00
		TOTAL :	\$ 66,000.00

SON: SESENTA Y SEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

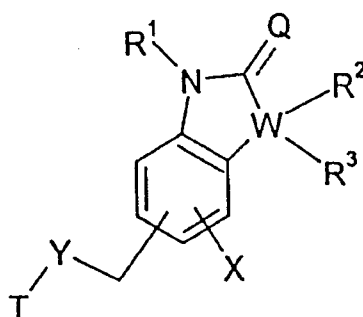
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición farmacéutica para el tratamiento
de un trastorno o afección seleccionado entre distimia,
trastorno depresivo mayor, depresión pediátrica, trastorno
de ansiedad generalizada, trastorno obsesivo-compulsivo,
trastorno de pánico, fobias tales como fobia social y
10 agorafobia; trastorno de estrés post-traumático, trastorno
de personalidad límite, dolor agudo, dolor crónico, migraña,
angiogénesis, quemaduras solares, incontinencia urinaria,
trastornos inflamatorios tales como artritis reumatoide,
osteoartritis, psoriasis y asma; emesis, incluyendo emesis
15 aguda, retardada y anticipada en la que el estado o el agente
emético es quimioterapia, radiación, cirugía, movimiento,
migraña o cualquier otro estado o agente emético; trastornos
causados por *Helicobacter pylori*, trastornos
cardiovasculares, trastornos oftálmicos, inflamación del
20 tracto urinario, psicosis, esquizofrenia, trastorno de la
conducta, trastorno de comportamiento disruptivo, trastorno
bipolar, trastornos del movimiento tales como el síndrome de
Tourette, síndrome de acinesia-rigidez, trastornos del
movimiento asociados a la enfermedad de Parkinson, discinesia
25 tardía y otras discinesias; trastornos cognitivos tales como

demencia (incluyendo la demencia relacionada con la edad y la demencia senil de tipo Alzheimer) y trastornos de la memoria; trastornos de la alimentación tales como anorexia nerviosa y bulimia nerviosa, trastorno de hiperactividad con
5 déficit de atención, síndrome de fatiga crónica, eyaculación precoz, síndrome premenstrual, trastorno disfórico premenstrual, dependencias y adicciones a sustancias químicas, trastornos somáticos relacionados con el estrés, neuralgia, neuropatía periférica, enfermedad de reflujo
10 gastroesofágico, distrofia simpática refleja, tal como el síndrome de hombro/mano; trastornos de hipersensibilidad tales como hipersensibilidad a la hiedra venenosa; fibromialgia, angina, enfermedad de Reynaud, enfermedades reumáticas tales como fibrositis; eccema, rinitis, alergias,
15 neuralgia post-herpética, cistitis, enfermedad inflamatoria del intestino, síndrome del intestino irritable, colitis, trastornos fibrosantes y del colágeno tales como escleroderma y fascioliasis eosinofílica; trastornos de la circulación sanguínea debidos a vasodilatación, y trastornos relacionados
20 con la inducción o supresión inmune tales como lupus sistémico eritematoso, en un mamífero, incluyendo un ser humano, que comprende una cantidad de un compuesto de fórmula general

25



(I)

o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la que:

W es metileno, etileno, propileno, vinileno, $-\text{CH}_2-\text{O}-$, $-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{S}-$ o $-\text{S}-\text{CH}_2-$;

5 R^1 , R^2 y R^3 son independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 -alquilo C_1-C_3 o halo-alquilo C_1-C_3 , con la condición de que cuando W es metileno, ni R^2 ni R^3 sean hidrógeno;

o uno de R^2 o R^3 puede ser hidroxilo;

10 X es halo, alcoxi C_1-C_3 , alquilo C_1-C_3 , halo-alcoxi C_1-C_3 o alqueno C_1-C_3 ;

Y es $-\text{NH}-$ o $-\text{O}-$;

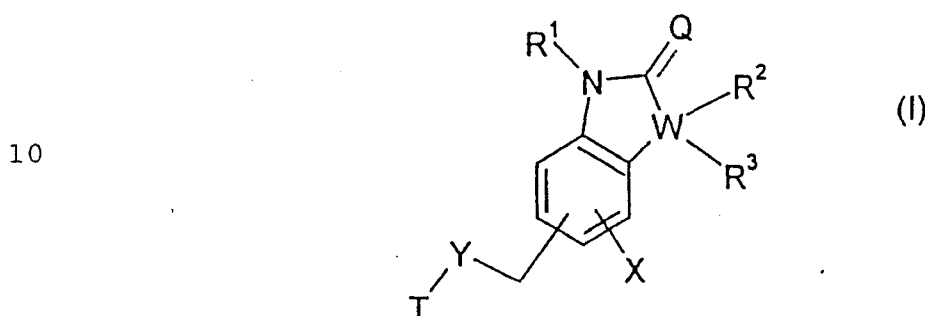
Q es oxígeno o azufre y presenta un doble enlace con el carbono al que está unido, o Q es metilo y presenta un enlace
15 sencillo con el carbono al que está unido; y

T es (2S,3S)-2-difenilmetilquinuclidin-3-ilo, (2S,3S)-2-difenilmetil-1-azanorbornan-3-ilo; o (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo, estando el grupo fenilo de dicho (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo opcionalmente sustituido con
20 uno o más sustituyentes, preferiblemente de cero a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre halo, alquilo (C_1-C_6) opcionalmente sustituido con de uno a siete átomos de flúor, alcoxi (C_1-C_6) opcionalmente sustituido con de uno a siete átomos de flúor, amino, ciano, nitro,
25 alquil (C_1-C_6)-amino y di[alquil (C_1-C_6)]amino; y

la línea de trazos representa un doble enlace opcional;
con la condición de que R¹ no puede ser (alcoxi C₁-C₃)-
CH₂- o halo-CH₂-;

o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que
5 es eficaz en el tratamiento de tal trastorno o afección, y
un vehículo farmacéuticamente aceptable.

2. Un compuesto de fórmula I



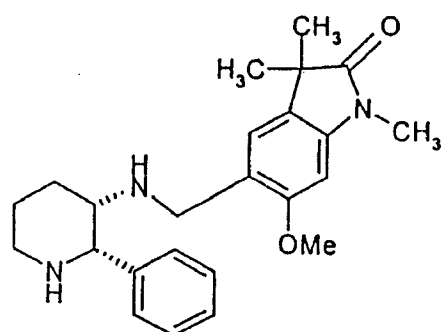
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en la
15 que Y es -NH-; T es (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo, estando
el grupo fenilo de dicho (2S,3S)-2-fenilpiperidin-3-ilo
opcionalmente sustituido con fluoro; Q es oxígeno y presenta
un doble enlace con el átomo de carbono al que está unido,
X es metoxi o etoxi, R¹ es hidrógeno, metilo o halo-alquilo
20 C₁-C₂, W es metileno, etileno o vinileno; y R² y R³ son
independientemente hidrógeno o metilo, o uno de R² o R³ puede
ser hidroxilo cuando W es etileno, tanto R² como R³ son metilo
cuando W es metileno, y tanto R² como R³ son hidrógeno cuando
W es vinileno.

25 3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2 que
se selecciona entre los siguientes compuestos y sus sales
farmacéuticamente aceptables:

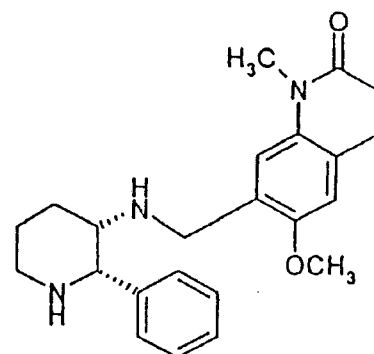
346

1354

5

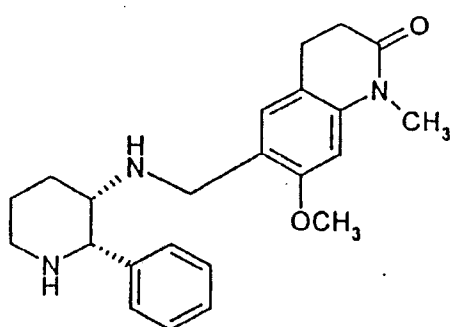


IA

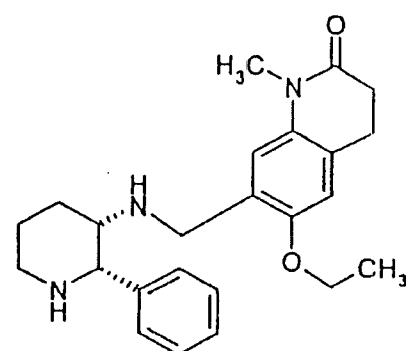


IB

10

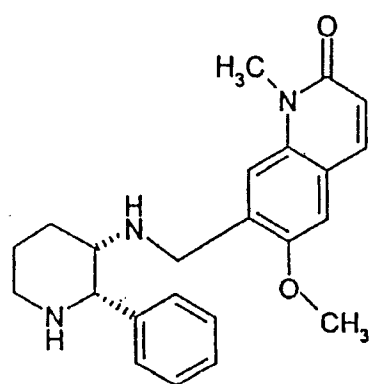


IC

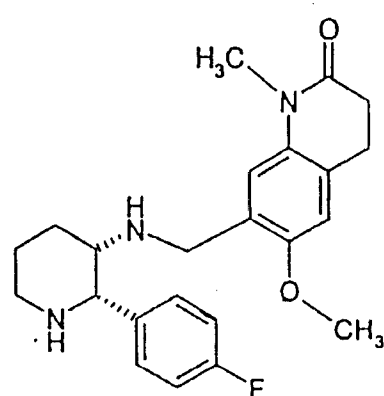


ID

15



IE



IF

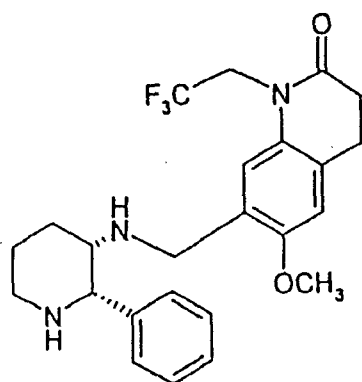
20

25

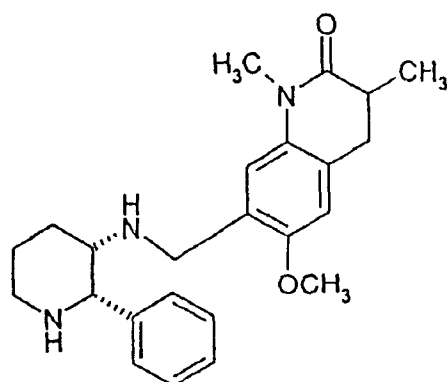
347

15/3/77

5

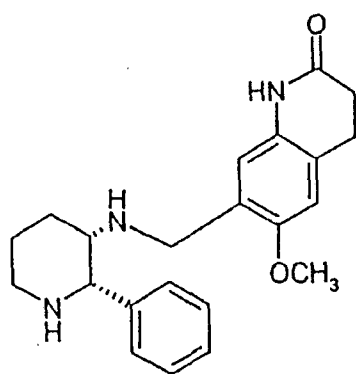


IG



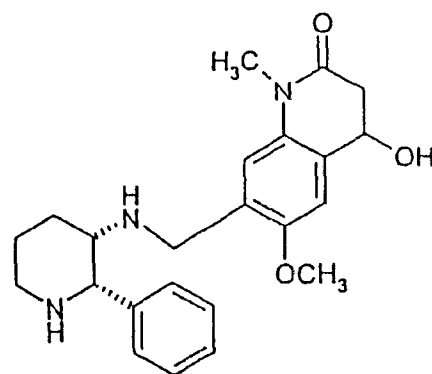
IH

10



IJ

y



IK

15

4. Una composición farmacéutica para el tratamiento de un trastorno o afección seleccionado entre distimia, trastorno depresivo mayor, depresión pediátrica, trastorno de ansiedad generalizada, trastorno obsesivo-compulsivo, 20 trastorno de pánico, fobias tales como fobia social y agorafobia; trastorno de estrés post-traumático y trastorno de personalidad límite en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto de fórmula I, o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es eficaz en el 25 tratamiento de tal trastorno o afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

igual que I

348 1855

5. Una composición farmacéutica para el tratamiento de un trastorno o afección seleccionado entre distimia, trastorno depresivo mayor, depresión pediátrica, trastorno de ansiedad generalizada, trastorno obsesivo-compulsivo, 5 trastorno de pánico, fobias tales como fobia social y agorafobia; trastorno de estrés post-traumático, trastorno de personalidad límite, dolor agudo, dolor crónico, migraña, angiogénesis, quemaduras solares, incontinencia urinaria, trastornos inflamatorios tales como artritis reumatoide, 10 osteoartritis, psoriasis y asma; emesis, incluyendo emesis aguda, retardada y anticipada en la que el estado o el agente emético es quimioterapia, radiación, cirugía, movimiento, migraña o cualquier otro estado o agente emético; trastornos causados por *Helicobacter pylori*, trastornos 15 cardiovasculares, trastornos oftálmicos, inflamación del tracto urinario, psicosis, esquizofrenia, trastorno de la conducta, trastorno de comportamiento disruptivo, trastorno bipolar, trastornos del movimiento tales como el síndrome de Tourette, síndrome de acinesia-rigidez, trastornos del 20 movimiento asociados a la enfermedad de Parkinson, discinesia tardía y otras discinesias; trastornos cognitivos tales como demencia (incluyendo la demencia relacionada con la edad y la demencia senil de tipo Alzheimer) y trastornos de la memoria; trastornos de la alimentación tales como anorexia 25 nerviosa y bulimia nerviosa, trastorno de hiperactividad con

déficit de atención, síndrome de fatiga crónica, eyaculación precoz, síndrome premenstrual, trastorno disfórico premenstrual, dependencias y adicciones a sustancias químicas, trastornos somáticos relacionados con el estrés, 5 neuralgia, neuropatía periférica, enfermedad de reflujo gastroesofágico, distrofia simpática refleja, tal como el síndrome de hombro/mano; trastornos de hipersensibilidad tales como hipersensibilidad a la hiedra venenosa; fibromialgia, angina, enfermedad de Reynaud, enfermedades 10 reumáticas tales como fibrositis; eccema, rinitis, alergias, neuralgia post-herpética, cistitis, enfermedad inflamatoria del intestino, síndrome del intestino irritable, colitis, trastornos fibrosantes y del colágeno tales como escleroderma y fascioliasis eosinofílica; trastornos de la circulación 15 sanguínea debidos a vasodilatación, y trastornos relacionados con la inducción o supresión inmune tales como lupus sistémico eritematoso, en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, que es 20 eficaz en el tratamiento de tal afección, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.

6 . Una composición farmacéutica para el tratamiento de un trastorno o afección seleccionado entre distimia, trastorno depresivo mayor, depresión pediátrica, trastorno 25 de ansiedad generalizada, trastorno obsesivo-compulsivo,

350
13788

trastorno de pánico, fobias tales como fobia social y
agorafobia; trastorno de estrés post-traumático, trastorno
de personalidad límite, dolor agudo, dolor crónico, migraña,
angiogénesis, quemaduras solares, incontinencia urinaria,
5 trastornos inflamatorios tales como artritis reumatoide,
osteoartritis, psoriasis y asma; emesis, incluyendo emesis
aguda, retardada y anticipada en la que el estado o el agente
emético es quimioterapia, radiación, cirugía, movimiento,
migraña o cualquier otro estado o agente emético; trastornos
10 causados por *Helicobacter pylori*, trastornos
cardiovasculares, trastornos oftálmicos, inflamación del
tracto urinario, psicosis, esquizofrenia, trastorno de la
conducta, trastorno de comportamiento disruptivo, trastorno
bipolar, trastornos del movimiento tales como el síndrome de
15 Tourette, síndrome de acinesia-rigidez, trastornos del
movimiento asociados a la enfermedad de Parkinson, discinesia
tardía y otras discinesias; trastornos cognitivos tales como
demencia (incluyendo la demencia relacionada con la edad y
la demencia senil de tipo Alzheimer) y trastornos de la
20 memoria; trastornos de la alimentación tales como anorexia
nerviosa y bulimia nerviosa, trastorno de hiperactividad con
déficit de atención, síndrome de fatiga crónica, eyaculación
precoz, síndrome premenstrual, trastorno disfórico
premenstrual, dependencias y adicciones a sustancias
25 químicas, trastornos somáticos relacionados con el estrés,

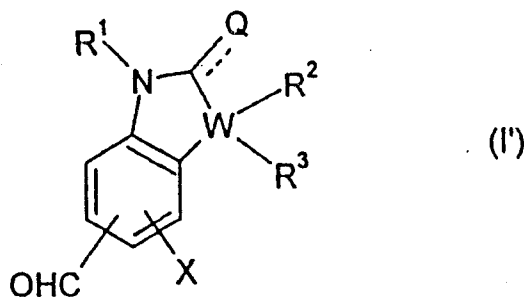
351 ~~1059~~

neuralgia, neuropatía periférica,.. enfermedad de reflujo gastroesofágico, distrofia simpática refleja, tal como el síndrome de hombro/mano; trastornos de hipersensibilidad tales como hipersensibilidad a la hiedra venenosa; 5 fibromialgia, angina, enfermedad de Reynaud, enfermedades reumáticas tales como fibrositis; eccema, rinitis, alergias, neuralgia post-herpética, cistitis, enfermedad inflamatoria del intestino, síndrome del intestino irritable, colitis, trastornos fibrosantes y del colágeno tales como escleroderma 10 y fascioliasis eosinofílica; trastornos de la circulación sanguínea debidos a vasodilatación, y trastornos relacionados con la inducción o supresión inmune tales como lupus sistémico eritematoso, en un mamífero, que comprende una cantidad de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 2, 15 o de una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable para antagonizar el receptor de la sustancia P.

1991 9'

7. Un compuesto de fórmula (I'):

20



25 en la que Q es oxígeno y presenta un doble enlace con el

352
19 7/8

átomo de carbono al que está unido, X es metoxi o etoxi, R¹ es hidrógeno, metilo o halo-alquilo C₁-C₂, W es metileno, etileno o vinileno; y R² y R³ son independientemente hidrógeno o metilo, o uno de R² o R³ puede ser hidroxilo cuando W es etileno, tanto R² como R³ son metilo cuando W es metileno, y tanto R² como R³ son hidrógeno cuando W es vinileno.

8. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 7, seleccionado entre el grupo compuesto por:

6-Metoxi-1-metil-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-7-carbaldehído;

6-Metoxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihydroquinolina-7-carbaldehído;

6-Metoxi-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-7-carbaldehído;

5-Metoxi-3,3-dimetil-2-oxo-2,3-dihydro-1H-indol-6-carbaldehído;

7-Metoxi-1-metil-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-6-carbaldehído;

6-Etoxi-1-metil-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-7-carbaldehído;

6-Metoxi-2-oxo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-7-carbaldehído; y

6-Metoxi-1,3-dimetil-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydroquinolina-7-carbaldehído.

353
961

375
2005-11-24

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

2020/
Bogotá, D.C.,

Doctor
Carlos Olarte
Apoderado

Oficio N°

10996

REFERENCIA

Radicación	00 32520
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Folios	004

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención N° 00 32520, realizado según el artículo 45 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina, se notifica:

Documentos estudiados:

- . Descripción: folios 188-230
- . Ejemplos: folios 230-295
- . Capítulo reivindicatorio estudiado: folios 350-360
- . Se reivindica prioridad presentada en Estados Unidos, el 06.05.99, bajo el número 60/132858

Objeto de la invención

Según las reivindicaciones 1 a 8 de la presente solicitud, se refiere a compuestos de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, cuyos sustituyentes se revelan en la descripción. Se describen composiciones farmacéuticas que contienen los compuestos y a métodos de tratamiento de desórdenes del SNC.

Clasificación internacional de patentes A 61 K 31/47

Claridad de la Solicitud

El art. 30 de la decisión 486 establece que *"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción"*

354 362

Teniendo en cuenta lo anterior, la materia de la reivindicación 4 es igual a la de la reivindicación 1. De igual manera la materia de la reivindicación 6 es igual a la contenida en la reivindicación 5.

Favor hacer las aclaraciones y correcciones del caso.

Determinación del estado de la técnica:

Consultadas las fuentes de información con que cuenta este despacho, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de prioridad de la presente solicitud - 06.05.99-, relacionados con la materia de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
1	WO 9703066	"Compuestos de benzolactama sustituidos como antagonistas de la sustancia P"	30.01.97

Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

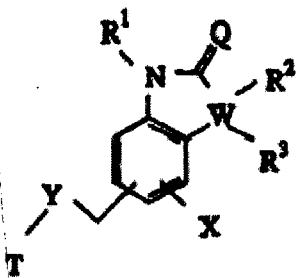
El artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina establece que: *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial"*

En cumplimiento del artículo 14 de la decisión 486 de la comisión de la comunidad andina, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

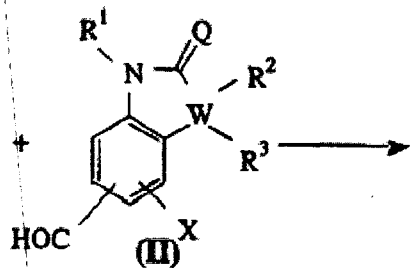
Evaluación de la NOVEDAD

El artículo 16 de la decisión 486 establece que *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica"*

La publicación WO 9703066 se relaciona con compuestos de benzolactama sustituidos de fórmula (I):



De igual manera, en la página 5, aparece el compuesto de fórmula II:



355
263

que es intermediario para sintetizar los compuestos de fórmula (I), cuyos sustituyentes se revelan en la descripción y son antagonistas de la sustancia P, que son útiles en desórdenes del SNC

Comparando elemento por elemento, el compuesto de la reivindicación 7 es igual al compuesto II del documento citado y puede afectar la novedad de la presente solicitud.

En conclusión los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
1	WO 9703066	7	Novedad

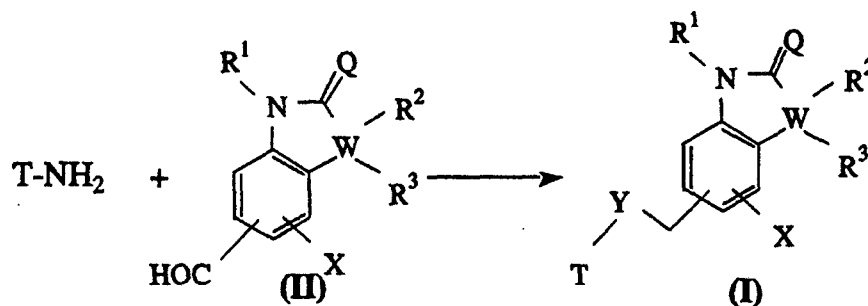
En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a 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 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001

Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 24 NOV. 2024

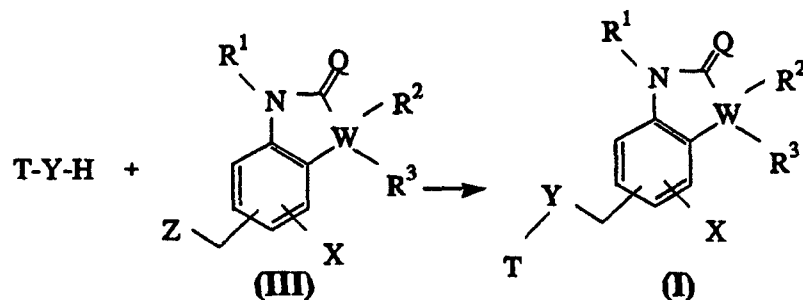
CONCEPTO TÉCNICO Número 1847	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202024
---------------------------------	-------------------------------------



Scheme A-I illustrates a method for preparing compounds of the formula (I) by reductive amination of a compound of the formula (II) with a compound of the formula: T-NH₂ (Y=NH). The reduction can be carried out by catalytic hydrogenation, or with several hydride reagents in a reaction-inert solvent. The catalytic hydrogenation may be carried out in the presence of a metal catalyst such as palladium or Raney nickel. Suitable hydride reagents include borohydrides such as sodium borohydride (NaBH₄), sodium cyanoborohydride (NaBH₃CN) and sodium triacetoxyborohydride (NaB(OAc)₃H), boranes, aluminum-based reagents and trialkylsilanes. Suitable solvents include polar solvents such as methanol, ethanol, methylene chloride, tetrahydrofuran (THF), dioxane and ethylacetate. This reaction is typically carried out at a temperature from -78°C to reflux temperature of the solvent, preferably from 0 °C to 25 °C for 5 minutes to 48 hours, preferably from 0.5 to 12 hours.

Alternatively, the compounds of the formula (I) of this invention may be prepared as shown in the following scheme A-II.

Scheme A-II



(wherein Z is a leaving group such as halo or sulfonate including tosylate or mesylate)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RADICACIÓN: 0-32520

EDICTO No. 4748

LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:

Que esta Superintendencia profirió **Resolución No. 5065 de 28-FEB-2006**. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud correspondiente a "COMPUESTOS DE BENZOLACTAMA SUSTITUIDOS".

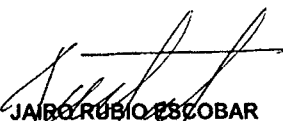
ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos Olarte García, o a quien haga sus veces, en su calidad de apoderado de Pfizer Products Inc., entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los

28 FEB. 2006

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


JAIME RUBIO ESCOBAR

Para notificar a los interesados, se fija el presente EDICTO en lugar visible al público en la SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, por el término de (10) diez días hábiles contados a partir de las 8:30 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc 22-MAR-2006
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 4748

Este edicto se desfija hoy 04-ABR-2006 a las cinco (5:00 p.m.)

