

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.-**SANOFI-SYNTHELABO.-** Solicitud de Patente de
Invencción para "**NUEVOS DERIVADOS DEL BENCENO**
QUE COMPRENDEN UNA FUNCION AMINA
SUSTITUIDA CON UN GRUPO ALQUILO Y UN GRUPO
CICLOALQUILO, UN PROCEDIMIENTO PARA SU
PREPARACION Y LAS COMPOSICIONES
FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIENEN".- Clase
A.61.-Expediente número 00-042.775.-

1. Me refiero a mi solicitud de 8 de Junio de 2000 y al auto dictado por ese Despacho notificado por Estado el 24 de Agosto del mismo año.

2. Por medio del presente atentamente manifiesto a usted que, debidamente autorizado por mi poderdante, modifíco el título de la solicitud con el objeto de dar cumplimiento a las exigencias del señor Examinador, para que quede como sigue:

**"NUEVOS DERIVADOS DEL BENCENO QUE COMPRENDEN UNA
FUNCION AMINA SUSTITUIDA CON UN GRUPO ALQUILO Y UN
GRUPO CICLOALQUILO, UN PROCEDIMIENTO PARA SU
PREPARACION Y LAS COMPOSICIONES FARMACEUTICAS QUE
LOS CONTIENEN"**

3. Anexos me permito presentar a usted:

- (1) Nuevo Resumen, Objeto y Finalidad de la Invención, **que reemplaza el originalmente presentado, el cual incluye el nuevo título de la solicitud**, el cual ha sido modificado con el fin de precisar aún más el grupo químico característico de los compuestos de la invención;
- (2) Nueva página 2 de la descripción, en la cual se ha modificado el título de la invención, como se expuso anteriormente;
- (3) Nuevas páginas 105, 106 y 107 de las reivindicaciones **que reemplazan las originalmente presentadas** bajo los mismos números en las cuales se ha modificado la reivindicación 9, con el objeto de indicar que la expresión Cy citada en dicha reivindicación 9 representa "**un grupo ciclohexilo monosustituido, disustituido, trisustituido o tetrasustituido con un grupo metilo; un grupo cicloheptilo, 4-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidrotiopiranilo o adamantilo;**".

Sobre este particular, llamo la atención del señor Examinador al hecho de que tal como se indica en el numeral c) de dicha reivindicación 9, la cetona de fórmula $\text{Cy}-\text{C}(=\text{O})$ designada como (3) corresponde a una cetona formada con el grupo de radicales indicados para R_1 en dicho numeral (c). Por consiguiente, el Señor Examinador entenderá que la expresión Cy representa los grupos indicados al inicio del numeral (c) para R_1 .

De acuerdo con lo anterior, la modificación de dicha reivindicación 9 permite aclarar al señor Examinador cual

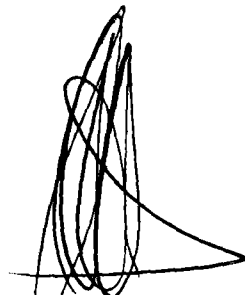
es el significado de la expresión objetada **Cy**, y la correspondiente cetona dando cumplimiento al requerimiento formulado.

- (4) En original y dos copias, una de ellas de 6cm x 6cm, Arte Final de la fórmula química I del invento, para la publicación en la Gaceta de la Propiedad Industrial; y
- (5) Nuevo extracto, en sus dos formas, **que reemplaza el originalmente presentado**, en el cual se ha incluido el nuevo título de la solicitud.

4. Llamo su atención al hecho de que la copia debidamente certificada de la primera solicitud presentada para el invento arriba nombrado **respecto de la cual reclamo prioridad**, a saber la solicitud francesa número 9907396 de 11 de Junio de 1999, junto con la traducción correspondiente a la totalidad del documento, fueron presentadas a ese Despacho mediante memorial de 4 de Agosto de 2000.

5. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. 10.784
Código 231

OBSERVACIONES: Se retiraron folios 276, 277 y 278 correspondientes a las tarjetas de propietarios, temática y el extracto para publicación. Del folio 275 se tomó ante final tamaño 6x6cm y 12x12cm.

202041

21 marzo 102

725
788

NUEVOS DERIVADOS DEL BENCENO QUE COMPRENDEN UNA FUNCION AMINA
SUSTITUIDA CON UN GRUPO ALQUILO Y UN GRUPO CICLOALQUILO, UN
PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACION Y LAS COMPOSICIONES
FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIENEN

benceno
grupo
camente
ervioso
estos
ticas y

por
se

223

Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		FORMATO DE DIGITALIZACION RELACION DE ANEXOS		ROYAL TECHNOLOGIES S.A. Barrios Unidos, Colombia	
Expediente No		No de Unidades		No de Folio	
Item					
1	CD				
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:					

Carta Final

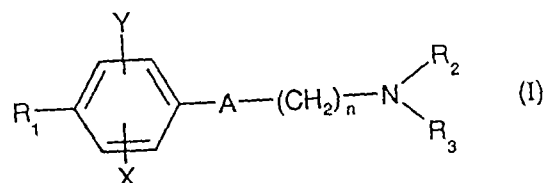
.at.

anidina
sigma;
idina o
a en el
e marcar
c. Nat.

RESUMEN OBJETO Y FINALIDAD DE LA INVENCION

NUEVOS DERIVADOS DEL BENCENO QUE COMPRENDEN UNA FUNCION AMINA
SUSTITUIDA CON UN GRUPO ALQUILO Y UN GRUPO CICLOALQUILO, UN
PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACION Y LAS COMPOSICIONES
FARMACEUTICAS QUE LOS CONTIENEN

La presente invención se refiere a compuestos de fórmula:

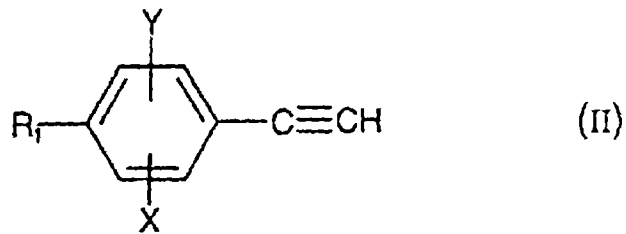


en la cual A, X, Y, n, R₁, R₂ y R₃ son tal como se han definido en la reivindicación 1. Estos compuestos se enlazan específicamente a los receptores sigma, en especial a los del sistema nervioso periférico.

farmacéuticamente aceptables, solvatos e hidratos de acuerdo con la reivindicación 7.

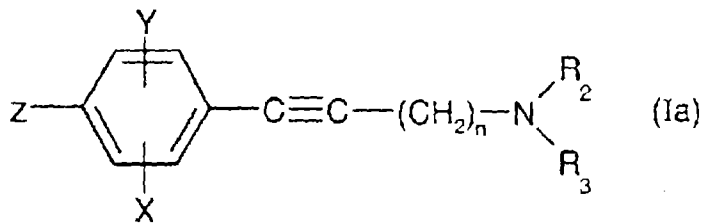
9. Procedimiento para la preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el cual A representa el grupo $-C\equiv C-$ caracterizado porque:

a) o, si $n = 1$, se efectúa una reacción de Mannich entre el derivado fenilacetilénico de fórmula:



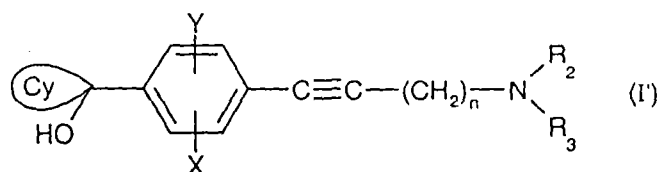
en la cual R_1 , X e Y son tal como se han definido para (I), y el formaldehído y la amina (1) HNR_2R_3 , R_2 y R_3 como se definieron para (I);

b) o se efectúa un acoplamiento de Suzuki entre el compuesto de fórmula:

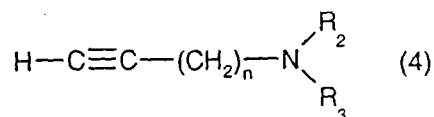


en la cual X, Y, n, R_2 y R_3 son tal como se han definido para (1) y Z representa un bromo, un yodo o el grupo trifluorometansulfonato (OTf) y un derivado borónico (2) de

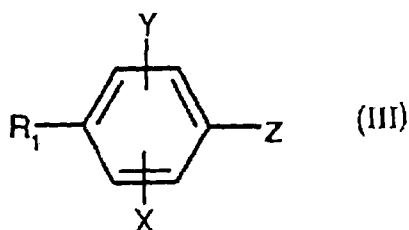
fórmula $R_1-B(OR)_2$ en el cual R_1 se define como en la fórmula (I) y R representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo o arilo en presencia de una base y de un catalizador metálico; c) o, cuando R_1 representa un grupo ciclohexilo monosustituido, disustituido, trisustituido o tetrasustituido por un grupo metilo; un grupo cicloheptilo, 4-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidrotiopiranilo o adamantilo, se efectúa un acoplamiento entre el compuesto (Ia) en el cual Z representa un átomo de yodo o de bromo con la cetona (3) correspondiente a R_1 representada por $\text{Cy}-\text{C}(=\text{O})-$ en presencia de una base para obtener intermediariamente el compuesto de fórmula:



en la cual X, Y, n, R_2 y R_3 son tal como se definieron para (I), y Cy representa un grupo ciclohexilo monosustituido, disustituido, trisustituido o tetrasustituido con un grupo metilo; un grupo cicloheptilo, 4-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidrotiopiranilo o adamantilo; siendo luego reducido dicho compuesto (I') en condiciones selectivas; d) o bien se efectúa una reacción de acoplamiento entre la amina de fórmula:



en la cual n , R_2 y R_3 son tal como se definieron para (I) y el compuesto de fórmula:



en la cual R_1 , X e Y son tal como se definieron para (I) y Z representa un átomo de bromo, de yodo o un grupo trifluorometilsulfonato (triflato u OTf).

10. Procedimiento para la preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el cual A representa el grupo $CH=CH-$ caracterizado porque se efectúa una hidrogenación con hidrógeno naciente o en presencia de ciclohexeno del compuesto (I) en el cual A representa el grupo acetilénico $-C\equiv C-$ para preparar el compuesto etilénico (I) bajo forma de una mezcla de los isómeros Z y E o se efectúa esta hidrogenación en presencia de un catalizador metálico sobre soporte para preparar el compuesto etilénico (I) en forma Z o también se hace reaccionar sobre el compuesto (I) en el cual A representa el grupo acetilénico $-C\equiv C-$ un hidruro metálico para preparar el compuesto etilénico (I) en forma E .

11. Procedimiento para la preparación de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el cual A representa el grupo $-CH_2-CH_2-$ caracterizado porque se efectúa una hidrogenación del compuesto (I) en el cual A representa un

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 281

Radicación no 00-42775

Concepto Técnico no _____

Clasificación Internacional de Patentes A61K 31/13 // 31/01 // 31/015 //
31/03

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-i).
- 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. Realizó cambio del título inicialmente presentado por el consignado en folio 272.
 2. Anexa respuesta al auto 2055 del 1º examen de forma en 105 folios 272 a 274.
 3. Anexa nuevas páginas 2, 105, 106 y 107 de la descripción y de las reivindicaciones que reemplazan las originalmente presentadas (folios 280 a 283).
 4. Adjunta nuevo extracto (folio 278), arte final (folio 275), tarjetas temática (folio 277) y de propietarios (folio 276).
- EXAMINADOR TÉCNICO 202041

Bogotá D. C., 21 marzo /02



280

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Folio 285

2002-07-30
416

2020
Bogotá, D.C.

Doctor(a)
JOSE ANTONIO LLOREDA
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación No.	00-42775
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	689
	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 JUL 2002

ALIX CÉSPEDES DE VERGEL

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, D.C., 19-04-05

El extracto de esta solicitud fue publicado en el número 518 de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha 30-07-02. El término hábil señalado por la ley expiró el 25-10-02 y SI NO se presentaron oposiciones por parte de terceros.

202041

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