

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

202078
Bogotá, D.C., 12, 10, 2007

Abogado
GUSTAVO TAMAYO
Apoderado
Solicitante: F. HOFFMANN -LA ROCHE AG.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-000965- -00006-0000

Fecha: 2007-10-25 14:33:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03000965
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	13597
	Folios	04

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:

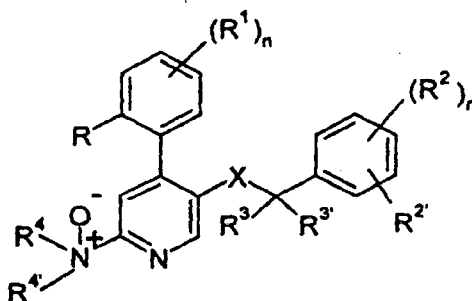
1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios: 29 a 79 como se radicó inicialmente.
- 1.2. Reivindicaciones: 1 a 13 Folios 102 a 107 como se radicó en fase internacional.
1 a 9 Folios 80 a 85 modificadas.
- 1.3. Prioridad: 14/07/2000, EP, 00115287.5

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "N – OXIDOS DE DERIVADOS DE 4-FENIL-PIRIDINA COMO PROFARMACOS ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR NK1".

Reivindicaciones 1–5: Compuestos representados por la fórmula (I):



Reivindicaciones 6-7: medicamentos de acuerdo a las reivindicaciones 1-6.

Reivindicación 8: Un proceso de fabricación.

Reivindicación 9: Un compuesto de fórmula (I) conforme a las reivindicaciones 1-5.

El **problema planteado** en esta solicitud es la necesidad de ~~compuestos~~ **compuestos** útiles como antagonistas del receptor de neuroquinina 1 (NK1).

Para **resolver este problema** técnico, la solicitud en estudio proporciona, profármacos, compuestos de fórmula (I) y medicamentos a base de estos compuestos.

- Clasificación Internacional de Patentes (IPC.): C07D213/76; A61K31/44; A61P25/00; A61P25/06.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

Los términos alquilo inferior, alcoxilo inferior, cicloalquilo, amina terciaria cíclica, entre otros y las frases "sales farmacéuticamente aceptables", "agente oxidante adecuado" son muy generales y ambiguas.

La descripción tan solo presenta (página 21, folio 48) resultados de la vida media (estabilidad) de **tres compuestos: de los ejemplos 1, 2 y 16** en plasma humano y animal, adicionalmente este estudio no realiza una comparación que permita establecer la ventaja en términos de estabilidad y afinidad por el receptor NK1 frente a otros compuestos conocidos en el estado de la técnica que también presenten actividad como antagonistas del receptor de NK1. Estos ejemplos con sus resultados no son suficientes y no pueden extrapolarse para todos los compuestos y medicamentos posibles que se pretenden proteger.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1, es muy amplia por la cantidad de sustituciones que se pueden realizar con los radicales mencionados : R_1 , R_2 y R_2' , R_3 , R_3' , R_4 , R_4' , R_5 , R_6 , X , n y m , sobre todo cuando son radicales aromáticos, obteniéndose así muchísimos compuestos. Igualmente esto afecta a las reivindicaciones de la 2-7 y 9 dependientes de la reivindicación 1.

No es claro como para R_1 y R_2 , n puede ser 3 ó 4, pues no se podrían sustituir más de 2 átomos de lo que representan estas R en el anillo fenilo. Por otra parte no es claro cómo se obtiene una amina terciaria cíclica, sin perder el oxígeno unido a dicha amina y adicionalmente no es conciso cuando mencionan amina cíclica sin precisar el número de átomos de dicho ciclo.

De otro lado, la frase: "y las sales de adición ácida farmacéuticamente aceptables de los mismos", resulta ambigua e imprecisa.

La reivindicación 8, reclama un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) el cual no se caracteriza por sus reactivos, productos a obtener, etapas y

condiciones del mismo. Adicionalmente menciona frases ambiguas e imprecisas como "oxidante apropiado", "...y si se desea convertir el compuesto obtenido en una sal ..."

Para el experto en la materia es incuestionable que cuando se habla de grupos heterocíclicos, en particular cuando se refieren a pirrolidin-1-ilo, piperidin-1-ilo, piperazin-1-ilo, morfolin-4-ilo, 1,1 dioxo-tiomorfolin-4-ilo) se esta haciendo referencia a diversas clases de radicales que provienen de una amplia gama de compuestos. De esta forma es preciso requerir al interesado para que señale el verdadero alcance de su invención ya que teniendo en cuenta la característica esencial de la fórmula (I) que es de menor complejidad química que los compuestos obtenidos una vez se efectúan las sustituciones correspondientes, resulta claro que las sustituciones en el núcleo de la fórmula (I) son muy amplias y no definen todos los compuestos reclamados a lo largo del capítulo reivindicatorio.

La materia reclamada en el capítulo reivindicatorio tal como se presenta, manifiesta carácter general e ilimitado en torno a los compuestos (reivindicaciones 1-5 y 9), procesos de obtención (reivindicación 8) y composiciones (medicamentos) (6-7) reclamados.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La característica esencial de la fórmula (I) no puede definir de forma inequívoca el concepto común inventivo que une a todas las modalidades que define la solicitud en su capítulo reivindicatorio, ya que al incluirse términos tan amplios y poco específicos en la definición de los radicales; R, R¹, R², R³, Y, X en la fórmula (I); es posible obtener compuestos estructuralmente más complejos que aquellos que se definen al amparo de la fórmula (I).

Por lo tanto es importante enfatizar en el punto de que un concepto inventivo, no puede definirse en términos generales y simplemente como una función química, como sucede con la definición de los radicales : R, R¹, R², R², R³, R³, R⁴ R⁴ X en la fórmula (I), basándose en la clasificación general de las sustituciones carbocíclicas o heterocíclicas sustituidos o no sustituidos, condensados o no; porque dentro de ellas se encuentran diversas categorías estructurales en atención al número y clase de átomos que conforman el anillo (cíclico, heterocíclico), la aromaticidad, el grado de saturación o insaturación ; como también a la clase de unión o enlace de los mismos.

En consecuencia se puede observar que de la fórmula (I) no se puede definir de forma inequívoca el concepto común inventivo que une a todas las modalidades que define la solicitud en su capítulo reivindicatorio.

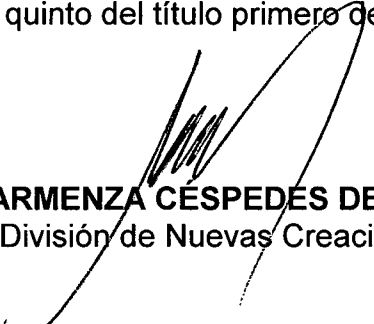
Esta Dependencia encuentra que la solicitud presenta, algunos grupos de invenciones:

- 1) Las modalidades que se agrupan bajo la estructura de las Tolil piridin-piperazinas.
- 2) Los que presentan grupos 4-oxi-morfolino
- 3) Las que tienen grupos Bipiridinilos
- 4) Y las Tolil nocotinamidas simples

En consecuencia, esta Superintendencia requiere al interesado para que precise el alcance de la invención o el grupo de invenciones que desea proteger, de una manera clara, concisa e inequívoca, con el fin de realizar el estudio del estado del arte más cercano y así poder evaluar la patentabilidad de la materia y su contribución al estado de la técnica.

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
26 OCT. 2007

CONCEPTO TÉCNICO No.1919	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202078
---------------------------------	---

vered3