10.

SUPERINTENDENCIA DE
DIVISION DE NUE

2020

Bogota, D.C. 03/10/2008 SUPERINTENI

Abogado
Emilio Ferreo No. C

Fecha: 2008-1

Act. 519 TRAE (Apoderado) Tm,.11 PATE

ASUNTO Radicación
TrÆmite
Evento
ActuaciOn
Oficio
Folios

Patente de lnvenciOn

Via Nacional

Via PCT (fase nacional)

Como resultäcio del examen de fondo, re la DecisiOn 486 de la ComisiOn de la Can

I. Documefltos estudiados

1.1. DescriDciOn: Folios: 43 I

1.2. Reivindicaciones: Folios: 69

1.3. Datos PCT: Solicitud In
Capitulo II
Fecha Sol. Ir
PublicaciOr.
Fecha Pub I
Fecha lnici
Fecha Sol.

1.4. Prioridad: DEIOI

2. Objeto de la invención

Titulo de la solicitud

flflØtodo para obtener (3-clan-I il]metanona y sue sales

Y COMERCIO
IONES

NDUSTRIA Y COMEROJO

12:1-t55 Dep. 2020 DIR NUEVASCR Yll Eve: 379 EASENACIONALII OINFPRME Folios: 1
57476

1282
03

nt de Modelo de Utilidad fl

ap 1 U Cap. II Efl

ado con fundamento en el artIculo 45 de iid d Andina, se le comunica:

PCT/EP01 /15240

icional: 21/12/2001
acional: W002/059092
acional: 01/08/2002
Nacional: 23/08/2003
al: 08/07/2003

23/01/2001

!j$)[4..(4.fluos-fenetjI)..pjperjn.j-

I

ind-I;4-(44lufenetil)-piperE cars do porque:

i)Un ihdiIØster do Is fOrmula (H)

ii) El fon$fl ester do Is fOrmula (IU) en un ¶lvado do oxima de Is for

iii) La 4ima do Is fOrmula (IV) so

iv) el ter do fOrmula (V) SO 8
cbxk.

v) of 4"do 3-ciano-1 H-indol-7-ca’
etif]piperazina 0 sus sales en of ci

vi) 14 so de Is fOrmula (I) obteni

sales I
Reivk thcacion 3: Se reivindic
care rizado porque en of paso
amo isis con I -(2-(4-fluor-fen I
corn Esto do Is fOrmula (1).

Revi caciOn 4 Se reivind1caE
porq so obtione Æcido 3-c,anoI
indosterdelafOrmüla(IJ).

Rei udicaclones 8, 9,. by II

OH

N.

un mØtodo pare obtener (3-clan-I H-etaflona do Iaf&rfiula(L)y sus sales

on I) so conviertd con hidroxilamina

on uncianindolØster tie fOrmula (V)

pare der Æcido 3-ciano-I H-indof-7-

so convierte con I -[2-(4-fl(jor-fenil)- do Is fOrmula (1) y,

nvierte, con un Acido, en una do sus

)do do acuerdo con Is clÆusUla I
r do Is fOrmula: (V) so convierte. por, razina a una de sus safes, en el,

do Is reivindicaciOn I caracterizado cabx1llco pór halogenaciOn dOUh.

lican los compuestos intermediarios:

of S1

H

S

Fi S

4

E

0

S

Formula

Sustento Descriotivo

El objeto de la invención es un fluoro-fenil-etil)piperazinH-1 -ilJ-me presenta activdad cimica antipsic efectos secundarios que se en neurolOgicas orignados en trasto depresiones, estados de angustia, dolor, trastornos del sueæo, inson nerviosa, bulimia, conductas adic entre otras.

Una vez catalogada la
de Ia Clasiflcación

3. De Ia solicitud de Patente

,ar obtener (3-dana-I H-indol-7-il)44-(4-a de formula (I). Dicho compuesto co mmnimos efectos secundarias o sin e’i el tratamiento de enfermedades de la transmisiOn serotoninØrgica coma do: es, de panico, conductas compulsivas,
tr$tornos de la alimentaciOn, anorexia
aiicciones a determinadas sustancias

de

e clasificO en la sección: A 61 K 31!39S

3.1. RivindicacIones (articulo 30Dj 48)

Teniendo on cuenta qua el articulo 304 la ecisión 486 establece la necesidad de que la materia objeto de reivindicact s encuentre definida en forms clara y condisa, eta Dependencia.se permit eæJaral seæor solicitanteIa siguiente:

El contenido de las ctÆusulas I a 4
variantes que se seæalan en formac
a Is secuencia general de la clÆusu

Para ilustrar este hecho se remits
en Is que: se define Is variante resp
amonOlisls entre 1 -[2-(4-f(jor4enik carboxHato de etilo sin que medie secuencia de etapas definida en la

Par otra parts, en la clÆusula4 el encuentrà una nueva variants ir, obtener luego el derivado cianura(etapa I) de Is secuencia originaria

Como se seæalO, existen aproxi clÆusulas I a 4 on la forma de seæalar:que dado que el compue estructurales a partir del estado caracteristica esencial que coligi. sentido,,: se configura un problems

diferenciar cuatro procesos dadas las nte en las clÆusulas 3 y4 con respecto

icitante al contenido de Is clÆusula 3

etapa iv) qua permits la reacciOn de :ina con el ester 3-ciano-1 H-indol-7-.
del Æcido como si ocurre en la

originalmente definido en la clÆusulaI ialogenación del compuesto (II) pars medie Is reacciOn de formilaciOn de Is sciOn de la oxima.

3mnte cuatro procesos definidos en las uI$s dependientes, at respecto as precise aI) de fOrmula (I) deriva SUS caracteristicas Ia tØcnica Øste no puede considerarse la s uatro: secuencias de reacciOn, en este aIa dependencia, dado qua las etapas qua

4

Formula

E

139
OH

N’

Hidroxil-ami

H Etapa (Ii)
ma

FOrmula (IV)

Etapa (III)

Saponihcac
. -

Etapa (iv

FOrmula (V)

ida (I) an especial

le incorpora la modificación definida en la tapa iv) y que constituye la reacciOn de dOn del Æeido.

4

WA

141

Proceso 3 A la etapa de haIogenacin defi Ida en la clÆusula 4se adiciona la secuencia las etapas iv), v) y vi) di la eivindicación 1, es decir, desde el cianurado h ista la obtenclØn del com tx sto e formula (I) con la mediación do la formaciOn d il Æcido on laetapa iv) o p nifi dOn.

al CN

F

Formula (V)

Saponilicación Etapa (iv)

CN

NH
+

VHla
HOO o

Acido 3ciano-1 H-indol-7-carboxflico

FOrmula (VI)

is Etapa (v)

-7-iI)-(4-(4-flüor-fenil)etiIJpipera2in-1-ilJmebnona

Formula (I)

Etapa (VI)

aI de compuesto do formula (I) on especial clorhidrato

01

 01

Proceso:4, A Is etapa de halogenaciOi do la secuehcia de etapas do Is clÆusul 3-ciano4Hindol-7-carboxilato do etilo

FOrmula (H)

Hal
I

1 HalogenaciOn
- ’’ N

Etapaci) H

go 0

FOrmula (VI)

ya1

(H)

Do otro lado, results oportuno seiialar q: Un Is secuencia logica do etapas qua permi e Is ol asimismo, s do importancia spree able fisicoquimics quo median las reaccon sen c ejemplifica e at sustento descriptivo do I soli 65 a 68, pO tat räzon, OSta depende ci edemas de las recornendàciones a e fc condiciones fl las etapas de reacción roc

4. Unidad o InvenciOn articu!o 25 D 86)

4.1 De Iasi orocesosde sintesis

El anÆhsisd: unidad do invenciOn on at

mÆs prOxirno a Is materia reivindicada (compuesto fi al de fOrmula (I) ha permit
at requisito d altura inventiva y como c pueden coex stir dentro do Is misma so mismo Un o cepto comün 6 inventivo.

142

en Is clâusula 4 se adiciona parte la cóndensacin directs del ester 441ior4enhl-etilJpiperazina.

CN

-o o i(4Thor-fthpOrazina

H-1n1o!4carboxffatD de ohio

Formula (V)

Amort011sls Etapa (v)

lane-I H4ndoi4-lI)-(4-(4-f r4onil)etiljpiporazirvl-ii)rnetanona FOrmula (I)

rmadOn do ml do compu$to do fOrmula (I) on ospecial clorhkirata,

oceso do s1ntesisse caracteriza pot enciOn de un producto determinado,
i indicaciOn do las condiciones  da etapa del proceso, tat ycomo so tud en los casos 1, 2 y 3 de los folios oità at intØreaadc, tenor en öuehtO nuladas Is incorporaciOn de las limientos do sinteSis que reclama.

las enseæanzas del estado del arte on) y en particular en to atinente at uir quØ el compuelto no cumple con ncia do ello los cuatro procesos no ado quo cada unô constituye en si

S

S

En atención a ello, esta Depender presente examen tØcnico (a secuenci cuatro procesos que reivindicO el reMndicatorio y que so consideran c el cuäl no ipueden coexistir dentro dc

A continuHciOn se ilustran los cuatro I por esta Dependencia:

Proceso 1. El definido en (a clÆusulaI

Proceso 2 Al proceso de (a clÆusula c(Æusu)a3 es decir (a que ocurre en amonô(isis directa sin quo medie la f

Proceso 3. A (a etapa de halogens secuencia do (as etapas iv), v) y \ cianurado hasta (a obtenciOn del coi formaciOn del Æcido en (a etapa iv) o

Proceso 4 A (a etapa de ha(oger do (a secuencia do etapas do (a cl 3ciano-1 H-indot-7-carboxilato de

En consecuencia, se recomienda al cuenta: los grupos o conceptos incorporar (as solicitudes divisi evidenciar do manera mÆs clara y o

4.2

Por otra parte, en (as clªusulas 8 a Ii de sintesis:

FOrmula (IV) FOrmula (V)

13

permitiO indicar en el numeral 3 del spas correspondiente a cada uno do los ito en las c(Æusulas I a 4 del pliego s inventivos independientes, motivo por sma solicitud do patente.

 conceptos inventivos -identificados

orpora (a modificación definida en (a iv) y que constituye la reacción do del Æcido.

nida en (a cIusula 4.-se adiciona la reivindicación I, es decir, desde el de fOrmula (I) con la mediaciOn do la

da en (a clÆusula 4 se adiciona parte sde (a condensaciOn directa del ester 2-(4-flüor-fenil-etil]piperazina.

fraccionar su soheitud, teniendo en entificados por esta dependencia e secuencias grficas quo permiten :Łlas dilerencias entre ellos.

na protección para los intermediarios

3-ciano-1 H-indol-7-carboxilico

4

FOrmula

Sobre este particular es preciso md, considerandentro de un mismo conce las sustancas intermediarias que inter es decir, Ia inmediatamente anterior producto final de, fOrmula (I):

(3-dane-I H-indol-741)-[4-

Es decir quo compuestos como el de f ester 3-N-(hidroxil-meten-amina)-1 H-in pasos de transformaciOn para Ilegar al inventivo ätinente a los procesos I y tOcnico).

Esta misma situaciOn ocurre con el de acuerdo con los procesos 3y 4 debe su antes de ilegar al compuesto de interØs

En este sentido, solamente constitu intermediarios de fOrmula (V) y su den conjunto inventivo con el proceso 2 y inventivo con el proceso 1.

S. Determinaciôn del Estado de la

Considerando que (a fecha de pres cual so reivindica prioridad es: 29/1 documentos relacionados en el e anterior a Østa.

M?

los compuestos interrnediarios se tivo en la medida que correspondan a reaccionan en la etapa mÆs prOxima, uesto de interOs, on este caso el

II; Q: NH

dii)- iperazin-I-imetanona

ula(1V) que corresponde a la oxima del 74rboxilato de etilo quo deben sufrir 3 pusto final no forman parte del concepto ier grÆfiôo del numeral 3 del concepto

do alogenado do fOrmula (VI) quo de al nttenos dos etapas do transformaciOn Iaf?rmula (I).

un concepto comCn e inventivo los) ac, do el primero constituye un mismo egudo constituye un mismo concepto

do la primera solicitud de patente de la 1, so rocediO a efectuar la bUsqueda de la tØcnica con fecha de publicaciOn

Anteriondades Dl y D2 an los folios 124 a I

6. AnÆllsisde patentabilidad (

6.1 Nivel inventivo ’ai’ticuIo18 D.

El nivel inventivo del objeto r caracterIsticas esenciales del pr
los elemertos esenciales de estr

So reivindican un proced
do la formula (I):

F-0 \

(3ciano-1 H4ndol-7-il)-[4-(44uo

El estado del arte previo a docurnentos:

Anterióridad Dl:

La publicaciOri Dl indica que compuest inhibidores do 5HT2.

6-N

(CH2m

Para la cual:

Y es H, CO(CH2)CH3 y n es de 0 a 3 X representa un grupo CO
R es un Mom de halógeno

C-

145

14.486)

to s evaluO por comparaciOn entre las inaldefinidas en el pliego reivindicatorio y
sim fares reveladas por el estado del arte.

do SIntesis para obtener un compuesto

el)-iperazin-1-il]metanona

in+enciOn presenta los siguientes

e la fOrmula (I) presentan actividad como

’N

148

NO NO
Re Reqwsito que Afecta odas
Dl EP0320983 j1 Nivel Inventivo
D2 US5206366 lall1 Nivelinventivo

En cumplhniento del artIculo 45 de Is
Andina, se le indica qua debe dat r
contados a partir de Is, fecha de nom
de no da respuesta al presente
subsistiern los impedimentos pars I

Notif(cluesp el presente oficio copf6 del capitulO quinto del tIt lo pr ero

ALIX CARMENZA C PEDES DE Jefe de Division de 14’uevas Creacior

El anterior, requerimiento tue ru

JOOCL2UO

CONCEPTO TECNIcO No. 2827

On 486 de Is Comisión de Is Comunidad dentro del tØrmino de sesenta dias
in Is presente comunicaciOn. En caso 1riento, 0 ci a pesar de Is respuesta iOn se denegarÆIs patente.

lo ispuesto en el numeral 5.2, literal e), Cicuiar Unica No lOde 2001.

por fijaciOn on lista, de fecha

EXAMINADOR TECNICO

COdigo No. 202044

m es un nUmero elegido entre I y 5

Al evaluar las caracterIsticas estructt

con las seæaladas para el compuesto la diferencia entre ellos estriba en la ii reemplazarla anhlina que se encontr del arte y que presentaban actividad

Mterioridad D2:
La publicación D2 revela estructuras

Ar es un grupo naftil, indolil opcional nesunnümero entre ly2
X y Yjuntos con el Ætomo defenilo al indolil.

Al realizar la comparaciôn elemento p tomo al cual se reivindican cuatro pro enseæanzas reveladas par el estado posible concluir lo siguiente:

Existe una diferencia notable entre el I revelada por el antecedente Dl, difen estructura que se pretende obtener por indolil en el extremo derecho del farm encuentran anillos de fenol en el la misi la estructura farmacofórica se conserve antecedente como el que resulta dØ ii bioisósteras, dada su analogia estn terapØutica que se reporta en el docun
HT2.

En cuanto al antecedente 1)2 se cons grupo tipo arilo y la presencia de un gru estructura farmacofórica. Sin embargo, que se pretende obtener con la que en el antecedente 02 se omitØ la presenci una cadena aiquilica, igual ocurre con anlo.

No obstante lo anterior, al evaluar concordancia con las reveladas por el subsanarse, por cuanto, en Ia publicac
este anillo por indol, benzoisotiazol, benzotriazol, ya que se trata de serif neurolØptica pare el tratamiento de er

el

el

compuesto reclamado y compararlas anteriondad Dl se hace evidente que ción de un anillo de 3-ciano-Indol para compuestos revelados por el estado receptor 5HT2.

el siguiente nücleo:

por fluoro

unidos pueden former un anillo de

to del compuesto de formula (I) en DS de sintesis y compararlo con las en las anterioridades DI y D2 es

sto objeto de interØs y la estructura e estriba en el hecho de que en la tica cuenta con un anillo de 3 ciano-mientras que en el antecedente se ô iOn. Por 10 demÆs puede decirse que :anto los compuestos revelados en el rà el solicitànte constituyŁn series y la conservación de la actividad 1 como antagonistas del receptor 5-

anillo de piperazina enlazado a otro en et extremo del a derecha de la ializa con detenimiento la estructura ntecedente D2 se evidencia que en grupo carbon110 y se reemplaza por a que enlaza la piperazina al grupo

eæanzas del antecedente 1)2 en ante Dl, dichas diferencias parecen indica la posibilidad de intercarnbiar benzotiazol, benzomidazol o Steras que conservan su actividad id,es como esquizofrenia, ansiedad,

M,
agitación, agresividad, tension, er psicOticos. Y las diferencias con D2 t Dl conserva el gr’upo carbonilo y Is volumino*os dentro del nücleo esenc comparaiOæque presents Is TablÆ

Tabla 1. Comparaciôn estructural enire compuesto (I)

147

s patolog[as asociadas a pacientes
se subsanan dado que el antecedente
alquflica pars enlazar los aniflos mÆs
como a continuaciOn se evidencia en Is

en los antecedentes Dl y D2 y el

Estructura obtenida a traves de los procesos I Me ente Dl Antecedente 1)2 reivindicados
(HY

I FO

ON

yo (C m

R

NH que puede ser nal, indolil, enfre oos, opdonalmente wbstth.iklo par fluoro
Y i, CO(H2)nCH3 ’ n
c XyYjuntos con eIÆomodetnioalcualestÆnunidoa
X co pueden fomiar un aniflo de indolil.
Râl ma d:halogeno
mz1a5

De esta manera, a partir de las ensei documentos Dl y D2 es posible deny pars el seflor solicitante y en tomb a de sintesiS diferentes. En este sentic comün:alrØdedor del cual se reünen posible concluir que existe falta de u

Por las razones expuestas.anteniom previo afØcta Is altura inventiva d considera que existe incumpHmien articulo 18 del ordenamiento juridico tal sentido recomienda fraccionar la inventivos ha considerado esta DepE atenciOn a la secuencias o procedimi que sepueden reivindicar coma con

7. Conclusion:

Los requisitos de patentabilidad de asi:

ue revelan en su conjunto tØcnico los structura como la que results de interØs se pretende reclamar cuatro procesos falta de altura inventiva del concepto ;ro procesos en una rnisma solicitud es invenciOn a posterior!

a dependencia encuentra qua el ante teria reclamada y por consiguiente 3 disposiciones contempladas en el ’del artIculo 25 de Is DecisiOn 486, en en tantas divisionales coma conceptos en el aparte de unidad de invenciOn en sintesis quimica y a los intermediarios ntivo comün.

solicitud se encuentran afectados