

Señores
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y CO
Bogotá, D.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-048789- -00006-0000

Fecha 2009-02-25 15 51 18 Dep 2020 NUECREACIONI
Tra 11 PATENTEIYII Eve 379 FASENACIONALII
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios 15

Re.: Código 011-378-444
Expediente No. 05-48.789
Fase nacional de Solicitud
de Patente PCT
EURO-CELTIQUE S.A.

En relación con el expediente de la referencia y dando cumplimiento a la última providencia recaída sobre este asunto por medio del presente escrito me permito manifestarles lo siguiente:

1. Adjuntamos un nuevo capítulo reivindicatorio el cual ha sido revisado y corregido. Las reivindicaciones 1-20 y 22-29 del juego reivindicatorio propuesto corresponden a las 28 reivindicaciones expedidas en la Patente Europea No. EP 1 562 932 B1. La reivindicación 21 propuesta corresponde a la reivindicación 28 de la Patente U.S. No. 7,202,259 B1 y las reivindicaciones 30-38 corresponden a las reivindicaciones permitidas 1-9 de la Solicitud Divisional Europea No. 07 006 697, expedida ahora como la Patente Europa No. EP 1 803 718 B1.
2. El Examinador objetó las reivindicaciones 13-15, 33-35, 53-55 y 73-75 las cuales estaban dirigidas a composiciones que comprenden tanto un compuesto de la descripción (un compuesto de la Fórmula I(a), I(b), I(c) o I(d) y un terapéutico adicional (un analgésico opioide, un analgésico no opioide o un agente anti-emético).

El objeto materia de las reivindicaciones 13-15, 33-35, 53-55 y 73-75 ha sido incorporado en la reivindicación 11 del capítulo reivindicatorio adjunto propuesto. En respuesta a las objeciones del Examinador, la Solicitante sostiene que la patentabilidad de la reivindicación dependiente 11 se establece por la mención de los compuestos novedosos y no obvios de las reivindicaciones 1 y 2. Tal como se observa en la descripción presentada (WO 2004/046132), los compuestos de la invención son útiles para el tratamiento de dolor y diarrea (ver por ej: página 89, líneas 17-24, página 90, línea 32 a página 91, línea 14, y en la página 92, líneas 8-11). La reivindicación 11 limita el alcance de la reivindicación 10 al solicitar la presencia de un analgésico opioide, un analgésico no opioide o un agente anti-emético en la composición mencionada de la reivindicación independiente 10.

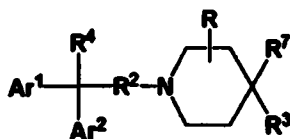
El apoyo para este tipo de composiciones terapéuticas se provee, *inter alia*, en la página 98, líneas 4-20 de la descripción original. Una persona versada en la técnica reconocería que enfermedades que incluyen dolor (el cual puede ser más de un tipo de dolor, ver por ej: página 89, línea 17 hasta la página 90, línea 31), náusea y/o diarrea serían tratadas de manera ventajosa

con una composición terapéutica que comprenda más de un agente activo. Por ello, las composiciones que reivindica la sociedad solicitante no son descritas de manera especulativa ni inadecuada. Es más, una persona versada en la técnica entendería el alcance y contenido de cada una de las fases mencionadas, "analgésico opioide", "analgésico no opioide", "antidiarreico" y "agente anti-emético".

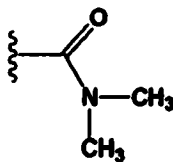
3. El Examinador también ha objetado las reivindicaciones 86-89 originales, afirmando que no es aceptable definir un kit por su contenido.

En respuesta a la objeción del Examinador, la sociedad solicitante observa que la reivindicación 13 propuesta está dirigida a un "kit médico para el tratamiento de dolor o diarrea que comprende un contenedor que contiene la composición de la reivindicación 10". La Solicitante sostiene que el kit de la reivindicación 13 se define no solo por su contenido sino también por los usos para los cuales se propone.

4. El Examinador ha objetado que el compuesto específico de la reivindicación 110 original (y que ahora es la reivindicación 14 propuesta) lleva un medio de ciano y un grupo fenilo en la posición 4 del anillo de piperidina. El Examinador objeta además la presencia del anillo de tetrazol adjunto a la posición 4 del anillo de piperidina presente en los compuestos reivindicados de la sociedad solicitante, cuya posición, la solicitante observa, también lleva un grupo fenilo sustituido opcionalmente
5. El Examinador también ha observado que D1 (WO97/09973) describe la estructura genérica de la Fórmula (II) siguiente:



Es en este contexto que el Examinador afirma que D1 describe que Ar¹, Ar² y R³ son fenilo, R es H, R² es (CH₂)₂, R⁷ es CN y R⁴ es



Mi representada no está de acuerdo con lo anterior. Tal como lo observó el Examinador, los compuestos de la Fórmula (II) de D1 aparecen en la página 24, línea 23, hasta la página 26, línea 7 del D1. Sin embargo, esta sección realmente excluye el grupo ciano como opción para R₃ o R₇. D1 menciona que, con respecto a los compuestos de la Fórmula (II), R⁷ es -OH o preferiblemente -C(O)OR¹⁷, mientras que R³ es fenilo o fenilo sustituido. Es decir, con respecto a los compuestos de la Fórmula (II) de D1, el grupo ciano no se identifica como una opción para R₃ o R₇.

Aparentemente, con base en la información del párrafo anterior, el Examinador afirma que el compuesto de la invención (presumiblemente el compuesto de la reivindicación 110 original y reivindicación 14 del nuevo juego reivindicatorio propuesto) se encuentra dentro del estado de la técnica y no es nuevo.

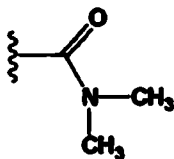
La descripción inicial de los compuestos de la Fórmula (I) en D1 abarca más de 10 páginas de la descripción (página 11, línea 1 hasta la página 21, línea

14), que tomados literalmente, abarcaría un número muy grande de compuestos. La solicitante sostiene que solo describiendo un género grande de compuestos no es suficiente para llevar a una persona versada en la técnica a ninguna especie en particular. Sin alguna guía o dirección, se dejaría que la persona versada seleccione un grupo individual para cada variable entre las muchas posibilidades que abarca esta amplia descripción (más de 300 páginas), sin ninguna guía que dirija al experto o que indique de otra forma que se debe alguna selección en particular en lugar de cualquiera de las otras.

Por ello, D1 no sugiere o enseña nada que pueda llevar a la persona versada en la técnica a escoger un grupo ciano de entre la lista de posibilidades para la variable R^3 o R^7 .

De hecho, la pequeña orientación que provee D1 aparta clara y distintamente a la persona versada en la técnica del grupo ciano para R^3 y R^7 . D1 identifica los compuestos preferidos de la Fórmula (I) como los de los subgéneros de la Fórmula (II) y ese subgénero no incluye un grupo ciano como una opción para R^3 o R^7 (página 24, línea 23, a la página 26, línea 7 del D1). De hecho, en esta sección, D1 solo identifica los medios $-OH$ y $C(O)OR^{17}$ como opciones de la variable R^7 .

6. El Examinador ha indicado que la técnica anterior más cercana es D1, el cual se supone menciona los compuestos en los cuales Ar^1 , Ar^2 y R^3 son fenilo, R es H, R^2 es $(CH_2)_2$, R^7 es CN y R^4 es:



y que dichos compuestos son formulados para producir hiperanalgesia

Nuevamente, mi representada sostiene que describir simplemente tal género grande de compuestos no es suficiente para llevar a una persona versada en la técnica a ninguna especie en particular. Sin alguna guía o dirección, se deja al experto seleccionar grupos individuales para cada uno de los siete grupos variables entre el número grande de posibles opciones que se mencionan en esta amplia descripción (más de 300 páginas), sin ninguna guía que indique o dirija que se debe hacer selección en particular en lugar de cualquiera de las otras.

De hecho, tal como se menciona en la sección anterior, la única guía que provee D1 aparta a la persona versada en la técnica del grupo ciano para R^3 o R^7 . Esto se debe a que donde D1 identifica los compuestos de la Fórmula (II) como que abarcan los compuestos preferidos, D1 especifica que este subgénero no incluye el grupo ciano como una opción para R^3 o R^7 (página 24, línea 23, a la página 26, línea 7 de D1).

7. El Examinador parece afirmar también que los compuestos que se reivindican originalmente se diferencian de los de la Fórmula (II) de D1 solo con respecto al sustituyente en la posición 4 del anillo de piperidina, es decir, un medio tetrazol en los compuestos originales y un medio ciano en los compuestos de la Fórmula (II) del D1. Como apoyo a estas afirmaciones, el Examinador cita las siguientes secciones de D1: (i) página 19, línea 15, (ii) página 20, línea 3, (iii) página 24, último párrafo, (iv) página 25, (v) página 61 (vi) página 174 y (vii) Reivindicación 1.

Tal como dice el Examinador afirma que:

...al ser la única diferencia el anillo tetrazol en la posición 4 del anillo de piperidínico (R^7), para una persona de nivel medio le es posible utilizar múltiples significados para R^7 , entre ellos un tetrazol o cualquier otro sustituyente para no modificar el efecto farmacológico conocido para los derivados de estructura 2,2-difenil-4-[(4-ciano-4-fenil)piperidino]birtilcarboxamida sustituidos

Nuevamente, la solicitante observa que la guía que provee D1 con respecto a los compuestos de la Fórmula (II), aparta clara y distintamente a la persona versada del grupo ciano para R^3 o R^7 . D1 identifica los compuestos preferidos de la Fórmula (I) como los del subgénero de la Fórmula (II). Sin embargo, como se dice arriba, ese subgénero no incluye un grupo ciano como una opción para R^3 o R^7 (página 24, línea 23 a la página 26, línea 7 del D1). De hecho, en esta sección, D1 solo identifica los medios $-OH$ y $-C(O)OR^{17}$ como opciones para la variable R^7 .

Además, mi representada sostiene que D1 no enseña o sugiere nada que pueda llevar a una persona versada a seleccionar un medio tetrazol para R^3 o R^7 . De hecho, la sociedad solicitante observa además que el Examinador no ha sugerido que D1 enseña de manera explícita o de otra forma menciona que R^3 o R^7 pueda ser un medio tetrazol.

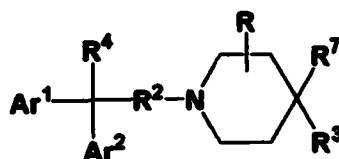
8. La sociedad solicitante observa además que las secciones de D1 que cita el Examinador no solo no apoyan las conclusiones del Examinador, sino que contradicen las conclusiones. A continuación, un análisis de cada una de las secciones:

- (i) Página 19, línea 15. El catálogo de grupos del que se puede seleccionar la variable R^4 comprende dos páginas de D1 – de la página 17, línea 22, hasta la página 19, línea 16. La línea 15 en la página 19 menciona que R^4 puede ser $-NR^5COR^5$.

La sociedad solicitante no ve la relevancia de esta sección puesto que R^4 no está fijo al anillo piperidina, y $-NR^5COR^5$ no cae dentro del alcance de la definición de R^1 dla sociedad solicitante, es decir, la variable correspondería a la variable R^4 de la Fórmula (II) de D1. Se solicita aclaración.

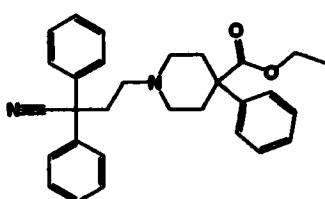
- (ii) Página 20, línea 3. El catálogo de grupos químicos del que se puede seleccionar la variable R^7 también comprende casi dos páginas de D1 – de la página 19, línea 17 a la página 21, línea 2. La línea 3 en la página 20 provee que R^7 puede ser CN. Es decir, de entre el grande número de posibles grupos para R^7 , el Examinador, llevado solo por la descripción de la sociedad solicitante y no por ninguna enseñanza o sugerencia en D1, ha seleccionado el grupo ciano para esta variable. El Examinador no ha señalado ninguna guía provista por D1 que lleve a una persona versada a escoger este grupo químico sobre cualquiera de los demás grupos químicos mencionados. De hecho, la única guía que provee D1 se aparta de la selección del medio ciano para R^3 o R^7 (es decir, los dos grupos fijos a la posición 4 del anillo de piperidina (cuando está presente) según se demuestra en las secciones anteriores. Esto es claro teniendo en cuenta las siguientes secciones adicionales que cita el Examinador, (iii) página 24, último párrafo, y (iv) página 25.

- (iii) Página 24, último párrafo. Este párrafo de D1 indica que entre los compuestos de la Fórmula (I), los de la Fórmula (II) (abajo) son compuestos preferidos:

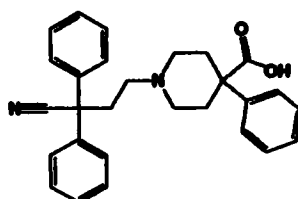


y

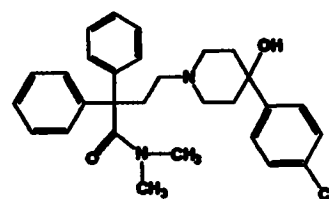
- (iv) Página 25. La descripción de estos compuestos preferidos de la Fórmula (II), página 25, continúa hasta los primeros dos párrafos de la página 26 de D1. Esta sección informa a las personas versadas que R³ es fenilo o fenilo sustituido y R⁷ es preferiblemente -OH (página 25, línea 6), y más preferiblemente, donde R⁴ es ciano, R⁷ es -C(O)OR¹⁷. D1 también provee que más compuestos preferidos de la Fórmula (II) son difeniloxilato y defenoxina, mientras que el compuesto más preferido de la Fórmula (II) es loperamida. A continuación se muestra la estructura química de cada uno de estos tres compuestos:



Difeniloxilato



Defenoxina



Loperamida

Es decir, en las secciones que cita el Examinador, D1 identifica los subgéneros y compuestos preferidos, más preferidos y aún más preferidos de la Fórmula (III) - y ninguno de esos compuestos incluye un medio ciano entre los grupos químicos que puedan seleccionarse para la variable R₃ o la variable R₇, que están fijos a la posición 4 del anillo piperidina.

Nuevamente, D1 no ofrece ninguna guía que pueda llevar a una persona versada seleccionar un grupo ciano para R₃ o R₇. Esta conclusión se refuerza aún más por las siguientes dos secciones de D1 que fueron citadas por el Examinador, (v) página 61 y (vi) página 174.

- (v) Página 61. La página 61 de D1 menciona que los compuestos particularmente preferidos de la Fórmula (II) son los de la Fórmula (IV), en la cual R⁷ se define como, y por lo tanto se limita a: -OH; no se sugiere, y mucho menos se menciona, que los compuestos descritos en la página 61 incluyen ninguno en el que R³ o R⁷ sea un medio ciano.
- (vi) Página 174. La página 174 de D1 muestra una Tabla donde se reporta la actividad biológica de morfina y otros ocho compuestos. La sociedad solicitante observa que todos estos ocho compuestos (excluida morfina) tiene un -OH fijo a la posición 4 del anillo piperidina, nuevamente, reforzando la mención no ambigua de D1 que dice que ninguno de los compuestos de interés lleva un medio ciano fijo a la posición 4 del anillo de piperidina. sin embargo, los datos en esta Tabla enseñan a la persona versada que los cambios reportados en la estructura química llevaron a cambios marcados en la actividad biológica.

(vii) Reivindicación 1. La Reivindicación 1 no ofrece ninguna información estructural. Por lo tanto, para la sociedad solicitante no es aparente por qué se citó esta reivindicación como apoyo al argumento del Examinador. Se solicita aclaración.

9. En resumen, la sociedad solicitante sostiene de manera respetuosa que D1 no enseña ni sugiere el compuesto de la reivindicación 14 propuesta, ni tampoco enseña ni sugiere que ninguno de los compuestos de la sociedad solicitante comprende un medio tetrazol en la posición 4 del anillo de piperidina. D1 describe la Fórmula (II) genérica (que a la vez es un subconjunto de la aún más amplia Fórmula (I)), la cual incluye 7 variables. Cada una de estas variables se describe como que abarca una selección grande de grupos químicos, los cuales a la vez, pueden incluir medios identificados utilizando variables adicionales (página 11, línea 1, hasta la página 21, línea 14 – excluyendo la discusión de las formas de sal de las mismas, que continúa hasta la página 23, línea 8). Aún cuando el medio ciano se provee dentro de la descripción de varias páginas de R⁷, en D1 no hay ninguna enseñanza o sugerencia que pueda llevar a una persona versada a seleccionar el grupo ciano para R³ o R⁷ de la Fórmula (II) de D1 en lugar de cualquier otro grupo químico identificado en la descripción de R³ o R⁷. De hecho, tal como se menciona arriba, D1 se aparta de los compuestos que comprenden un medio ciano en la posición 4 de un anillo de piperidina.

Por lo tanto, la sociedad solicitante sostiene que D1 no enseña ni sugiere nada que pueda llevar a una persona versada a escoger entre el número grande de grupos químicos citados provistos para cada una de las 7 variables de, por ej: la Fórmula (II), precisamente seleccionado solo el grupo específico para cada una de las 7 variables que, colectivamente, darían el compuesto de la reivindicación 14 propuesta.

10. Esta conclusión es aún más aparente con respecto a los compuestos de la presente invención que comprenden un medio tetrazol fijo a la posición 4 del anillo de piperidina. Esto se debe a que en más de 300 páginas de texto, D1 no enseña ni sugiere el uso de un medio tetrazol como un posible grupo químico para sustitución en la posición 4 del anillo de piperidina. Por ello, D1 no puede interpretarse razonablemente como que ofrece ninguna base que pueda llevar a una persona versada en la técnica a escoger entre el número grande de grupos químicos mencionados provistos para cada una de estas variables de por ej: la Fórmula (II) e identificar de alguna forma un medio que ni se enseña ni siquiera se sugiere en la descripción de más de 300 páginas de D1.

Tal como se menciona arriba, teniendo en cuenta los datos de la Tabla en la página 174 del D1, una persona versada reconocería que las variaciones en la estructura de los compuestos mencionados llevan a diferencias marcadas en la actividad biológica. Por ello, la persona experta no tendría ninguna base razonable para esperar que la sustitución de un grupo tetrazol, por ej: el grupo hidroxilo de los compuestos en la Tabla de la página 174 de D1 daría un compuesto con alguna actividad biológica, y mucho menos la misma actividad biológica.

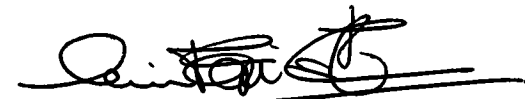
Por lo tanto, D1 no enseña ni sugiere el compuesto de la reivindicación 14 propuesta (reivindicación 110 original) ni los compuestos de las reivindicaciones 1 y 2 propuestas de la sociedad solicitante (es decir, los compuestos de la Fórmula I(a), I(b), I(c) y I(d)).

11. Teniendo en cuenta lo dispuesto por el Consejo de Estado en sentencia proferida dentro del Expediente No. 7684 el 22 de Octubre de 2004 y acogida

por esa Superintendencia mediante memorando interno de fecha 22 de Diciembre de 2004 dirigido a los funcionarios de la Delegatura de Propiedad Industrial, no se hace necesario acompañar comprobante de pago por concepto de modificación de la solicitud por cuanto el nuevo pliego reivindicatorio se presenta a instancia de la Superintendencia en cumplimiento de lo ordenado por el artículo 45 de la Decisión 486.

Renuncio al término faltante de traslado, y les solicito conceder el privilegio de patente de invención aquí tramitado.

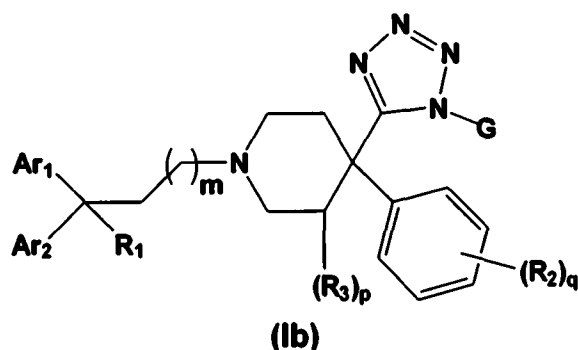
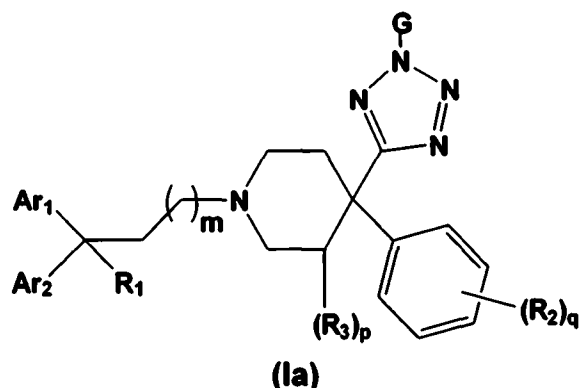
De Usted Atentamente,


LUIS FELIPE CASTILLO GIBSONE
T.P. 68.995 del C.S.J.

200
198

Reivindicaciones:

1. Un compuesto de la fórmula (Ia) o (Ib)



o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, en donde:

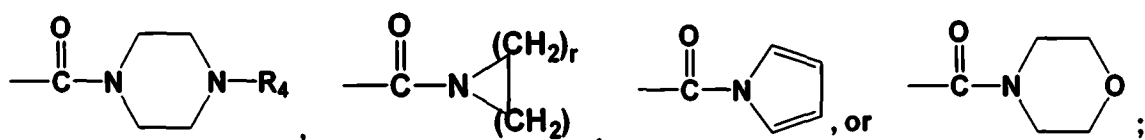
Ar₁ es cicloalquilo -C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

Ar₂ is fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

G es -H, -L-(CH₂)_nCO₂**R₄**, -L(CH₂)_n**R₅**, -(C₁-C₅ alquilenos)CO₂**R₄**, o (alquilenos C₁-C₅)**R₅**;

L = -C(O)-, -SO₂- o -SO-;

R₁ = H, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -CO₂**R₄**, -CHO, -CN, -(alquilo C₁-C₄), -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(C₁-C₄)₂,



R₂ and **R₃** son cada uno independientemente -halógeno, -alquilo C₁-C₃, -O(alquilo C₁-C₃), -NH(alquilo C₁-C₃), o -N(alquilo C₁-C₃)₂;

R₄ = -H, -alquilo C₁-C₁₀, -CH₂O(alquilo C₁-C₄), -CH₂N(alquilo C₁-C₄)₂, o -CH₂NH(alquilo C₁-C₄);

R₅ = -NH₂, -NH₂SO₂**R₄**, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -SO₂NH₂, -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(alquilo C₁-C₄)₂, -SO₂NH(alquilo C₁-C₄), -SO₂N(alquilo C₁-C₄)₂, -H, -OH, -CN, -cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

m = un entero de 0 a 4;

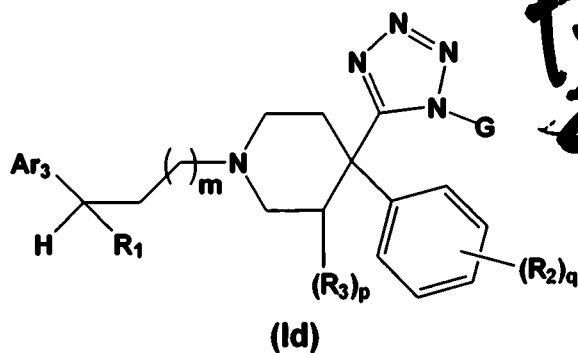
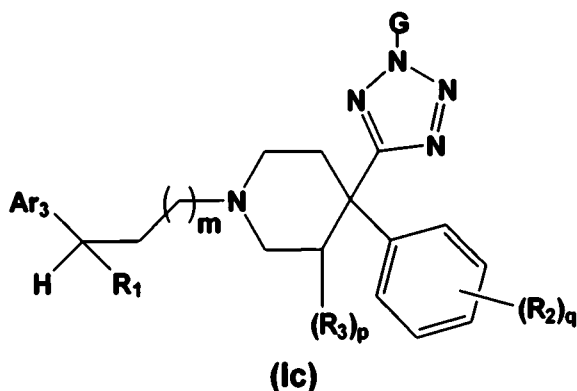
n = un entero de 1 a 4;

p = 0 o 1;

q = un entero de 0 a 3; y

r = un entero de 1 a 6.

2. Un compuesto de la formula (Ic) o (Id)



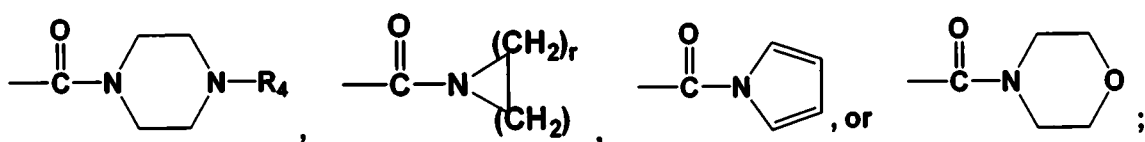
o una sal farmacéuticamente aceptable de lo mismo, en donde:

Ar₃ es fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

G is -H, -L-(CH₂)_nCO₂**R₄**, -L(CH₂)_n**R₅**, -(alquilenos C₁-C₅)CO₂**R₄**, o (alquilenos C₁-C₅)**R₅**;

L = -C(O)-, -SO₂-, o -SO-;

R₁ = H, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -CO₂**R₄**, -CHO, -CN, -(alquilo C₁-C₄), -C(O)NH(C₁-C₄ alquilo), -C(O)N(C₁-C₄)₂,



R₂ y **R₃** son cada uno independientemente halógeno, -alquilo C₁-C₃, -O(alquilo C₁-C₃), -NH(alquilo C₁-C₃), o -N(alquilo C₁-C₃)₂;

R₄ = -H, -alquilo C₁-C₁₀, -CH₂O(alquilo C₁-C₄), -CH₂N(alquilo C₁-C₄)₂, o -CH₂NH(alquilo C₁-C₄);

R₅ = -NH₂, -NH₂SO₂**R₄**, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -SO₂NH₂, -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(alquilo C₁-C₄)₂, -SO₂NH(alquilo C₁-C₄), -SO₂N(alquilo C₁-C₄)₂, -H, -OH, -CN, -cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

m = un entero de 0 a 4;

n = un entero de 1 a 4;

p = 0 or 1;

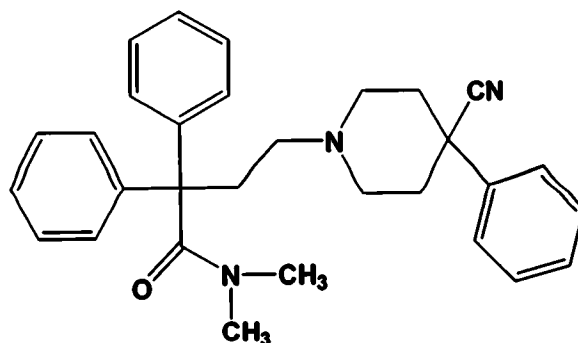
q = un entero de 0 a 3; y

r = un entero de 1 a 6.

3. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 1, en donde **Ar₁** y **Ar₂** son fenilo.
4. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 2, en donde **Ar₃** es fenilo.
5. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, en donde **m** = 1 y **G** = H.

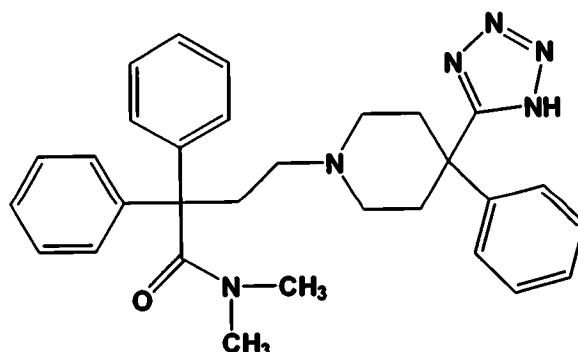
202
195
201

6. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, en donde R_1 es $-C(O)NH_2$, $-C(O)NH(\text{alquilo } C_1-C_4)$, $-C(O)N(\text{alquilo } C_1-C_4)$ (alquilo C_1-C_4), o CN .
7. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, en donde $p = 0$ y $q = 0$.
8. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, en donde $G = -(CH_2)_2NHSO_2H$, $-CH_2C(O)NH_2$, $-CH_2C(O)NH(\text{alquilo } C_1-C_4)$, $-CH_2C(O)N(\text{alquilo } C_1-C_4)(\text{alquilo } C_1-C_4)$, $-(CH_2)_2C(O)OCH_2CH_3$, o $-(CH_2)_4C(O)OCH_2CH_3$.
9. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, en donde $p = 1$.
10. Una composición que comprende una cantidad efectiva de un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1 ó 2, y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.
11. La composición de la reivindicación 10, que además comprende un analgésico opioide, un analgésico no opioide o un agente antiemético.
12. La composición de la reivindicación 10, que además comprende un agente antidiarreico.
13. Un kit médico para el tratamiento de dolor o diarrea que comprende un contenedor que contiene la composición de la reivindicación 10.
14. Un compuesto de la fórmula



o una sal farmacéutica del mismo.

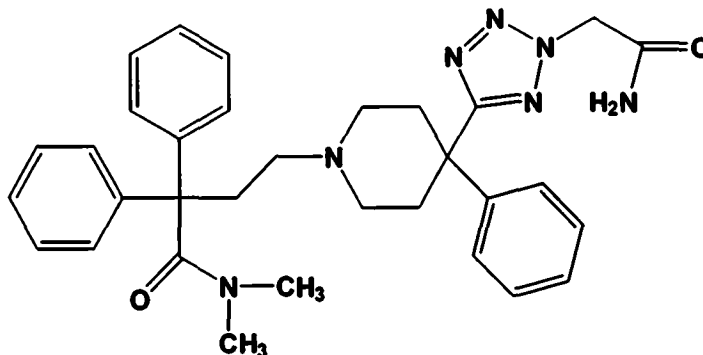
15. Un compuesto según la reivindicación 1 de la fórmula



203
196
202

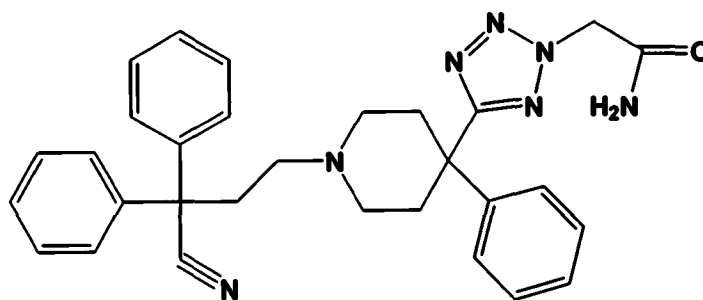
o una sal farmacéutica del mismo.

16. Un compuesto de la reivindicación 1 según la fórmula:



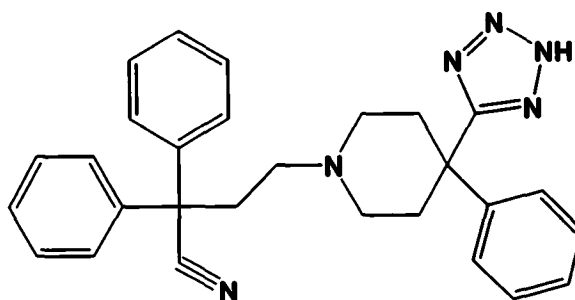
o una sal farmacéutica del mismo.

17. Un compuesto de la reivindicación 1 según la fórmula



o una sal farmacéutica del mismo.

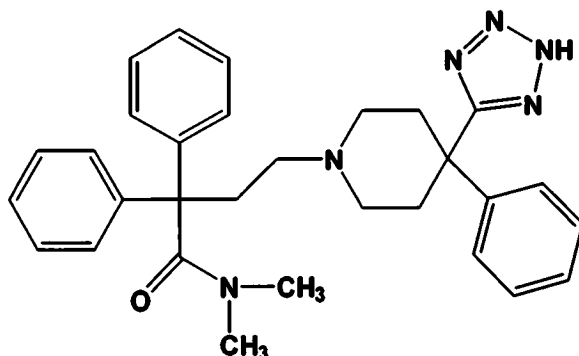
18. Un compuesto de la reivindicación 1 según la fórmula



o una sal farmacéutica del mismo.

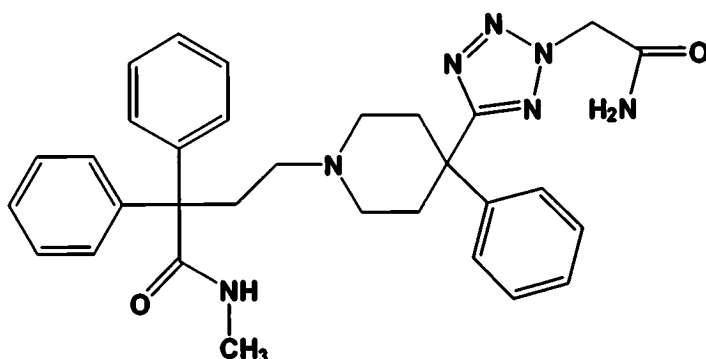
204
197
203

19. Un compuesto de la reivindicación 1 según la fórmula



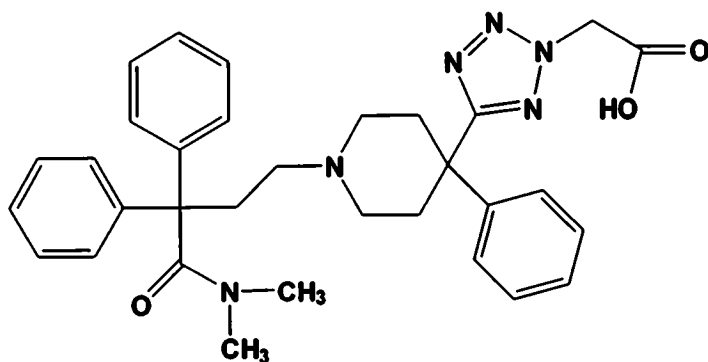
o una sal farmacéutica del mismo.

20. Un compuesto según la reivindicación 1 de la fórmula



o una sal farmacéutica del mismo.

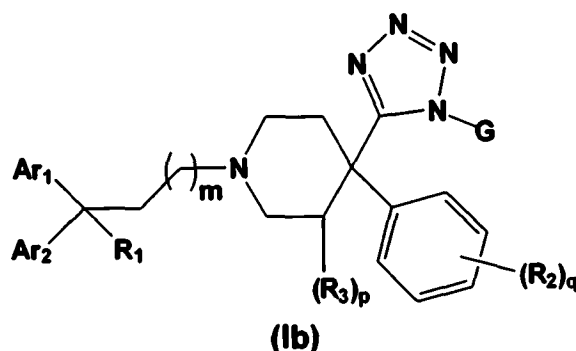
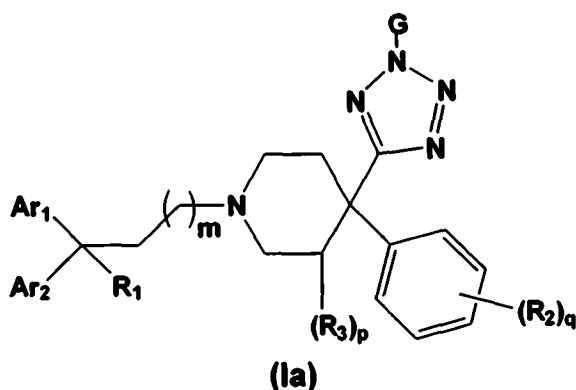
21. Un compuesto según la reivindicación 1 de la fórmula



o una sal farmacéutica del mismo.

22. Una cantidad efectiva de un compuesto de las reivindicaciones 1, 2, o 16-21, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una preparación de un medicamento para el tratamiento del dolor.
23. La cantidad efectiva de la reivindicación 22, en donde se administra además una cantidad efectiva de un analgésico opioide, de un analgésico no opioide o de un agente antiemético.

- 205
198
204
24. Una cantidad efectiva de un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1, 2 o 16-21, en la preparación de un medicamento, en donde se contacta una célula capaz de expresar un receptor opioide.
 25. La cantidad efectiva de la reivindicación 24, en donde el receptor es un receptor κ -opioide, a receptor μ -opioide, un receptor δ -opioide receptor, o un receptor ORL-1.
 26. Un método para preparar una composición, que comprende mezclar un compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de las reivindicaciones 1, 2 o 16-21, y un vehículo o excipiente farmacéuticamente aceptable.
 27. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 16-21, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para uso en un medicamento.
 28. Una cantidad efectiva de un compuesto de las reivindicaciones 1, 2 o 16-21 o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto en la preparación de un medicamento para el tratamiento de diarrea.
 29. La cantidad efectiva de la reivindicación 28, en donde se administra una cantidad efectiva de un analgésico opioide, de un analgésico no opioide, o de un agente antiemético.
 30. Un compuesto de la fórmula (Ia) o (Ib)



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para uso como medicamento, en donde:

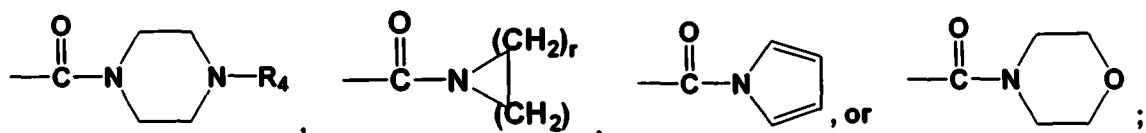
Ar₁ es -cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

Ar₂ is fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

G es -H, -L-(CH₂)_nCO₂**R₄**, -L(CH₂)_n**R₅**, -(alquilenos C₁-C₅)CO₂**R₄**, o (alquilenos C₁-C₅)**R₅**;

L = -C(O)-, -SO₂-, o -SO-;

R₁ = H, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -CO₂**R₄**, -CHO, -CN, -(alquilo C₁-C₄), -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(C₁-C₄)₂,



R₂ y **R₃** son cada uno independientemente -halógeno, -alquilo C₁-C₃, -O(alquilo C₁-C₃), -NH(alquilo C₁-C₃), o -N(alquilo C₁-C₃)₂;

R₄ = -H, -alquilo C₁-C₁₀, -CH₂O(alquilo C₁-C₄), -CH₂N(alquilo C₁-C₄)₂, o -CH₂NH(alquilo C₁-C₄);

R₅ = -NH₂, -NH₂SO₂**R₄**, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -SO₂NH₂, -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(alquilo C₁-C₄)₂, -SO₂NH(alquilo C₁-C₄), -SO₂N(alquilo C₁-C₄)₂, -H, -OH, -CN, -cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

m = un entero de 0 a 4;

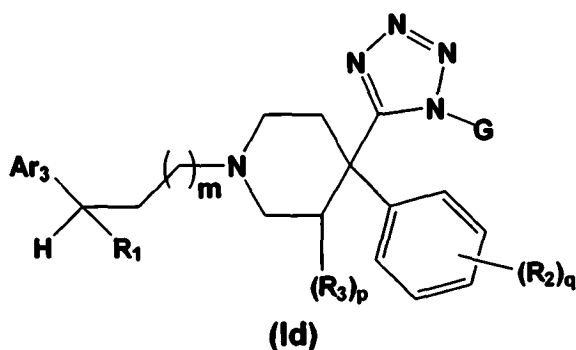
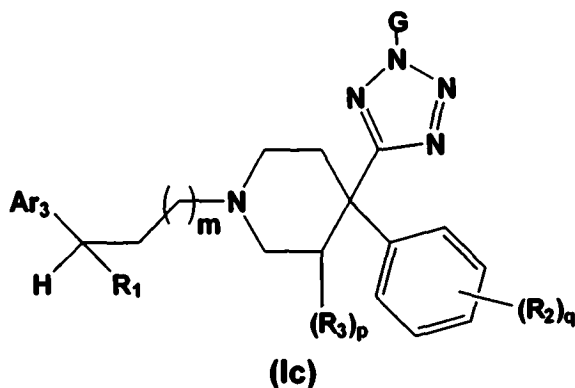
n = un entero de 1 a 4;

p = 0 o 1;

q = un entero de 0 a 3; y

r = un entero de 1 a 6.

31. Un compuesto de la fórmula (Ic) o (Id)



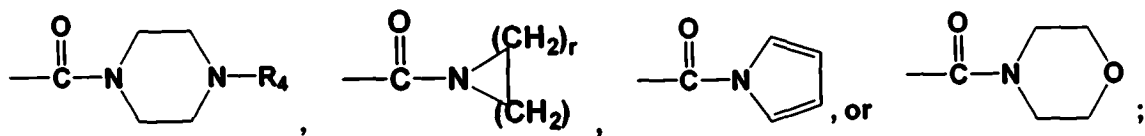
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo para uso como medicamento, en donde:

Ar₃ es fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o -heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

G es -H, -L(CH₂)_nCO₂**R₄**, -L(CH₂)_n**R₅**, -(alquilenos C₁-C₅)COOR₄, o (alquilenos C₁-C₅)**R₅**;

L = -C(O)-, -SO₂-, o -SO-;

R₁ = H, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -CO₂**R₄**, -CHO, -CN, -(alquilo C₁-C₄), -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(C₁-C₄)₂,



R₂ y **R₃** son cada uno independientemente halógeno, -alquilo C₁-C₃, -O(alquilo C₁-C₃), -NH(alquilo C₁-C₃), o -N(alquilo C₁-C₃)₂;

R₄ = -H, -alquilo C₁-C₁₀, -CH₂O(alquilo C₁-C₄), -CH₂N(alquilo C₁-C₄)₂, o -CH₂NH(alquilo C₁-C₄);

R₅ = -NH₂, -NH₂SO₂**R₄**, -C(O)NH₂, -C(O)NHOH, -SO₂NH₂, -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(alquilo C₁-C₄)₂, -SO₂NH(alquilo C₁-C₄), -SO₂N(alquilo C₁-C₄)₂, -H, -OH, -CN, -cicloalquilo C₃-C₈, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrilo o -heteroarilo (de 5 a 7 miembros), cada uno sustituido o insustituido con uno o más grupos **R₂**;

m = un entero de 0 a 4;

207
2005
15

n = un entero de 1 a 4;

p = 0 o 1;

q = un entero de 0 a 3; y

r = un entero de 1 a 6.

32. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 30, en donde **Ar₁** y **Ar₂** son fenilo.
33. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable of the compound of reivindicación 31, wherein **Ar₃** is fenilo.
34. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable of the compound of reivindicación s 30 or 31, wherein **m** = 1 and **G** = H.
35. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 30 ó 31, en donde **R₁** es -C(O)NH₂, -C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -C(O)N(alquilo C₁-C₄) (alquilo C₁-C₄), o CN.
36. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 30 ó 31, en donde **p** = 0 y **q** = 0.
37. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 30 ó 31, en donde **G** = -(CH₂)₂NHSO₂H, -CH₂C(O)NH₂, -CH₂C(O)NH(alquilo C₁-C₄), -CH₂C(O)N(alquilo C₁-C₄)(alquilo C₁-C₄), -(CH₂)₂C(O)OCH₂CH₃, o -(CH₂)₄C(O)OCH₂CH₃.
38. El compuesto o una sal farmacéuticamente aceptable del compuesto de la reivindicación 30 ó 31, en donde **p** = 1.

207
208

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

202012
Bogotá, D.C., 04 de diciembre de 2009

Apoderado: LUIS FELIPE CASTILLO GIBSON

ASUNTO	Radicación	05-48789
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	158
	Folios	

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:

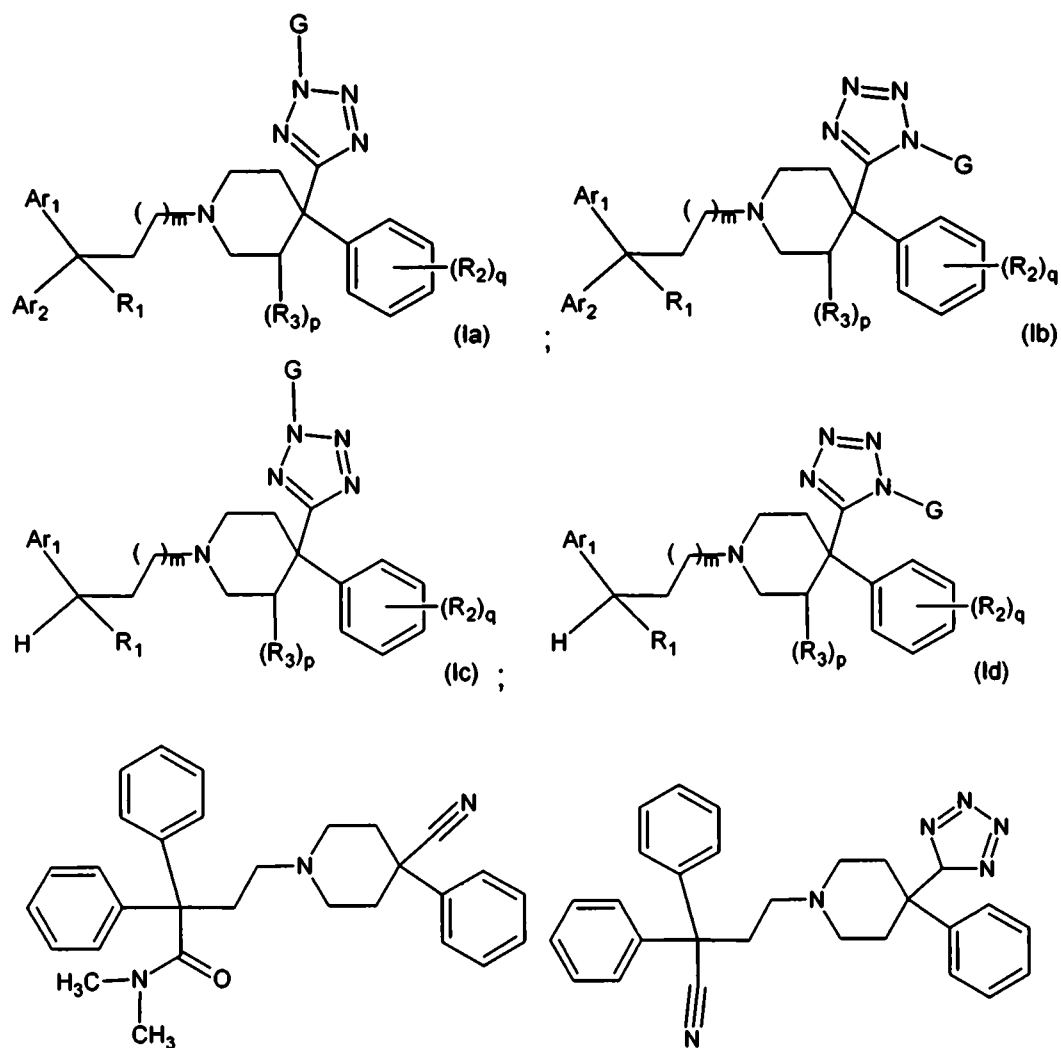
1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios: 04 a 138 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 138 a 151 como se radicó inicialmente
Folios
- 1.3. Prioridad: Folios 1: 18 de noviembre de 2002, US 60/427.381.

2. Objeto de la invención

Nuevo título de la solicitud: DERIVADOS DE 4-TETRAZOLILO-4 FENILPIPERIDINA PARA EL TRATAMIENTO DEL DOLOR.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en los compuestos de fórmula:



El objeto de la invención se clasificó de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC): A61K31/343, A61K31/381, A61P25/00, C07D307/87 , C07D333/72 , C07C229/02, C07C211/03.

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486 de la C.A.N.)

-La reivindicación 13 referente a un kit, el cual no aparece técnicamente sustentado como tal, ni tampoco aparece definido por sus características técnicas, tal como ya se había indicado en el primer examen e patentabilidad, y se hizo caso omiso a la objeción.

-Las reivindicaciones 23 a 29, no delimitan el alcance de las reivindicaciones, porque el segundo principio activo no está definido, esta mencionado de manera especulativa, por un efecto desaseado o a conseguir y sin sustento técnico real en la descripción, de tales las mezclas de principios activos, reclamadas como "composición", por el mero hecho de enumerar analgésicos o cualquier otro componente no es un soporte técnico, tal como se había indicado en el primer examen de patentabilidad y se ha rehusado a corregir apropiadamente la solicitud al respecto.

209
209

-Las reivindicaciones 1 y 30, 2 y 31, son redundantes entre sí, reclaman doblemente la misma materia, el hecho de que le agreguen la frase "*para uso como medicamento*" en las reivindicaciones 30 y 31, no le confiere una característica técnica particular como compuestos, que los haga diferentes a los ya reclamados en las reivindicaciones 1 y 2.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486 de la C.A.N)

El capítulo reivindicatorio carece de unidad de invención a posteriori por lo siguiente:

Al hacer la revisión correspondiente por parte de esta oficina estos pueden ser los grupos de invención que se distinguen:

- (i) Compuestos derivados de 4-[4-(4-fenil)- 4-ciano-1-piperidil]- N,N-dimetil-2,2-difenil-butanamida
- (ii) Compuestos derivados de (3-ciano-3,3-difenil-propil)- 4-fenil-piperidinil-4-tetrazol
- (iii) Compuestos derivados de 4-(4-ciano-4-fenilpiperidin-1-il)-N,N-dimetil-2,2-Difenilbutanamida
- (iv) Compuestos derivados de : 4-(4-tetrazol-4-fenil-1-piperidil)-N,N-dimetil-2,2-difenil-butanamida

Cada una de estas invenciones, es una invención distinta caracterizada por su propia característica estructural nueva.

5. Conclusión:

-A pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, porque se ha rehusado a corregir las objeciones realizadas en el primer examen de patentabilidad, y se ha presentado una respuesta con modificaciones de manera que subsisten los mismos defectos además de la unidad inventiva.

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.


JESUS FERNEL GARCIA GARCIA
Director de nuevas creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
08 ENE. 2010

CONCEPTO TECNICO No. 4378 EXAMINADOR TECNICO Código N°.202012