

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

P2006/000047

SOLICITUD DE:

1

☐

Corrección de Error Material.

☒

Modificación a una Solicitud.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: ELI LILLY AND COMPANY

Dirección: Lilly Corporate Center, Indianápolis
Indiana 46285 E.U.A.

Nacionalidad o Domicilio: Estadounidense
Lugar de Constitución: Estados Unidos de América

Teléfono: _____
E-mail: _____

Fax: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: CARLOS R. OLARTE

Dirección: World Trade Center Torre A
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10. Bogotá

Teléfono: 601-7700 **Fax:** 601-7799

E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747 Bta
TP 74.295

4

Número de expediente:
06-038.099

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada VER PAGINA ADJUNTA

6

Comprobante de pago No. 08-33,065

Fecha Abril 24 de 2008

7

Anexos

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso. Documento que soporta la cesión de Derechos.

☐

Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.

8

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA:

C.C. 79.782.747 Bta T.P. 74.295

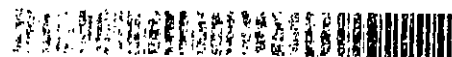
149 149
7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

VIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 33,065
FECHA : ABRIL 24 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-038059-00004-0000

LEY 1529 NUECREACION
LEY 178 FASENACIONALI
Folios 8

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
DLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	598754	23/04/2008	5,180,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEAS COMERCIALES	103,000.00
		TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

150
150
3

ANEXO EXPLICATIVO DE LAS MODIFICACIONES

Las Reivindicaciones fueron modificadas de la siguiente manera.

La nueva Reivindicación 1 incorpora las antiguas reivindicaciones 1 a 7.

Las antiguas Reivindicaciones 2 a 7 fueron eliminadas

La nueva Reivindicación 2 incorpora las antiguas reivindicaciones 8 a 16.

Las antiguas Reivindicaciones 8 a 16 fueron eliminadas.

Las nuevas Reivindicaciones 3 y 4 corresponden a las antiguas Reivindicaciones 17 y 18.

Las nuevas Reivindicaciones 5 a 13 corresponden a las antiguas Reivindicaciones 19 a 21, 23 a 24, 26 a 27, 29 a 30.

Las antiguas Reivindicaciones 22, 25, 28 fueron eliminadas.

Las antiguas Reivindicaciones 31 a 37 fueron eliminadas.

La nueva Reivindicación 15 incorpora las antiguas Reivindicaciones 43 a 48.

Las nuevas Reivindicaciones 14, 16 a 20 corresponden a las antiguas Reivindicaciones 38, 39 a 42 y 49.

REIVINDICACIONES MODIFICADAS

151
151

1. Una Forma IV cristalina de {2-[1-(3,5-bis(trifluorometil)bencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona, caracterizada por al menos uno de los que sigue:

- a) un espectro de resonancia magnética nuclear ^{13}C de estado sólido, que comprende picos en los siguientes cambios químicos: 52.3 ± 0.2 y 195.4 ± 0.2 ppm;
- b) un patrón de difracción en polvo de rayos-X que comprende al menos dos picos, en donde un pico es $12.1 \pm 0.1^\circ$, y el segundo pico se selecciona del grupo que consiste de $8.3 \pm 0.1^\circ$, $14.3 \pm 0.1^\circ$, $16.6 \pm 0.1^\circ$, $16.9 \pm 0.1^\circ$, y $18.5 \pm 0.1^\circ$ en 2θ ;
- c) un patrón de difracción en polvo de rayos-X que comprende al menos, los siguientes picos: $8.3 \pm 0.1^\circ$, $12.1 \pm 0.1^\circ$, $16.6 \pm 0.1^\circ$, $16.9 \pm 0.1^\circ$, y $18.5 \pm 0.1^\circ$ en 2θ .

2. Una Forma V cristalina de {2-[1-(3,5-bis(trifluorometil)bencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona, caracterizada por al menos uno de los siguientes:

- a) un espectro de resonancia magnética nuclear ^{13}C de

152
8/152

estado sólido, que comprende picos en los siguientes cambios químicos: 54.3 ± 0.2 y 196.6 ± 0.2 ppm.

b) un patrón de difracción en polvo de rayos-X que comprende al menos dos picos, en donde un pico es $12.5 \pm 0.1^\circ$, y el segundo pico se selecciona del grupo que consiste de $15.8 \pm 0.1^\circ$, $16.5 \pm 0.1^\circ$, $19.1 \pm 0.1^\circ$, $19.7 \pm 0.1^\circ$, $21.5 \pm 0.1^\circ$, $25.3 \pm 0.1^\circ$, $27.7 \pm 0.1^\circ$ y $28.6 \pm 0.1^\circ$ en 2θ .

c) un patrón de difracción en polvo de rayos-X que comprende al menos, los siguientes picos: $12.5 \pm 0.1^\circ$, $25.3 \pm 0.1^\circ$, $27.7 \pm 0.1^\circ$, y $28.6 \pm 0.1^\circ$ en 2θ .

3. Un compuesto, que es (2-clorofenil)-[2-(2-hidroxi-2-piridin-4-il-vinil) piridin-3-il]metanona o una sal del mismo.

4. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 3, caracterizado porque es fosfato de (2-clorofenil)-[2-(2-hidroxi-2-piridin-4-il-vinil)piridin-3-il]metanona.

5. Un proceso para preparar un compuesto, que es {2-[1-(3,5-bistrifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona, caracterizado porque comprende hacer reaccionar (2-clorofenil)-{2-(2-hidroxi-2-piridin-4-il-vinil)piridin-3-

153
153
b

il]metanona o una sal de fosfato del mismo, con 1-azidometil-3,5,-bistrifluorometilbenceno en la presencia de una base adecuada y un solvente.

6. El proceso de conformidad con la reivindicación 5, caracterizado porque la base es carbonato de potasio.

7. El proceso de conformidad con la reivindicación 5 ó 6, caracterizado porque el solvente se selecciona del grupo que consiste de dimetilsulfóxido, isopropanol, etanol, tetrahidrofurano y tolueno.

8. Un proceso para preparar el compuesto de la Reivindicación 1, caracterizado porque comprende la cristalización de {2-[1-(3,5-bistrifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona a partir de un solvente.

9. El proceso de conformidad con la reivindicación 8, caracterizado porque el solvente se selecciona del grupo que consiste de isopropanol, acetona, acetonitrilo, propanol, butanol, acetato de etilo, éter butílico terciario metílico y diclorometano.

10. Un proceso para preparar el compuesto de la Reivindicación 1, caracterizado porque comprende cristalización de {2-[1-(3,5-bistrifluorometilbencil)-5-

154
154
5

piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona por transformación de fase mediada por solución.

11. Un proceso para preparar el compuesto de la Reivindicación 2, caracterizado porque comprende cristalización de {2-[1-(3,5-bistrifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona a partir de una mezcla de un solvente y un anti-solvente.

12. El proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el solvente es metanol o etanol.

13. El proceso de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 27 a 29, caracterizado porque el anti-solvente es agua.

14. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto de las reivindicaciones 1 o 2, en combinación con uno o más portadores, excipientes o diluyentes farmacéuticamente aceptables.

15. La composición de conformidad con la reivindicación 14, caracterizada porque comprende al menos uno de los siguientes: manitol, celulosa microcristalina, hidroxipropilcelulosa, dióxido de sílica coloidal, croscarmelosa de sodio y ácido esteárico.

155
~~155~~
8

16. La composición de conformidad con la reivindicación 14 o 15, caracterizada porque comprende un tensoactivo aniónico.

17. La composición de conformidad con la reivindicación 16, caracterizada porque el tensoactivo aniónico es laurilsulfato de sodio.

18. La composición de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 14 a 17, caracterizada porque comprende un ácido.

19. La composición de conformidad con la reivindicación 18, caracterizada porque el ácido es ácido cítrico.

20. La composición de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 14 a 19, caracterizada porque comprende la Forma IV cristalina de {2-[1-(3,5-bistrifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il)-(2-clorofenil)-metanona.

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-38099

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **580** DE

FECHA **28 DE SEPTIEMBRE DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL **27 DE DICIEMBRE DE 2007**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO X



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

04-104176

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21 EXPEDIENTE No. 04-104176

54 TÍTULO Derivados de triazol como antagonistas
de receptores de fagocinina.

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL A61K 31/413; A61K 31/439,
A61K 31/501.

71 SOLICITANTE Eli Lilly and Company
Lilly Corporated center, Indianapolis.
DOMICILIO IN 46285 E.U.A.

74 APODERADO Carlos R. Obarrio

22 BOGOTÁ, D. C., Octubre 15, 2004

55

158
206

Compounds" (Wiley-Interscience 1994) y J. Jacques, A. Collet y S.H. Wilen, "Enantiomers, Racemates, and Resolutions", Wiley-Interscience 1981). Se entiende que la presente invención contempla todos los enantiómeros y mezclas de enantiómeros, incluyendo los racematos.

5 El experto reconocerá que los compuestos de la presente invención pueden existir en forma de tautómeros. Se entiende que las formas tautoméricas de los compuestos de fórmula (I) están también abarcadas en la presente invención.

10 Esta invención incluye las sales farmacéuticamente aceptables de los compuestos de fórmula I. Un compuesto de esta invención puede poseer un grupo funcional suficientemente básico que puede reaccionar con cualquiera de una serie de ácidos inorgánicos y orgánicos formando una sal farmacéuticamente aceptable.

15 La expresión "sal farmacéuticamente aceptable" como se utiliza en la presente memoria, designa una sal de un compuesto de la fórmula I anterior. Debe reconocerse que el contralón particular que forma parte de cualquier sal de esta invención no es habitualmente de naturaleza crítica, a condición de que la sal en conjunto sea farmacológicamente aceptable y a condición de que el contralón no contribuya a cualidades indeseables en la sal en conjunto.

20 El compuesto de fórmula I y los intermedios descritos en la presente memoria forman sales de adición de ácido farmacéuticamente aceptables con una amplia variedad de ácidos orgánicos e inorgánicos, e incluyen las sales fisiológicamente aceptables que se utilizan a menudo en la química farmacéutica. Dichas sales son también parte de esta invención. Se forma una
25 sal de adición de ácido farmacéuticamente aceptable a partir de un ácido

159
702

farmacéuticamente aceptable, como es bien sabido en la técnica. Dichas sales incluyen las sales farmacéuticamente aceptables enumeradas en Journal of Pharmaceutical Science, 66, 2-19 (1977), que son conocidas por el experto en la técnica. Los ácidos inorgánicos típicos utilizados para formar dichas sales

5 incluyen ácido clorhídrico, bromhídrico, yodhídrico, nítrico, sulfúrico, fosfórico, hipofosfórico, metafosfórico, pirofosfórico y similares. Pueden utilizarse también sales derivadas de ácidos orgánicos tales como ácidos alifáticos mono- y dicarboxílicos, ácidos alcanólicos sustituidos con fenilo, ácidos hidroxialcanólicos e hidroxialcanodiolicos, ácidos aromáticos, ácidos sulfónicos

10 alifáticos y aromáticos. Dichas sales farmacéuticamente aceptables incluyen por tanto acetato, fenilacetato, trifluoroacetato, acrilato, ascorbato, benzoato, clorobenzoato, dinitrobenzoato, hidroxibenzoato, metoxibenzoato, metilbenzoato, orto-acetoxibenzoato, naftaleno-2-benzoato, bromuro, isobutirato, fenilbutirato, α -hidroxibutirato, butin-1,4-dicarboxilato, hexin-1,4-

15 dicarboxilato, caprato, caprilato, cinnamato, citrato, formiato, fumarato, glicolato, heptanoato, hipurato, lactato, malato, maleato, hidroxmaleato, malonato, mandelato, mesilato, nicotinato, isonicotinato, nitrato, oxalato, ftalato, tereftalato, propiolato, propionato, fenilpropionato, salicilato, sebacato, succinato, suberato, bencenosulfonato, para-bromobencenosulfonato,

20 clorobencenosulfonato, etilsulfonato, 2-hidroxietilsulfonato, metilsulfonato, naftaleno-1-sulfonato, naftaleno-2-sulfonato, naftaleno-1,5-sulfonato, para-toluenosulfonato, xlenosulfonato, tartrato y similares.

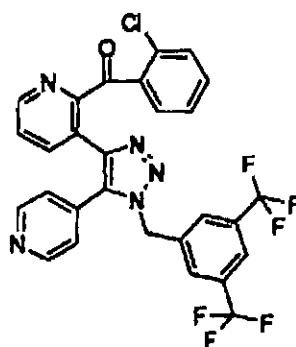
Como se utiliza en la presente memoria, el término "paciente" designa un mamífero que está aquejado por uno o más trastornos asociados a taquiclininas

25 en exceso. Los conejillos de indias, perros, gatos, ratas, ratones, caballos,

160
16/11/2
441

Ejemplo 258

{3-[1-(3,5-Bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-2-il}-
(2-clorofenil)metanona



- 5 Se añade $\text{Pd}_2(\text{dba})_3 \cdot \text{CHCl}_3$ (42 mg, 0,04 mmol) a una solución desgasificada de éster 2-(2-clorobenzil)piridin-3-ílico del ácido trifluorometanosulfónico (148 mg, 0,41 mmol) y 4-[3-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-tributílestannanil-3H-[1,2,3]triazol-4-il]piridina (288 mg, 0,45 mmol) en tolueno (2 ml). Se sella la mezcla en atmósfera de N_2 y se
- 10 calienta a 120°C durante 2 horas. Se añade $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (94 mg, 0,08 mmol), se sella y se calienta a 120°C durante otras 48 horas. Se concentra, se disuelve en ACN, se lava con hexanos (x3), se seca sobre MgSO_4 y se concentra. Se purifica el residuo mediante cromatografía ultrarrápida en gel de sílice, eluyendo con 0-10% de ACN/ Et_2O , proporcionando el compuesto del título (28
- 15 mg, 11%) en forma de un sólido de color tostado. EM (PI) 588 (M+1). TLC: R_f 0,33 (10% de ACN/ Et_2O).

2 Los compuestos de la presente invención pueden administrarse solos o en forma de una composición farmacéutica, es decir, combinados con

161
162
163
164

vehículos o excipientes farmacéuticamente aceptables, cuya proporción y naturaleza están determinados por la solubilidad y las propiedades químicas de los compuestos seleccionados, la vía elegida de administración y la práctica farmacéutica estándar. Los compuestos de la presente invención, aunque
5 eficaces por sí mismos, pueden formularse y administrarse en forma de sus sales farmacéuticamente aceptables con fines de estabilidad, conveniencia de cristalización, solubilidad aumentada y similares.

Por tanto, la presente invención proporciona composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de fórmula I y un diluyente
10 farmacéuticamente aceptable.

Los compuestos de fórmula I pueden administrarse mediante una variedad de vías. Al efectuar el tratamiento de un paciente aquejado por los trastornos descritos en la presente memoria, puede administrarse un compuesto de fórmula I en cualquier forma o modo que haga al compuesto
15 biodisponible en una cantidad eficaz, incluyendo las vías oral y parenteral. Por ejemplo, los compuestos de fórmula I pueden administrarse por vía oral, mediante inhalación, por vía subcutánea, intramuscular, intravenosa, transdérmica, intranasal, rectal, ocular, tópica, sublingual, bucal y similares. La administración oral se prefiere generalmente para el tratamiento de los
20 trastornos neurológicos y psiquiátricos descritos en la presente memoria.

Un experto en la técnica de preparar formulaciones puede seleccionar fácilmente la forma y modo apropiados de administración dependiendo de las características particulares del compuesto seleccionado, del trastorno o la afección a tratar, de la etapa del trastorno o afección y de otras circunstancias
25 relevantes ("Remington's Pharmaceutical Sciences", 18ª edición, Mack

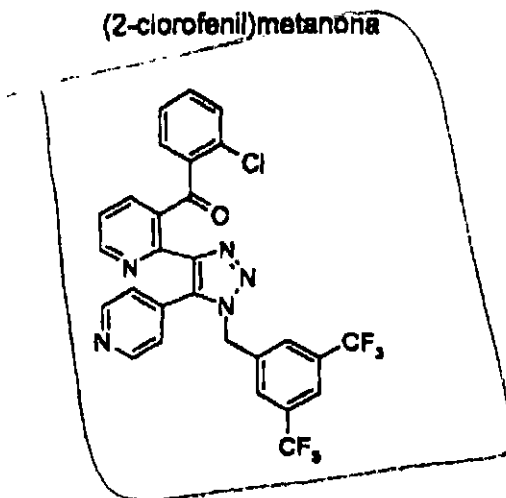
307/162
308
309
40

643,1; espectro de masas (PI): $m/z = 643,9$ (M+1), $m/z = 641,8$ (M-1); $^1\text{H-RMN}$ (250 MHz, CDCl_3) δ 9,69 (s, 0,6H), 8,39 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,15-7,49 (m, 5H), 7,27 (s, 2H), 6,80-7,05 (m, 5H), 5,26 (s, 2H), 2,16 (s, 3H).

5

Ejemplo 132

{2-[1-(3,5-Bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il}-(2-clorofenil)metanona



Se combinan 4-[3-(3,5-bis(trifluorometilbencil)-5-tributylestannanil-3H-
10 [1,2,3]triazol-4-il]piridina (489 g, 740 mmol) y tolueno (1 l), y se añade (2-
bromopiridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona (240 g, 810 mmol) en tolueno (500 ml).
A continuación, se añaden tris(dibencilidenacetona)dipaladio (16,95 g, 18,5
mmol) y tolueno (300 ml). Se añade tri-2-furilfosfina (17,35 g, 74 mmol) en
tolueno (200 ml), y se calienta la mezcla de reacción a reflujo (113°C). Tras la
15 terminación de la reacción, se retira el disolvente mediante rotavapor y se
purifica el producto bruto mediante cromatografía en columna ultrarrápida
(gradiente de diclorometano/acetato de etilo). Se trata el material con carbón
activado en acetato de etilo, se lava con una solución acuosa de sal trisódica

163
163
163
163

-N-CH-CH-CR⁸-.
.

18. El compuesto de la reivindicación 1, en el que el compuesto se selecciona del grupo constituido por:

5 { (2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

{4-amino-2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-fenil-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

10 {5-amino-3-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-fenil-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridazin-4-il)-(2-clorofenil)metanona,

{4-amino-2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

{5-amino-3-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridazin-4-il)-(2-clorofenil)metanona,

15 {2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-3-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

{2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il}fenilmetanona,

20 {5-amino-3-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-pirimidin-5-il-1H-[1,2,3]-triazol-4-il]piridazin-4-il)-(2-clorofenil)metanona,

{4-amino-2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-morfolin-4-il-1H-[1,2,3]-triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

{2-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-pirazin-2-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]piridin-3-il)-(2-clorofenil)metanona,

25 {3-[1-(3,5-bis-trifluorometilbencil)-5-piridin-3-il-1H-[1,2,3]triazol-4-

164
~~164~~

~~163~~

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE.

ASUNTO	Radicación	06038099
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	12594
	Folios	011

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT/US2004/030914
Fecha de Presentación Internal.	12-10-2004.

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:

Documentos estudiados

<u>Descripción:</u>	Folios: 51 a 106 (como se radicó inicialmente)
<u>Reivindicaciones:</u>	Folios: 107 a 115 (como se radicó inicialmente)
	Folios: 151 a 155 Modificado en fase internacional.
<u>Prioridad:</u>	Folio 1 (24-10-2003, US60/514.300).

Se acepta para estudio el capítulo reivindicatorio de los folios 151 a 155.

Objeto de la invención

Título de la solicitud: NUEVAS FORMAS CRISTALINAS DE {2-[1-(3,5-BIS-TRIFLUOROMETIL-BENCIL)-5-PIRIDIN-4-IL-1H-[1,2,3]TRIAZOL-4-IL]-PIRIDIN-3-IL}-(2-CLOROFENIL)-METANONA.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en formas cristalinas IV y V del compuesto {2-[1-(3,5-BIS-TRIFLUOROMETIL-BENCIL)-5-

PIRIDIN-4-IL-1H-[1,2,3]TRIAZOL-4-IL]-PIRIDIN-3-IL}-(2-CLOROFENIL)-METANONA.

Reivindicación 1 : Una forma cristalina IV de {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona.

Reivindicación 2 : Una forma cristalina V de de {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona.

Reivindicaciones 3-4 : Un compuesto que es {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona o una sal del mismo.

Reivindicaciones 5-7 : Un proceso para preparar un compuesto que es el {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona o una sal del mismo.

Reivindicaciones 8-10 : Un proceso para preparar la forma cristalina IV.

Reivindicaciones 11-13: Un proceso para preparar la forma cristalina V.

Reivindicaciones 14-20: Una composición farmacéutica que las contiene.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de formas altamente cristalinas del compuesto {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona, que pueda ser reproduciblemente y eficientemente preparada a escala comercial.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona las formas cristalinas IV y V del compuesto {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1h-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona , composiciones farmacéuticas que las contienen y proceso para prepararlas.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC): C07D401/04, C07D213/46,A61K31/44,A61P25/00.

De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Las reivindicaciones 1 y 2 no son claras ni concisas cuando se utiliza el término " al menos". Se le sugiere al solicitante eliminarlo.

Las reinvidicaciones 8 y 10 no son claras cuando se habla de " Un proceso para preparar el compuesto de la reivindicación 1 ". En este caso no se esta preparando el compuesto sino la forma cristalina (IV). Se le sugiere al solicitante cambiar la palabra "compuesto" por " forma cristalina (IV).

La reinvidicación 11 no es clara cuando se habla de " Un proceso para preparar el compuesto de la reivindicación 2 ". En este caso no se esta preparando el compuesto sino la forma cristalina (V). Se le sugiere al solicitante cambiar la palabra "compuesto" por " forma cristalina (V).

La reivindicación 14 no es clara cuando se habla de " Una composición farmacéutica caracterizada porque comprende " un compuesto " de las reivindicaciones 1 o 2 Se le sugiere al solicitante cambiar la palabra "compuesto" por " una forma cristalina" .

La reivindicación 13 no es clara ya que se reclama el proceso de acuerdo con las reivindicaciones 27 a 29?. No depende de la 11?.

Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 24-10-2003, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	C04-104176	DERIVADOS DE TRIAZOL COMO ANTAGONISTAS DE RECEPTORES DE TAQUICININA	15-10-2004*

* Corresponde a la publicación internacional WO03091226 de fecha de prioridad : 26-04-2002.

Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

Respecto a la solicitud en estudio

Las reivindicación 3 dice " : Un compuesto que es {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona o una sal del mismo" .

Respecto al estado de la técnica

D1 (Folio 163 , reivindicación 16) divulga el compuesto {2-[1-(3,5-bis-trifluorometil-bencil)-5-piridin-4-il-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-piridin-3-il}-(2-clorofenil)-metanona o una sal del mismo". Dentro de las sales se encuentran aquellas derivadas de ácidos inorgánicos como el ácido fosfórico (sal fosfato) . (Ver folio 159, líneas 4-22)

Por lo tanto el documento D1 ya divulga el compuesto reclamado en la actual solicitud , por lo que no es nuevo.

Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	C04-104176	3-4	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 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
Dirección de Nuevas Creaciones (C).

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
13 NOV. 2009.

CONCEPTO TÉCNICO No. 3408	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202075
-------------------------------------	--