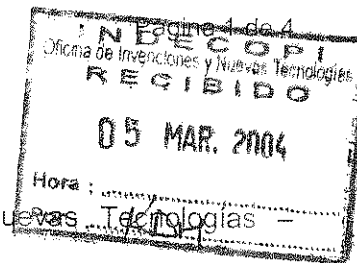


INFORME TÉCNICO VDG 09 – 2004

A : Sr. Néstor Escobedo Ferradas
Jefe de la Oficina de Invenciones y Nuevas Tecnologías - INDECOPI

DE : Q.F. Víctor Durand Guevara – Examinador Externo

ASUNTO : Examen de Fondo de la Solicitud de Patente de Invención
"DERIVADOS DE 3-AMINO-3-ARILPROPANO-1-OL CON EFECTO ANALGÉSICO"

EXPEDIENTE : 000296 – 2000 / OIN de fecha 2000.04.04

PRIORIDAD : DE 19915602.6 de fecha 1999.04.07

1. TEXTO ANALIZADO

- (X) Memoria descriptiva originalmente presentada.
- (X) 31 reivindicaciones originalmente presentadas.
- (X) Escrito de fecha 2000.09.13 mediante el cual se presentan nuevas páginas 8, 9, 10, 11, 12, 16, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35 y 42.
- (X) Escrito de fecha 2000.09.15 mediante el cual se presentan nuevas páginas 8, 9, 10, 11, 12, 16, 19, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35 y 42, que reemplazan a los presentados mediante escrito de fecha 2000.09.13 y no implican una ampliación de la invención originalmente presentada (Artículo 34 de la Decisión 486).

2. SUFICIENCIA Y CLARIDAD DE LA INVENCIÓN

A. La descripción de la invención permite la comprensión del problema técnico y la solución que plantea la invención a dicho problema, por lo tanto la memoria descriptiva CUMPLE con los requisitos del Artículo 28 de la Decisión 486.

B. Las reivindicaciones 1 a 15 definen la materia que se desea proteger, son claras, concisas y se encuentran sustentadas en la descripción, con la precisión que en la reivindicación 1 la expresión "y/o" es ambigua y representa un término impreciso, por lo que se recomienda reemplazarlo por "y" o una coma.

C. La reivindicación 16 no define claramente la materia que se desea proteger, puesto que en ninguna parte de la memoria descriptiva se describe al compuesto intermedio Id; asimismo, la etapa en la que se hace reaccionar el alcohol de fórmula Id con HalX tampoco se encuentra descrito en la memoria descriptiva; por lo que la reivindicación 16 NO CUMPLE con los requisitos de suficiencia y claridad del Artículo 30 de la Decisión 486.

Por lo tanto :

- ♦ Las reivindicaciones 1 a 15 CUMPLEN con los requisitos del Artículo 30 de la Decisión 486, con la precisión señalada en el punto 2B del presente informe.
- ♦ La reivindicación 16 NO CUMPLE con los requisitos de Suficiencia y Claridad del Artículo 30 de la Decisión 486.

3. NO INVENCIONES Y EXCLUSIONES A LA PATENTABILIDAD

Las reivindicaciones 1 a 15 al definir productos serían patentables de acuerdo al Artículo 14 de la Decisión 486. Además no se encuentran contemplados dentro de los alcances de los Artículos 15 y 20 de la Decisión 486, por lo que se consideran susceptibles de patentarse, con la precisión señalada en el punto 2B del presente informe.

Las reivindicaciones 17 a 31 se refieren al uso de productos, por lo que NO SON SUSCEPTIBLES DE PATENTARSE en concordancia con la interpretación del Artículo 14 de la Decisión 486 por el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, que solo considera patentables los productos o procedimientos, por lo que deben ser retirados del pliego de reivindicaciones.

Por lo tanto :

- ♦ Las reivindicaciones 17 a 31 referidas a usos NO SON SUSCEPTIBLES DE PATENTARSE en concordancia con la interpretación del Artículo 14 de la Decisión 486 por el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, por lo que deben ser retirados del pliego de reivindicaciones.

4. UNIDAD DE INVENCION

Del análisis efectuado a las reivindicaciones se ha observado que el elemento a patentar común a todas las reivindicaciones independientes es el derivado de 3-amino-3-arylpropan-1-ol de fórmula I, por lo que las reivindicaciones 1 a 15 guardan Unidad de Invención y CUMPLEN con lo establecido en el Artículo 25 de la Decisión 486, con la precisión señalada en el punto 2B del presente informe.

5. NOVEDAD

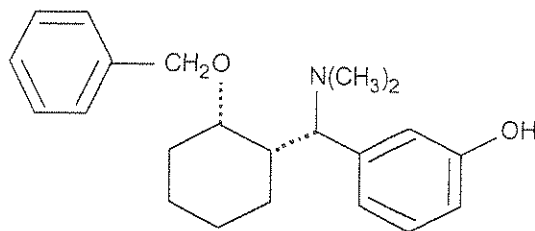
Reivindicaciones independientes : 1, 13, 14, 15.
Reivindicaciones dependientes : 2 – 12.

Los antecedentes más cercanos son :

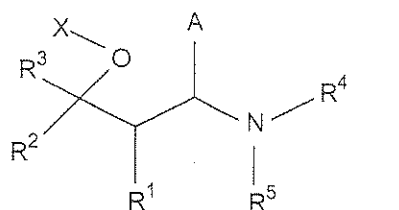
- D1** : US 4 143 158 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORPORATION)
Publicado el 06 de marzo de 1979 (1979.03.06)
"Inhibición de la liberación de prolactina por un antagonista opiáceo".
- D2** : US 3 975 436 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORPORATION)
Publicado el 17 de agosto de 1976 (1976.08.17)
"Antagonistas narcóticos de bencilamina".
- D3** : US 3 937 818 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORPORATION)
Publicado el 10 de febrero de 1976 (1976.02.10)
"Antagonistas narcóticos de bencilamina".

El documento **D1** describe al compuesto (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benzoiloxi ciclohexil)-m-cresol, el cual es un antagonista de narcóticos que además inhibe la liberación de prolactina sin inhibir significativamente la liberación de la hormona del crecimiento.

Los documentos **D2** y **D3** describen compuestos que antagonizan los efectos farmacológicos de agentes narcóticos en animales de sangre caliente, entre los que se menciona al compuesto (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benciloxiciclohexil)-m-cresol, el cual también se encuentra descrito en el Ejemplo 4.



La **REIVINDICACIÓN 1** define derivados de 3-amino-3-arylpropan-1-ol de fórmula general I, en la cual



R^1 , R^2 representan independientemente entre sí, un radical C_{1-6} -alquilo o R^1 y R^2 en conjunto forman un ciclo $(CH_2)_{2-6}$ que también puede estar benzocondensado o fenilsustituido

R^3 representa H o metilo

R^4 , R^5 representan independientemente entre sí, C_{1-6} -alquilo, C_{3-6} -cicloalquilo, fenilo, bencilo, fenetilo, o R^4 y R^5 en conjunto forman un ciclo $(CH_2)_{3-6}$ o $CH_2CH_2OCH_2CH_2$

A representa un radical arilo, que eventualmente contiene heteroátomos en el sistema cíclico, y puede contener sustituyentes

X representa un bencilo sustituido de la fórmula XI, o un radical benzoílo sustituido de la fórmula XII, en las cuales

R^{12} a R^{14} representan independientemente entre sí H, F, Cl, Br, CHF_2 , CF_3 , OR^{11} , SR^{11} , OCF_3 , SO_2CH_3 , SO_2CF_3 , C_{1-6} -alquilo, fenilo, CN, $COOR^{11}$, NO_2 , y

R^{11} representa H, C_{1-6} -alquilo, fenilo, bencilo, fenetilo

o sus diastereómeros o enantiómeros en forma de sus bases o sales con ácidos fisiológicamente tolerables.

I. En el compuesto de la reivindicación 1, si R^1 y R^2 forman ciclohexilo, R^3 es H, R^4 y R^5 son ambos metilo, A es 2-hidroxifenilo, y X es benzoílo de fórmula XII (R^{12} , R^{13} y R^{14} son todos H); se obtiene el compuesto (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benzoiloxi ciclohexil)-m-cresol del documento D1.

II. En el compuesto de la reivindicación 1, si R^1 y R^2 forman ciclohexilo, R^3 es H, R^4 y R^5 son ambos metilo, A es 2-hidroxifenilo, y X es bencilo de fórmula XI (R^{12} , R^{13} y R^{14} son todos H); se obtiene el compuesto (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benciloxi ciclohexil)-m-cresol de los documentos D2 y D3.

El compuesto de la reivindicación 1 se encuentra anticipado por los compuestos (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benzoiloxiciclohexil)-m-cresol del documento D1 y (1)- α -dimetilamino- α -(cis-2-benciloxiciclohexil)-m-cresol de los documentos D2 y D3.

Las reivindicaciones 2 a 12 al ser dependientes de la reivindicación 1 tampoco cumplen con ser novedosas.

Las reivindicaciones 13 a 15 que definen composiciones farmacéuticas que comprenden, entre otros, un compuesto según las reivindicaciones 1 a 12, tampoco cumplen con ser novedosas.

Por lo tanto :

- ♦ Las reivindicaciones 1 a 15 NO CUMPLEN con el requisito de Novedad del Artículo 16 de la Decisión 486.

6. NIVEL INVENTIVO

En caso las objeciones respecto a la novedad fueran superadas, las opciones posibles de los sustituyentes R¹ a R⁵, A y X comprende a un mayor número de compuestos que no se encuentran todas sustentadas en la memoria descriptiva, por lo que se considera necesario limitar el contenido de la reivindicación 1 y sus dependientes solamente a las opciones posibles sustentadas en los 6 ejemplos de la memoria descriptiva.

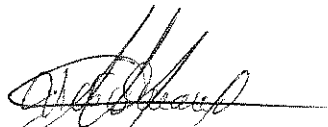
7. CONCLUSIONES

- ♦ Las reivindicaciones 1 a 15 NO CUMPLEN con el requisito de Novedad del Artículo 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.
- ♦ La reivindicación 16 NO CUMPLE con los requisitos de Suficiencia y Claridad del Artículo 30 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.
- ♦ Las reivindicaciones 17 a 31, referidas a usos NO SON SUSCEPTIBLES DE PATENTARSE en concordancia con la interpretación del Artículo 14 de la Decisión 486 por el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina, por lo que deben ser retirados del pliego de reivindicaciones.

8. BIBLIOGRAFÍA

Base de Datos Nacional	(X)
Solicitudes US en Internet	(X)

Realizado por



Víctor A. Durand Guevara
Examinador Externo
C.Q.F.P. N° 6769

000179

INFORME DE BÚSQUEDA

Expediente 000296-2000/OIN

Fecha de presentación	2000.04.04	Fecha de prioridad	1999.04.07
C.I.P. Int. 7 : C07C 217/52, C07C 219/24, A61K 31/235, A61K 31/137			
Estrategia de Búsqueda empleada			
A61K31/135			
EL RESULTADO DE LA BÚSQUEDA REALIZADA HASTA LA FECHA CONSIDERA COMO RELEVANTES LOS SIGUIENTES DOCUMENTOS			
Categoría	Cita del documento, indicando las partes pertinentes y la fecha de publicación	Reivindicaciones afectadas	
X	US 4 143 158 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.) Publicado el 06 de marzo de 1979 (1979.03.06) "Inhibición de la liberación de prolactina por un antagonista opiáceo".	R1 – R15	
X	US 3 975 436 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.) Publicado el 17 de agosto de 1976 (1976.08.17) "Antagonistas narcóticos de bencilamina".	R1 – R15	
X	US 3 937 818 (AMERICAN HOME PRODUCTS CORP.) Publicado el 10 de febrero de 1976 (1976.02.10) "Antagonistas narcóticos de bencilamina".	R1 – R15	
Categoría de documentos citados X : Particularmente relevante por sí solo Y : Particularmente relevante combinado con otro(s) A : Estado de la técnica general O : Divulgación oral E : Solicitud nacional presentada antes pero publicada después de la fecha de presentación de la solicitud examinada (sólo con X) D : Citado en la solicitud L : Citado por otras razones P : Anterior a la fecha de presentación pero posterior a la fecha de prioridad T : Teoría o principio en el que se basa la invención			
Examinador : Q.F. Víctor Durand Guevara.			