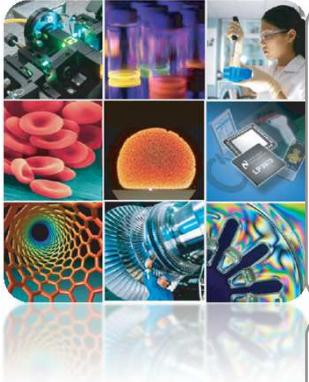




UNIVERSITÀ
DEGLI STUDI
DI PADOVA

innovazione.su
misura.it



Il Brevetto in Chimica

docente: dr. Filippo Ghiraldo
filippo.ghiraldo@unipd.it



© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Materiale didattico sottoposto a copyright ad uso esclusivo degli studenti del corso:
Il Brevetto In Chimica
Università di Padova
A.A. 2012-2013
L'utilizzo con altre finalità, in particolare a scopo commerciale, verrà perseguito penalmente ai sensi della normativa vigente a tutela del diritto d'autore.



Tipi di brevetto

innovazione.su
misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

2

Le invenzioni derivate - 1

Le invenzioni brevettabili, definite come soluzioni nuove ed originali di un problema tecnico, vengono tradizionalmente divise in due gruppi:

- Brevetti di prodotto;
- Brevetti di procedimento o metodo (art. 67 CPI).

I procedimenti hanno ad oggetto non una struttura fisica ma un modo di operare atto ad ottenere un risultato nuovo.

Deve essere sempre indicato il risultato finale ovvero l'uso per il quale il prodotto o il procedimento è destinato.

Se l'uso non fosse espressamente specificato, esso deve essere facilmente desumibile da un esperto del settore, sulla base dell'analisi della descrizione e delle eventuali figure.

Le invenzioni derivate - 2

Le invenzioni derivate sono quelle soluzioni nuove ed originali di un problema tecnico che derivano da un'invenzione precedente.

Questa caratteristica non significa che abbiano un grado di originalità ridotta.

Si distinguono in tre categorie:

- Invenzioni di perfezionamento**, in quanto idonee a realizzare un migliore rendimento rispetto ad una soluzione di problema tecnico già nota;
- Invenzioni di combinazione**, in quanto comportano un'ingegnosa, nuova ed originale, combinazione di elementi e mezzi conosciuti in tutto o in parte e da cui deriva un nuovo risultato industriale;
- Invenzioni di traslazione**, in quanto ottengono un risultato finale, nuovo ed originale, attraverso l'applicazione ad un **settore diverso** di un'invenzione nota in un altro campo.

Le invenzioni derivate - 3

Un'invenzione derivata si dice autonoma se la sua attuazione non necessita di licenza da parte del titolare del brevetto da cui trae origine.

- In questo caso il titolare dell'invenzione derivata possiede "Libertà di Attuazione" (Freedom To Operate).

Nel caso in cui l'attuazione della nuova invenzione, implichi l'utilizzazione di un altro trovato, protetto da un precedente brevetto ancora in vigore, avremo un'invenzione dipendente.

Essa in mancanza del consenso del titolare dei diritti del brevetto anteriore, costituisce una contraffazione.

- In questo caso il titolare dell'invenzione derivata NON possiede Freedom To Operate.

Le invenzioni derivate - 4

La legge favorisce il titolare delle invenzioni dipendenti, nel senso di consentirgli di ottenere una licenza obbligatoria (art. 71 CPI):

- Salvo pagamento di un equo compenso;
- Previa prova del mancato ottenimento di una licenza contrattuale non iniqua;
- Il brevetto dipendente rappresenti un importante progresso tecnico di considerevole rilevanza economica.

La contraddizione è evidente, dal momento che la rilevanza economica non potrebbe esser valutata se non all'esito dello sfruttamento del brevetto.

L'istituto della "Licenza obbligatoria" descritto è, nella prassi, inutilizzato.

La libertà di attuazione - 1

Se un inventore scopre che un farmaco per la cura dell'ipertensione ha capacità, qualora utilizzato per uso topico, di far crescere i capelli, egli può sicuramente decidere di procedere alla brevettazione.

Il nuovo utilizzo (farmaco per il trattamento dell'alopecia) infatti, è nuovo e originale rispetto al primo uso come antiipertensivo.

Tuttavia egli *non* potrà mettere in vendita il prodotto per la cura della calvizie se non con l'autorizzazione dal detentore del primo brevetto (quello relativo alla molecola della quale è stato dimostrato l'uso come anti-ipertensivo).

La libertà di attuazione - 2

I brevetti dipendenti permettono di sottolineare la differenza tra brevettabilità e possibilità di attuare la propria invenzione:

- La **libertà di attuazione (FTO)** dipende dal fatto che il brevetto non interferisce con privative di terzi ;
- La **brevettabilità** di un'invenzione dipende dalla presenza dei requisiti di brevettabilità (novità, inventività, industrialità)

Per chiarire questo concetto facciamo riferimento al caso reale del Minoxidil, la molecola con proprietà anti-ipertensive brevettata negli Stati Uniti (US 3,461,461):

- Prima fu brevettata per l'uso a fini antiipertensivi;
- Dopo per l'uso topico nel trattamento della calvizie.

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: peculiarità

Nella maggior parte delle giurisdizioni non esistono differenze significative sotto il profilo legale per ottenere un brevetto per un'invenzione in campo chimico o farmaceutico rispetto ad un brevetto in altri rami della tecnica come la meccanica.

In particolare un brevetto chimico o farmaceutico non rappresenta un brevetto "sui generis" ovvero un particolare brevetto con "diritti speciali".

Tuttavia, i requisiti di brevettabilità, uniti alla peculiarità del settori chimico e farmaceutico danno luogo a diverse categorie di brevetti e di rivendicazioni.

[innovazione.su.misura.it](http://www.innovazionesumisura.it)

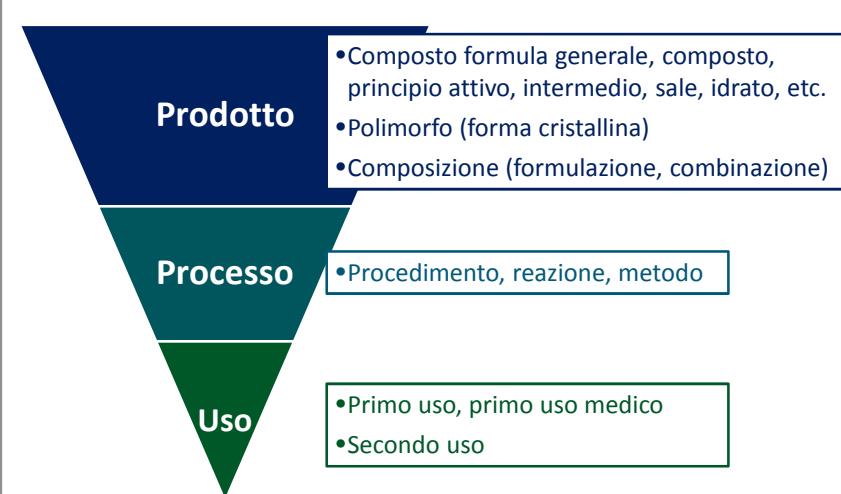
Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

9

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: categorie e gerarchia - 1



- Composto formula generale, composto, principio attivo, intermedio, sale, idrato, etc.
- Polimorfo (forma cristallina)
- Composizione (formulazione, combinazione)

- Procedimento, reazione, metodo

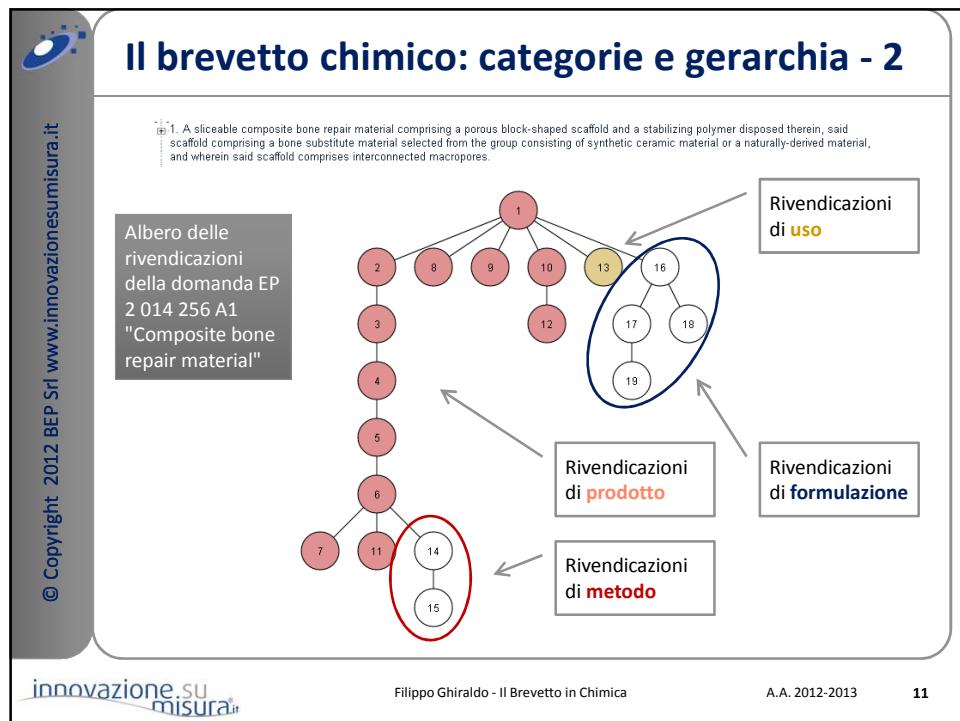
- Primo uso, primo uso medico
- Secondo uso

[innovazione.su.misura.it](http://www.innovazionesumisura.it)

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

10



Rivendicazione di prodotto - 1

© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

E' generalmente considerata come rivendicazione superiore in quanto rivendica la sostanza chimica attiva come una nuova entità chimica.

Nei brevetti "composizione" ("composition of matter") il termine indica in realtà una rivendicazione di prodotto.

Se c'e' una rivendicazione di prodotto su un farmaco solo il titolare del brevetto o licenziatario può produrre, vendere o importare il prodotto chimico per qualsiasi uso senza violare il brevetto del prodotto.

Questo tipo di richiesta di brevetto per i farmaci è ora consentito nei paesi commercialmente più importanti, anche se si tratta di un evento piuttosto recente rispetto alla storia dei brevetti:

- 1970, Giappone, la Svizzera, la Svezia e l'Italia;
- 1987, Austria;
- 1992, il Portogallo, la Spagna e la Grecia.

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

12

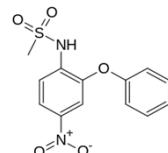


Rivendicazione di prodotto - 2

Il nuovo farmaco è rivendicato sia dal nome chimico o dalla struttura chimica o entrambi.

Il farmaco può essere richiesto tramite una struttura Markush ovvero una struttura chimica di base con diversi gruppi chimici opzionali che possono essere fissati alla struttura di base.

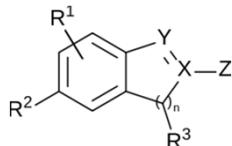
Questo è nota come una generica rivendicazione di un composto. Un farmaco sarà coperto dalla rivendicazione generica e ci può essere una rivendicazione specifica al chimico.



Nimesulide - nome IUPAC

N-(4-Nitro-2-fenossifenil)metansulfonammide

Alcune strutture Markush sono così generali che possono coprire milioni di prodotti chimici reali.



Rivendicazione “Product-by-process”

Questo tipo di rivendicazione copre una sostanza chimica “C” (o un altro processo X_2 utilizzato per la produzione di un farmaco) ogni volta che il farmaco è prodotto mediante il procedimento brevettato X_1 .

- "Product obtained by the process of claim X," "Product made by the steps of . . . , and the like."

Utilizzata quando non si può definire il prodotto in termini di composizione senza far riferimento al processo.

Rappresenta il secondo migliore tipo di rivendicazione da fare nella domanda in quanto conferisce anche una protezione contro l'importazione di un prodotto.

Tuttavia, il farmaco può essere prodotto e commercializzato se un'altra società può ideare un processo commercialmente valido non coperto nel brevetto alternativo a X_1

Rivendicazione di processo - 1

Questo tipo di rivendicazione copre il processo chimico (o di altra natura) X utilizzato per la produzione di un farmaco "C".

Il prodotto chimico "C" emerso dal processo X non invece è coperto dal brevetto.

E' meno forte della rivendicazione di prodotto per la difficoltà di dimostrare che un contraffattore utilizza il processo brevettato.

Per questo molti paesi hanno un "inversione dell'onere della prova" clausola in cui l'autore della violazione potenziale deve dimostrare che il processo brevettato non è in uso.

14. A method for preparing the composite bone repair material according to claim 6, comprising the steps:

- a) preparing a porous block-shaped synthetic ceramic scaffold;
- b) mixing an aqueous solution of a multi-arm PEG-thiol with an aqueous solution of a multi-arm PEG-acrylate, wherein the total number of arms is equal or larger than five;
- c) soaking the ceramic bone block with the mixture.

15. A method according to claim 14, adding to the mixture in step b) a bioactive agent.

Rivendicazione di processo - 2

Acesulfame-K

A process for the preparation of 6-methyl-3,4-dihydro-1,2,3-oxathiazin-4-one, 2,2-dioxy [dioxide] and its non-toxic salts by

(a) reaction of a sulfamic acid derivative with at least an equimolar amount of the acetoacetylating agent in an inert organic solvent, where appropriate in the presence of an amine or a phosphine as catalyst, to give an acetoacetamide derivative and

(b) ring closure of the acetoacetamide derivative used being a salt of sulphamic acid which is at least partially soluble in the inert organic solvent used, and the acetoacetylating agent used being diketene or acetoacetyl chloride, and comprises carrying out the reaction at temperatures between -30 and +50°C, and comprises the acetoacetamide-N-sulphonate, which is formed in this step, being ring-closed in step (b) by the action of at least an equimolar amount of SO₃⁻, where appropriate in an inert inorganic or organic solvent, at temperatures between -70 and +175°C, to form 6-methyl-3,4-dihydro-1,2,3-oxathiazin-4-one, 2,2-dioxide, and comprises the product which results from this in the acid form then being neutralised with a base, where appropriate, in an additional step (c).

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Rivendicazione di formulazione - 1

Questo tipo rivendica la forma farmaceutica attraverso la quale si concretizza il dosaggio del farmaco.

E' comunemente nota come una "composizione", ma non deve essere confusa con la rivendicazione precedente ("composition of matter").

Essa può assumere la forma di una formulazione di un particolare farmaco o classe di farmaci, o una formulazione generale applicabile a molti farmaci con diverse azioni quali:

- Tecnologie a lento rilascio;
- Cerotti transdermici, ecc.

Cannabis, under the tongue

Può essere anche brevetti di "process formulation" che coprono i processi di realizzazione utilizzati per produrre la formulazione.

CLAIMS

1. A pharmaceutical composition formulated for sublingual aerosol delivery comprising a pharmaceutically active agent which is cannabis.

GB 2,361,869

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 17

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Rivendicazione di formulazione - 2

16. A kit for preparing a composite bone repair material according to claim 1 comprising the porous block-shaped synthetic ceramic scaffold and a stabilizing polymer.
17. A kit according to claim 16 comprising:
 - a) the porous block-shaped synthetic ceramic scaffold;
 - b) a multi-arm PEG-thiol
 - c) a multi-arm PEG-acrylate, wherein the total number of arms is equal or larger than five.
 - d) buffers for the multi-arm PEG-thiol and multi-arm PEG-acrylate.
18. A kit according to claim 16 or 17 additionally comprising a bioactive agent
19. A kit according to claim 17 additionally comprising a bioactive agent premixed either with the multi-arm PEG-thiol or with the multi-arm PEG-acrylate.

Questo tipo di rivendicazione sono comuni anche al di fuori del settore strettamente farmaceutico.

Un esempio di rivendicazione di formulazione che riguarda un kit per la rigenerazione ossea basata su materiali innovativi.

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 18

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Rivendicazione di protocollo di dosaggio

EP 0 724 444

1. The use of [finasteride] for the preparation of a medicament for oral administration of androgenic alopecia in a person and wherein the dosage amount is about 0.05 to 1.0 mg
2. The use as claimed in claim 1 wherein the dosage is 1.0mg.
3. The use as claimed in claim 1 or 2 wherein the treatment is of male pattern baldness.

[innovazione.su
misura.it](http://www.innovazionesumisura.it) Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 19

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Rivendicazione di metodo d'uso

Questo comprende l'uso del farmaco per il trattamento di una malattia. Questo tipo di richiesta è consentito originariamente negli Stati Uniti e in Germania, ma ora viene accettato in altri paesi, compreso il Regno Unito. Tuttavia richiede un'attenta formulazione della rivendicazione specialmente nelle domande europee (a dimostrazione che il "fai da te" nella predisposizione di un domanda di brevetto può essere molto rischiosa).

Di solito si evita una rivendicazione diretta per un metodo di trattamento (non permessa in Europa ma negli USA ed in Australia consentita).

1. The use of nimesulide for the preparation of a medicament useful for the treatment of cataract (EP532900A1).
13. Use of the composite bone repair material according to any of the preceding claims for the manufacture of a device for the treatment of oral bone defects.

In USA ed in Australia:

A method of treatment of Y by administration of a compound of formula X

[innovazione.su
misura.it](http://www.innovazionesumisura.it) Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 20

In sintesi:

Types of Patent Claim

- 3 main types of pharmaceutical claim
- If compound is new:
 - A compound of general formula X
- If compound is known, but no medical use is known:
 - A compound of general formula X for use in the treatment of Y
- If compound is known, and (different) medical use is known:
 - Use of a compound of general formula X in the preparation of a medicament for the treatment of Y
 - AND/OR in Europe only since 2007:
 - A compound of general formula X for use in the treatment of Y
- Second non-medical use (allowed by EPO)

innovazione.su misura.it

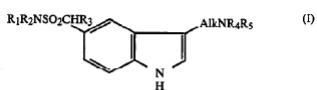
Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

21

Il brevetto chimico: categoria prodotto - 1

We claim:
1. A compound of formula (I):



wherein
 R_1 represents a hydrogen atom or a C₁₋₆ alkyl or C₃₋₆ alkenyl group;
 R_2 represents a hydrogen atom or a C₁₋₃ alkyl, C₃₋₆ alkenyl, phenyl, phen(C₁₋₄alkyl) or C₅₋₇ cycloalkyl group;
 R_3 represents a hydrogen atom or a C₁₋₃alkyl group;
 R_4 and R_5 , which are the same or different, each represents a hydrogen atom or a C₁₋₃ alkyl or propenyl group or R_4 and R_5 together form a benzylidene group; and

Composto (molecola, principio attivo, intermedio)
...A compound of general formula (I) wherein...

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

22

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: categoria prodotto - 2

Un esempio nel campo dei biomateriali: [EP2014256\(A1\)](#)

Claims

1. A sliceable composite bone repair material comprising a porous block-shaped scaffold and a stabilizing polymer disposed therein, said scaffold comprising a bone substitute material selected from the group consisting of synthetic ceramic material or a naturally-derived material, and wherein said scaffold comprises interconnected macropores.
2. Composite bone repair material of claim 1 wherein the scaffold is a synthetic ceramic material comprising a calcium phosphate.
3. Composite bone repair material of claim 2 wherein the calcium phosphate is selected from the group consisting of hydroxyapatite and tricalcium phosphate or a mixture thereof.
4. Composite bone repair material of claim 3 wherein the stabilizing polymer comprises polyethylene glycol.
5. Composite bone repair material of claim 4 wherein the stabilizing polymer is a degradable polyethylene glycol hydrogel.
6. Composite bone repair material of claim 5 wherein the hydrogel is formed by a crosslinking reaction of at least two precursor molecules.
7. Composite bone repair material of claim 6 wherein the crosslinking reaction is a Micheal type addition.
8. Composite bone repair material according to any of the preceding claims wherein the ceramic scaffold has a total porosity between 75% and 95%.

 Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 23

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: categoria prodotto - 3

Composto si può riferire a:

- molecola, principio attivo, intermedio

Piccole modifiche ad un composto, ad esempio di un certo principio attivo, purché molto migliorative rispetto ad esso, possono essere sufficienti per conferire novità ed attività inventiva quindi possono essere brevettate.

Esempi:

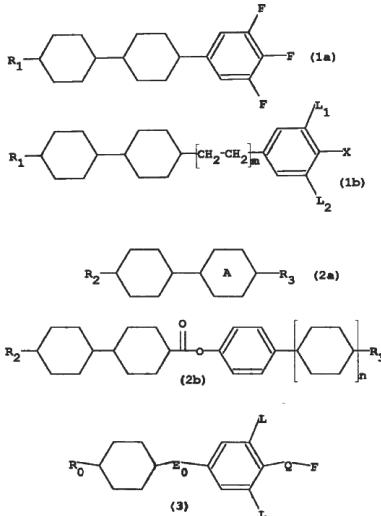
- Benzodiazepine come Lorazepam (Wyeth) o Oxazepam (Pharmacia&Upjohn) leggermente diverse da
- Diazepam (Roche) e con effetti/usi medici diversi.

I nuovi sali o forme idrate di principi attivi o specifiche molecole (purché dotati di funzione) possono essere brevettati (brevetto di prodotto/ derivato)

 Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 24

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Composizione di NLC (US5904876A) - 1



Abstract:

The invention relates to a Nematic Liquid-Crystal **composition** based on terminally and laterally fluorinated compounds and dielectrically neutral compounds.

This composition is highly useful for plasma-addressed display devices.

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 25

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Composizione di NLC (US5904876A) - 2

Novelty
The nematic LC compsns. contain: (a) 15-35 wt.% of cpds. of formula (1a) or (1b); and (b) 65-85 wt.% of cpds. of formula (2a) or (2b); where R1 = 1-5 C straight-chain alkyl; L1 and L2 = H or F; X = F, OCF2H or OCF3; m and n = 0-1; R2 and R3 = 1-5 C straight chain alkyl or alkoxy; and ring A = trans-1, 4-phenylene or trans-1, 4-cyclohexylene.

Use
The compsns. contg. terminally and laterally fluorinated cpds. and dielectrically neutral cpds. are useful for plasma-addressed display devices (claimed), which are highly favoured for commercially interesting displays with a high information content, e.g. television, computer terminals, automobiles and aeroplanes.

Advantage
The compsns. have very high RC times and show reduced viscosity which allows operation in AMDs in the first minimum of transmission and there is no crystallisation at 30°C. The compsns. show dielectric anisotropies of < 4.0 (pref. 1-3, esp. 1.5-2.5), and 1.5-2.5, and clearing points of > 85°C, pref. > 90°C. The cpds. are obtd. in known processes (eg. see EP0387032 and DE3321373).

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 26

Composizione di NLC (US5904876A) - 3

We claim:

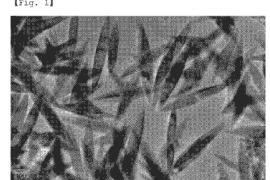
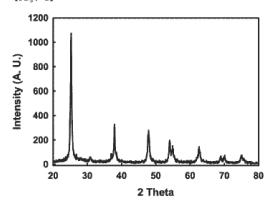
1. A nematic liquid-crystal composition comprising:
 15 to 35% by weight of two or more compounds selected from group 1
 consisting of compounds of the formulae 1a and 1b: in which R¹ is a
 straight-chain alkyl group of 1 to 5 carbon atoms,
 X is F, OCF₂ H or OCF₃ and m is 0 or 1, and
 L¹ and L² are each independently H or F,
 provided that at least one compound of the formula 1a is contained in the
 composition and at least one compound of the formula 1b wherein L¹ is H
 and X is F is contained in the composition, and
 65 to 85% by weight of at least four compounds from group 2 consisting of
 compounds of the formulae 2a and 2b in which R² and R³ are each
 independently a straight-chain alkyl or alkoxy group of 1 to 5 carbon atoms,
 n is 0 or 1. provided that:
 at least one compound of formula 2a, in which at least one compound of
 formula 2a, in which at least one compound of formula 2b, in which n is 0,
 and at least one compound of formula 2b, in which n is 1, are contained in
 the composition.

innovazione.su misura.it Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 27

US7887780B2 - 1

What is claimed is:

1. A process for preparing titania nanorods for dye sensitized or quantum-dot nanoparticle sensitized solar cells, comprising:
 (a) slowly adding dropwise chilled distilled water to titanium tetrachloride (TiCl₄) to prepare a solution of titanium oxychloride (TiOCl₃);
 (b) adding basic solution the solution of titanium oxychloride to maintain pH of the titanium oxychloride solution within a range from 3.5 to 4, thereby providing a suspension of titanium oxyhydroxide (TiO(OH)_x) precipitate;
 (c) adding basic solution the suspension of titanium oxyhydroxide precipitate to adjust the suspension of titanium oxyhydroxide precipitate to be weakly basic, and heating and stirring the mixture at 80 to 100° C.;
 (d) isolating and collecting titanium oxyhydroxide from the heated and stirred suspension of titanium oxyhydroxide precipitate, and washing the collected titanium oxyhydroxide with a weakly basic aqueous solution; and
 (e) adding distilled water and 20 to 500 fold of hydrogen peroxide (H₂O₂) on the basis of 1 mole of Ti⁴⁺ in the titanium oxyhydroxide to the washed titanium oxyhydroxide to form a mixture, and heat-treating the mixture at a temperature of 90 to 100° C. for 1 to 7 days to prepare titania nanorods having a mean length of 100 nm to 300 nm.

U.S. Patent Feb. 15, 2011 US 7,887,780 B2
 [Fig. 1] 
 [Fig. 2] 

innovazione.su misura.it Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 28

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

US7887780B2 - 2

Novelty
Preparing titania nanorods for dye-sensitized or quantum dot nanoparticle-sensitized solar cells comprises preparing aqueous titanium oxychloride solution from titanium tetrachloride; preparing titanium oxyhydroxide precipitate with controlled particle size and shape via pH adjustment, control of reaction rate and heat treatment; and adding hydrogen peroxide and water to titanium oxyhydroxide and heating the mixture.

Use
Process for preparing titania nanorods for dye-sensitized or quantum dot nanoparticle-sensitized solar cells (claimed).

Advantage
The process prepares titania nanorods of anatase structure having rod-shape with longer dimension in one direction by using pure hydrogen peroxide without adding surfactant or templates. The titania nanorods have less intergranular defection as compared to photoelectrodes achieved by connection of ball-type particles, so that the nanorods have excellent property of transferring photoelectric current generated by dye or quantum dot nanoparticles.

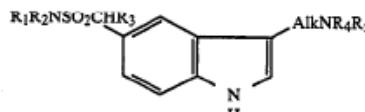
innovazione.su misura.it Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 29

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: categoria prodotto - 3

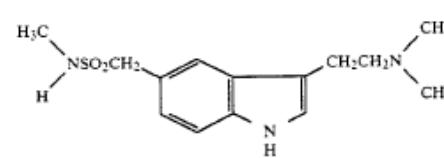
Brevetti di formula generale

Rivendica un classe di molecole Es. Sumatriptan (US4816470).



Brevetto di selezione

Rivendica un composto all'interno di una formula generale. Es. Sumatriptan (US5037845).



innovazione.su misura.it Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 30



Brevetti di selezione e di formula generale

Il **brevetto di selezione** è brevettabile se non è individuato nella prima domanda di **brevetto di formula generale** e se è deducibile solo con l'impiego di ulteriore attività inventiva.

Il brevetto di selezione se concesso è però dipendente dal brevetto di formula generale ;

Il brevetto di selezione può anche appartenere ad un titolare diverso da quello che detiene il brevetto di formula generale .

Questo pone limiti ad entrambi i titolari dei due brevetti.



Assenza di solventi

Paxil

2. Paroxetine hydrochloride anhydrate substantially free of bound organic solvent.

GB 2,297,550

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Livello di purezza

Simvastatin

20. 6(R)-{2-[B(S)-(2,2-dimethylbutyloxy)-2(S), 6(R)-dimethyl-1,2,6,7,8,8a(R)-hexahydronaphthyl-1(S)ethyl]-4(R)-hydroxy-3,4,5,6-tetrahydro-2H-pyran-2-one containing less than 0.2% of dimeric impurity.

EP 351,918

 Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 33

 © Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Il brevetto chimico: isomeri ottici - 1

Gli isomeri ottici di un composto sono considerati nuovi rispetto ai racemati se non sono già presenti allo stato dell'arte descritti ("novità")
Se presentano inaspettati effetti rispetto ai racemati sono brevettabili ("originalità").
In campo farmaceutico, negli ultimi 20 anni sono molti i brevetti rilasciati relativi alle forme otticamente attive di principi attivi già noti

 Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica A.A. 2012-2013 34



Il brevetto chimico: polimorfi - 1

Le nuove forme cristalline (polimorfi) sono considerate nuovi composti (derivati) e sono brevettabili (“brevetti di Polimorfismo”).

Le nuove forme devono presentare dei vantaggi come:

- Fluidità, stabilità,
- Biodisponibilità rispetto alle forme note

Dipendono però dai brevetti di prodotto.

Negli ultimi 10 anni sono moltissimi i brevetti relativi ai nuovi polimorfi dei principi attivi

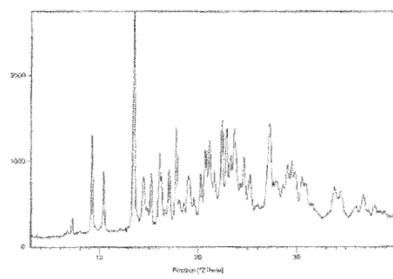
Spesso hanno un rilevante valore economico (es. brevetto EP1429757 della Ciba (Fluvastatin Sodium salt).



Il brevetto chimico: polimorfi - 2

EP1816125A1

FIGURE 1



Claims:

1. A crystalline polymorph of rimonabant, denominated Form III, which is characterized by X-ray reflections at 7.2218, 10.4594, 13.4718, 16.0555, 16.2819, 17.7165, 20.2555, 22.3736, 23.2326, 23.6070, 24.5675 and $29.4467 \pm 0.2^\circ 2\theta$.
5. The crystalline polymorph of claim 1 or 4 having a powder X-ray diffraction pattern substantially as shown in Figure 1.
6. The crystalline polymorph of claim 1 or 4 having a DSC thermogram substantially as shown in Figure 2.
7. The crystalline polymorph of claim 1 or 4 having IR spectrum substantially as shown in Figure 3.



Il brevetto chimico: polimorfi - 3

Mechanism

Cannabinoid B1 receptor antagonist.

Use

(A) is useful for treating obesity, smoking cessation, overweight and/or related diseases (claimed). No biological data given.

Advantage

(A) can appreciably influence pharmaceutical properties such as dissolution rate and bioavailability. (A) is stable for extended periods of time without the need for specialized storage conditions.



Il brevetto chimico: polimorfi - 4

Il Rimonabant (o SR141716) è un farmaco antiobesità anorettizzante, ritirato dal mercato. Si tratta di un agonista inverso per il recettore CB1 dei cannabinoidi. Il suo effetto principale è la riduzione dell'appetito.

Il farmaco è stato ritirato dal commercio il 23 ottobre 2008 perché si è dimostrato provocare gravi disturbi psichiatrici.

La priorità del brevetto è 2006-02-02: quasi sicuramente non riguarda il farmaco incriminato.

Forse si tratta di un'evoluzione

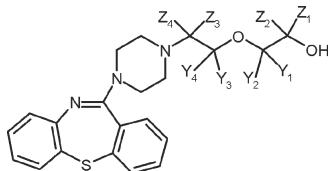
Il brevetto chimico: isotopi - 1

I composti contenenti isotopi (analoghi isotopici) sono considerati nuovi rispetto ai composti senza isotopi e possono essere inventivi
Es. Quetiapine deuterated, WO2008066620 (Concert Pharmaceuticals Inc., NEW API)

Composizione deuterata (WO2008066620)

We claim:

1. A compound of formula I: or a salt, hydrate, or solvate thereof, wherein: each Z is independently selected from hydrogen or **deuterium**; each Y is independently selected from hydrogen, deuterium or fluorine; and at least one Z is deuterium.
2. The compound of claim 1, wherein Y1 and Y2 are each independently deuterium or fluorine.
3. The compound of claim 2, wherein Y1 and Y2 are each deuterium
4. The compound of any one of claims 1 to 3, wherein Y3 and Y4 are each independently deuterium or fluorine.



(I)

Composizione deuterata (KR2010008277)

© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Claims (English)

1. The anthracene derivative having the structure of the following equation 1:

(1) It is selected from the group consisting of the heteromorphy link chemical compound of the C2~C20 including the Ar₁ in the equation, ar₂ is each independently substituted or non-substituted C1~C20 aliphatic compound group, and the aromatic compound, N, S, O of the substituted or non-substituted C6~C30; it is substituted with the substituent selected from the C1~C20 aliphatic compound group substituted for, and the aromatic compound and group consisting of the heteromorphy link chemical compound of the C2~C20 including N, S, and O is the substitution of the carbon number 6 to 24 or the nonsubstitution aryl group, substitution or the nonsubstitution heteroaryl group of the carbon number 2 to 24, substitution or the non-substituted alkyl having carbon number 1 to 24, the heteroalkyl group of the carbon number 1 to 24, and the cycloalkyl radical, alkoxy, cyano group, halogen group, aryloxy group, alkylsilyl group, arylsilyl group, hydrogen of the carbon number 3 to 24 and deuterium of C6~C30; and R₁, R₂, and R₃ are selected from each independently substituted or

Composizione deuterata utilizzata in dispositivi OLED

(1)

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

41

Altri esempi: settore packaging - 1

© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

UK Patent No. 2108363 (Granted 1984)

1) A composite confection product, which comprises a multiplicity (for example, at least four) of thin superimposed layers of extrudable aerated confection material, comprising ice confection, mousse, whipped cream confection, or an obvious equivalent thereof, the superimposed aerated confection layers being interleaved by very thin layers, i.e. thinner than the aerated confection layers, of fat-based couverture confection material.

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

42



© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Altri esempi: settore packaging - 2

UK Patent No. 2143718 (Granted 1985)

1) A composite confection product, which comprises a multiplicity of at least four thin superimposed layers of extruded aerated confection material, comprising ice confection, mousse, whipped cream confection or obvious equivalent thereof, each said layer having a thickness of less than 5mm.

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

43



© Copyright 2012 BEP Srl www.innovazionesumisura.it

Altri esempi: settore packaging - 3

UK Application No. 2183592A (filed 1985)

1) A beverage package comprising a sealed, non-resealable, container having a primary chamber containing beverage having gas in solution therewith and forming a primary headspace comprising gas at a pressure greater than atmospheric; a secondary chamber having a volume less than said primary chamber and which communicates with the beverages in said primary chamber through a restricted orifice, said secondary chamber containing beverage derived from the primary chamber and having a secondary headspace therein comprising gas at a pressure greater than atmospheric so that the pressure within the primary and secondary chambers are substantially at equilibrium, and wherein said package is openable, to open the primary headspace to atmospheric pressure and the secondary chamber is arranged so that on said opening the pressure differential caused by the decrease in pressure at the primary headspace causes at least one of the beverage and gas in the secondary chamber to be ejected by way of the restricted orifice into the beverage of the primary chamber and said ejection causes gas in the solution to be evolved and form, or assist in the formation of, a head of froth on the beverage.

innovazione.su misura.it

Filippo Ghiraldo - Il Brevetto in Chimica

A.A. 2012-2013

44