

PROVA CHIMICA TEMA 2005-2006

- **IMPOSTAZIONE GENERALE DEL TEMA**

Si ricorda che all'epoca del tema d'esame in questione venivano assegnati dei punti anche per il corretto inquadramento della prior-art e per il problema tecnico.

Il tema d'esame riguarda una invenzione costituita da composti utili come agenti foto sensibilizzanti .

Il tema è formulato in modo da richiamare l'attenzione del candidato sui seguenti punti:

- a. Rivendicazione d'uso farmaceutico e di composizione farmaceutica diretta ad un insieme di composti formato dai composti di formula 1 e l'estere etilico dell'acido 5-amminolevulánico, composto già noto ma di cui era noto l'uso solo come intermedio nella preparazione dell'acido 5-amminolevulánico;
- b. Rivendicazione di prodotto nuovo diretta solo ai composti di formula 1;
- c. Invenzione aggiuntiva costituita dalla pomata contenente l'estere etilico dell'acido 5-amminolevulánico e suo uso nel favorire la cicatrizzazione della pelle.

E' possibile iniziare le rivendicazioni indifferentemente sia con quella di uso o quella di composizione farmaceutica più ampia seguita successivamente dalle altre.

Si ricorda che a partire dal 28 gennaio 2011, per effetto della Decisione della Camera allargata di ricorso dell'EPO G2/08, i cosiddetti "Swiss claim" sono stati obiettati nei riguardi delle domande europee aventi data di deposito o di priorità (validamente rivendicata) dopo tale data.

Per questa ragione si preferisce in questa sede non utilizzare gli "Swiss claims" ma redigere le rivendicazioni in modo da poter essere accettate attualmente.

- **POSSIBILI RIVENDICAZIONI:**

Uso

1. *Composto di formula (I) o dei loro sali farmaceuticamente accettabili per l'uso come medicinale*



in cui

R^1 e R^2 *indipendentemente, rappresentano idrogeno o un gruppo C_1 - C_4 alchile lineare o ramificato;*

R^3 rappresenta un gruppo alchile, lineare o ramificato, C_1 - C_6 sostituito facoltativamente da $-OH$, $-O(C_1-C_3)$, NH_2 o arile.

2. Composto, secondo la rivendicazione 1, per l'uso come agenti fotosensibilizzanti in terapia o diagnosi
3. Composto, secondo la rivendicazione 1, in cui R^1 ed R^2 rappresentano idrogeno e R^3 rappresenta etile.
4. Composto, secondo la rivendicazione 1, selezionato fra i seguenti:

R^1 idrogeno, R^2 metile, R^3 n-butile; R^1 etile, R^2 idrogeno, R^3 isopentile; R^1 isopropile, R^2 metile, R^3 $(CH_3)_2CHOCH_2CH_2-$; R^1 idrogeno, R^2 etile, R^3 $CH_2(OH)CH_2CH_2CH_2-$.

5. Composti secondo ciascuna delle rivendicazioni da 1 a 3 per l'uso in modo topico.

Non è chiaro dal testo fornito se i possibili sostituenti ammino o arile siano stati effettivamente preparati e testati in quanto non risultano esemplificati in tabella e non risulta definito il termine arile. L'omissione di tali sostituenti risulterebbe essere la soluzione più supportata nella realtà. Segue una rivendicazione dipendente diretta al composto preferito.

In analogia si può così scrivere una rivendicazione di composizione farmaceutica e la sua dipendente diretta al composto preferito.

Le rivendicazioni dipendenti aggiuntive possono essere costituite dalla precisazione anche degli altri composti in tabella.

6. Composizione farmaceutica comprendente almeno uno dei composti di formula (I) o un loro sale farmaceuticamente accettabile, come definiti nella rivendicazione 1 e usuali eccipienti.
7. Composizione farmaceutica secondo la rivendicazione 4, comprendente il composto o un suo sale farmaceuticamente accettabile, come definito nella rivendicazione 2.
8. Composizione farmaceutica, secondo la rivendicazione 4, comprendente almeno uno dei composti o un suo sale farmaceuticamente accettabile, come definiti nella rivendicazione 3.
9. Composizione farmaceutica secondo ciascuna delle rivendicazioni da 4 a 6 per uso topico.

- **Esempio di Rivendicazioni di composto**

La rivendicazione indipendente copre solamente i composti nuovi.

Le rivendicazioni dipendenti vanno a coprire particolarmente i composti esemplificati e composti preferiti.

10. Composti di formula (I) e loro sali farmaceuticamente accettabili, come definiti nella rivendicazione 1, con l'eccezione del composto come definito nella rivendicazione 2 (oppure si può ripetere la definizione del composto).

11. Composti di formula (I), secondo la rivendicazione 9, comprendenti i seguenti:

R^1 idrogeno, R^2 metile, R^3 n-butile; R^1 etile, R^2 idrogeno, R^3 isopentile; R^1 isopropile, R^2 metile, R^3 $(CH_3)_2CHOCH_2CH_2-$; R^1 idrogeno, R^2 etile, R^3 $CH_2(OH)CH_2CH_2CH_2-$; e loro sali farmaceuticamente accettabili.

- **PROCESSO**

Una possibile rivendicazione di processo, assolutamente semplice, poiché non ci sono altri dettagli, può essere la seguente:

12. Processo per preparare i composti di formula (I) come definiti nella rivendicazione 8 a partire dall'acido 5-amminolevulinico. :

- **INVENZIONE AGGIUNTIVA**

Si sarebbe potuto pensare a un deposito di una domanda parallela diretta a coprire la composizione in forma di pomata e l'uso dei composti nella cicatrizzazione, come esemplificato di seguito.

1. *Composizione farmaceutica per uso topico, comprendente il composto di formula (I) o un suo sale farmaceuticamente accettabile*



e usuali eccipienti.

2. *Composizione, secondo la rivendicazione 1, in cui il composto di formula (I) è al 5% in peso.*
3. *Composto come definito nella rivendicazione 1 per l'uso nella cicatrizzazione di escoriazione della pelle di mammiferi.*
4. *Composto secondo la rivendicazione 4 per l'uso nell'uomo.*

Alternativamente si poteva pensare di redigere delle rivendicazioni dipendenti dalla rivendicazione 1 per il nuovo uso, così come una rivendicazione indipendente diretta alla composizione topica contenente il composto noto. In questo caso si potrebbe avere una possibile obiezione di non-unità.