

CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier-abogados.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

319 324
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación: 01009901 00000002 Folios: 17
Fecha (GG): 2001-02-02 15:58:00
Trámite: C32 PATENTES D 1 REGISTRO 444 REQUERIDA
Dependencia: SC88 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Referencia : Expediente No. 01.009.901
Solicitante : MERCK PATENT GmbH
Asunto : Solicitud de patente para: "DERIVADOS DE
INDOL-3-IL0"
Fecha de la solicitud : 09 de febrero de 2001

TRAMITE:02 - EVENTO:01 - ACTUACION:444

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al oficio número 1021, notificado por fijación en lista del 5 de abril de 2001.

Para atender a la providencia anterior solicité un plazo por medio de mi memorial número 01009901 00000002 radicado el 1 de junio de 2001.

2. Mediante el oficio número 1021 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. Documento de cesión de inventores. Presento junto con este escrito el documento en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por el inventor al solicitante.

320
28

2.2. Capítulo reivindicatorio. Presento con este escrito un nuevo pliego reivindicatorio ya que el presentado con la solicitud contiene defectos en la enumeración.

2.3. Copia Certificada. Me permito informarle que la copia de la copia certificada de la solicitud de patente alemana número 100 06 139.7 del 11 de febrero de 2000, en la cual se basa la reivindicación de la prioridad fue presentada junto con mi memorial 01009901 00000003 del día 11 de junio de 2001 y el documento original fue presentado junto con mi memorial 01009901 del día 3 de julio de 2001.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, - 2 AGO. 2001
Señora Jefe,


EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 09266-801-026-4

ASN ASN-ID-219

DECLARATION OF INVENTORSHIP

WITH ASSIGNMENT

DECLARACION DE INVENTORES

CON TRANSFERENCIA

100 A 037
7500
321

We, the undersigned

Nosotros,

Dr. Matthias Wiesner; Dr. Simon Goodman; Dr. Rudolf Gottschlich

citizens of

de nacionalidad

Germany

Alemania

residing at

domiciliados en

Frankfurter Str. 250

Frankfurter Str. 250

64293 Darmstadt

64293 Darmstadt,

Germany

Alemania

by these presents declare under oath to be the sole and true inventors of the invention titled:

por el presente documento declaramos bajo juramento ser los únicos y verdaderos inventores de la invención titulada:

~~Process for the preparation of 5-4-piperonyl benzofuran derivatives and their use as insecticides~~

Indol-3-yl-Derivatives

Derivados de Indol -3-yl

and to transfer in full property without reservation or limitation whatsoever all our rights on same to

y que cedemos en plena propiedad y sin reserva ni limitación alguna todos nuestros derechos sobre la misma a

Merck Patent GmbH
Darmstadt, Germany

Merck Patent GmbH
Darmstadt, Alemania

residing at

domiciliada en

Darmstadt, Germany

Darmstadt, Alemania

who may apply for and obtain its own name the registration of the corresponding patent in the Republic of Columbia, holding all the corresponding rights.

quien podrá solicitar y obtener a su nombre el registro de la patente correspondiente en la República de Columbia ejerciendo todos los derechos que a ello corresponde.

Granted and signed at

Dado y firmado en

on

a los días del mes de de 20

INVENTORS:

INVENTORES:


Dr. Matthias Wiesner


Dr. Simon Goodman


Dr. Rudolf Gottschlich

322

Umstehende, heute eigenhändig vor mir vollzogenen Unterschriften der mir persönlich bekannten Herren:

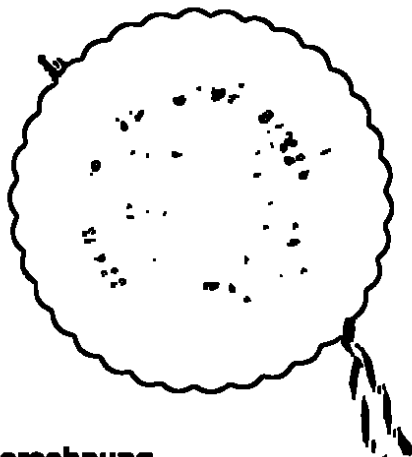
1. Dr. Matthias Wiesner,
2. Dr. Simon Goodman,

beide Geschäftsanschrift: 64293 Darmstadt, Frankfurter Str. 250,

beglaubige ich hiermit.

Der Notar fragte die Beteiligten nach einer Vorbefassung i.S. von § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG. Sie wurde von den Erschienenen verneint.

Darmstadt, den 27. November 2000




(Dr. Ebner, Notar)

Kostenberechnung

Geschäftswert: DM 5.000,00 (festges. gem. § 30,2 KostO)

Gebühr gem. §§ 32, 141, 45 KostO
(Unterschriftsbeglaubigung)

DM 20,00

Auslagen gem. §§ 136, 152 KostO
16% MWSt.

DM 5,00

DM 4,00

Gesamt

DM 29,00


(Dr. Ebner, Notar)

323 208

Nr. 1184 der Urkundenrolle für 2000 (E)

Umstehende, heute eigenhändig vor mir vollzogene Unterschrift des Herrn:

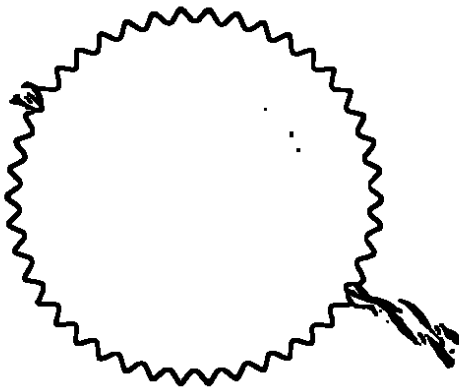
Dr. Rudolf Gottschlich, persönlich bekannt,

Geschäftsanschrift: 64293 Darmstadt, Frankfurter Str. 250,

beglaubige ich hiermit.

Der Notar fragte den Beteiligten nach einer Vorbefassung im Sinne von § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG. Sie wurde von dem Erschienenen verneint.

Darmstadt, den 18. Dezember 2000




(Dr. Ebner, Notar)

Kostenberechnung

Geschäftswert: DM 5.000,00 (festges. gem. § 30,2 KostO)	
Gebühr gem. §§ 32, 141, 45 KostO	DM 20,—
(Unterschriftbeglaubigung)	
Auslagen gem. §§ 137, 152 KostO	DM 5,—
16% MWSt.	<u>DM 4,—</u>
Gesamt	DM 29,—


(Dr. Ebner, Notar)

- 910 E - 2/2 -

Die Echtheit vorstehender Unterschrift des
Notars Dr. Wolfgang Ebner in Darmstadt
und die Echtheit des beigedruckten Dienst-
siegels/stempels werden hiermit bestätigt.
Zugleich wird bescheinigt, daß der Vorge-
nannte zur Vornahme der Amtshandlung
befugt war.

Geb.Verz.Nr. 1a) aa) bb) JVKostO: DM 20,1
Darmstadt, den 20. DEZ. 2000

Der Präsident des Landgerichts



Im Auftrag

Wellenreuther
Vorsitzender Richter

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von ...Dr. Wolfgang Ebner.....
3. in seiner Eigenschaft als ...Notar.....
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des Notars
Dr. Wolfgang Ebner in Darmstadt.....

Bestätigt

5. in Darmstadt 6. am 27.06.2001

7. durch den Präsidenten des Landgerichts

am 1.06.2001 2/1 - 940/2001

10. Unterschrift



Schmidt-von Rhein

324
B

TRADUCCION OFICIAL No. 8537

Traducción de los sellos y legalizaciones en alemán que se encuentran a continuación de un documento escrito en inglés y español, por medio del cual los señores Dr. Matthias Wiesner; Dr. Simon Goodman; Dr. Rudolf Gottschlich declaran ser los únicos inventores de la invención titulada **Derivados de indol-3-ilo**, y ceden sin limitación a la sociedad Merck Patent GmbH, domiciliada en Darmstadt, Alemania, todos los derechos inherentes a dicha invención. Hay 3 firmas.

Protocolo notarial No. 1094 del 2001 (E)

Certifico la autenticidad de las firmas antecedentes puestas ante mí por los señores

1. Dr. Matthias Wiesner,

2. Simon Goodman

ambos con domicilio comercial en 64293 Darmstadt, Frankfurter Str. 250.

El notario preguntó a los interesados sobre una previa actuación en el sentido del Art. 3 inciso 1 numeral 7 de la

LUZ ARRIAGA DE HEER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
[Firma]
Resolución No. 889 Minjusticia

325
325

Ley de Legalizaciones. La pregunta fue contestada negativamente.

Darmstadt, 27 de noviembre 2000.

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Ebner, notario)

(Hilo y oblea notarial en relieve)

Costas

Valor del negocio: DM 5.000 (seg. Art. 30,2 KostO)

Derechos según Art. 32, 141, 45 KostO DM 20,--
(autenticación de firma)

Derechos según Art. 136, 152 KostO DM 5,00

IVA 16% DM 4,00

DM 29,00

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Ebner, Notario)

Protocolo notarial No. 1184 del 2000 (E)

Certifico la autenticidad de las firmas antecedentes puestas ante mí por el señor

Dr. Rudolf Gottschlich, a quien conozco en persona

LUX ANTIAGA DE HERNER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
[Firma]
 Resolución No.589 Minjusticia

con domicilio comercial en 64293 Darmstadt, Frankfurter Str.
250

El notario preguntó a los interesados sobre una previa actuación en el sentido del Art. 3 inciso 1 numeral 7 de la Ley de Legalizaciones. La pregunta fue contestada negativamente.

Darmstadt, 18 de diciembre 2000

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Ebner, notario)

(Hilo y oblea notarial en relieve)

Valor del negocio: DM 5.000 (seg. Art. 30,2 Kost0)

Derechos según Art. 32, 141, 45 Kost0 DM 20,--
(autenticación de firma)

Derechos según Art. 136, 152 Kost0 DM 5,00

IVA 16% DM 4,00

DM 29,00

Fdo.: firma ilegible

(Dr. Ebner, Notario)

LUZ ARRIAGA DE HE/BER
TRADUCCION E INTERPRETE OFICIAL
[Firma]
RECIBIENDO DEL NOTARIO

328
4
H

(dorso) -910 E - 2/2 -

Se certifica la autenticidad de la firma antecedente del notario de Darmstadt, Dr. Wolfgang Ebner, y la del sello oficial que la acompaña. Igualmente se certifica que el mencionado notario estaba facultado para realizar ese acto oficial.

Regl. Derechos numeral 1 a) bb) JVKosto: DM 20,--

Darmstadt, 20 de diciembre 2000

El Presidente del Tribunal Regional

Fdo.: firma ilegible

Wellenreuther

Juez Presidente

(sello redondo en tinta)

El Presidente del Tribunal Regional

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de octubre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por el notario Dr. Wolfgang Ebner

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario de Darmstadt, Dr. Wolfgang Ebner

11/12/2000
ARRIAGA DE HERBER
NOTARIO E INTERPRETE OFICIAL
Firma: [Firma]
Resolución: [Resolución]

328
27/7

Certificado

5. en Darmstadt 6. El 27.06.2001
7. por el Presidente del Tribunal Regional
8. bajo el No 910 E 2/1 - 940/2001
9. Sello 10. Firma
El Presidente del Fdo.: firma ilegible
Tribunal Regional de Darmstadt Schmidt-von Rhein

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, de la cual se deja nota en los
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 27 de julio 2001

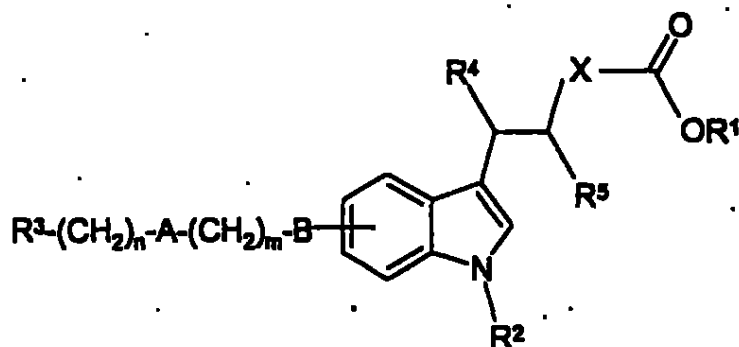
LIZ ARRIAGA DE HERRER
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
Resolución No.546 Minjusticia
155993
MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2001 AUG -1 A 11:23
Jefe de Legaciones
Embajada de Bogotá D.C.

329/354

REIVINDICACIONES

1. Derivados de indol-3-ilo de la fórmula I



donde

- A y B independientemente entre sí significan O, S, NH, NR⁷, CO, CONH, NHCO o un enlace directo, !!!
- X significa alquileno insustituido o monosustituido con R⁴ o R⁵ con 1 a 2 átomos de C o un enlace directo,
- R¹ significa H, Z o -(CH₂)ₒ-Ar,
- R² significa H, R⁷ o -C(O)Z,
- R³ significa NHR⁶, -NR⁶-C(=NR⁶)-NHR⁶, -C(=NR⁶)-NHR⁶, -NR⁶-C(=NR⁹)-NHR⁶, -C(=NR⁹)-NHR⁶ o Het¹,
- R⁴ o R⁵ independientemente entre sí significan H, oxo, R⁷, -(CH₂)ₒ-Ar, -C(O)-(CH₂)ₒ-Ar, -C(O)-(CH₂)ₒ-R⁷, -C(O)-(CH₂)ₒ-Het, Het, NHR⁶, NHA_r, NH-Het, CONH-R⁷, CONH-(CH₂)ₒ-Ar, CONH-(CH₂)ₒ-Het, OR⁷, OAr, OR⁶ o O-Het,
- R⁶ significa H, -C(O)R⁷, -C(O)-Ar, -C(O)-Het, R⁷, COOR⁷, COO-(CH₂)ₒ-Ar, COO-(CH₂)ₒ-Het, SO₂-Ar, SO₂R⁷ o

330
33

SO₂-Het,

- R⁷ significa alquilo con 1 a 10 átomos de C o cicloalquilo con 3 a 10 átomos de C,
- R⁸ significa Hal, NO₂, CN, Z, -(CH₂)₀-Ar, COOR¹, OR¹, CF₃, OCF₃, SO₂R¹, NHR¹, N(R¹)₂, NH-C(O)R¹, NHCOOR¹, COOH, COOZ o C(O)R¹,
- R⁹ significa CN o NO₂,
- Z significa alquilo con 1 a 6 átomos de C,
- Ar significa arilo insustituido o sustituido una o varias veces con R⁸,
- Hal significa F, Cl, Br o I,
- Het significa un resto mono- o bicíclico saturado, parcial- o totalmente insaturado con 5 a 10 elementos del anillo, donde pueden estar presentes 1 o 2 átomos de N y/o 1 o 2 átomos de S o O y el resto heterocíclico puede estar sustituido una o dos veces con R⁸,
- Het¹ significa un resto mono- o bicíclico heterocíclico saturado, parcial- o totalmente insaturado con 5 a 10 elementos del anillo y 1 a 4 átomos de N, que puede estar insustituido o sustituido una o dos veces con Hal, R⁷, OR⁷, CN, NHZ, oxo o NO₂,
- n significa 0, 1 o 2,
- m significa 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6,
- o significa 0, 1 o 2,

331
230

así como sus sales y solvatos fisiológicamente inofensivos.

2. Los enantiómeros de la fórmula I según reivindicación 1.

3. Los compuestos de la fórmula I según reivindicaciones 1 y 2, caracterizados porque X es un enlace directo.

4. Los compuestos de la fórmula I según reivindicaciones 1 a 3, caracterizados porque

B significa O,

R⁴ significa R⁷, -(CH₂)₀-Ar o Het,

o significa 0 o 1,

R⁵ significa H y

R⁷ significa alquilo con 1 a 10 átomos de C o cicloalquilo con 3 a 10 átomos de C.

5. Los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1

- a) ácido 3-fenil-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
- b) ácido 3-fenil-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
- c) ácido 3-fenil-3-{6-[4-(piridin-2-il-amino)-butoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
- d) ácido 3-fenil-3-{5-[4-(piridin-2-il-amino)-butoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
- e) ácido 3-fenil-3-{5-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-1H-

3322
9/1

indol-3-il}-propiónico;

- f) ácido 3-fenil-3-[6-(piridin-2-il-amidocarboximetoxi)-indol-3-il]-propiónico;
 - g) ácido 3-fenil-3-[6-(benzimidazol-2-il-amidocarboximetoxi)-indol-3-il]-propiónico;
 - h) ácido 3-fenil-3-[6-(imidazol-2-il-amidocarboximetoxi)-indol-3-il]-propiónico;
 - i) ácido 3-{6-[3-(4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il-amino)-propoxi]-1H-indol-3-il}-3-fenil-propiónico;
 - j) ácido 3-(4-fluorfenil)-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico;
 - k) ácido 3-(3,5-diclorofenil)-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico;
 - l) ácido 3-(4-cloro-5-trifluormetil-fenil)-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico;
 - m) ácido 3-ciclohexil-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico;
 - n) ácido 3-piridin-4-il-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
 - o) ácido 3-(3-cloro-fenil-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico;
 - p) ácido 3-fenil-3-[6-(3-guanidino-propiloxi)-indol-3-il]-propiónico;
 - q) ácido 3-benzo[1,2,5]tiadiazol-5-il-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-1H-indol-3-il}-propiónico;
-

3330

- r) ácido 3-(3-hidroxi-fenil)-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propoxi]-indol-3-il}-propiónico;
- s) ácido 3-[4-metoxicarbonil-fenil]-3-{6-[3-(piridin-2-il-amino)-propiloxi]-indol-3-il}-propiónico,
- y sus sales y solvatos fisiológicamente inofensivos.

6. Procedimiento para la preparación de los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1 y sus sales o solvatos, caracterizado porque

- a) se libera un compuesto de la fórmula I de uno de sus derivados funcionales tratándolo con un agente de solvólisis o hidrogenólisis,
- o
- b) se convierte un resto R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y/o R^6 en otro resto R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y/o R^6 ,
- i) convirtiendo por ej. un grupo amino en un grupo guanidino por reacción con un agente de amidación,
- ii) saponificando un éster,
- iii) alquilando o acilando un grupo amino,
- iv) convirtiendo un grupo ciano en un grupo amidino,

y/o convirtiendo una base o ácido de la fórmula I en una de sus sales.

7. (Los) los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1 y sus sales y solvatos fisiológicamente

inofensivos como sustancias activas terapéuticas.

8. Los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1 y sus sales y solvatos fisiológicamente inofensivos como inhibidores de la integrina.

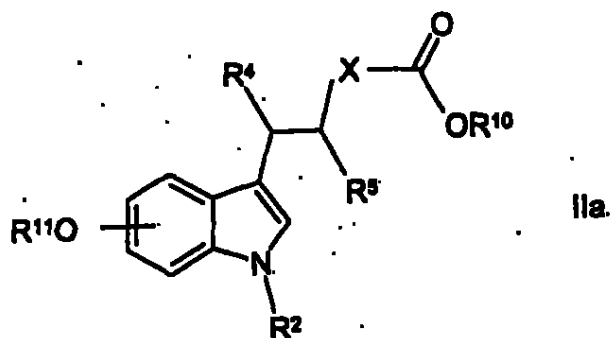
9. Preparación farmacéutica caracterizada por un contenido de por lo menos un compuesto de la fórmula I según reivindicación 1 y/o una de sus sales o solvatos fisiológicamente inofensivos.

10. Empleo de los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1 y/o de sus sales y solvatos fisiológicamente inofensivos para la preparación de un medicamento.

11. Empleo de los compuestos de la fórmula I según reivindicación 1 y/o de sus sales y solvatos fisiológicamente inofensivos para la preparación de un medicamento para el tratamiento de trombosis, infarto del miocardio, enfermedades cardíacas coronarias, arterioesclerosis, inflamaciones, restenosis, artritis reumática, enfermedad degenerativa macular, retinopatía diabética, enfermedades tumorales, osteoporosis, infecciones y restenosis después de angioplastia.

12. Los compuestos de la fórmula IIa

340
335

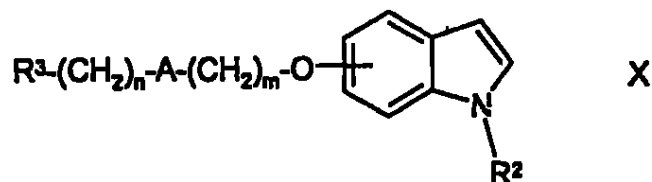


donde R^2 , R^4 y R^5 tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y

X significa un enlace,

R^{10} y R^{11} independientemente entre sí significan un grupo protector hidroxilo o H.

13. Los compuestos de la fórmula X



donde

R^2 , R^3 , A, n y m tienen el significado indicado en la reivindicación 1 y sus sales.



336

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 341

Radicación no 01-8901

Concepto Técnico no 1705

Clasificación Internacional de Patentes: A61K 31/404

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI [☒] NO [☐] Contiene un resumen de la invención (Art.26-e).
- SI [☒] NO [☐] Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d).
- SI [☒] NO [☐] Contiene la descripción de la invención (Art.26-b).
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d)
- SI [☒] NO [☐] Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c).
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h).
- SI [☐] NO [☐] NO ES APLICABLE [☒] Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-i).
- SI [☐] NO [☒] La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-j).
- SI [☒] NO [☐] La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI [☒] NO [☐] **CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI [☐] NO [☒] ver hoja(s) anexa(s)

EXAMINADOR TÉCNICO
202050

Bogotá D. C., . DICIEMBRE 6 DEL 2002

Carrera 13 No. 27-00 Piso 8 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia



337

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Folio: 342

2020
Bogotá DCDoctora
EMILIO FERRERO
Apoderado

REFERENCIA:

Radicación No.	01-9901
Trámite	002
Evento	001
Actuación	416
Oficio No.	2319
Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC, a los 28 de Dic. 2002

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

526

202050

Carrera 13 No. 27-00 Fls 5 y 10
Cónmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@dic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia