

CASTELLANOS & Co.  
ABOGADOS  
Calle 94 A No. 7 A - 09  
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-010041 - 00005-0000

Fecha: 2009-04-17 15:15:33 Dep. 2020 NUECREACION  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 7

Re.: Expediente No. 05.010.041

Solicitud de Patente de Invención para: **ARILCICLOALQUILAMINAS ACILADAS Y  
SU USO COMO PRODUCTOS FARMACEUTICOS**

Solicitante: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GmbH**

### **RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO**

**LUIS PATIÑO LEIVA**, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en atención a su oficio No. 15563 notificado el 5 de diciembre de 2008, y posterior prórroga el día 27 de febrero de 2009 atentamente me permito dar repuesta al mismo de la siguiente manera:

#### **Claridad de las reivindicaciones**

Con el fin de superar la objeción en cuestión, la reivindicación 1 ha sido claramente limitada en cuanto a los radicales  $R_1$  y  $R_2$ . En efecto, el radical  $R_1$  ha sido restringido a fenilo sustituido o no sustituido así como los sustituyentes del mismo. De igual manera, la definición de  $R_2$  ha sido restringido a los grupos heteroarilo específicos descritos en la página 16 de la descripción. Los sustituyentes  $R_{10}$  a  $R_{27}$  han sido eliminados. De igual manera, el valor de  $n$  ha sido restringido a 1 o 3. Por su parte, las reivindicaciones 3 y 6 han sido eliminadas.

Así las cosas, el capítulo reivindicatorio ha sido drásticamente restringido, los términos arilo y heteroarilo han sido claramente definidos de tal manera que el compuesto de formula (I) es totalmente claro y conciso.

133-133

**CASTELLANOS & Co.**  
A B O G A D O S  
Calle 94 A No. 7 A - 09  
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Por otra parte, la reivindicación 7 ha sido eliminada del capítulo reivindicatorio y por lo tanto la objeción sobre dicha reivindicación debe tenerse como superada.

#### **Reivindicaciones de Uso**

Con el fin de superar la objeción de uso, las reivindicaciones 9 y 10 han sido eliminadas del capítulo reivindicatorio

#### **Novedad**

La presente invención es novedosa en vista del documento D1 toda vez que el capítulo reivindicatorio ha sido drásticamente restringido con sustituyentes claramente definidos.

En el documento D1 se establece de manera general que el grupo  $R_1$  ( $R_1$  en D1 corresponde al grupo  $R_2$  en la presente solicitud) puede ser fenilo el cual puede tener un sustituyente escogido entre halógeno, hidroxilo, amino, nitro, trifluorometilo y alcoxi inferior, aunque el único compuesto revelado en D1 que contiene dicho grupo fenilo es el compuesto en el cual,  $R_2$  ( $R_2$  en la presente solicitud) es 3,4,5-trimetoxifenil. Ahora bien, teniendo en cuenta que en la definición de  $R_2$  en la presente solicitud se ha eliminado el radical arilo y se ha restringido a heteroarilo, la presente invención es novedosa en vista de D1.

Por otra parte, los dos únicos compuestos específicos que se encuentran revelados en D1 y que estarían cubiertos por la presente solicitud son los compuestos en los cuales el grupo  $R_1$  ( $R_1$  en la presente solicitud) es fenilo no sustituido y el grupo  $R_2$  ( $R_2$  en la presente solicitud) es piridin-4-il o 3,4,5-trimetoxifenil. Ahora bien, en los demás compuestos específicos mencionados en D1 el grupo correspondiente a  $R_2$  no es un grupo aromático como si se requiere en la definición de  $R_2$  de la presente solicitud. Es más, los compuestos específicos revelados en D1 se encuentran excluidos por el condicionante de la presente invención al final de la reivindicación 1.

En conclusión, la divulgación genérica de D1 no anticipa de ninguna manera las características estructurales del compuesto acá reivindicado.

134 134

**CASTELLANOS & Co.**  
**ABOGADOS**  
Calle 94 A No. 7 A - 09  
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Teniendo en cuenta que todas las objeciones han sido debidamente superadas con el nuevo pliego reivindicatorio, solicito a su Despacho conceder el privilegio de patente a la presente invención.

Sin embargo, si el examinador lo considera necesario, solicito respetuosamente emitir una segunda acción oficial en el asunto de la referencia.

**Anexos**

- Nuevo capítulo reivindicatorio
- Formulario de modificaciones
- Recibo de pago

De la Señora Jefe,

  
Luis Patiño Leyva

C.C. No. 2.930.616 de Bogotá

T.P.A. No.2698 del C. Sup. de la Judicatura

Calle 94A # 7A-09

Teléfonos: 6107420

17 ABR. 2009

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una solicitud

②

Nombre: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GmbH**

Dirección: **Brüningstrasse 50  
Frankfurt am main  
Alemania**

Domicilio: **Frankfurt am main  
Alemania**

Lugar de Constitución: **Alemania**

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE  
O APODERADO

Nombre: **LUIS PATIÑO LEYVA**

Dirección: **Calle 94A # 7A-09**

Teléfono: **610 74 20** Fax: **610 74 80**

E-mail: **info@castellanosyco.com**

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

**2.930.616** TPA **2698**

④

Número de Expediente:

**05.010.041**

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio para el examen de patentabilidad.

⑥

Comprobante de pago No.

**09-26,469**

Fecha

**3 de abril de 2009**

⑦

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.

☐

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

☒

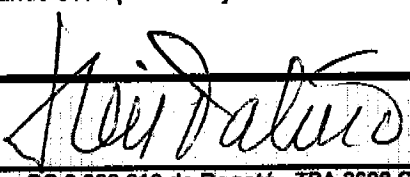
Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE

**LUIS PATIÑO LEIVA**

FIRMA

  
**CC 2.930.616 de Bogotá - TPA 2698 CSJ**

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página - LPL/P20139

17 ABR. 2009

## SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 26,469  
FECHA : ABRIL 3 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-010041- -00005-0000

Fecha: 2009-04-17 15:15:33 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 7

## \*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*

| DEPOSITANTE        | TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO | FECHA PGO  | Vr. PAGO     |
|--------------------|--------------|-----------------|-----------|----------|------------|--------------|
| ALVARO CASTELLANOS | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062751367 | 19885036 | 03/04/2009 | 1,484,000.00 |

## \*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*

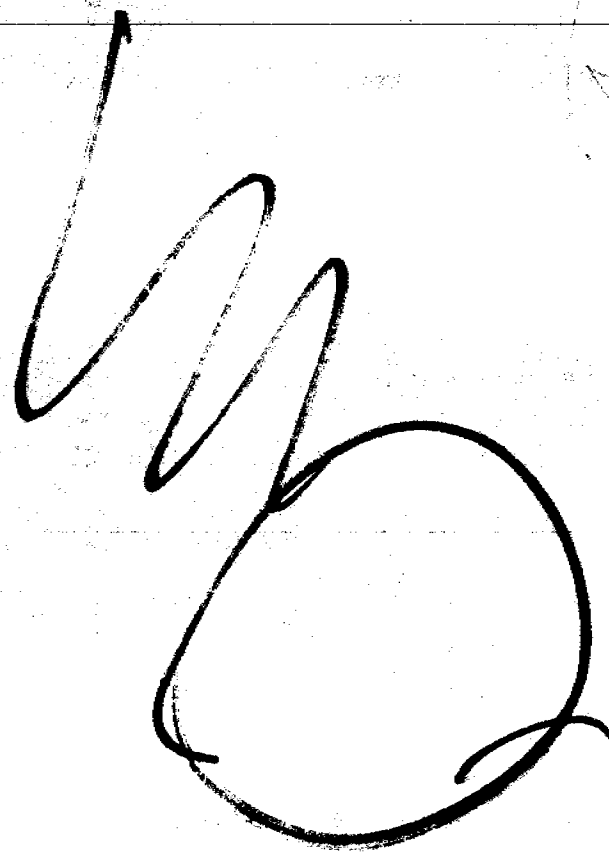
| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO                       | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|--------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-03 | CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA |                |
|       |             | 12 MARCAS Y LEAS COMERCIALES   | 111,000.00     |
|       |             | TOTAL :                        | \$ 111,000.00  |

SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

130

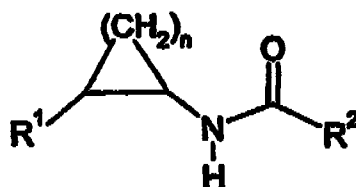


137  
137

1

# **REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto de la fórmula I



5 en cualquiera de sus formas estereoisómeras, o una mezcla de las mismas en cualquier relación, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde, en la fórmula I:

R¹ es fenilo, el cual está no sustituido o sustituido con uno o múltiples sustituyentes idénticos o diferentes, seleccionados del grupo consistente en alquilo-C₁-C₃, halógeno y  
10 CF₃.

R² es furilo, pirrolilo, tienilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, imidazolilo, piridazinilo, pirazinilo, piridinilo, pirimidinilo, benzimidazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, indolilo, benzofuranilo,  
15 benzodioxolilo, benzotiofenilo e indazolilo, están no sustituidos o portan uno o múltiples sustituyentes idénticos o diferentes, seleccionados del grupo consistente en:

halógenos; alquilo-C₁-C₃, CF₃; fenilo, piridinil-metilo, tienilo-metilo, OH, alcoxi C₁-C₃, alquilsulfonil, C₁-C₃, NH₂, alquilamino C₁-C₄, diamino (alquilo C₁-C₄), (alquilo C₁-C₃)-  
20 CONH-, (alquilo C₁-C₃)-SO₂NH y morfolinilo

n es 1 o 3

con la condición de que, si R¹ es fenilo no sustituido, R² no puede ser tienilo no sustituido,  
25 piridinilo no sustituido, indolil no sustituido, 3-hidroxi-4-metoxipiridinil-2-il o 2,6 dicloropiridinil-2-il

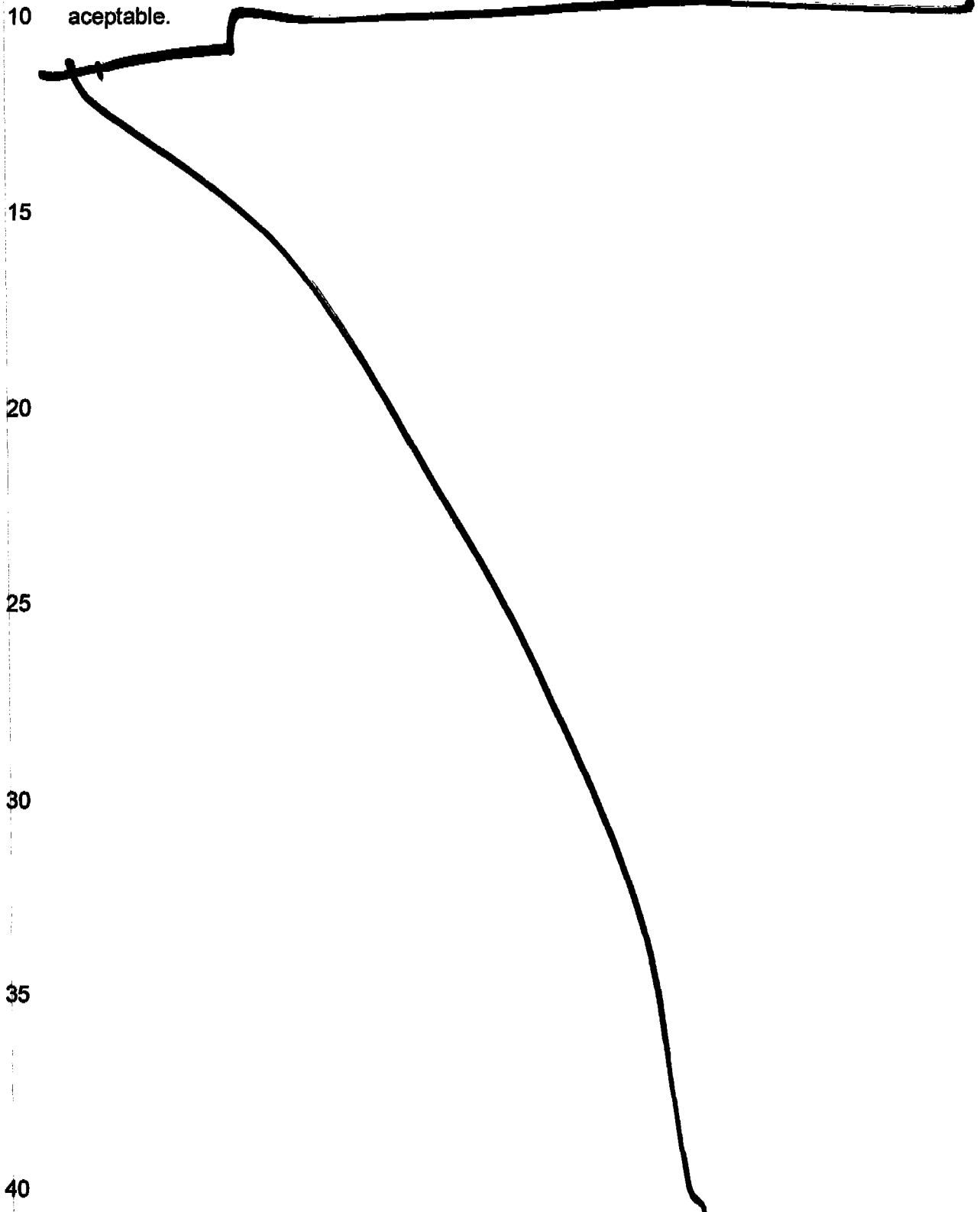
2. Un compuesto de la fórmula I como se ha definido en la reivindicación 1, en  
30 cualquiera de sus formas estereoisómeras, o una mezcla de las mismas en cualquier relación, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde en la fórmula I el residuo R¹ es fenilo no sustituido.

3. Un compuesto de la fórmula I como se ha definido en una o más de las  
35 reivindicaciones 1 a 2, en cualquiera de sus formas estereoisómeras, o una mezcla de las mismas en cualquier relación, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde en la fórmula I el número n es 1.

4. Un compuesto de la fórmula I como se ha definido en una o más de las reivindicaciones 1 a 3, en cualquiera de sus formas estereoisómeras, o una mezcla de las mismas en cualquier relación, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde en la fórmula I el número n es 3.

5

5. Una preparación farmacéutica que comprende una dosis efectiva de al menos un compuesto de la fórmula I, según se ha definido en la reivindicación 1, en cualquiera de sus formas estereoisómeras, o una mezcla de las mismas en cualquier relación, y/o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.



139  
139

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**  
**DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

Bogotá, D.C., 24 de diciembre de 2009

Apoderado: Luis Patiño Leiva

**ASUNTO**

Radicación 05-10041  
Trámite 002  
Evento 001  
Actuación 430  
Oficio 449  
Folios

Patente de Invención ☒

Vía PCT (fase nacional) ☒

Cap. I ☐

Cap. II ☒

No. Sol. Internacional

PCT/EP2003/008104

Fecha de Presentación Internal.

24-jul-2003

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento nuevamente en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina de Naciones, se le comunica:

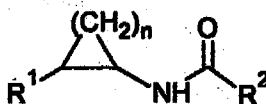
**1. Documentos estudiados**

- a) Descripción: Folios: 43 a 77 (como se radicó inicialmente)
- b) Reivindicaciones: Folios 78 a 89 (como se radicó inicialmente)
- c) Prioridad: Folio: 1, EP02017587, 07/ago/2002

**2. Objeto de la invención**

Título de la solicitud: Arilcicloalquilaminas aciladas y su uso como productos farmacéuticos.

El objeto son los compuestos que estas dentro del alcance de la formula Markush (I):



Y las composiciones que los comprenden.

- Reivindicaciones 1-4: Compuestos de la fórmula (I);
- Reivindicación 5: Composiciones que los comprenden.

Se catalogó la invención, según la Clasificación Internacional de Patentes (I.P.C.)  
C07C233/58, A61K31/66, A61P9/00

140  
140

### 3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el estado de la técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria

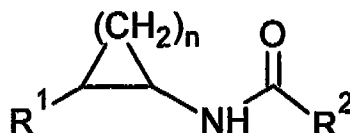
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la materia de la solicitud, y se encontró el siguiente documento más relevante:

| Nº | Documento | Título                   | Fecha de publicación* |
|----|-----------|--------------------------|-----------------------|
| D1 | US3192229 | Phenylcyclopropyl amides | 29-jun-1965           |

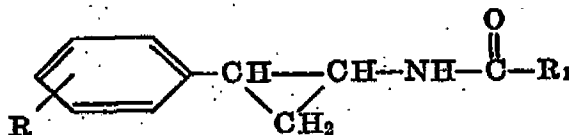
### 4. Análisis de patentabilidad (Artículo 14 D 486 de la C.A.N.)

#### 4.1 Novedad (Artículo 16 D486 de la C.A.N.)

La solicitud en estudio reclama compuestos de formula general (I):



D1 [US3192229] enseña compuestos de formula N-(2-phenylcyclopropyl) aril ó hateroaril amida



bons) such as methyl or ethyl, and  $R_1$  is hydrogen or a substituent of the group consisting of:

(b) Phenyl containing at least one nuclear substituent such as a halogen like chlorine, hydroxy, amino, nitro, trifluoromethyl and lower alkoxy.

(c) Aralkyl groups such as phenyl-lower alkyl groups including the benzyl, phenethyl, phenylisopropyl and phenylbutyl.

(e) Heterocyclic groups such as pyridyl, pyridyl-lower alkyl, N-lower alkyl piperidyl, N-lower alkyl piperidyl-lower alkyl, pyrrolidyl, pyrrolidyl-lower alkyl, N-lower alkyl pyrrolidyl-lower alkyl, indolyl and 5-keto-2-pyrrolidyl.

La solicitud en estudio sigue reclamando compuestos del estado de la técnica tal como por ejemplo:

N-(2-phenylcyclopropyl)-5-methyl-3-isoxazole-carboxamide

141  
141

N-(2-phenylcyclopropyl)-pyrrolidine-2-carboxamide  
N-(2-phenylcyclopropyl)-nicotinamide  
N-(1-methyl-2-phenylcyclopropyl)-isonicotinamide  
N-(2-phenylcyclopropyl)-nicotinamide

**Composición:**

|                                                             | Mg. |
|-------------------------------------------------------------|-----|
| (1) N-trans-2-phenylcyclopropyl-5-pyrrolidone-2-carboxamide | 5   |
| (2) Starch, U.S.P.                                          | 57  |
| (3) Lactose, U.S.P.                                         | 73  |
| (4) Talc, U.S.P.                                            | 9   |
| (5) Stearic acid                                            | 6   |

Tal como se puede ver la anterioridad D1 destruye categóricamente la novedad de la solicitud. Véase Columnas 1-4, donde se demuestra categóricamente que la solicitud en estudio no tiene novedad.

Si una solicitud no posee novedad, obviamente no tiene novel inventivo.

**13. Conclusión:**

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

| N° | Documento N° | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta       |
|----|--------------|----------------------------|----------------------------|
| D1 | US 3192229   | 1 a 3 y 5<br>4             | Novedad<br>Nivel inventivo |

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 60 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.

  
**JESUS FERNEL GARCIA GARCIA**

Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

CONCEPTO TÉCNICO No. 4444 EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202012