

CAVELIER

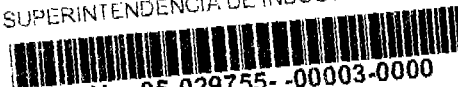
ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

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

Teléfono: (57-1) 347 3811

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-029755-00003-0000

Fecha: 2007-08-28 17:17:27 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

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

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 05.029.755
Asunto : Solicitud de Patente para **DERIVADOS DE LA
PRODROGA 1,3-DIAMINO-2-HIDROXIPROPANO**
Solicitante : **ELAN PHARMACEUTICALS, INC AND PHARMACIA
& UPJOHN LLC**
Clase : A61K 031/131, A61P 025/028
Publicada en : La Gaceta No. 571 Del 29 de diciembre de 2006
Fecha de Solicitud : 5 de abril de 2005

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado en el asunto de la referencia, atentamente, solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia presentada de acuerdo con el Capítulo II del PCT y según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo por valor de \$202.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 36155 de 28 de diciembre de 2006.

2. Ruego atentamente a la Señora Jefe se sirva ordenar que se anexe este recibo para que se efectúe dicho examen y se continúe con el trámite de la solicitud.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 14692 841 001 9
MSMASGVID-103301\WPC14692
No. M-2007-103301\MSM

1301
1301

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-029755- -00003-0000

Fecha: 2007-06-28 17:17:27 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800174009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 49,007
FECHA : JUNIO 20 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55800363	19/06/2007	48,912,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	114 PTC CAP-II EXAMEN DE PATENTIBILIDAD	202,000.00
TOTAL :			\$ 202,000.00

SON: DOSCIENTOS DOS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

COLO 14692 841 001 9

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No 05-29755

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **571** DE

FECHA **29 DE DICIEMBRE DE 2006** EL TERMINO HABIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL **28 DE MARZO DEL 2007**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO _____ **X** _____



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets

Publication number:

0 223 437
A2

D1303
1303

12

EUROPEAN PATENT APPLICATION

21 Application number: 86308270.7

22 Date of filing: 23.10.86

51 Int. Cl.: **C 07 K 5/00, C 07 C 103/50,**
C 07 D 233/64, A 61 K 37/02,
A 61 K 31/16

30 Priority: 12.11.85 US 797321

43 Date of publication of application: 27.05.87
Bulletin 87/22

24 Designated Contracting States: DE FR GB IT

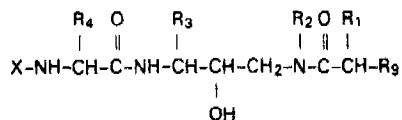
71 Applicant: E.R. Squibb & Sons, Inc.,
Lawrenceville-Princeton Road, Princeton,
N.J. 08540 (US)

72 Inventor: Gordon, Eric Michael, 126 Laning Avenue,
Pennington New Jersey (US)

74 Representative: Thomas, Roger Tamlyn et al, D. Young &
Co. 10 Staple Inn, London WC1V 7RD (GB)

54 Aminocarbonyl renin inhibitors.

57 Compounds are disclosed of the formula



wherein R₁, R₂, R₃, R₄, R₉, and X are defined herein. These compounds intervene in the conversion of angiotensinogen to angiotensin II by inhibiting renin and thus are useful as anti-hypertensive agents.

EP 0 223 437 A2

1304
1304

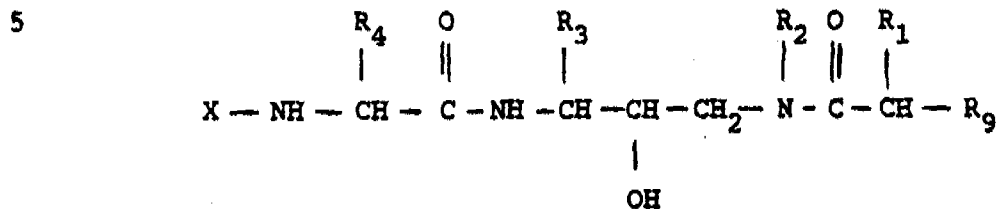
0223437

-1-

HA359

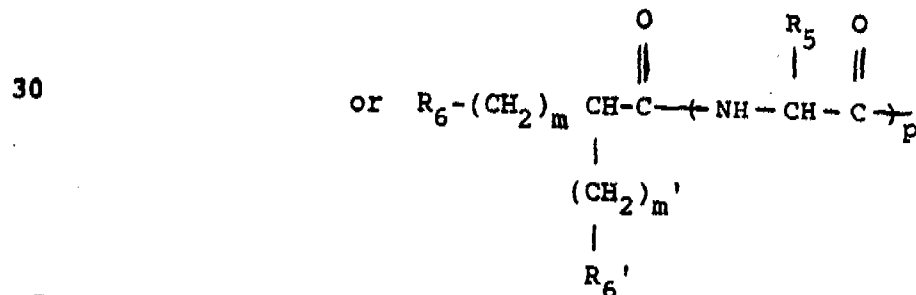
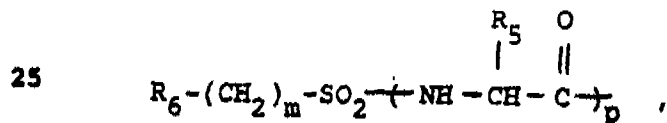
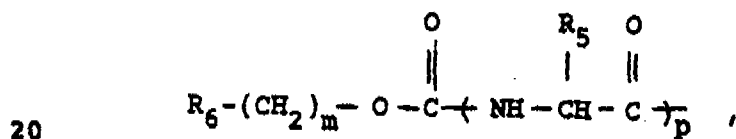
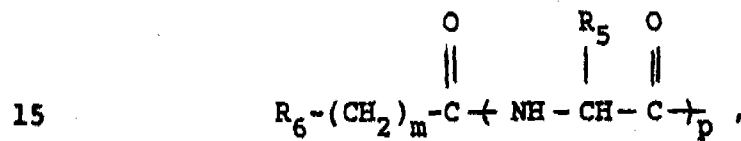
AMINOCARBONYL RENIN INHIBITORS

This invention is directed to new amino
carbonyl containing renin inhibitors of formula I
including pharmaceutically acceptable salts thereof
(I)

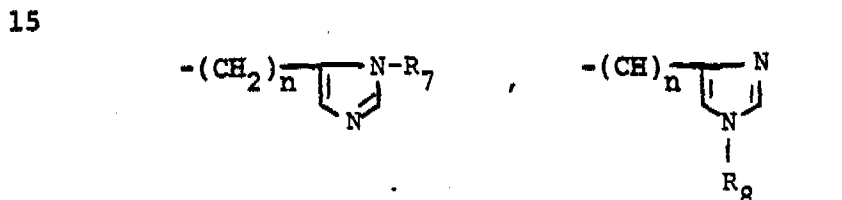
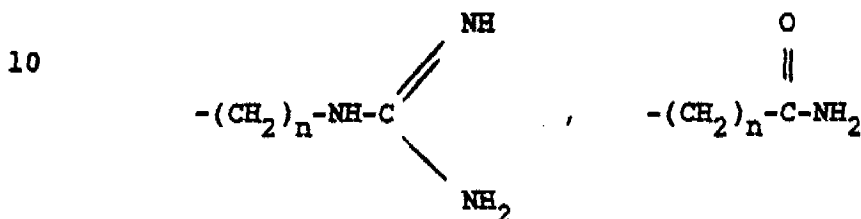


10 wherein:

X is



R_3 , R_4 , R_5 , R_{11} , and R_{12} are independently selected from hydrogen, lower alkyl, halo substituted lower alkyl, $-(CH_2)_n$ -aryl, $-(CH_2)_n$ -heterocyclo, $-(CH_2)_n$ -OH, $-(CH_2)_n$ -NH₂, $-(CH_2)_n$ -SH, $-(CH_2)_n$ -S-lower alkyl, $-(CH_2)_n$ -S- $(CH_2)_g$ -NH₂, $-(CH_2)_n$ -O- $(CH_2)_g$ -OH, $-(CH_2)_n$ -O- $(CH_2)_g$ -NH₂, $-(CH_2)_n$ -S- $(CH_2)_g$ -OH,



20 and $-(CH_2)_n$ -cycloalkyl.

R_1 and R_2 are independently selected from hydrogen, lower alkyl, $-(CH_2)_m$ -aryl, and $-(CH_2)_m$ -cycloalkyl and $-(CH_2)_n$ -heterocyclo.

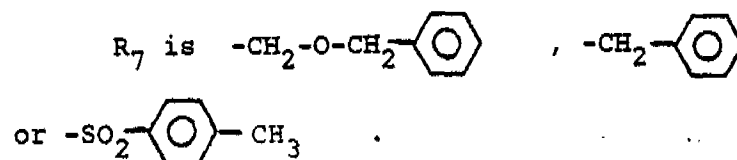
25 R_6 and R_6' are independently selected from lower alkyl, cycloalkyl, aryl, and heterocyclo.

p is zero or one.

m and m' are independently selected from zero and an integer from 1 to 5.

n is an integer from 1 to 5.

30 g is an integer from 2 to 5.



1306
1306

0223437

-3-

HA359

R_8 is 2,4-dinitrophenyl.

R_9 is hydrogen, lower alkyl, $-(CH_2)_m$ -cycloalkyl,

5

$-(CH_2)_m$ -aryl, $-(CH_2)_n$ -heterocyclo, $-\overset{\overset{O}{||}}{C}-NH-R_{10}$, or
 $-\overset{\overset{O}{||}}{C}-R_{13}$.

10

R_{10} is hydrogen, lower alkyl, $-(CH_2)_m$ -cycloalkyl,
 $-(CH_2)_m$ -aryl, $-(CH_2)_n$ -heterocyclo, or

$\begin{array}{ccccc} R_{11} & O & & R_{12} & O \\ | & || & & | & || \\ -CH- & C- & NH- & CH- & C- \end{array} \xrightarrow{q} R_{13}$

15

q is zero or one.

R_{13} is hydroxy, -O-lower alkyl,
 -O- $(CH_2)_m$ -cycloalkyl, -O- $(CH_2)_m$ -aryl,
 -O- $(CH_2)_n$ -heterocyclo, $-NH_2$, or -O-salt forming ion.

20

The term lower alkyl used in defining various symbols refers to straight or branched chain radicals having up to seven carbons.

The term cycloalkyl refers to saturated rings of 4 to 7 carbon atoms with cyclopentyl and cyclohexyl being most preferred.

25

The term halogen refers to chloro, bromo and fluoro.

30

The term halo substituted lower alkyl refers to such lower alkyl groups described above in which one or more hydrogens have been replaced by chloro, bromo or fluoro groups such as trifluoromethyl, which is preferred, pentafluoroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, chloromethyl, bromomethyl, etc.

35

1307
1307

0223437

HA359

- 4 -

5 The term aryl refers to phenyl, 1-naphthyl,
2-naphthyl, mono substituted phenyl, 1-naphthyl,
or 2-naphthyl wherein said substituent is lower
alkyl of 1 to 4 carbons, lower alkylthio of 1 to 4
carbons, lower alkoxy of 1 to 4 carbons, halogen,
hydroxy, amino, -NH-alkyl wherein alkyl is of 1 to
4 carbons, or -N(alkyl)₂ wherein alkyl is of 1 to 4
carbons, di or tri substituted phenyl, 1-naphthyl
10 or 2-naphthyl wherein said substituents are
selected from methyl, methoxy, methylthio,
halogen, and hydroxy.

15 The term heterocyclo refers to fully satura-
ted or unsaturated rings of 5 or 6 atoms containing
one to four N atoms, or one O and up to two N atoms,
or one S and up to two N atoms. The heterocyclo
ring is attached by way of an available carbon atom.
Preferred heterocyclo groups include 2- and 3-thienyl,
2- and 3-furyl, 2-, 3- and 4-pyridyl, and
imidazolyl. The term heterocyclo also includes
20 bicyclic rings wherein the five or six membered
ring containing O, S and N atoms as defined above
is fused to a benzene ring. The preferred
bicyclic ring is indolyl.

25 Jones et al. in WO 84/03044 disclose renin
inhibiting tetra-, penta-, or hexapeptide
analogues of the formula

X-D-E-A-B-Z-W

30 where X and W are terminal groups; D, E, B and Z,
of which any one or, except with reduced
analogues, two may be absent, are aromatic, lipo-
philic or (in the case of E) aromatic, lipophilic,
or basic amino acid or amino acid analogue
35 residues, and A is an analogue of a lipophilic or

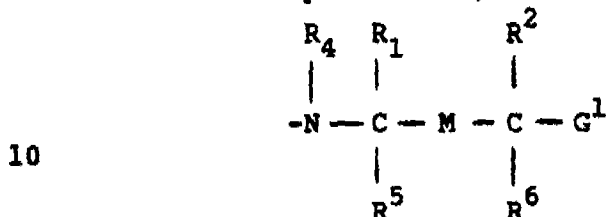
1308
1308

0223437

-5-

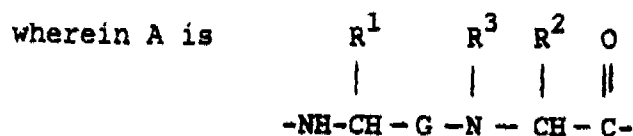
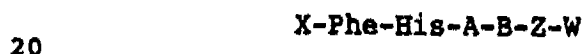
HA359

aromatic dipeptide residue wherein the peptide link
is replaced by one to four-atom carbon or carbon-
nitrogen link which as such or in hydrated form is
an unhydrolyzable tetrahedral analogue of the
5 transition state of the peptide bond as given
above. In particular, A is defined as

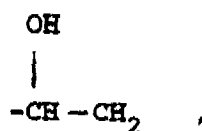


wherein M can be -CH-OH.

Selke et al. in European Patent Application
104,041 disclose renin inhibitory polypeptides
15 including the partial sequence



25 and G is

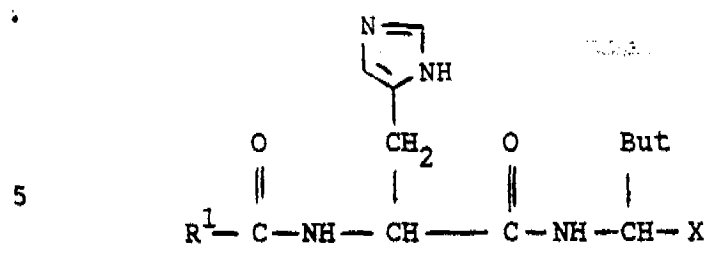


30 X is hydrogen, protecting group, or an amino acyl
residue, B is a lipophilic amino acyl residue, and
Z plus W are an amino alcohol residue or Z is
aminoacyl and W is hydroxy, ester, amide, etc.

Matsueda et al. in European Patent
Application 128,672 disclose renin inhibiting
35 peptides of the formula

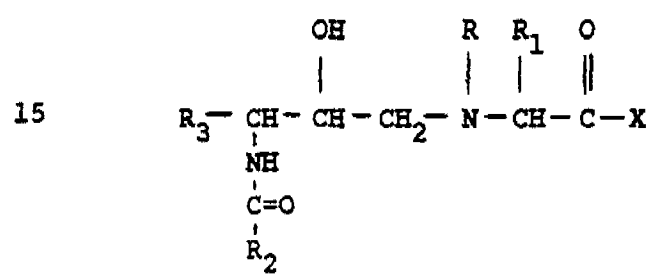
309
1359

0223437



wherein But represents an isobutyl or sec-butyl group and X includes a group of the formula -CH(R²)-Y.

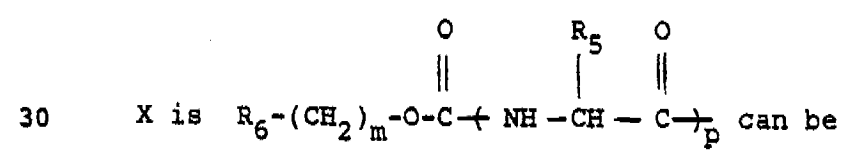
10 Gordon et al. in U.S. Patent 4,514,391 disclose hydroxy substituted peptide compounds of the formula



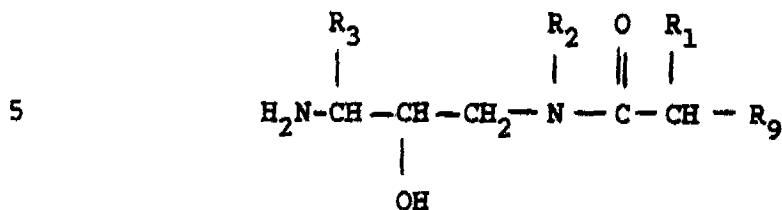
20 which possess angiotensin converting enzyme or enkephalinase inhibition activity.

This invention in its broadest aspects relates to the compounds of formula I above, to compositions and the method of using such compounds as antihypertensive agents.

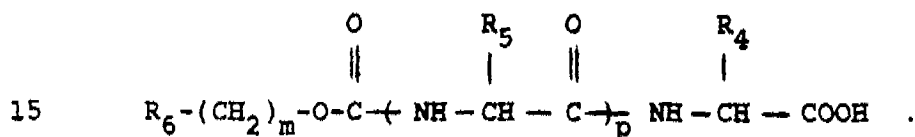
The compounds of formula I wherein



prepared by coupling an alcohol of the formula
(II)

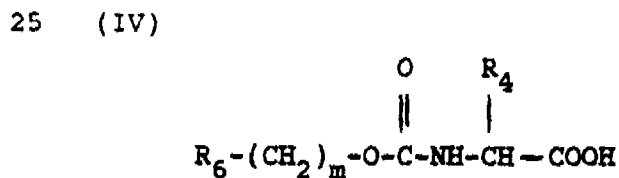


preferably the hydrochloride salt thereof with
a peptide of the formula
(III)



This reaction is preferably performed in a solvent
such as dimethylformamide and in the presence of
hydroxybenzotriazole, diisopropylethylamine, and a
coupling agent such as dicyclohexylcarbodiimide.

The corresponding compounds of formula I
wherein p is zero can be prepared by coupling
the alcohol of formula II with the amino acid of
the formula



13H
1311

The compounds of formula I, and the pharmaceutically acceptable salts thereof, are anti-hypertensive agents. They inhibit the conversion of angiotensinogen to angiotensin I and therefore, are useful in reducing or relieving angiotensin related hypertension. The action of the enzyme renin on angiotensinogen, a pseudoglobulin in blood plasma, produces angiotensin I. Angiotensin I is converted by angiotensin converting enzyme (ACE) to angiotensin II. The latter is an active pressor substance which has been implicated as the causative agent in several forms of hypertension in various mammalian species, e.g., humans. The compounds of this invention intervene in the angiotensinogen → (renin) → angiotensin I → (ACE) → angiotensin II sequence by inhibiting renin and reducing or eliminating the formation of the pressor substance angiotensin II. Thus by the administration of a composition containing one (or a combination) of the compounds of this invention, angiotensin dependent hypertension in a species of mammal (e.g., humans) suffering therefrom is alleviated. A single dose, or preferably two to four divided daily doses, provided on a basis of about 100 to 1000 mg., preferably about 250 to 500 mg. per kg. of body weight per day is appropriate to reduce blood pressure. The substance is preferably administered orally, but parenteral routes such as the subcutaneous, intramuscular, intravenous or intraperitoneal routes can also be employed.

1312
1312

The compounds of this invention can also be formulated in combination with a diuretic for the treatment of hypertension.

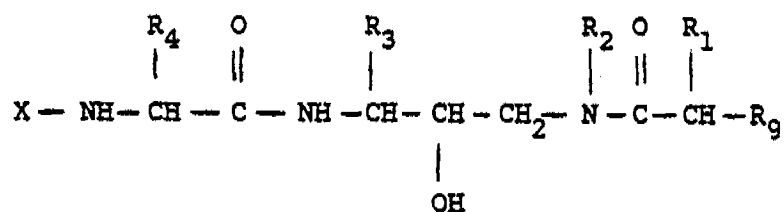
A combination product comprising a compound
5 of this invention and a diuretic can be administered in an effective amount which comprises a total daily dosage of about 1000 to 6000 mg., preferably about 3000 to 4000 mg. of a compound of this invention, and about 15 to
10 300 mg., preferably about 15 to 200 mg. of the diuretic, to a mammalian species in need thereof. Exemplary of the diuretics contemplated for use in combination with a compound of this invention are the thiazide diuretics, e.g., chlorothiazide,
15 hydrochlorothiazide, flumethiazide, hydroflumethiazide, bendroflumethiazide, methyclothiazide, trichloromethiazide, polythiazide or benzthiazide as well as ethacrynic acid, ticrynafen, chlorthalidone, furosemide, musolimine, bumetanide,
20 triamterene, amiloride and spironolactone and salts of such compounds.

The compounds of formula I can be formulated for use in the reduction of blood pressure in compositions such as tablets, capsules or elixirs
25 for oral administration or in sterile solutions or suspensions for parenteral administration. About 100 to 500 mg. of a compound of formula I is compounded with physiologically acceptable vehicle, carrier, excipient, binder, preservative,
30 stabilizer, flavor, etc., in a unit dosage form as called for by accepted pharmaceutical practice.

1313
1313

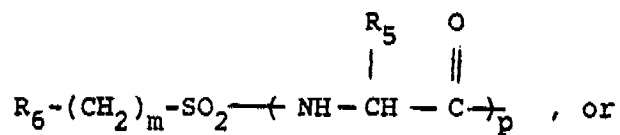
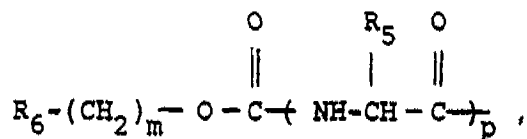
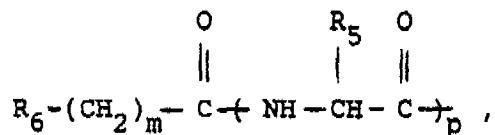
CLAIMS

1. A compound of the formula



or such a compound in pharmaceutically acceptable salt form wherein:

X is

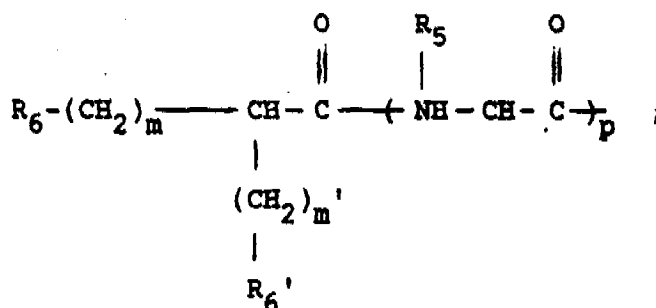


1314
1314

HA359

-63-

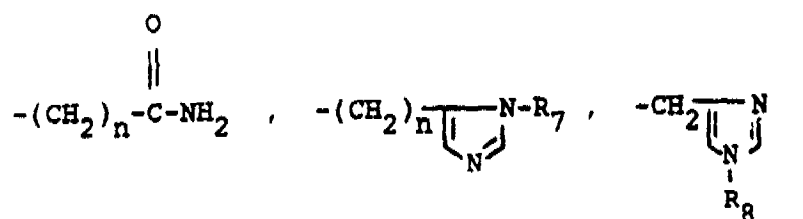
0223437



p is zero or one;

R₃, R₄, R₅, R₁₁, and R₁₂ are independently selected from the group consisting of hydrogen, lower alkyl, halo substituted lower alkyl,

-(CH₂)_n-aryl, -(CH₂)_n-heterocyclo, -(CH₂)_n-OH, -(CH₂)_n-NH₂, -(CH₂)_n-SH, -(CH₂)_n-S-lower alkyl, -(CH₂)_n-O-(CH₂)_g-OH, -(CH₂)_n-O-(CH₂)_g-NH₂, -(CH₂)_n-S-(CH₂)_g-OH,



and -(CH₂)_n-cycloalkyl;

R₁ and R₂ are independently selected from the group consisting of hydrogen, lower alkyl, -(CH₂)_m-aryl, -(CH₂)_m-cycloalkyl and -(CH₂)_n-heterocyclo;

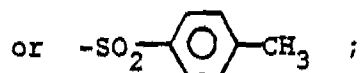
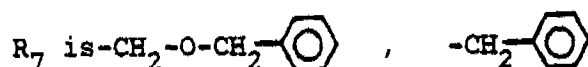
135
1315

R_6 and R_6' are independently selected from the group consisting of lower alkyl, cycloalkyl, aryl, and heterocyclo;

m and m' are independently selected from the group consisting of zero and an integer from 1 to 5;

n is an integer from 1 to 5;

g is an integer from 2 to 5;

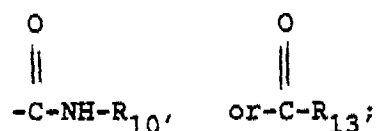


R_8 is 2,4-dinitrophenyl;

R_9 is hydrogen, lower alkyl,

$-(\text{CH}_2)_m$ -cycloalkyl, $-(\text{CH}_2)_m$ -aryl,

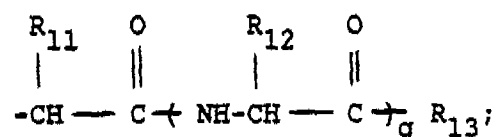
$-(\text{CH}_2)_n$ -heterocyclo,



R_{10} is hydrogen, lower alkyl,

$-(\text{CH}_2)_m$ -cycloalkyl, $-(\text{CH}_2)_m$ -aryl,

$-(\text{CH}_2)_n$ -heterocyclo, or



R_{13} is hydroxy, -O- lower alkyl,

-O- $(\text{CH}_2)_m$ -cycloalkyl, -O- $(\text{CH}_2)_m$ -aryl,

-O- $(\text{CH}_2)_n$ -heterocyclo, or $-\text{NH}_2$;

q is zero or one;

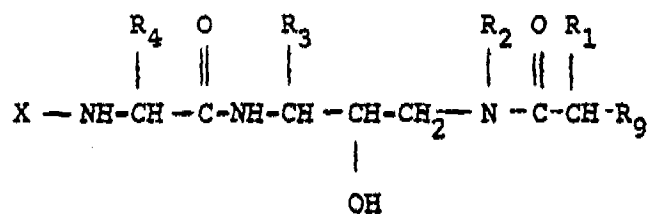
1316
1314

HA359

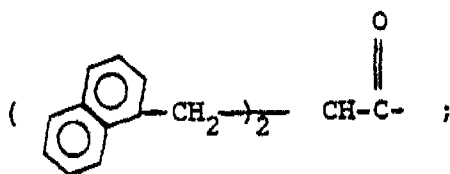
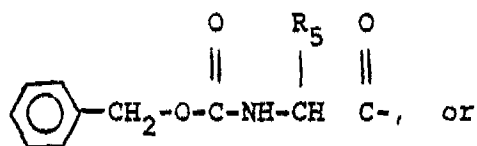
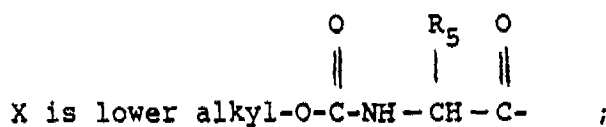
-66-

0223437

2. A compound of Claim 1 having the formula



or such a compound in pharmaceutically acceptable salt form wherein:



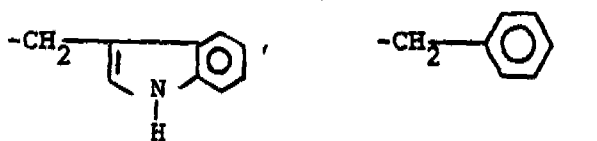
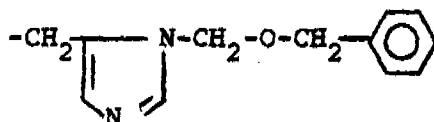
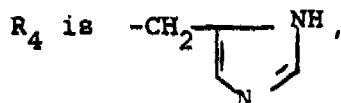
R_1 is hydrogen or lower alkyl of 1 to 5 carbons;

R_2 is hydrogen, lower alkyl of 1 to 5 carbons, $-(CH_2)_m$ -cyclopentyl, $-(CH_2)_m$ -cyclohexyl,

or $-(CH_2)_m$ - ;

m is an integer from 1 to 3

R_3 is straight or branched chain lower alkyl of 3 to 5 carbons, $-CH_2$ -cyclopentyl, or $-CH_2$ -cyclohexyl;



0223437

1318
1318

10. The compound of Claim 3, N-[(1S)-1-(cyclohexylmethyl)-2-hydroxy-3-[[1-oxo-2-[[[(phenylmethyl)amino]carbonyl]hexyl]amino]-propyl]-N²-[N-[(1,1-dimethylethoxy)carbonyl]-L-phenylalanyl]-L-histidinamide.

11. A composition for treating hypertension in a mammalian species comprising a pharmaceutically acceptable carrier and an anti-hypertensively effective amount of a compound of Claim 1.

12. A method of treating hypertension in a mammalian species which comprises administering an anti-hypertensively effective amount of the composition of Claim 11.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO
Apoderado

ASUNTO	Radicación	05-029755
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	11631
	Folios	1323

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒
No. Sol. Internacional	PCT/US2003/028116		
Fecha de Presentación Internal.	2003/09/08		

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

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios: 576 a 1073 como se radicó inicialmente

Reivindicaciones: Folios 1074 a 1276 como se radicó inicialmente

Prioridad: Fecha: 2002/09/06, país: US y número: 60/408.783

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: Derivados de la prodroga 1,3 – diamino-2-hidroxiopropano

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles para la enfermedad de Alzheimer.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de la prodroga 1,3 – diamino- 2- hidroxiopropano capaces de producir compuestos que inhiben la betasecretasa, enzima que produce el péptido beta amiloide (beta A), componente de las placas amiloides de los cerebros con enfermedad de Alzheimer.

3. De la solicitud de Patente

Titulo

Se sugiere al solicitante que modifique el título de la invención de acuerdo a lo que desea proteger en su capítulo reivindicatorio ya que al incluir el término "prodroga" está directamente sugiriendo un "uso" pues las prodrogas tienen su efecto "in vivo", es decir, son "biológicamente activas", ya que se pueden convertir compuestos biológicamente activos bajo condiciones fisiológicas; además es un término vago que no especifica de manera precisa el compuesto derivado al cual se refiere.

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Una vez revisado el capítulo reivindicatorio esta dependencia encuentra:

- La fórmula general no es representativa, ni define todas las posibilidades de compuestos que se pueden obtener ya que en la práctica no es posible realizar las sustituciones respectivas en dichas estructuras para reproducir todas las estructuras moleculares que pueden formarse a partir de dicha fórmula. Por lo tanto se requiere al solicitante delimitar y concretar su materia.
- El solicitante no es claro cuando incluye en sus reivindicaciones los compuestos: "**prodroga**". Al realizar la lectura del capítulo reivindicatorio, se encuentra que las frases resultan imprecisas, dado que no especifican con exactitud el(los) compuesto(s) a los cuales se refiere con dicho término por lo tanto no se aceptan tal como aparecen.
- Reivindicaciones 12 – 16: No es congruente con la descripción un método de generar un compuesto de fórmula (Y) in vitro o in vivo que comprende exponer un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a un medio acuoso ya que este medio acuoso bien puede ser fluidos gástricos. Adicionalmente, no se encuentra sustentado como se formaría un compuesto de fórmula (Y), exponiendo un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1 a un medio acuoso. Si se tratase de una prodroga tal como está reivindicado, los principios de esta reacción ya serían conocidos ya que por el mismo hecho de ser prodroga realizaría su conversión química por procesos metabólicos in vivo, es decir, en medio acuoso. De la misma forma, de acuerdo con la descripción folio 731 *"los compuestos de la invención pueden ser preparados por aquellos expertos en la técnica con base solamente en el conocimiento de la estructura química del compuesto"*. *"De hecho, hay más de un proceso para preparar los compuestos de esta invención"*. *"Los métodos pueden ser encontrados en la técnica"*. Por lo tanto se requiere al solicitante eliminar dichas reivindicaciones de proceso
- De acuerdo a los folios 777, 1061 y siguientes (ensayos biológicos) los compuestos preparados y ensayados preferidos (no dice cuales) son efectivos para inhibir aproximadamente el 50% de la actividad enzimática de la betasecretasa a una concentración de menos 50 micromolar, 10 micromolar, 1 micromolar y 10 micromolar o menos (este último parece un error). Por lo cual es cuestionable si la extensión de la reivindicación 1 es razonable y justificada y debería reducirse a aquellos compuestos para los cuales realmente fue demostrado el efecto deseado que sea comparable con el estado de la técnica.

- Reivindicación 5: no dice los significados de $-NR_{1-a}$ R_{1-b}
- Reivindicaciones 7, 8: las definiciones de R_5 , R_8 , R_{51} son mas grandes que las dada en la reivindicación 1.

El objeto de la solicitud no es claro e incumple así mismo con el requisito de concisión, dadas las observaciones esbozadas en los numerales precedentes. En este sentido se requiere al interesado para que realice las modificaciones correspondientes a fin de subsanar las no conformidades encontradas por este Despacho.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d)

Reivindicaciones 17 - 18: Se refiere a un método para prevención o tratamiento por lo tanto están exceptuadas de patentabilidad según la legislación vigente.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

Reivindicaciones 19 - 20: Se refieren a usos de los compuestos reivindicados para la fabricación de medicamentos por lo tanto están exceptuadas de patentabilidad según la legislación vigente.

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria 2002/09/06

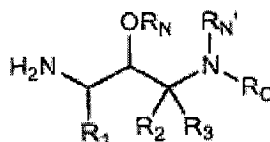
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D ₁	EP0223437	AMINOCARBONYL RENIN INHIBITORS	1986/10/23

7. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

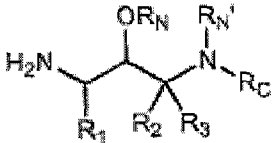
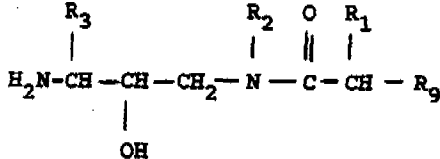
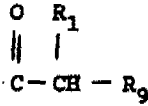
Reivindicaciones 1 – 11, 21: compuestos de la siguiente fórmula general.



Reivindicación 22: Composición que comprende un compuesto reivindicado y un portador fisiológicamente aceptable o excipiente.

D1 enseña compuestos que intervienen en la conversión de angiotensinogeno a angiotensina II inhibiendo la renina, siendo así útiles como agentes antihipertensivos.

- Algunos de los elementos característicos del compuesto de la reivindicación 1, habían sido divulgados previamente en el Estado de la Técnica según la tabla siguiente:

TABLA 1			
SOLICITUD		ANTERIORIDAD (D ₁)	Comparación
			
R ₁	Alquilo, alqueniilo o alquinilo cada uno opcionalmente sustituido con Halo, Alcoxi, OH, SH, arilo, heteroarilo, heterocicilo, amino	R ₃ Alquilo opcionalmente sustituido con Halo -(CH ₂) _n - OH -(CH ₂) _n - SH -(CH ₂) _n - arilo -(CH ₂) _n - heterociclo -(CH ₂) _n - NH ₂	IGUAL
OR _N	OH	OH	IGUAL
R ₂ R ₃	H	CH ₂	IGUAL
R _{N'}	-C(=O)-(CRR') ₀₋₆ R ₁₀₀ R= H, alquilo R'= H, alquilo R ₁₀₀ = alquilo	 R ₁ = H, Alquilo R ₉ = Alquilo	IGUAL
R _C	Alquilo Alquilo-cicloalquilo Alquilo-R ₂₀₅ R ₂₀₅ (fenilo)	R ₂ Alquilo -(CH ₂) _m -arilo -(CH ₂) _m -cicloalquilo -(CH ₂) _n -heterociclo	IGUAL

De manera que el objeto de esta solicitud, tal como aparece en la reivindicación 1 y sus dependientes 2-11 y 21 no es nuevo según algunos de los ejemplos de sustituciones ilustrados en la anterior tabla. Por la multiplicidad de radicales, probablemente se encontrarán muchos otros compuestos no ilustrados aquí que tampoco serán nuevos.

Tampoco es nueva la composición que de ella depende según la reivindicación 22 pues los compuestos que la comprenden no son nuevos.

6. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D ₁	EP0223437	2-11 y 21 - 22	NOVEDAD

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.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

CONCEPTO TÉCNICO No. 2057	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202087
-------------------------------------	--