

CASTELLANOS & Co.

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-116725- -00006-0000

Fecha: 2009-05-20 14:27:20 Dep: 2020 NUECREACIONE
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act: 444 RESPUESTAREQUE Folios: 9

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. **05.116.725**

Solicitud de Patente de Invención para: **DERIVADOS DE AZAINDOL COMO
INHIBIDORES DEL FACTOR Xa**

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. 2182 notificado el 20 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 anterior objeción, presento a consideración del señor examinador un nuevo pliego reivindicatorio compuesto por 3 reivindicaciones las cuales se encuentran basadas en las reivindicaciones 7, 8 y 10 de la solicitud internacional PCT/EP2004/004754.

Dicho pliego reivindicatorio se encuentra debidamente sustentado por los ejemplos de la descripción con sustituyentes claramente definidos por lo que solicito al señor examinador tener como superada la objeción por claridad

CASTELLANOS & Co.

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

446
446

Reivindicaciones de Uso

La reivindicación 11 ha sido eliminada del capítulo reivindicatorio por lo que la objeción en cuestión debe tenerse como superada.

Unidad de invención

Teniendo en cuenta que el capítulo reivindicatorio ha sido drásticamente restringido con grupos claramente definidos, la objeción por unidad de invención debe tenerse como superada.

Novedad

En cuanto a la novedad, respetuosamente me gustaría hacer los siguientes comentarios:

El señor examinador establece que D1 enseña compuestos de fórmula (I), pero en este caso no se encuentra un grupo de fórmula (I) sino un compuesto específico que corresponde al compuesto del ejemplo 26 de D1 después de realizar la búsqueda respectiva.

Además, en el oficio este compuesto aparece como un "copy-paste" del documento D1 y por debajo se puede observar la frase incompleta "A suspension of 2.76 g". Así mismo, aparecen las palabras scheme II y esquema I (en inglés y español)

Lo anterior, con el fin de solicitarle al señor examinador de la manera más respetuosa más claridad en cuanto a la redacción de los oficios ya que esto nos genera confusión y la comunicación con nuestros clientes se dificulta bastante.

Ahora bien, volviendo a la objeción en cuestión, la presente invención es novedosa en vista de D1 por las razones que expongo a continuación:

La definición del radical V en el nuevo capítulo reivindicatorio corresponde a piperidinilo mientras que en el documento D1 dicho radical corresponde a tetrazolil. Adicionalmente, la presente invención se diferencia de D1 por la presencia del radical D el cual corresponde a piridilo en la presente invención mientras que en D1 corresponde a fenilo.

CASTELLANOS & Co.

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

447
447

Finalmente, la definición de -Q-R0 nunca corresponde a fenilo en la presente invención como si ocurre en la definición de D1.

Así las cosas, solicito al señor examinador conceder el privilegio de patente a la presente invención toda vez que las objeciones planteadas por su Despacho han sido claramente superadas.

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

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una solicitud

②

Nombre: **SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GmbH**

IDENTIFICACIÓN

Dirección: **Brüningstrasse 50
65929 Frankfurt am main
Alemania**

C.C.

☐

NIT

☐

Domicilio: **65929 Frankfurt am main
Alemania**

C.E.

☐

Otro

☐

Lugar de Constitución: **Alemania**

Cual

Teléfono:

Fax:

Número

E-mail:

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **LUIS PATIÑO LEYVA**

IDENTIFICACIÓN

Dirección: **Calle 94A # 7A-09**

C.C.

☒

NIT

☐

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

C.E.

☐

Otro

☐

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

Cual

Número

2.930.616

TPA

2698

④

Número de Expediente:

05.116.725

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio para el examen de patentabilidad

⑥

Comprobante de pago No.

09-35,999

Fecha

15 de mayo 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

2002859
449

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-116725- -00006-0000

Fecha: 2009-05-20 14:27:20 Dep: 2020 NUECREACION
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act: 444 RESPUESTAREQUE Folios: 3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 35,999
FECHA : MAYO 15 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VT. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	105797451	15/05/2009	2,641,000.00

***** CONCEPTO *****

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

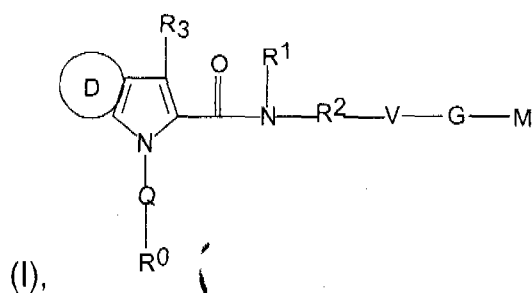
SON: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I,



En donde

R0 es 1) piridilo o benzotiofenilo, en donde el piridilo y el benzotiofenilo están no sustituidos o mono- o disustituidos independientemente el uno del otro por R8, o

2) un heterociclico fuera del grupo tienilo, tiadiazolilo, isoxazolilo y tiazolilo, en donde dicho heterociclico está sustituido con un residuo seleccionado del grupo tienilo, 2-tienilo y 3-tienilo, en donde dicho residuo está no sustituido o mono- o disustituido independientemente el uno del otro con R8,

R8 es F, Cl, Br, -OCH₃ o -C(O)-NH₂

La subestructura D es piridilo y está no sustituido o sustituido 1, 2, 3 o 4 veces con R3, o está sustituido 1 o 2 veces con =O,

Q es -CH₂-C(O)-NH- o metileno,

R¹ es un átomo de hidrógeno,

R² es un enlace directo,

R¹⁴ es flúor, cloro, =O, metilo, etilo o -NH₂

V es piperidina, en donde la piperidina está no sustituida o mono- o disustituida independientemente el uno del otro por R¹⁴,

G es un enlace directo,

451
451

M es un átomo de hidrógeno, alquilo-(C₂-C₄), isopropilo o piridilo, en donde el residuo está no sustituido o mono- o disustituido independientemente el uno del otro por R14.

R3 es 1) átomo de hidrógeno,

2) flúor, cloro,

3) alquilo-(C₁-C₄)-, en donde el alquilo está no sustituido o mono- o disustituido o trisustituido independientemente el uno del otro por R13,

4) alquilenno-(C₀-C₂)-O-R19, en donde R19 es

a) un átomo de hidrógeno o

b) alquilo-(C₁-C₄)-, en donde el alquilo está no sustituido o mono- o di- o tri-sustituido independientemente el uno del otro por R13.

5) alquilenno-(C₀-C₄)-C(O)-O-R11, o

6) alquilenno-(C₀-C₄)-C(O)-N-(R11)-R12

R11 y R12 son independientemente el uno del otro idénticos o diferentes y son

1) Un átomo de hidrógeno o

2) Alquilo-(C₁-C₄), donde el alquilo está no sustituido o mono- o di- o tri-sustituido independientemente el uno del otro por R13 o

R11 y R12 junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos pueden formar un anillo, el cual se selecciona del grupo de azetidina, imidazolidina, morfolina, (1,4)-oxazepan piperazina, piperidina, pirrolidina o tiomorfolina,

R13 es flúor, =O, -OH, -CF₃, -C(O)-O-R10, C-(O)-N(R10)-R20, -N(R10)-R20 o alquilenno -(C₀-C₃)-O-R10,

R10 y R20 son independientemente el uno del otro hidrógeno, alquilo-(C₁-C₄)- o perfluoroalquilo-(C₁-C₃).

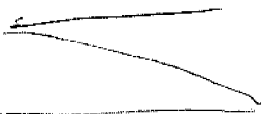
452
452

2. Un compuesto de fórmula I como se reivindica en la reivindicación 1, en donde el compuesto de fórmula I es

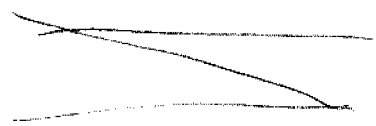
(1-isopropil-piperidin-4-il) amida del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-1H-pirrol [2,3-b] piridina-2-carboxílico.



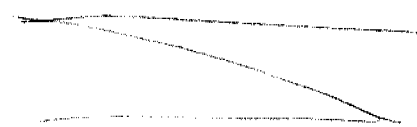
Éster metílico del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-2-(1-isopropil-piperidin-4-ilcarbamoil)-1H-pirrol [2,3-b] piridina-5-carboxílico.



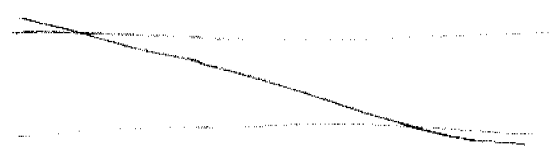
Ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-2-(1-isopropil-piperidin-4-ilcarbamoil)-1H-pirrol [2,3-b] piridina-5-carboxílico.



5-Amida 2-[(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida] del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-1H-pirrol [2,3-b] piridina-2,5-dicarboxílico.



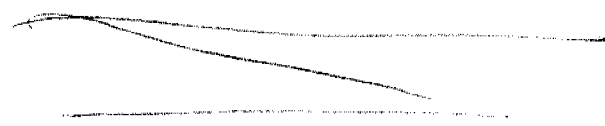
(1-isopropil-piperidin-4-il) amida del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-1H-pirrol [3,2-b] piridina-2-carboxílico.



Ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-2-(1-isopropil-piperidin-4-ilcarbamoil)-1H-pirrol [3,2-b] piridina-5-carboxílico.



(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-5-oxo-4,5-dihidro-1H-pirrol [3,2-b] piridina-2-dicarboxílico.



Éster metílico del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-2-(3, 4, 5, 6-tetrahidro-2H-[1,4'] bipyridin-4-ilcarbamoil)-1H-pirrol [3,2-b] piridina-5-carboxílico.

453
453

Ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-ilmetil]-2-(3, 4, 5, 6-tetrahidro-2H-[1,4']
bipiridin-4-ilcarbamoil)-1H-pirrol [3,2-b] piridina-5-carboxílico.

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-
ilmetil]-5-(2-metóxi-etoxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico.

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-[5-(5-cloro-tiofen-2-il)-isoxazol-3-
ilmetil]-5-(2-hidroxi-etoxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico.

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-[(5-cloro-piridin-2-ilcarbamoil)-metil]-5-
(2-metóxi-etóxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico.

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-[(5-cloro-piridin-2-ilcarbamoil)-metil]-5-
(2-hidróxi-etóxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico.

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-(6-cloro-benzo[b]tiofen-2-ilmetil)-5-(2-
metóxi-etóxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico, o

(1-isopropil-piperidin-4-il)-amida del ácido 1-(6-cloro-benzo[b]tiofen-2-ilmetil)-5-(2-
hidróxi-etóxi)-1H-pirrol [2,3-c] piridina-2-carboxílico.

3. Una preparación farmacéutica, que comprende al menos un compuesto de
fórmula I como se reivindica en las reivindicaciones 1 o 2 y un vehículo
aceptable farmacéuticamente.

1 154
434

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 05-116725

Clasificación Internacional (IPC): C07D471/04

Concepto Técnico No.

Patente de Invención



Vía PCT (fase nacional)



Cap. I



Cap. II



No. Sol. Internacional

PCT/EP2004/004754

Fecha de Presentación Internal.

WO2004/101563

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:

Folios: 131 a 260

Como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones:

Folios 261 a 312

Como se radicó inicialmente.

Folios 377 a 431

Modificación

Folios 450 a 453

Nueva Modificación.

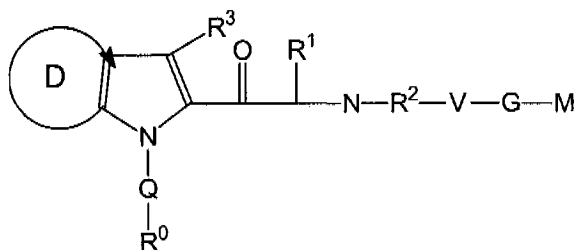
Prioridad:

Folio 1: EP03011304.7, 19-may-2003

Objeto de la invención

Título de la solicitud: DERIVADOS DE AZAINDOL COMO INHIBIDORES DEL FACTOR Xa.

El objeto de la solicitud ahora son los derivados 1H-pirrolo[2,3-b]piridina-2-carboxamida y 1H-pirrolo[2,3-c]piridina-2-carboxamida de fórmula:



-Reivindicaciones 1 y 2: Un compuesto de la fórmula (I).

-Reivindicación 15: Composiciones que los contienen.

Se clasificó la invención de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC) : C07D471/04,

455
435

Determinación del Estado de la Técnica

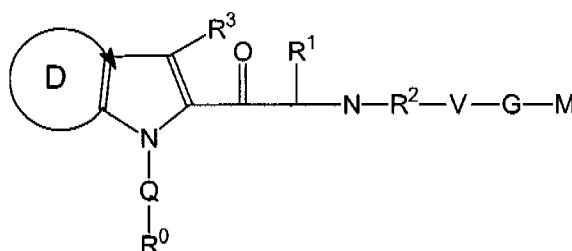
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 19 de mayo de 2003, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	EP0186367	Novel acidic indole compounds and their use as antiallergy agents	02-07-1986

Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

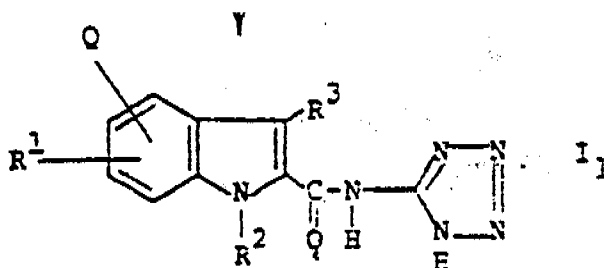
Novedad (artículo 16 D486 de la C.A.N.)

La presente se refiere a compuestos que caen dentro del alcance de la fórmula Markush (I) :



Donde la subestructura D es piridilo.

- D1 enseña compuestos derivados de indol con fórmula (I)



Especialmente el compuesto 5-metoxi-3-(1-metiletoxi)-1-fenil-N1H-tetrazol-5-il-iH-ondol-2-carboxamida L-arginina sal.

Que eran compuestos específicos que caían dentro del alcance de los compuestos de fórmula general (I) de la solicitud en estudio, antes de la modificación del capítulo reivindicatorio, ahora el nuevo capítulo reivindicatorio no esta referido a los derivados indol, quedo direccionado a los derivados 1H-pirrollo[2,3-b]piridina-2-carboxamida y 1H-pirrollo[2,3-c]piridina-2-carboxamida, por lo tanto los compuestos ahora reclamados con la fórmula (I) son nuevos, entonces cumplen con el requisito exigido en el art.16 D486.

Nivel inventivo (artículo18 D486 de la C.A.N.)

Las nuevas reivindicaciones comprenden ahora derivados 1H-pirrollo[2,3-b]piridina-2-carboxamida y 1H-pirrollo[2,3-c]piridina-2-carboxamida, mientras la

456
486

anterioridad citada en el examen de patentabilidad, son derivados indólicos con sustituyentes diferentes. Luego de comparar el documento relevante encontrado en el estado de la técnica y señalado arriba, no se ve afectado el Nivel Inventivo porque no es obvio y derivar de manera evidente el compuesto ahora reclamado y que tengan un efecto farmacológico como inhibidores reversibles de las enzimas de coagulación sanguínea factor Xa. Por lo tanto las reivindicaciones cumplen con la exigencia del art.18 D 486.

Aplicación industrial (artículo19 D 486)

Los derivados de 1H-pirrol[2,3-b]piridina-2-carboxamida y 1H-pirrol[2,3-c]piridina-2-carboxamida tal como es reclamado en la presente solicitud, son susceptibles de ser sintetizados, por el método descrito, en las cantidades requeridas por la industria farmacéutica, para producir medicamentos, por lo tanto se considera que tiene aplicación industrial

Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** las reivindicaciones: 1 a 3 (folios: 450 a 453) y el título debe estar acorde con la materia descrita y reivindicada por lo tanto el título debe ser: **"DERIVADOS DE 1H-PIRROLO[2,3-B]PIRIDINA-2-CARBOXAMIDA Y 1H-PIRROLO[2,3-C]PIRIDINA-2-CARBOXAMIDA"**

Bogotá, D.C., 22 de mayo de 2009

CONCEPTO TECNICO N° 1747	EXAMINADOR TECNICO Código No.202012
--------------------------	-------------------------------------