

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72
BOGOTA 8, COLOM

Trámite
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-066497- -00003-0000

Fecha 2008-07-01 17 03 12 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 538 PETICION Folios. 2

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

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 06.066.497
Asunto : Solicitud de Patente para **PROCEDIMIENTO DE PREPARACION**
Solicitante : **BAYER HEALTHCARE AG**
Clase : A61K 031/016, A61K 031/505, A61P 007/000, C07D 409/014
Publicada en : La Gaceta No. **587** Del 18 de enero de 2008
Fecha de Solicitud : 10 de julio de 2006

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 I 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 \$420.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 44372 de 26 de diciembre de 2007.

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-14033-841-027-1
ASGVGG\ID-129460\WPC14033
No. M-2008-129460\ASG

INSTITUTO DE INVESTIGACIONES
CIENTÍFICAS Y TECNOLÓGICAS

DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

CONSEJO DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

TRABAJO DE LA COMISIÓN DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE LA OFICINA DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

EN EL MES DE MARZO DE 1958 EN EL INSTITUTO DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

EXAMENADO EN LA OFICINA DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES

CON LA PARTICIPACIÓN DE LOS SEÑORES DR. JUAN CARLOS GARCÍA Y DR. JUAN CARLOS GARCÍA
Y LOS SEÑORES DR. JUAN CARLOS GARCÍA Y DR. JUAN CARLOS GARCÍA
Y LOS SEÑORES DR. JUAN CARLOS GARCÍA Y DR. JUAN CARLOS GARCÍA
Y LOS SEÑORES DR. JUAN CARLOS GARCÍA Y DR. JUAN CARLOS GARCÍA

INSTITUTO DE INVESTIGACIONES Y OPERACIONES - DEPARTAMENTO DE INVESTIGACIONES

1958

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



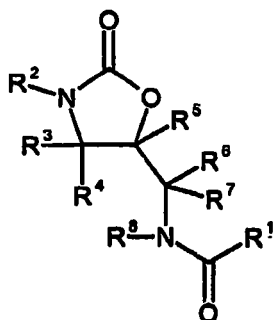
(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
5. Juli 2001 (05.07.2001)

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
PCT WO 01/47919 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 413/14, 413/12, 417/14, A61K 31/42, A61P 7/00 (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; 51368 Leverkusen (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/12492 (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.
- (22) Internationales Anmeldedatum: 11. Dezember 2000 (11.12.2000)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität: 199 62 924.2 24. Dezember 1999 (24.12.1999) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 51368 Leverkusen (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): STRAUB, Alexander [DE/DE]; Moospfad 30, 42113 Wuppertal (DE). LAMPE, Thomas [DE/DE]; Briller Strasse 46, 42105 Wuppertal (DE). POHLMANN, Jens [DE/DE]; Kronenstrasse 14, 42285 Wuppertal (DE). RÖHRIG, Susanne [DE/DE]; Buschstrasse 20, 45276 Essen (DE). PERZBORN, Elisabeth [DE/DE]; Am Tescher Busch 13, 42327 Wuppertal (DE). SCHLEMMER, Karl-Heinz [DE/DE]; Wildsteig 22a, 42113 Wuppertal (DE). PERNERSTORFER, Joseph [AT/DE]; Alsenstrasse 19, 42109 Wuppertal (DE).
- Veröffentlicht:
- Mit internationalem Recherchenbericht.
 - Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen.
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: SUBSTITUTED OXAZOLIDINONES AND THEIR USE IN THE FIELD OF BLOOD COAGULATION

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE OXAZOLIDINONE UND IHRE VERWENDUNG IM GEBIET DER BLUTGERINNUNG



(I)

(57) Abstract: The invention relates to the field of blood coagulation, more specifically it relates to novel oxazolidinone derivatives of the general formula (I), to methods for producing them as well as to their use as active substances for medicaments for the prophylaxis and/or the treatment of diseases.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft das Gebiet der Blutgerinnung. Es werden neue Oxazolidinonderivate der allgemeinen Formel (I), Verfahren zu ihrer Herstellung sowie ihre Verwendung als Arzneimittelwirkstoffe zur Prophylaxe und/oder Behandlung von Erkrankungen beschrieben.

WO 01/47919 A1

THE UNITED STATES OF AMERICA
DEPARTMENT OF THE INTERIOR
BUREAU OF LAND MANAGEMENT

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

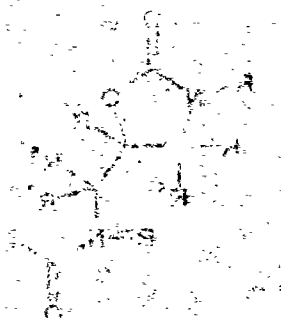
WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH

WATER RESOURCES DIVISION
SALT LAKE CITY, UTAH



89
50

b) 2-((5*S*)-2-Oxo-3-[4-(3-oxo-4-morpholinyl)phenyl]-1,3-oxazolidin-5-yl)methyl)-1*H*-isoindol-1,3(2*H*)-dion:

5 Zu einer Suspension des Aminoalkohols (3.58 g, 9.05 mmol) in Tetrahydrofuran (90 ml) wird unter Argon bei Raumtemperatur *N,N'*-Carbonyldiimidazol (2.94 g, 18.1 mmol) und Dimethylaminopyridin (katalytische Menge) gegeben. Die Reaktionssuspension wird bei 60°C für 12 h geführt (der Niederschlag geht in Lösung, nach einiger Zeit erneute Bildung eines Niederschlages), mit einer zweiten Portion *N,N'*-Carbonyldiimidazol (2.94 g, 18.1 mmol) versetzt und weitere 12 h bei 60°C

10 geführt. Der Niederschlag (gewünschtes Produkt) wird abfiltriert, mit Tetrahydrofuran gewaschen und getrocknet. Das Filtrat wird im Vakuum eingeeengt und weiteres Produkt mittels Flash-Chromatographie (Dichlormethan-Methanol-Gemische) gereinigt. Gesamtausbeute: 3.32 g, 87 % der Theorie.

MS (ESI): m/z (%) = 422 ($[M+H]^+$, 100);

15 HPLC (Methode 4): rt (%) = 3.37 (100).

c) 5-Chloro-*N*-((5*S*)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morpholinyl)phenyl]-1,3-oxazolidin-5-yl)methyl)-2-thiophencarboxamid:

20 Zu einer Suspension des Oxazolidinons (4.45 g, 10.6 mmol) in Ethanol (102 ml) wird bei Raumtemperatur tropfenweise Methylamin (40%ig in Wasser, 10.2 ml, 0.142 mol) gegeben. Die Reaktionsmischung wird für 1 h refluxiert und im Vakuum eingeeengt. Das Rohprodukt wird ohne weitere Reinigung in die nächste Reaktion eingesetzt.

25

Zu einer Lösung des Amins in Pyridin (90 ml) wird unter Argon bei 0°C 5-Chlorthiophen-2-carbonsäurechlorid (2.29 g, 12.7 mmol) getropft. Die Eiskühlung wird entfernt und das Reaktionsgemisch 1 h bei Raumtemperatur gerührt und mit Wasser versetzt. Nach Zugabe von Dichlormethan und Phasentrennung wird die wässrige

30 Phase mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden getrocknet (Natriumsulfat), filtriert und im Vakuum eingeeengt. Das gewünschte

clorotiofeno-2-carbonilo en donde la reacción se realiza en un disolvente seleccionado de éter, alcohol, cetona y agua usando una base inorgánica.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de un procedimiento de síntesis de 5-cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofenocarboxamida que sea sencillo.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona el procedimiento de la presente solicitud.

- Clasificación Internacional de Patentes A 61 K 31/16

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

El contenido de la reivindicación 15, que trata de "Uso de de 5-cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofenocarboxamida ...", no es patentable, debido a que la legislación vigente únicamente contempla los productos y procedimientos como objeto de patente.

4. Determinación del Estado de la Técnica

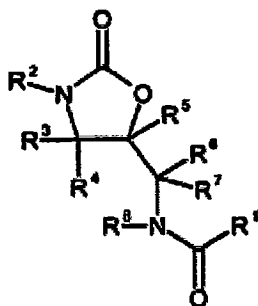
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 15.01.04, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 0147919	"Oxazolidinonas sustituidas y su uso en el campo de la coagulación de la sangre"	05.07.01

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Novedad (artículo 16 D486)

- La solicitud WO 0147919 revela compuestos de fórmula:



, de manera específica se revela el compuesto del

... ..

... ..

... ..

... ..

... ..

... ..

... ..

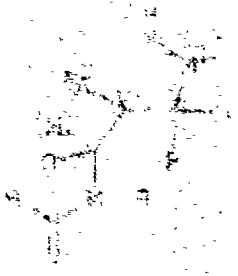
... ..

...	...	...	...
...	...	...	...
...	...	...	...
...	...	...	...

... ..

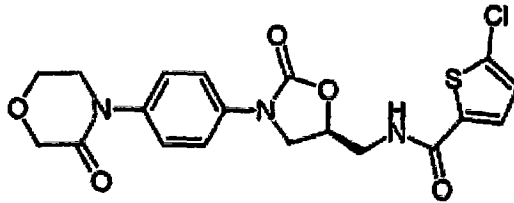
... ..

... ..



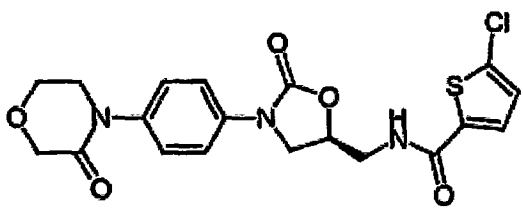
... ..

62
63



ejemplo 44:

- La reivindicación 14 de la presente solicitud se relaciona con el



compuesto de fórmula:

Comparando elemento por elemento, se aprecia que el compuesto específico de D1 es igual al de la presente solicitud, afectando la novedad de la misma, debido a que no es correcto caracterizar el compuesto por su procedimiento de síntesis, ya que lo característico del compuesto es su fórmula química y ésta ya fue revelada en D1

6. Conclusión:

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

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 0147919	14	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 sesenta 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 5 del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


Álix Carmenza Céspedes de Vergel
Directora de Nuevas Creaciones (c)

04 JUN. 2012

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

CONCEPTO TECNICO No. 1865	EXAMINADOR TECNICO Código No.202024
------------------------------	--