

CAVELIER

ABOGADOS

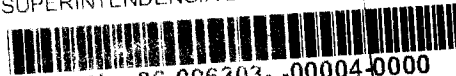
www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

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

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
60
60

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 06-096303- -00004-0000
Fecha: 27/09/2007 17:00:04 Dep. 2020 NUECREACIONE
TR. 15 PATENTILYII Evt: 379 FASENACIONALII
Act: 538 REVISION Folios: 2

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 06.096.303
Asunto : Solicitud de Patente para **[HIDROCLORURO DE [4-(5-AMINOMETIL-2-FLUORO-FENIL)-PIPERIDIN-1-IL]-[4-BROMO-3-METIL-5-PROPOXI-TIOFEN-2-IL]-METANONA COMO UN INHIBIDOR DE LA TRIPTASA DE MASTOCITOS]**
Solicitante : **AVENTIS PHARMACEUTICALS, INC.**
Clase : A61K 031/4535, A61P 011/006, C07D 409/06
Publicada en : La Gaceta No. **579** Del 31 de agosto de 2007
Fecha de Solicitud : 25 de septiembre 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 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 \$210.000.00, 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-15896-841-009-8
ASG\JGG\ID-119494\WPC15896
No. M-2008-119494\ASG

NIT 860.041.367-3

162
~~162~~

[illegible]

***** CONSIGNACION *****

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

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

Q10 15896-841 009-8

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
29 November 2001 (29.11.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/90101 A1(51) International Patent Classification⁷: C07D 401/06,
211/16, 401/10, 409/06, 413/10, 405/06, 513/04, 413/14,
495/04, 409/14, 401/12, 487/04, 417/06, 471/04, 405/14

(21) International Application Number: PCT/US01/13811

(22) International Filing Date: 27 April 2001 (27.04.2001)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0012362.0 22 May 2000 (22.05.2000) GB
09/843,126 26 April 2001 (26.04.2001) US(71) Applicant (for all designated States except US): AVENTIS
PHARMACEUTICALS PRODUCTS INC. [US/US];
Route 202-206, P.O. Box 6800, Bridgewater, NJ 08807
(US).

(72) Inventors; and

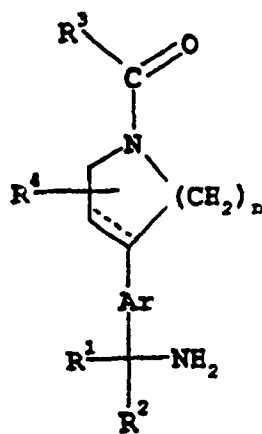
(75) Inventors/Applicants (for US only): ASTLES, Peter, C.
[GB/GB]; The Flour Store, The Mill House, Chevening
Road, Chipstead, Sevenoaks, Kent TN13 2RY (GB).
EASTWOOD, Paul, R. [GB/GB]; 31A Lodge Avenue,
Gidea Park, Romford, Essex RM2 5AB (GB). HOUILLE,
Olivier [FR/FR]; 98, rue de la Croix-Nivert, F-75015
Paris (FR). LEVELL, Julian [GB/US]; 26 Locust Drive,
Apt. 44, Summit, NJ 07901 (US). PAULS, Heinz
[CA/US]; Route 202-206, P.O. Box 6800, Bridgewater,
NJ 08807-0800 (US). CZEKAJ, Mark [US/US];3897 Charter Club Drive, Doylestown, PA 18901 (US).
LIANG, Guyan [US/US]; 2004 Plaza Drive, Wood-
bridge, NJ 07095 (US). GONG, Yong [CN/US]; 3802
Sunny Slope Road, Bridgewater, NJ 08807-0800 (US).
PRIBISH, James [US/US]; 112 Willow Grove Road,
Stewartsville, NJ 08886 (US). NEUENSCHWANDER,
Kent [US/US]; Route 202-206, P.O. Box 6800, Bridgewater,
NJ 08807-0800 (US).(74) Agents: COPPOLA, William, C. et al.; Route 202-206,
P.O. Box 6800, Bridgewater, NJ 08807-0800 (US).(81) Designated States (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.(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian
patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European
patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE,
IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF,
CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: ARYLMETHYLAMINE DERIVATIVES FOR USE AS TRYPTASE INHIBITORS



(I)

(57) Abstract: Provided herein are compounds of formula (I) wherein R¹⁻⁴, n and Ar are as defined in claim 1, and their pharmaceutical compositions. These compounds are tryptase inhibitors and may be used in the treatment of e.g. asthma and inflammatory diseases.

WO 01/90101 A1

164
164

"Aroyl" means an aryl-CO- group in which the aryl group is as described herein. Exemplary aroyl groups include benzoyl and 1- and 2-naphthoyl.

5 "Aroylamino" is an aroyl-NH- group wherein aroyl is as previously defined.

"Aryl" as a group or part of a group denotes: (i) an optionally substituted monocyclic or multicyclic aromatic carbocyclic moiety of about 6 to about 14 carbon atoms, such as phenyl or naphthyl; or (ii) an optionally substituted partially saturated multicyclic aromatic carbocyclic moiety in which an aryl and a cycloalkyl or cycloalkenyl group are fused together to form a cyclic structure, such as a tetrahydronaphthyl, indenyl or indanyl ring. Aryl groups may be substituted with one or more aryl group substituents which may be the same or different, where "aryl group substituent" includes, for example, acyl, acylamino, alkoxy, alkyloxycarbonyl, alkylendioxy, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, alkylthio, aroyl, aroylamino, aryl, arylalkenyl, arylalkynyl, arylalkyloxy, arylalkyloxycarbonyl, arylalkylthio, aryloxy, aryloxyalkyl, aryloxycarbonyl, arylsulfinyl, arylsulfonyl, arylthio, carboxy, cyano, halo, heteroaroyl, heteroaryl, heteroarylalkenyl, heteroarylalkynyl, heteroarylalkyloxy, heteroaroylamino, heteroaryloxy, heteroaryloxyalkyl, hydroxy, nitro, trifluoromethyl, -NY¹Y², -CONY¹Y², -SO₂NY¹Y², -Z²-C₂₋₆alkylene-NY¹Y² {where Z² is O, NR⁸ or S(O)_m}, -NY¹-(C=O)alkyl, -NY¹-SO₂alkyl or alkyl optionally substituted with alkoxy, aroyl, aryl, aryloxy, heteroaryl, hydroxy, or -NY¹Y².

"Arylalkenyl" means an aryl-alkenyl- group in which the aryl and alkenyl are as previously described. Preferred arylalkenyls contain a lower alkenyl moiety. Exemplary arylalkenyl groups include styryl and phenylallyl.

"Arylalkyl" means an aryl-alkyl- group in which the aryl and alkyl moieties are as previously described. Preferred arylalkyl groups contain a C₁₋₄alkyl moiety. Exemplary arylalkyl groups include benzyl, 2-phenethyl and naphthalenemethyl.

"Arylalkyloxy" means an arylalkyl-O- group in which the arylalkyl groups is as previously described. Exemplary arylalkyloxy groups include benzyloxy and 1- or 2-naphthalenemethoxy.

"Arylalkyloxycarbonyl" means an arylalkyl-O-CO- group in which the arylalkyl groups is as previously described. An exemplary arylalkyloxycarbonyl group is benzyloxycarbonyl.

165
165

"Cycloalkyl" means a saturated monocyclic or bicyclic ring system of about 3 to about 10 carbon atoms optionally substituted by oxo, alkyl, aryl or -C(=O)-NY¹Y². Exemplary monocyclic cycloalkyl rings include C₃₋₈cycloalkyl rings such as cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl and cycloheptyl.

5

"Cycloalkylalkyl" means a cycloalkyl-alkyl- group in which the cycloalkyl and alkyl moieties are as previously described. Exemplary monocyclic cycloalkylalkyl groups include cyclopropylmethyl, cyclopentylmethyl, cyclohexylmethyl and cycloheptylmethyl.

10 "Halo" or "halogen" means fluoro, chloro, bromo, or iodo. Preferred are fluoro or chloro.

"Heteroaroyl" means a heteroaryl-C(=O)- group in which the heteroaryl group is as described herein. Exemplary groups include pyridylcarbonyl.

15 "Heteroaroylamino" means a heteroaroyl-NH- group in which the heteroaryl moiety are as previously described.

"Heteroaryl" as a group or part of a group denotes: (i) an optionally substituted aromatic monocyclic or multicyclic organic moiety of about 5 to about 10 ring members in which one or more of the ring
20 members is/are element(s) other than carbon, for example nitrogen, oxygen or sulfur (examples of such groups include benzimidazolyl, benzthiazolyl, benzthiophenyl, furyl, imidazolyl, indolyl, indoliziny, isoxazolyl, isoquinolinyl, isothiazolyl, oxadiazolyl, pyrazinyl, pyridazinyl, pyrazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrrolyl, quinazolinyl, quinolinyl, 1,3,4-thiadiazolyl, thiazolyl, thienyl and triazolyl groups, optionally substituted by one or more aryl group substituents as defined above); (ii) an
25 optionally substituted partially saturated multicyclic heterocarbocyclic moiety in which a heteroaryl and a cycloalkyl or cycloalkenyl group are fused together to form a cyclic structure (examples of such groups include pyrimidinyl groups). Optional substituents include one or more "aryl group substituents" as defined above.

30 "Aryldiyl" means an optionally substituted bivalent radical derived from an aryl group as defined herein. Exemplary aryldiyl groups include optionally substituted phenylene, naphthylene and indanylene. Suitable substituents include one or more "aryl group substituents" as defined above, particularly halogen, methyl or methoxy.

35 "Heteroaryldiyl" means a bivalent radical derived from a heteroaryl group as defined below.

166
166

The compounds of the present invention are basic, and such compounds are useful in the form of the free base or in the form of a pharmaceutically acceptable acid addition salt thereof.

Acid addition salts are a more convenient form for use; and in practice, use of the salt form inherently amounts to use of the free base form. The acids which can be used to prepare the acid addition salts include preferably those which produce, when combined with the free base, pharmaceutically acceptable salts, that is, salts whose anions are non-toxic to the patient in pharmaceutical doses of the salts, so that the beneficial inhibitory effects inherent in the free base are not vitiated by side effects ascribable to the anions. Although pharmaceutically acceptable salts of said basic compounds are preferred, all acid addition salts are useful as sources of the free base form even if the particular salt, per se, is desired only as an intermediate product as, for example, when the salt is formed only for purposes of purification, and identification, or when it is used as intermediate in preparing a pharmaceutically acceptable salt by ion exchange procedures. Pharmaceutically acceptable salts within the scope of the invention include those derived from mineral acids and organic acids, and include hydrohalides, e.g. hydrochlorides and hydrobromides, sulfates, phosphates, nitrates, sulfamates, acetates, citrates, lactates, tartrates, malonates, oxalates, salicylates, propionates, succinates, fumarates, maleates, methylene-bis-b-hydroxynaphthoates, gentisates, isethionates, di-p-toluoyltartrates, methane-sulfonates, ethanesulfonates, benzenesulfonates, p-toluenesulfonates, cyclohexylsulfamates and quinate.

As well as being useful in themselves as active compounds, salts of compounds of the invention are useful for the purposes of purification of the compounds, for example by exploitation of the solubility differences between the salts and the parent compounds, side products and/or starting materials by techniques well known to those skilled in the art.

With reference to formula (Ia) above, the following are particular and preferred groupings:

R^1 may particularly represent hydrogen.

R^2 may particularly represent hydrogen.

R^3 may particularly represent aryl, such as optionally substituted phenyl or optionally substituted naphthyl, especially substituted phenyl. Exemplary optional substituents include one or more halo atoms or alkyl substituted by aryl, alkyl substituted by aryloxy, alkyl substituted by aroyl, alkyl substituted by heteroaryl, arylalkynyl, heteroarylalkynyl, aryl, heteroaryl, arylalkenyl or arylalkyloxy,

167
f67

wherein said substituent is selected from the group consisting of a halo atom, an alkyl substituted by aryl, and alkyl substituted heteroaryl, wherein the aryl or heteroaryl groups are further substituted by one or more aryl group substituents;

R^4 comprises hydrogen or a cyano; and

5 R^5 comprises hydrogen, a lower alkyl or a halo.

35. The compound of Claim 34, wherein:

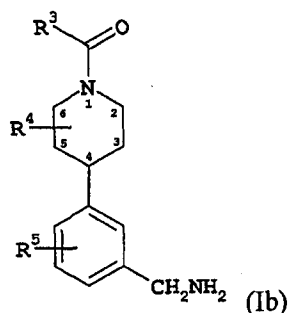
R^3 comprises phenylC₁₋₃alkylpyridyl [e.g. 5-phenylethyl-pyrid-3-yl], phenylC₁₋₃alkylthienyl [e.g. 5-phenylethyl-thien-2-yl] or indolyl [e.g. indol-6-yl];

10 R^4 comprises a hydrogen or a cyano; and

R^5 comprises a methyl or a fluoro, and is attached to the phenyl ring of formula (Ib) in the position para to the CH₂NH₂ group.

36. A compound of formula (Ib):

15



wherein

20 R^3 is aryl, arylalkenyl, cycloalkenyl, cycloalkyl, heteroaryl, heteroarylalkenyl, heterocycloalkenyl, a carbon linked heterocycloalkyl or alkyl optionally substituted by one or more groups selected from hydroxy, alkoxy, alkyloxycarbonylamino, cycloalkyl, heterocycloalkyl, R^6 , $-OR^6$, $-S(O)_mR^6$ or $-C(=O)-R^6$;

R^4 is hydrogen, acyl, alkoxy, alkyloxycarbonyl, carboxy, cyano, halo, hydroxy, $-C(=O)-NY^1Y^2$ or alkyl optionally substituted with alkoxy, alkylcarbonylamino, alkylsulfonylamino, hydroxy, 25 $-S(O)_m$ -alkyl or $-NY^1Y^2$; and

R^5 is hydrogen, acyl, alkoxy, alkyloxycarbonyl, aryl, carboxy, cyano, halo, heteroaryl, heteroaryloxy, heterocycloalkyl, heterocycloalkyloxy, heterocycloalkylalkyloxy, heteroarylalkyloxy, hydroxy, trifluoromethyl, $-C(=O)-NY^1Y^2$, $-NY^1Y^2$, $-Z^1-C_{2-6}$ alkylene- R^7 or alkyl optionally substituted with

168
168

alkoxy, alkylcarbonylamino, alkylsulfonylamino, aryl, heteroaryl, heterocycloalkyl, hydroxy, ureido, -C(=O)-NY¹Y², -SO₂-NY¹Y², -S(O)_m-alkyl or -NY¹Y², and,

a corresponding N-oxide of said compound, a prodrug of said compound, a pharmaceutically acceptable salt of said compound, a solvate of said compound, an N-oxides and prodrugs.

5

37. The compound of Claim 36, wherein R³ is an aryl comprising a phenyl or a naphthyl.

38. The compound of Claim 37, wherein said aryl is substituted by at least one substituent comprising a halo atom, an alkyl substituted by an aryl, an alkyl substituted by a heteroaryl.

10

39. The compound of Claim 38, wherein said aryl or heteroaryl of said substituent is further substituted by at least one aryl group substituent.

15

40. The compound of Claim 36, wherein R³ is a heteroaryl comprising a pyridyl, a quinoliny, a thienyl, a furanyl, or an indolyl.

41. The compound of Claim 41, wherein said heteroaryl is substituted by at least one substituent comprising an alkyl substituted by an aryl, or an alkyl substituted by a heteroaryl.

20

42. The compound of Claim 42, wherein said aryl and said heteroaryl of said substituent are further substituted by at least one aryl group substituent.

43. The compound of Claim 36, wherein R³ comprises phenylC₁₋₃alkylpyridyl [e.g. 5-phenylethylpyrid-3-yl], phenylC₁₋₃alkylthienyl [e.g. 5-phenylethyl-thien-2-yl], or indolyl [e.g. indol-6-yl].

25

44. The compound of Claim 36, wherein R⁴ comprises a hydrogen or a cyano.

45. The compound of Claim 36, wherein R⁵ comprises a hydrogen, a lower alkyl or a halo.

30

46. The compound of Claim 45, wherein R⁵ comprises a methyl or a fluoro.

47. The compound of Claim 45, wherein R⁵ is attached to the phenyl ring of formula (Ib) in the position para to the CH₂NH₂ group.

35

48. The compound of Claim 36, wherein:

109
169

60. The method of Claim 59, wherein the inflammatory disease comprises joint inflammation, arthritis, rheumatoid arthritis, rheumatoid spondylitis, gouty arthritis, traumatic arthritis, rubella arthritis, psoriatic arthritis, or osteoarthritis;
the dermatological condition comprises atopic dermatitis or psoriasis; and
5 the condition related to atherosclerotic plaque rupture comprises myocardial infarction, stroke, or angina.
61. A method for treating a patient suffering from, or subject to, a condition that can be ameliorated by the administration of an inhibitor of tryptase, wherein the method comprises
10 administering to the patient an effective amount of a compound of Claim 36.
62. The method of Claim 61, wherein the condition comprises inflammatory disease, a disease of joint cartilage destruction, ocular conjunctivitis, vernal conjunctivitis, inflammatory bowel
15 disease, asthma, allergic rhinitis, an interstitial lung disease, fibrosis, scleroderma, pulmonary fibrosis, liver cirrhosis, myocardial fibrosis, a neurofibroma, a hypertrophic scar, a dermatological condition, a condition related to atherosclerotic plaque rupture, periodontal disease, diabetic retinopathy, tumor growth, anaphylaxis, multiple sclerosis, a peptic ulcer, or a syncytial viral infection.
- 20 63. The method of Claim 62, wherein the inflammatory disease comprises joint inflammation, arthritis, rheumatoid arthritis, rheumatoid spondylitis, gouty arthritis, traumatic arthritis, rubella arthritis, psoriatic arthritis, or osteoarthritis;
the dermatological condition comprises atopic dermatitis or psoriasis; and
the condition related to atherosclerotic plaque rupture comprises myocardial infarction, stroke,
25 or angina.
64. A pharmaceutical composition comprising a compound of Claim 1 and a second compound selected from the group consisting of a beta andrenergic agonist, an anticholinergic, an anti-inflammatory corticosteroid, and an anti-inflammatory agent; and a pharmaceutically
30 acceptable carrier thereof.
65. The pharmaceutical composition of Claim 64, wherein the beta andrenergic agonist comprises albuterol, terbutaline, formoterol, fenoterol or prenaline;
the anticholinergic comprises ipratropium bromide;
35 the anti-inflammatory corticosteroid comprises beclomethasone dipropionate, triamcinolone acetonide, flunisolide or dexamethasone; and
the anti-inflammatory agent comprises sodium cromoglycate or nedocromil sodium.

170
~~170~~

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
Luís Patiño
Apoderado

ASUNTO	Radicación	06 96303
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	011 10870

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
----------------------	-------------------------------------	-------------------------------	--------------------------

Vía Nacional	☐
--------------	--------------------------

Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐	Cap. II	☒
-------------------------	-------------------------------------	--------	--------------------------	---------	-------------------------------------

No. Sol. Internacional	PCT/US2005/009899
Fecha de Presentación Internal.	24/03/2005

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

- | | | |
|------|--------------------------|--|
| 1.1. | <u>Descripción:</u> | Folios 33 - 62 |
| 1.2. | <u>Reivindicaciones:</u> | Folios 63 - 64 |
| 1.3. | <u>Prioridad:</u> | Presentada en Estados Unidos el 26.03.04, bajo el número 60/556927 |

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: "Hidrocloruro de [4-(5-aminometil-2-fluoro-fenil)-piperidin-1-il]-(4-bromo-3-metil-5-propoxi-tiofen-2-il)-metanona como un inhibidor de la triptasa de mastocitos".

Según las reivindicaciones 1-26 se refiere al compuesto de fórmula I o un profármaco, solvato y a las sales de los mismos y a composiciones farmacéuticas que los contienen.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de más compuestos que sean inhibidores de la triptasa de mastocitos.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona los compuestos de la presente solicitud que son activos sobre la triptasa de mastocitos en procesos inflamatorios.

- Clasificación Internacional de Patentes A 61K 31/4535

3. De la solicitud de Patente

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- El término "profármaco" no se encuentra debidamente sustentado en la descripción, pues no se describe el procedimiento, ni la manera de obtenerlos.

4. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D 486 literal d)

- El contenido de las reivindicaciones 4-15, que trata de "Un método para tratar a un paciente...", no es patentable, debido a que se relaciona con métodos de tratamiento aplicados al ser humano o a animales.

5. Determinación del Estado de la Técnica

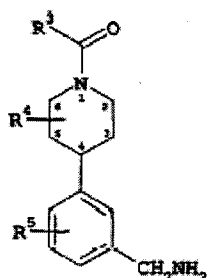
Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 26.03.04, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 0190101	"Derivados de arilmetilamina para uso como inhibidores de triptasa"	29.11.01

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

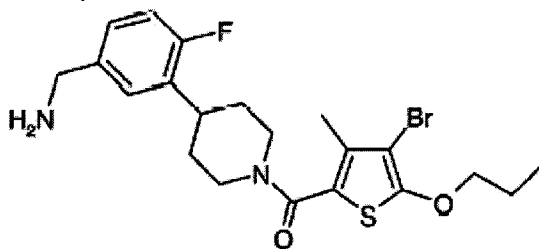
6.1. Novedad (artículo 16 D486)

- La publicación WO 0190101 se relaciona con compuestos de



fórmula , en donde R5 es halo, R4 es H y R3 es heteroaril en donde heteroaril significa un radical aromático de 5-10 miembros en donde uno o más de ellos es un átomo diferente al carbono como el azufre, donde dicho radical se encuentra opcionalmente sustituido, así como sus sales (se menciona el clorhidrato) y composiciones farmacéuticas que los contienen solos o en combinación con agentes antiinflamatorios.

- La presente solicitud trata de compuestos de fórmula:



, así como su sal clorhidrato y composiciones que lo contienen, solos o en combinación con agentes antiinflamatorios.

Comparando elemento por elemento, los compuestos y las composiciones de las reivindicaciones 1-3 y 16-26 son iguales a las reveladas en los documentos citados, ya que las definiciones de R3-R5 corresponden a los sustituyentes específicos del compuesto de la presente solicitud.

En conclusión los elementos característicos de los compuestos de las reivindicaciones 1-3 y 16-26 de la presente se encuentra revelado en D1 y puede afectar la novedad de la presente solicitud.

7. Conclusión:

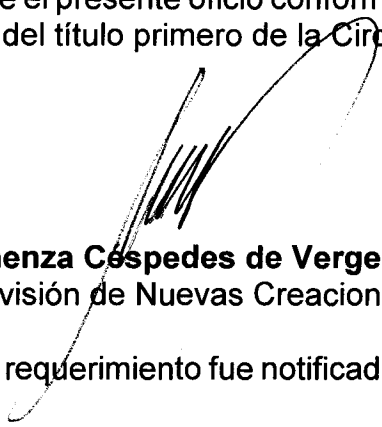
Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 0190101	1-3, 16-26	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.

173
~~173~~

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
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

20/04/2004

CONCEPTO TECNICO No. 3160	EXAMINADOR TECNICO Código No.202024
-------------------------------------	---



REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION E 14541

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/06-96303

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 30 del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que la solicitud de patente de invención titulada "[HIDROCLORURO DE [4-(5-AMINOMETIL-2-FLUORO-FENIL)-PIPERIDIN-1-IL]-(4-BROMO-3-METIL-5-PROPOXI-TIOFEN-2-IL)-METANONA COMO UN INHIBIDOR DE LA TRIPTASA DE MASTOCITOS]", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2005/009899 de fecha 24 de marzo del 2005, fue radicada en esta Superintendencia el 25 de septiembre del 2006 bajo el número 06-096303 -00000-0000, para que se dé comienzo a la fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *"Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales.(...) Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente"*.

CUARTO: Que realizado el examen de fondo, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 163 a 173 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente. Frente a dicho requerimiento no hubo pronunciamiento alguno por parte del solicitante, por lo cual es procedente negar el privilegio de patente solicitado con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION 514571

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. PCT/06-96303

RESUELVE:

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención para la solicitud correspondiente a "[HIDROCLORURO DE [4-(5-AMINOMETIL-2-FLUORO-FENIL)-PIPERIDIN-1-IL]-(4-BROMO-3-METIL-5-PROPOXI-TIOFEN-2-IL)-METANONA COMO UN INHIBIDOR DE LA TRIPTASA DE MASTOCITOS]", que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT).

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Luis Patiño Leyva, en su calidad de apoderado de AVENTIS PHARMACEUTICALS INC., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición interpuesto ante el Superintendente de Industria y Comercio, al momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 16 de JUL 2010

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
LUIS PATIÑO LEYVA
Calle 94 A No. 7A-09
Bogotá D.C.