

P20010/ (58952)

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-106440- -00003-0000
Fec: 2007-03-08 15:03:42 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 11 PATENTEYII
Evs: 379 FASENACIONALII
Act 444 RESPUESTAREQUE **Folios: 18**

E. S. D.

Ref.: Expediente: No. 06.106.440

Solicitud de Patente PCT entrada fase nacional para:

"DERIVADOS DE IMIDAZOL UTILIZADOS COMO INHIBIDORES DE TAFIa"

Solicitante: SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH

RESPUESTA A EXAMEN DE FORMA

LUIS PATIÑO LEYVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en atención a su oficio No. 13918 Notificado el 1 de diciembre 2006 y estando dentro del término de prórroga que solicité el 30 de Enero de 2007, atentamente me permito dar repuesta al mismo en los siguientes términos:

- Acompaño documento de cesión de los inventores a la sociedad solicitante del registro de patente, junto con su traducción oficial.
- Formato PCT/IB/306 que certifica la adición del inventor Hauke SZILLAT.
- Formato PCT/IPEA/409. Informe Preliminar Internacional sobre Patentabilidad Capítulo II el cual no contiene anexos.

Cumplido así con lo dispuesto, atentamente solicito a Ud. se continúe con el trámite correspondiente a esta solicitud de Patente de Invención.

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

Carrera 11A No. 94-76 Oficina 308 Santa Fe de Bogotá

Teléfonos: 6161948

09 MAR. 2007

Los suscritos
(We, the undersigned)

- 1) Dr. Christopher Kallus, Gotenstrasse 1, 65929 Frankfurt, Germany
- 2) Dr. Holger Heltsch, Castellumstrasse 52, 55252 Mainz-Kastel, Germany
- 3) Dr. Andreas Lindenschmidt, Brahmsstr. 4, 65812 Bad Soden, Germany
- 4) Dr. Sven Grueneberg, Heingraben 11, 65779 Kelkheim, Germany
- 5) Dr. Hauke Szillat, Kapellenberg 26, 65931 Frankfurt, Germany

declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título
(declare that we are the inventors of the invention titled)

Imidazole derivatives used as TAFIa inhibitors

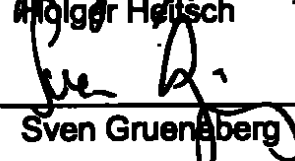
y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios y
(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its privileges and

anexidades a favor de **SANOPI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH**, domiciliada en Frankfurt am Main, Alemania
(attachments, to Sanofi-Aventis Deutschland GMBH domiciled in Frankfurt, Germany)

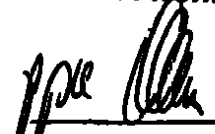
Firma de los cedentes
Firmado en Frankfurt
El

Signatures of Assignors
Signed at
on

INVENTORS:

1st:		2nd:	
	Christopher Kallus		Holger Heltsch
3rd:		4th:	
	Andreas Lindenschmidt		Sven Grueneberg
5th:			
	Hauke Szillat		

Sanofi-Aventis Deutschland GmbH

 
Dr. Wein Breuer
Signature of Assignee

Nummer 1449/2006 der Urkundenrolle

Der Notar versichert, daß er die Beteiligten nach einer Vorbefassung im Sinne des § 3 Abs. 1 Satz 1 Nr. 7 BeurkG gefragt hat. Die Frage wurde verneint.

The Notary Public confirms, that he has asked the participants, if there has been a prior involvement in the meaning of § 3 section 1 sentence 1 No. 7 BeurkG (Law on Notarization). This question was answered in the negative.

Die vorstehenden, heute vor mir anerkannten Unterschriften von

It is officially certified that

1. Dr. Christopher Kallus, Frankfurt,
2. Dr. Holger Heitsch, Mainz-Kastel,
3. Dr. Andreas Lindenschmidt, Bad Soden,
4. Dr. Sven Grünberg, Kelkheim,
5. Dr. Hauke Szillat, Frankfurt,
6. Prokurist Dr. Elmar-Michael Wein, Niedernhausen,
7. Handlungsbevollmächtigter Dieter Breuer, Frankfurt,

werden hiermit beglaubigt.
Sie sind mir persönlich bekannt.

have signed this document.
They are personally known to me.

Gleichzeitig wird bestätigt, daß die Personen zu 6) und 7) gemeinsam zeichnungs- und vertretungsberechtigt sind für die

At the same time it is confirmed that the persons 6) and 7) are entitled to jointly sign and represent in legally binding manner the

Sanofi-Aventis Deutschland GmbH in Frankfurt am Main

laut Eintragung im Handelsregister -HR B 40661-, das vom Notar am 10. Nov. 2006 eingesehen wurde, bzw. lt. vorliegender Vollmacht.

according to the Commercial Register -HR B 40661-, which has been inspected by the Notary Public on Nov. 10, 2006, or according to the letter of authorization, which I have before me.

Frankfurt am Main, den 16. November 2006



[Signature]
Friedrich, Notar

Kostenrechnung:

Wert : 10.000,-- EUR	
Gebühr §§ 141, 32, 45 Kost.O.	13,50 EUR
Gebühr § 150 Kost.O.	13,-- EUR
Steuer 16 %	<u>4,24 EUR</u>
	<u>30,74 EUR</u>

[Signature]
Notar

210

APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)



1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Klaus Peter Friedrich
3. in seiner Eigenschaft als amtlich bestellter Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des(der)
Notars

Bestätigt

5. in Frankfurt/Main
6. am 21.11.06
7. durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Ea A 10366
9. Siegel/Stempel
10. Unterschrift



K. P. Friedrich
I.V. Franke

63



[Traducción Oficial del Alemán]

Registro Notarial Número 1449/2006

El Notario Público confirma que él les preguntó a los participantes acerca de algún eventual impedimento previo en el sentido del Artículo 3 inciso 1 párrafo 1 No. 7 de la Ley de Notarización. La pregunta fue contestada negativamente.

Se autentican oficialmente las firmas que aparecen anteriormente, las cuales fueron reconocidas el día de hoy en mi presencia como las suyas propias por

1. Doctor Christopher Kallus, domiciliado en Frankfurt,
2. Doctor Holger Heitsch, domiciliado en Mainz-Kastel,
3. Doctor Andreas Lindenschmidt, domiciliado en Bad Soden,
4. Doctor Sven Grüneberg, domiciliado en Kelkheim,
5. Doctor Hauke Szillat, domiciliado en Frankfurt,
6. Apoderado Doctor Elmar-Michael Wein,
domiciliado en Niedernhausen,
7. Apoderado Dieter Breuer, domiciliado en Frankfurt.

Todos ellos conocidos personalmente por el suscrito Notario.

Al mismo tiempo se confirma que las personas mencionadas en los numerales 6) y 7) se encuentran autorizadas para firmar conjuntamente en nombre y representación de la compañía

Sanofi-Aventis Deutschland GmbH
domiciliada en Frankfurt am Main,

según consta en la correspondiente entrada del Registro Comercial HRB 40661 que fue inspeccionada por el Notario el día 10 de Noviembre de 2006 o según consta en el poder que he tenido a la vista.

Frankfurt am Main, 16 de Noviembre de 2006

KLAUS PETER FRIEDRICH, NOTARIO EN FRANKFURT AM MAIN
(Firma y Sello Oficial)

Nota de gastos:

Valor del negocio: 10.000,00 EUROS

Impuesto Artículo 141, 32, 45 Disp. Impuestos 13,50 EUROS

Impuesto Artículo 150 Disposición Impuestos 13,-- EUROS

16% I.V.A. 4,24 EUROS

Total: 30,74 EUROS

Klaus Peter Friedrich, Notario en Frankfurt am Main

(Firma)

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por: Klaus Peter Friedrich
3. En su calidad de: Notario Público nombrado oficialmente
4. Y lleva el sello oficial: del Notario

Confirmado

5. En: Frankfurt/Main
6. El día: 21.11.06
7. Por: El Señor Presidente del Tribunal Regional
8. Bajo el No.: 91 Ea A 10366
9. Sello: EL PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL
FRANKFURT AM MAIN
10. Firma: En representación Franke


ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 8433 Minjusticia 5

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

555358
A. F. Cuatrecasas
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2007 EN 24 A 8 53
Uld
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

23

Sanofi-Aventis Deutschland GmbH
Patentabteilung K801
Vorg.
Dat.: 27. Feb. 2007
OWV.
St. wie Vorg. / eingeg.

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

SANOI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH
Patent- und Lizenzabteilung
Industriepark Höchst, Geb. K 801
65926 Frankfurt
ALLEMAGNE

(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

Date of mailing (day/month/year) 19 February 2007 (19.02.2007)	
Applicant's or agent's file reference 2004/0028	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2005/003630	International filing date (day/month/year) 07 April 2005 (07.04.2005)

1. The following indications appeared on record concerning:

☒ the applicant ☒ the inventor ☐ the agent ☐ the common representative

Name and Address	State of Nationality	State of Residence
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	Teleprinter No.	

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☒ the person ☐ the name ☒ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address SZILLAT, Hauke Am Kapellenberg 26 65931 Frankfurt am Main Germany	State of Nationality	State of Residence
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	Teleprinter No.	

3. Further observations, if necessary:

The person identified in Box 2 should be added to the record as applicant for the United States of America only and inventor for all designated States.

4. A copy of this notification has been sent to:

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☒ the elected Offices concerned
☐ the International Preliminary Examining Authority ☐ other:

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70	Authorized officer Cendana Aurora Facsimile No. +41 22 338 89 75 Telephone No. +41 22 338 99 05
---	--

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

214

PCT

REC'D 19 SEP 2006

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts DEAV2004/0028	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/18	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/003630	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 07.04.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 22.04.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D401/06 C07D401/14 C07D408/14 C07D417/06 A61K31/435 A61K31/41 A61P7/00		
Anmelder SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH et al.		
1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird. 2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 7 Blätter einschließlich dieses Deckblatts. 3. Außerdem legen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen a. ☐ (an den Anmelder und das internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um ☐ Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften). ☐ Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht. b. ☐ (nur an das internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/dies elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enhalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).		
4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten: ☒ Feld Nr. I Grundlage des Berichts ☐ Feld Nr. II Priorität ☒ Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit ☐ Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung ☒ Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung ☐ Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen ☐ Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung ☐ Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung		
Datum der Einreichung des Antrags 02.02.2006	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 13.09.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patenten 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tlx 31 651 spo nl Fax +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Fritz, Martin Tel. +31 70 340-3024 	

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/003630

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der Sprache beruht der Bescheld auf

- ☒ der Internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde.
- ☐ einer Übersetzung der Internationalen Anmeldung in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
 - ☐ Internationale Recherche (nach Regeln 12.3 a) und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der Internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4 a))
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 a) und/oder 55.3 a))

2. Hinsichtlich der Bestandteile* der Internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt):*

Beschreibung, Seiten

1-51 In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 In der ursprünglich eingereichten Fassung

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

 Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/003630

Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

☐ die gesamte internationale Anmeldung,

☒ Ansprüche Nr. 1

Begründung:

- ☐ Die genannte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt zu werden braucht (*genaue Angaben*):
- ☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):
- ☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):
- ☒ Für die obengenannten Ansprüche Nr. 1 wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.
- ☐ Ohne das Sequenzprotokoll konnte kein sinnvolles Gutachten erstellt werden; der Anmelder hat es versäumt, innerhalb der vorgeschriebenen Frist:
- ☐ ein Sequenzprotokoll in Papierform einzureichen, das dem in Anhang C zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht, und ein solches Sequenzprotokoll lag der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nicht in einer für sie annehmbaren Art und Weise vor.
- ☐ ein Sequenzprotokoll in elektronischer Form einzureichen, das dem in Anhang C zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard entspricht, und ein solches Sequenzprotokoll lag der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nicht in einer für sie annehmbaren Art und Weise vor.
- ☐ die erforderliche Gebühr für verspätete Einreichung zu entrichten, wenn ein Sequenzprotokoll aufgrund einer Aufforderung nach den Regeln 13ter.1 a) oder b) und 13ter.2 eingereicht wurde.
- ☐ Ohne die Tabellen zu den Sequenzprotokollen konnte kein sinnvolles Gutachten erstellt werden; der Anmelder hat diese Tabellen nicht innerhalb der vorgeschriebenen Frist in elektronischer Form entsprechend den in Anhang C-bis zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen technischen Anforderungen eingereicht, und solche Tabellen lagen der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nicht in einer für sie annehmbaren Art und Weise vor.
- ☐ Die Tabellen zum Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll, sofern sie nur in elektronischer Form vorliegen, entsprechen nicht den in Anhang C-bis zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen technischen Anforderungen.
- ☐ siehe Beiblatt für weitere Angaben.

21

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/003630

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 2-10
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche
	Nein: Ansprüche 2-10
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 2-10
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Verbindungen (Ia) gerichtet ist.

Die anmeldungsgemässen Verbindungen (Ia) sind den in D1 (Beispiele) und D2 (Verbindungen 9d-9j, 10d-10j) strukturell ähnlich. Bestimmte Vertreter der anmeldungsgemässen Verbindungen (Ia) unterscheiden sich von den aus D1 (Beispiele) bekannten Substanzen lediglich infolge der Definition eines der Substituenten A4 und A5, beispielsweise sei hier Verbindung 8-21 gemäss D1 genannt, in der der Austausch des Methylrestes des 3-Methoxy-Substituenten gegen eine Phenylgruppe zu einem Vertreter der anmeldungsgemässen Verbindungen (Ia) führen wurde.

D1 und D2 offenbaren die Eignung der darin beschriebenen Verbindungen als TAFIa-Inhibitoren.

Die Neuheit der Ansprüche 2-10 wird anerkannt (Artikel 33(2) PCT).

Als nächster Stand der Technik lässt sich das Dokument D1 ansehen.

Aufgabe der vorliegenden Anmeldungen war es somit, weitere Substanzen bereitzustellen, die als TAFIa-Inhibitoren und somit als Antikoagulantien geeignet sind.

Die Aufgabe wurde durch Vertreter der Verbindungen (Ia) gelöst.

Wie bereits oben ausgeführt wurde sind die anmeldungsgemässen Verbindungen (Ia) in bestimmten Fällen bekannten Verbindungen mit der gleichen pharmakologischen Wirkung strukturell ähnlich; infolgedessen müssen sie als für den Fachmann naheliegend angesehen werden.

Es wird in diesem Zusammenhang darauf hingewiesen, dass für chemische Verbindungen nur dann eine erfinderische Tätigkeit anerkannt werden kann, wenn mindestens eine der folgenden Voraussetzungen erfüllt ist:

- a. unerwartete Struktur
- b. unerwartete Verwendung oder Wirkung
- c. Herstellung durch ein erfinderisches Verfahren, jedoch nur, falls hierdurch ein tech-

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER
BERICHT ZUR PATENTIERBARKEIT
(BEI BLATT)**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2005/003630

nisches Vorurteil überwunden oder bis zu ihrer Herstellung angenommen wurde, dass diese mit unüberwindbaren Hindernissen verbunden ist

Da offensichtlich keine der obigen Voraussetzungen erfüllt sind, kann für den Gegenstand der Ansprüche 2-10 eine erfinderische Tätigkeit im Sinne des Artikels 33(3) PCT nicht anerkannt werden.

Weitere Beanstandungen:

Im Widerspruch zu den Erfordernissen der Regel 5.1 a) ii) PCT werden in der Beschreibung weder der in den Dokumenten D1-D2 offenbarte einschlägige Stand der Technik noch diese Dokumente angegeben.

Zeile 23 von Seite 93 (Anspruch 2) ist offensichtlich unvollständig. Dies sollte, um die Erfordernisse des Artikels 6 PCT zu erfüllen, korrigiert werden

TRATADO DE COOPERACIÓN INTERNACIONAL EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD (Capítulo II del Tratado de Cooperación Internacional en materia de Patentes)

Referencia del expediente del solicitante o del agente DEAV2004/0028	PARA ACCIÓN ADICIONAL Véase formulario PCT/IPEA/416	
Solicitud internacional nº PCT/EP2005/003630	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 07.04.2005	Fecha de prioridad (día/mes/año) 22.04.2004
Clasificación internacional de patentes (CIP) o a la vez clasificación nacional y CIP INV. C07D401/06 C07D401/14 C07D409/14 C07D417/06 A61K31/435 A61K31/41 A61P7/00		
Solicitante SANOFI-AVENTIS DEUTSCHLAND GMBH et al.		

- El presente Informe es el informe de examen preliminar internacional, establecido por esta Administración encargada del examen preliminar internacional según el Artículo 35 y se transmite al solicitante conforme al Artículo 36.
- Este INFORME comprende un total de 7 hojas, incluida la presente hoja de portada.
- Este informe también contiene ANEXOS, que comprenden:
 - ☐ (remitido al solicitante y a la Oficina Internacional) un total de 25 hojas, descritas a continuación:
 - ☐ hojas de la descripción, las reivindicaciones y/o los dibujos que han sido modificadas y que sirven de base al presente informe, y/o de hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Administración (véase la Regla 70.16 y la Instrucción Administrativa 807 del PCT).
 - ☐ hojas que reemplazan a otras hojas anteriores, pero que esta Administración considera que contienen modificaciones que se extienden más allá de la divulgación de la invención tal como fue originalmente presentada, según se indica en el punto 4 del Recuadro I y en el Recuadro Suplementario.
 - ☐ (remitido únicamente a la Oficina Internacional) un total de (indicar tipo y número de soporte(s) electrónico(s)) , que contiene una lista de secuencias y/o tabla(s) relativas(s), solo en formato legible por ordenador, como se indica en el Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias (ver Instrucción Administrativa 802).

4. El presente Informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes:

- | | | |
|-------------------------------------|---------------|---|
| ☒ | Recuadro I | Base de la opinión |
| ☐ | Recuadro II | Prioridad |
| ☒ | Recuadro III | No formulación de opinión sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial |
| ☐ | Recuadro IV | Falta de unidad de invención |
| ☒ | Recuadro V | Declaración motivada según el Artículo 35(2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración |
| ☐ | Recuadro VI | Ciertos documentos citados |
| ☐ | Recuadro VII | Defectos en la solicitud internacional |
| ☐ | Recuadro VIII | Observaciones relativas a la solicitud internacional |

Fecha de presentación de la petición de examen preliminar internacional 02.02.2006	Fecha de terminación del presente informe 13.09.2006
Nombre y dirección postal de la administración encargada del examen preliminar internacional  Oficina Europea de Patentes – P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk – Países Bajos Tel. +31 70 340 – 2040 Tlx 31 651 epo nl Fax +31 70 340 – 3016	Funcionario autorizado Fritz, Martin  Teléfono Nº +31 70 340-3024

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD**

Solicitud internacional n°
PCT/EP2005/003630

Recuadro I. Base del Informe

1. Por lo que respecta al idioma, este informe se ha basado

- ☒ la solicitud internacional en el idioma en el cual se depositó
☐ una traducción del idioma original al siguiente idioma, que es el de una traducción proporcionada a los fines de:
- ☐ búsqueda internacional (según Reglas 12.3 (a) y 23.1(b))
 - ☐ publicación de la solicitud internacional (según Regla 12.4 (a))
 - ☐ examen preliminar internacional (según Reglas 55.2 (a) y/o 55.3(a))

2. Por lo que respecta a los elementos* de la solicitud internacional, este informe se basa en *(las hojas de reemplazo que se han enviado a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento según el artículo 14 se denominan en este informe como "inicialmente presentadas" y no se anexan al informe):*

Descripción, páginas:

1-81 como se depositaron inicialmente

Reivindicaciones, N°.:

1-10 como se depositaron inicialmente

- ☐ una lista de secuencias y/o tabla(s) relativa(s), véase Recuadro Suplementario Relativo a la Lista de Secuencias

3. ☐ Las modificaciones han ocasionado la cancelación de:

- ☐ la descripción, páginas
- ☐ las reivindicaciones, nos
- ☐ los dibujos, hojas/fig. .
- ☐ la lista de secuencias (*especificar*)
- ☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (*especificar*)

4. ☐ Este informe ha sido establecido como si no se hubiesen presentado (algunas de) las modificaciones anexadas a este informe y listadas abajo, ya que se ha considerado que iban más allá de la divulgación de la invención tal como fue presentada, como se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2.c)).

- ☐ la descripción, páginas
- ☐ las reivindicaciones, N°s
- ☐ los dibujos, hojas/fig.
- ☐ la lista de secuencias (*especificar*)
- ☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (*especificar*)

* En caso de que se aplique el punto 4, algunas o todas estas páginas pueden llevar el sello de "sustituida"

Recuadro III. Ausencia de formulación de opinión sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad industrial

1. No se ha examinado la cuestión de si el objeto de la invención reivindicada parece ser nuevo, implicar una actividad inventiva (no ser evidente) o ser susceptible de aplicación industrial, por lo que respecta:
- ☐ al conjunto de la solicitud internacional,
 - ☒ a las reivindicación n° 1
debido a que:
 - ☐ dicha solicitud internacional, o dichas reivindicaciones Nos., se refieren al objeto siguiente, el cual no requiere un examen preliminar internacional (*precisar*):
 - ☐ la descripción, las reivindicaciones o los dibujos (*indíquense los elementos particulares abajo*) o dichas reivindicaciones Nos. en cuestión, no son claros, de manera que no es posible formular una opinión significativa (*precisar*):
 - ☐ las reivindicaciones, o dichas reivindicaciones Nos., no están fundadas en la descripción, por lo que es imposible formular una opinión significativa (*precisar*):
 - ☒ no se ha emitido informe de búsqueda internacional para dicha reivindicación n° 1
 - ☐ no fue posible formular una opinión significativa sin la lista de secuencias; el solicitante, no aportó, dentro del tiempo límite prescrito:
 - ☐ una lista de secuencias en papel cumpliendo con la norma prevista en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, y la mencionada lista no estuvo a disposición de la Autoridad Examinadora Internacional Preliminar en forma y manera aceptable para ella
 - ☐ una lista de secuencias en formato electrónico cumpliendo con la norma prevista en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, y la mencionada lista no estaba disponible en la Administración encargada del Examen Preliminar Internacional en forma y manera aceptable para ella
 - ☐ la tasa por presentación tardía de una lista de secuencias en respuesta a un requerimiento según las Reglas 13ter.1^a) o b) y 13ter.2
 - ☐ no se pudo formular una opinión significativa sin las tablas relativas a las listas de secuencias; el solicitante no presentó en el plazo establecido dichas tablas en formato electrónico de acuerdo con los requisitos técnicos establecidos en el Anejo C-bis de las Instrucciones Administrativas, y dichas tablas no estuvieron a disposición de la Administración encargada del Examen Preliminar Internacional en forma y manera aceptable para ella
 - ☐ las tablas relativas a las listas de secuencias de nucleótidos y/o de aminoácidos, si se han presentado únicamente en formato electrónico, no cumplen con los requisitos técnicos previstos en el Anexo C-bis de las Instrucciones Administrativas
 - ☐ véase hoja separada para más detalles

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD**

Solicitud internacional nº
PCT/EP2005/003630

**Recuadro V. Declaración motivada según el artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad
inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta
declaración**

1. Declaración

Novedad	Si:	Reivindicaciones	2-10
	No:	Reivindicaciones	
Actividad inventiva	Si:	Reivindicaciones	2-10
	No:	Reivindicaciones	
Aplicabilidad industrial	Si:	Reivindicaciones	2-10
	No:	Reivindicaciones	

2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)

véase hoja separada

23A

Con respecto al Punto III

No se proporciona ninguna opinión sobre novedad, actividad inventiva y aplicación industrial.

Para el objeto no recogido en el Informe de Búsqueda no se lleva a cabo ningún Examen Preliminar Internacional (véase la Regla 66.1 e) PCT).

Con respecto al Punto V

Declaración motivada según la Regla 66.2(a)(ii) en relación con la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; documentos y declaraciones para sustentar esta declaración.

- D1: WO 03/013526 A (MERCK & CO. INC; BARROW, JAMES, C; SELNICK, HAROLD, G; NANTERMET, PHIL) 20 Feb. 2003 (20-2-2003)
- D2: BARROW ET AL.: "Synthesis and Evaluation of Imidazole Acetic Acid Inhibitors of Activated Thrombin-Activatable Fibrinolysis Inhibitor as Novel Antithrombotics" J. MED. CHEM., tomo 46, 2003, hojas 5294-5297, XP002338234
- D3: NANTERMET ET AL.: "Imidazole acetic acid TAFAla inhibitors: SAR studies centered around the basic P¹ group" BIOORG. & MED. CHEM. LETT., tomo 14, Septiembre 2004 (09-2004), hojas 2141-2145, XP002338235

La presente solicitud describe compuestos de las fórmulas generales (I) (reivindicación 1) y (Ia) (reivindicaciones 2-6), un procedimiento para su preparación (reivindicación 7), medicamentos que contienen estos compuestos (reivindicación 8), así como su uso para la preparación de medicamentos (reivindicaciones 9-10).

Dado que en el caso de la reivindicación 1 no se ha realizado la búsqueda, ésta no se ha examinado ni en cuanto a novedad ni en cuanto a la eventual presencia de actividad inventiva o aplicación industrial (véase la Regla 67.1 (iv) PCT).

17

Los comentarios siguientes en relación con la novedad, actividad inventiva y aplicación industrial de las reivindicaciones 2-10 se refieren únicamente al contenido en el que realmente se ha hecho la búsqueda (Art. 17(2) PCT), es decir, la parte de estas reivindicaciones que está dirigida a los compuestos (Ia).

Los compuestos (Ia) de acuerdo con la solicitud son estructuralmente similares a los indicados en D1 (Ejemplos) y D2 (compuestos 9d-9j, 10d-10j). Determinados representantes de los compuestos (Ia) de acuerdo con la solicitud se diferencian de las sustancias conocidas por D1 (Ejemplos) únicamente como consecuencia de la definición de uno de los sustituyentes A4 y A5, a título de ejemplo se menciona en este caso el compuesto 8-21 de acuerdo con D1, en el que el intercambio del radical metilo del sustituyente 3-metoxi por un grupo fenilo conduciría a un representante de los compuestos (Ia) de acuerdo con la solicitud.

D1 y D2 dan a conocer la adecuación de los compuestos en ellos descritos como inhibidores de TAFIa.

Se reconoce la novedad de las reivindicaciones 2-10 (Artículo 33(2) PCT).

Como Estado de la Técnica más próximo se puede considerar el documento D1.

Por consiguiente, era misión de la presente solicitud poner a disposición otras sustancias que fuesen adecuadas como inhibidores de TAFIa y, por consiguiente, como anticoagulantes.

El problema se resuelve mediante representantes de los compuestos (Ia).

Como ya se ha indicado arriba, los compuestos (Ia) de acuerdo con la solicitud son estructuralmente similares a compuestos con la misma actividad farmacológica; como consecuencia, deben ser considerados por el experto en la materia como evidentes.

A este respecto, se hace alusión a que para compuestos químicos solamente se puede reconocer una actividad inventiva cuando al menos se cumpla una de las siguientes premisas:

- a. Estructura inesperada
- b. Uso o efecto inesperado

- c. Preparación mediante un procedimiento inventivo, pero sólo en caso de que con ello se haya superado un juicio previo técnico o se haya supuesto hasta su preparación que ésta estaba ligada con impedimentos insuperables.

Dado que evidentemente no se cumple ninguna de las premisas anteriores, no se puede reconocer para el objeto de las reivindicaciones 2-10 una actividad inventiva en el sentido del Artículo 33(3) PCT.

Otras objeciones:

En contraposición de los requisitos de la Regla 5.1 a) ii) PCT, en la memoria descriptiva no se indica el Estado conocido de la Técnica divulgado en los documentos D1 y D2, ni tampoco estos documentos

La línea 23 de la página 93 (reivindicación 2) está evidentemente incompleta. Esto debería corregirse con el fin de cumplir los requisitos del Artículo 6 PCT.