

367 364

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-055084- -00004-0000

Fecha: 2011-02-17 15:30:01 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 379 FASENACIONALII  
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

2020  
Bogotá, D.C.,

Abogado  
**ALICIA LLOREDA RICAURTE**

|        |            |          |
|--------|------------|----------|
| ASUNTO | Radicación | 07-55084 |
|        | Trámite    | 011      |
|        | Evento     | 379      |
|        | Actuación  | 538      |
|        | Oficio     |          |
|        | Folios     | 8        |

2011-02-17

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional PCT/EP2005/011430  
Fecha de Presentación Internal. 25-10-2005

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**

Descripción: Folios: 74 a 289 (como se radicó inicialmente)

Reivindicaciones: Folios 290 a 311 (como se radicó inicialmente)  
Folios 329 a 350 (modificación).

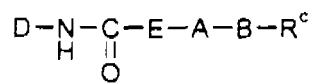
Prioridad: Fecha: 03-11-2004; país y número: EP04105465.1.  
Fecha: 12-01-2005; país y número: EP05100132.9.

**2. Objeto de la Invención**

Titulo de la invención: "NUEVOS DERIVADOS DE CARBOXAMIDA"

Problema Técnico Planteado: la necesidad de suministrar nuevos inhibidores de factor Xa que desplieguen su acción con mejores propiedades farmacológicas, como una mejor selectividad con respecto al factor de coagulación Xa (folio 79)

Solución: proveer compuestos de fórmula (I) inhibidores del factor Xa.

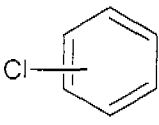
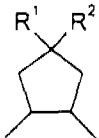
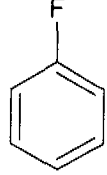
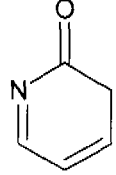
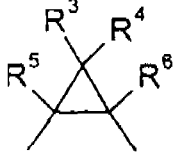
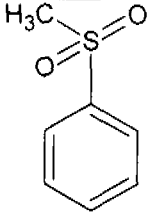


La invención se catalogó según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC.) como: C07D213/64; C07D213/75; C07D233/64; C07D279/02

3. De la solicitud de Patente

a. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1 carece de concisión ya que abarca un número demasiado alto de alternativas posibles dentro de la misma. Al parecer, los compuestos favoritos de la solicitud de acuerdo con los ejemplos corresponden a los siguientes sustituyentes:

| D                                                                                   | E                                                                                   | A      | B                                                                                    | R <sup>c</sup>                                                                        |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------|--------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
|  |  | -CONH- |  |  |
|                                                                                     |  |        |                                                                                      |  |

La solicitud reclama un número indeterminado de compuestos con una elevada variabilidad estructural, sin embargo los valores de Ki presentados por el solicitante se limitan a los ejemplos 47, 48 y 52, cuyos resultados no son representativos ni extrapolables a la alta gama de compuestos estructuralmente diferentes solicitados.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La solicitud carece de unidad de invención, debido a que comprende múltiples conceptos inventivos. De acuerdo con los ejemplos los grupos inventivos preferidos son:

- I. Compuestos en los que D es arilo, E es E-1, B es fenilo y R<sup>c</sup> es arilo.
- II. Compuestos en los que D es arilo, E es E-2, B es fenilo y R<sup>c</sup> es arilo.
- III. Compuestos en los que D es arilo, E es E-3, B es fenilo y R<sup>c</sup> es arilo.
- IV. Compuestos en los que D es arilo, E es E-1, B es fenilo y R<sup>c</sup> es heteroarilo.
- V. Compuestos en los que D es arilo, E es E-2, B es fenilo y R<sup>c</sup> es heterociclilo.

El solicitante debe limitar la solicitud a un único concepto inventivo.

5. 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 03-11-2004

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* |
|----|----------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1 | WO01/64642     | BENZAMIDES AND RELATED INHIBITORS OF FACTOR XA                                       | 07-09-2001            |
| D2 | US2003/0162787 | INHIBITORS OF FACTOR XA AN OTHER SERINE PROTEASE INVOLVED IN THE COAGULATION CASCADE | 28-08-2003            |

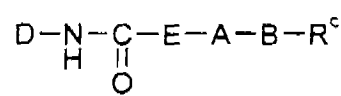
D1 divulga derivados de dicarboxamida activos como moduladores del factor de coagulación Xa

6. Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

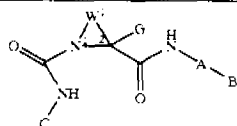
El análisis de nivel inventivo se hará frente al primer grupo inventivo de la solicitud.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 reclama compuestos de la fórmula (I):



Análisis de las diferencias con respecto al estado de la técnica:

| Características esenciales de la Solicitud                                                                                                                     | D1                                                                                    | D2             |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
|                                                                                                                                                                | WO01/64642                                                                            | US2003/0162787 |
| $\begin{array}{c} \text{D}-\text{N}-\text{C}-\text{E}-\text{A}-\text{B}-\text{R}^c \\   \quad    \\ \text{H} \quad \text{O} \end{array}$<br>A-Q-D-E-G-J-X (Ia) |  |                |
| D = arilo opcionalmente sustituido por uno, dos o tre átomos de halógeno elegidos entre cloro, fluor y bromo                                                   | ✓                                                                                     | ✓              |
| E=                                                                                                                                                             | ✓                                                                                     | ✓              |

|                                                                                                                                                                                 |   |   |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|---|
| E-1:  , E-2:  |   |   |
| A= -CONH- O -NHCO-                                                                                                                                                              | ✓ | ✓ |
| B= fenilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido                                                                                                        | ✓ | ✓ |
| R <sup>C</sup> = arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido                                                                                           | ✓ | ✓ |

El estado de la Técnica más cercano es D1 que divulga derivados de carboxamida que comprenden los mismos sustituyentes de los compuestos de la presente solicitud (ver documento completo)

La solicitud se diferencia de D1 en que los compuestos favoritos son aquellos en que E un ciclo de tres o cinco elementos sustituido, mientras que los compuestos divulgados por D1 presentan preferiblemente un anillo de seis miembros entre los grupos de carboxamida (ver D1 ejemplos pág. 160 y siguientes).

El Efecto Técnico que logra la diferencia es el mismo que logra la anterioridad, ya que los compuestos divulgados por D1 son igualmente inhibidores del factor Xa (Ver D1 folio 359, abstract).

El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud consite en seleccionar múltiples compuestos divulgados en D1.

D2 describe compuestos de dicarboxamida, en los que el anillo entre cada carboxamida es preferiblemente un ciclo de tres elementos. D2 enseña que los compuestos de este tipo son inhibidores del factor Xa con adecuados valores de IC<sub>50</sub> a concentración de enzima de 3pM y 30pM (ver folio 364, tabla 1)

En conclusión, los compuestos y composiciones de las reivindicaciones 1 y sus dependientes carecen de nivel inventivo.

7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud se encuentran afectados así:

| Nº | Documento      | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|----|----------------|----------------------------|----------------------|
| D1 | WO01/64642     | 1-65                       | Nivel inventivo      |
| D2 | US2003/0162787 | 1-65                       | Nivel inventivo      |

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 quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.



**JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
Director de Nuevas Creaciones (C)

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

11 FEB 2011

|                                  |                                                |
|----------------------------------|------------------------------------------------|
| <b>CONCEPTO TÉCNICO</b><br>No.54 | <b>EXAMINADOR TÉCNICO</b><br>Código No. 202073 |
|----------------------------------|------------------------------------------------|