

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

2020  
Bogotá, D.C.,

Abogad  
**LUIS PATIÑO LEYVA**  
info@castellanosyco.co

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**No. 09-057335- -00005-0000**

Fecha: 2012-10-24 13:44:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 3

|        |            |              |
|--------|------------|--------------|
| ASUNTO | Radicación | 09 057 335   |
|        | Trámite    | 011          |
|        | Evento     | 378          |
|        | Actuación  | 519          |
|        | Oficio     | <b>19190</b> |
|        | Folios     | <b>3</b>     |

|                                     |                                                |                                                 |
|-------------------------------------|------------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| Patente de Invención                | <input checked="" type="checkbox"/>            | Patente de Modelo de Utilidad                   |
| Vía Nacional                        |                                                |                                                 |
| Vía PCT (Fase Nacional)             | <input checked="" type="checkbox"/> Capítulo I | <input checked="" type="checkbox"/> Capítulo II |
| No. Solicitud Internacional         | PCT/EP2007/010101                              |                                                 |
| Fecha de Presentación Internacional | 22/Noviembre/2007                              |                                                 |

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 comunica:

**1. Documentos estudiados**

|                   |                  |                   |
|-------------------|------------------|-------------------|
| Descripción:      | Folios 192 a 305 | 03/Junio/2009     |
| Reivindicaciones: | Folios 306 a 366 | 03/Junio/2009     |
| Prioridad:        | DE 06/12/2006    | 06/Diciembre/2006 |

**2. Análisis de la prioridad**

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

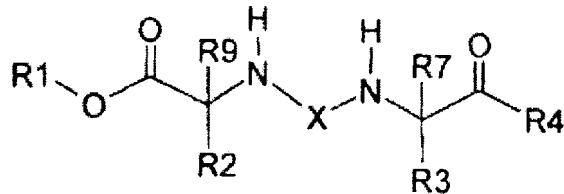
**3. Objeto de la invención**

Título de la solicitud: "Derivados de úrea y de sulfamida en calidad de inhibidores de TAFIa".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar

compuestos alternativos inhibidores de TAFIa útiles para el uso en trastornos asociados con trombosis, embolismos, hipercoagulabilidad o cambios fibróticos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I).



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la clasificación internacional de patentes (CIP): A61K31/17; A61K31/36; A61K31/381; A61K31/40; A61K31/4164; A61K31/4184; A61K31/4402; A61K31/4409; A61P9/10.

#### 4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 1 – 10 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

#### 5. De la Solicitud de Patente

##### Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio presentado carece de claridad y concisión por cuánto:

Deben eliminarse de las reivindicaciones los términos ambiguos que no permiten definir la invención ni que pueda ser reproducida por el experto en la materia. Se deben eliminar las expresiones: “forma estereoisómera y/o mezclas de estas formas en cualquier posición”, “sal fisiológicamente tolerada”, “vehículo, aditivo y/o otros ingredientes activos” “excipientes farmacéuticamente adecuados”.

Las reivindicaciones 1-22 no están debidamente sustentadas en la descripción porque de las definiciones de X, A1, A2, m, n, x, Het, PG (grupo protector), R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R11, R12, R13, R14, R15, se obtiene un gran número de compuestos, muchos de los cuales no están ilustrados en la forma de ejemplos de la invención dentro del capítulo descriptivo. Es necesario que el solicitante limite significativamente la materia a proteger con el fin de limitar el alcance de la invención.,

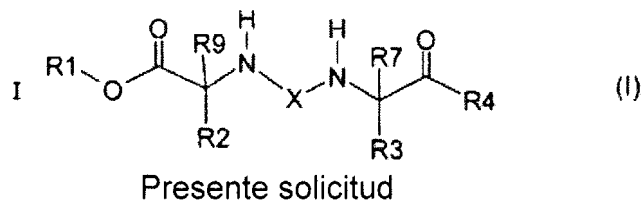
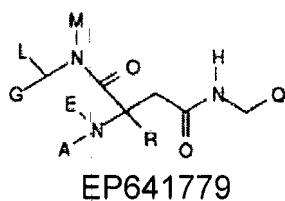
El método mencionado en la reivindicación 21 debe estar caracterizado por las etapas que lo conforman y estar plenamente sustentado en la descripción.

La composición farmacéutica mencionada en la reivindicación 22 debe caracterizarse a partir de los elementos y proporciones de los mismos que la componen, de acuerdo con la información sustentada en la descripción.

#### 6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención según el documento EP641779 el cual divulga compuestos (I), útiles en el tratamiento de enfermedades causadas por agregación plaquetaria inducida por trombina, los cuales comparten características técnicas que afectan el nivel inventivo de los compuestos de la

invención.



Específicamente, el compuesto éster metílico de N-[[[3-[[[1-(aminoiminometil)-3-piperidinil]metil]amino]-1-[hexahidro-1H-azepin-1-il)carbonil]-3-oxopropil]amino]carbonil]-L-fenilalanina (D1: pág. 8, líneas 13 a 24) cumple con la definición estructural de la fórmula general (I) de la presente solicitud, con la diferencia en la definición del grupo R3, el cual en la anterioridad es un grupo: 1-(aminoiminometil)-3-piperidinil]metil]amino]-carbonilmetil, que no cae dentro de la definición de dicho radical R3 en la presente solicitud. Sin embargo, R3 está definido como H, grupos alquilo, cicloalquilo y arilo sustituidos o sin sustituir, y sus diversas combinaciones, lo cual indica que los grupos que definen R3 no comparten ninguna característica técnica estructural, lo cual hace que R3 no pueda ser tomado como la característica técnica que defina la unidad de invención.

Por lo tanto, se determinó que la presente solicitud se refiere a 5 grupos inventivos, definidos por las siguientes características esenciales:

1° Compuestos de fórmula I, donde X= CO y R1=H (Reivindicaciones 16 a 22).

2° Compuestos de fórmula I, donde X= CO y R1=-((C1-C6)-alquilo) (Reivindicaciones 16 a 22).

3° Compuestos de fórmula I, donde X= CO y R1=-(C0-C4)-alquilenos o C3-C12-cicloalquilo (Reivindicaciones 16, 21 y 22).

4° Compuestos de fórmula I, donde X= CO y R1=-(C1-C6)-alquilenos o (C6-C14) arilo (Reivindicaciones 16, 21 y 22).

5° Compuestos de fórmula I, donde X= SO<sub>2</sub> y R1=como se define en la reivindicación 1. (Reivindicaciones 11 a 15, 21 y 22).

Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, según los grupos mencionados o los considerados por el solicitante, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

El presente examen se llevará a cabo sobre el primer grupo inventivo.

## 7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: diciembre 06 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Ítem | Documento   | Título                                                            | Fecha de Publicación |
|------|-------------|-------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1   | EP0641779A1 | Novel 1-amidinopiperdines and 4-amidinomorpholines as aggregation | 08/Marzo/1995        |

|    |             | inhibitions.                                |                |
|----|-------------|---------------------------------------------|----------------|
| D2 | WO99/011606 | Inhibitors of protein tyrosine phosphatase  | 11/Marzo/1999  |
| D3 | EP0611776A2 | New pseudopeptides with antiviral activity. | 24/Agosto/1994 |

D1  
[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en\\_EP&FT=D&date=19950308&CC=EP&NR=0641779A1&KC=A1](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19950308&CC=EP&NR=0641779A1&KC=A1)  
Divulga carboxamidas novedosas de la fórmula en la que A, E, G, L, M, R y Q tienen el significado especificado en la descripción, y los hidratos o solvatos de los mismos inhiben la trombina inducida por la agregación de plaquetas y la coagulación del fibrinógeno en el plasma.

D2  
<http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO1999011606&recNum=1&docAn=US1998017327&queryString=FP:wo9911606%20&maxRec=1>  
Divulga inhibidores no peptídicos de fórmula (I) y (II) de la proteína tirosina fosfatasa 1 (PTP1) que son útiles para el tratamiento y / o prevención de la diabetes no insulino-dependiente mellitus (DMNID).

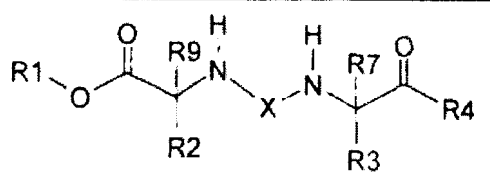
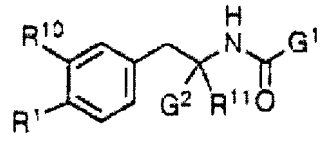
D3  
[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=EP&NR=0611776A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=19940824&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=EP&NR=0611776A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=19940824&DB=EPODOC&locale=en_EP)  
Divulga pseudopéptidos que tienen actividad antiviral y la fórmula general (I) con los significados de los sustituyentes indicados en la descripción, y su uso como agentes antivirales, en particular para los citomegalovirus.

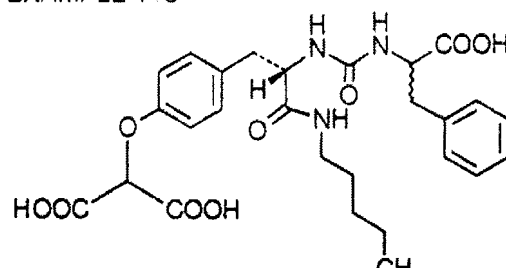
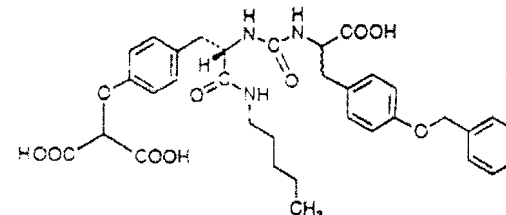
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

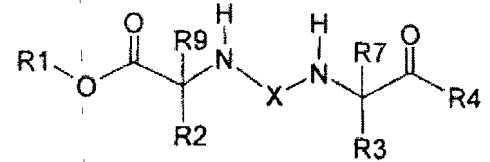
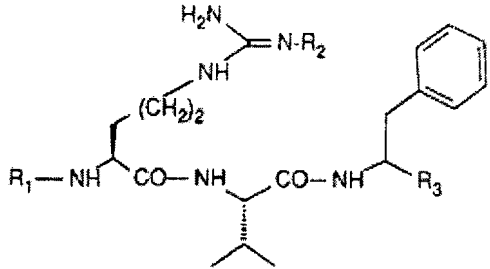
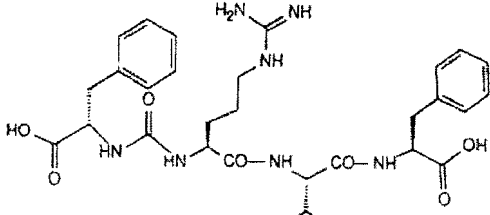
La reivindicación 16 (Grupo inventivo 1º) consiste en un compuesto de fórmula I con las siguientes características técnicas:

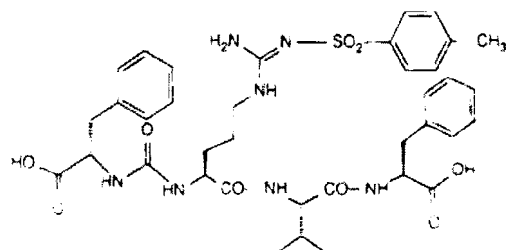
Comparación de las características técnicas **esenciales** con las del Estado de la Técnica (D2):

| Características <b>esenciales</b>                                                   | D2                                                                                                                     |
|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  | <br>I (Reiv. 1)                    |
| Donde:<br>X= C=O                                                                    | Donde<br>G1=-NR8R4<br>R4=H                                                                                             |
| R1=H                                                                                | R8= CH(R7)CO2R5<br>R7= C1-C6-alquilo-G3<br>Donde G3= fenilo naftilo o heterociclo<br>opcionalmente sustituido.<br>R5=H |
| R2= -(A1)m-A2 Donde m=0 o 1 y A2= en general heterociclo o cicloalquilo             | G2= CONHR3<br>R3= puede ser en general alquilo hasta 12 carbonos, opcionalmente sustituido así                         |
| R9=H                                                                                |                                                                                                                        |
| R3= alquilen (C1-C6)arilo(C6-C14)                                                   |                                                                                                                        |
| R7=H                                                                                |                                                                                                                        |
| R4= -N(R6)2                                                                         |                                                                                                                        |

|                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                  |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Los dos R6 pueden ser iguales o diferentes y pueden ser en general alquilo, alquileno, arilo entre otros. | como alquil-cicloalquilo.<br>R11= H                                                                                                                                                                                              |
|                                                                                                           | Ejemplos como:<br><br>EXAMPLE 116<br><br><br>EXAMPLE 119<br> |

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica (D3):

| Características <b>esenciales</b>                                                                                                                                                                                                                                                                    | D3                                                                                                                 |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <br><br>Donde:<br>X= C=O<br><br>R4= -N(R6)2<br>Los dos R6 pueden ser iguales o diferentes y pueden ser en general alquilo, alquileno, arilo entre otros.<br><br>R3= alquilen (C1-C6)arilo(C6-C14)<br>R7=H<br>R1=H | <br><br>I (Reiv. 1)            |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | R5=H<br>Ejemplos como:<br><br> |



Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 16 habían sido divulgadas previamente de forma independiente en los documentos D2 ó D3, los cuales dan a conocer compuestos de fórmula general I, cuyas características técnicas se traslapan con las de la presente invención.

En consecuencia, la reivindicación 16 no es nueva según lo divulgado en los documentos D2 o D3.

Las reivindicaciones dependientes 17 a 20 y 22 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

## 9. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

| Ítem | Documento   | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|-------------|----------------------------|----------------------|
| D2   | WO99/011606 | 16 -22                     | Novedad              |
| D3   | EP0611776A2 | 16 -22                     | 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 (60) 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

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 No. 10 de 2001.

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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha **30 OCT. 2012**

Realizado por: Ximena Andrade. *XA*  
Revisado por: Consuelo Leguizamón. *CL*  
Aprobado por: José Luis Salazar López.

Expediente 09 057 335 1er Art 45