

Brigard & Castro
Abogados

Apartado 3692

Cra. 7 16-56
Bogotá - Colombia S.A.

AS: 90.116

Radicación : 03018834 00000003
Fecha (MD): 2003-10-31 16:13:14
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 444 RESPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 17

.com.co

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

RESPUESTA A OFICIO 05832 DE JULIO 25, 2003

REF: Expediente No. 03 018.834 - Solicitud de Patente Entrada en Fase Nacional Corresp. a la Solicitud Internacional PCT/SE01/01880

a favor de ASTRAZENECA AB

Titulada: PIRROLIAMIDAS BICÍCLICAS COMO INHIBIDORES DE GLUCÓGENO FOSFORILASA

RAMIRO CASTRO DUQUE, vecino de Bogotá, portador de la tarjeta profesional No. 1003, obrando como apoderado de la sociedad ASTRAZENECA AB, según lo acredita el documento de poder presentado en esa División, para dar cumplimiento al requerimiento notificado por fijación en lista el 25 de Julio de 2003, cuyo término fue prorrogado mediante escrito radicado el 23 de Septiembre de 2003 y de acuerdo con los Artículos 38 y 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, Artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la SIC, me permito anexar los siguientes documentos:

1. Documento donde consta la cesión del derecho a la Patente otorgado por los Inventores al solicitante, debidamente apostillado.
2. Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA, junto con su correspondiente traducción al castellano.
3. Extracto para publicación y Tarjeta de Archivo Temático.

De la señora jefe atentamente,



RAMIRO CASTRO DUQUE
C.C. No. 170.322 de Bogotá
Código 340
Cra 7 No. 16-56 Piso 9

Bogotá, Octubre 30, 2003
CHP/MEV/hsr.

(FORMA PI - 1B)

EXTRACTO

21 03 018.834

22 05-03-2003

31 0021831.3

32 06-09-2000

33 GB

51

74 RAMIRO CASTRO DUQUE

72 JULIE B. BARTLETT, SUE FREEMAN, PETER KENNY,
ANDREW MORLEY, PAUL WHITAMORE

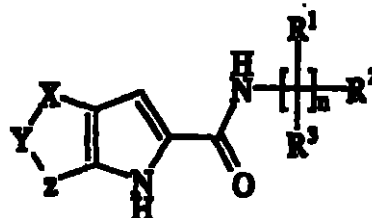
86 PCT/SE01/01880

Dibujo Característico
se puede pegar aquí
6 cms. x 6 cms.

Titulo No.

Fecha

177 Un compuesto de fórmula (I):



en donde:

-X-Y-Z- se selecciona de -S-CR⁴=CR⁴-, -CR⁴=CR⁴-S-,
-O-CR⁴=CR⁴-, -CR⁴=CR⁴-O-, -N-CR⁴-S-, -S-CR⁴-N-,
-NR⁶-CR⁴=CR⁴- y -CR⁴=CR⁴-NR⁶;

Continúa al respaldo

71 ASTRAZENECA AB, SODERTALJE, SUECIA

TITULO PIRROLILAMIDAS BICICLICAS COMO INHIBIDORES DE GLUCOGENO FOSFORILASA

CORTAR POR AQUI

R¹ se selecciona de hidrógeno halo, nitro, ciano, hidroxil, amino, carboxi, carbamilo, mercapto, sulfamilo, ureido, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₁₋₆alcóxi, C₁₋₆alcenilo, C₁₋₆alceniloí, N-(C₁₋₆alquil)amino, N,N-(C₁₋₆alquil)₂amino, C₁₋₆alcenilamino, N-(C₁₋₆alquil)carbamilo, N,N-(C₁₋₆alquil)₂carbamilo, C₁₋₆alquilS(O)_n en donde a es 0 a 2, C₁₋₆alcóxicarbonilo, C₁₋₆alcóxicarbonilamino, N-(C₁₋₆alquil)sulfamilo, N,N-(C₁₋₆alquil)sulfamilo, C₁₋₆alquilsulfonilamino, C₁₋₆alquilsulfonil-N-(C₁₋₆alquil)amino, C₃₋₆cicloalquilo, C₃₋₆cicloalquilC₁₋₆alquilo, arilo, arilC₁₋₆alquilo, grupo heterocíclico y (grupo heterocíclico)C₁₋₆alquilo; en donde R¹ pueden sustituirse opcionalmente por uno o más grupos seleccionados de P y en donde el dicho grupo heterocíclico contiene una mitad -NH- ese nitrógeno puede sustituirse opcionalmente por un grupo seleccionado de R;

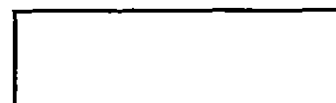
R² se selecciona de hidrógeno halo, nitro, ciano, hidroxil, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, trifluorometiloí, amino, carboxi, carbamilo, mercapto, sulfamilo, ureido, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alquenilo, C₂₋₆alquinilo, C₁₋₆alcóxi, C₁₋₆alcenilo, C₁₋₆alceniloí, N-(C₁₋₆alquil)amino, N,N-(C₁₋₆alquil)₂amino, C₁₋₆alcenilamino, N-(C₁₋₆alquil)carbamilo, N,N-(C₁₋₆alquil)₂carbamilo, N-(C₁₋₆alquil)-N-(C₁₋₆alcóxi)carbamilo, C₁₋₆alquilS(O)_n en donde a es 0 a 2, C₁₋₆alcóxicarbonilo, C₁₋

alcóxicarbonilamino, N-(C₁₋₆alquil)sulfamilo, N,N-(C₁₋₆alquil)₂sulfamilo, sulfamiloamino, N-(C₁₋₆alquil)sulfamiloamino, N,N-(C₁₋₆alquil)₂sulfamiloamino, C₁₋₆alquilsulfonilamino, C₁₋₆alquilsulfonilaminocarbonilo, C₁₋₆alquilsulfonil-N-(C₁₋₆alquil)amino y un grupo -E-F-G-H; R³ es hidrógeno o C₁₋₆alquilo;

n se selecciona de 0-4; en donde los valores de R¹ pueden ser los mismos o diferentes; y en donde los valores de R³ pueden ser los mismos o diferentes; o su sal de aceptación farmacéutica o éster hidrolizable *in vivo*; con condiciones.

269

**EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION
Entrada en Fase Nacional**



DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD: 03 018.834

(86) No. SOLICITUD INTERNACIONAL

PCT/SE01/01880

(22) FECHA DE
PRESENTACION: 05-03-2003

(51) INT. CL.:

(71) SOLICITANTE:
ASTRAZENCA AB

(30) PRIORIDAD:

(31) No. DE SOLICITUD: 0021831.3

(72) INVENTOR/ES: Julie B. Bartlett, Sue Freeman, Peter
Kenny, Andrew Morley, Paul Whittamore

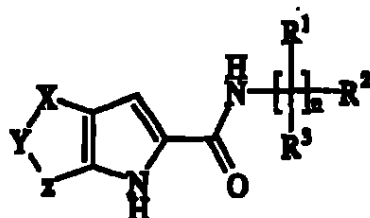
(32) FECHA DE
PRESENTACION: 06-09-2000

(21) (33) PAIS: GB

(74) APODERADO: RAMIRO CASTRO DUQUE

(54) TITULO: PIRROLILAMIDAS BICICLICAS COMO INHIBIDORES DE GLUCÓGENO FOSFORILASA

(57) RESUMEN: g) Un compuesto de fórmula (I):



en donde:

-X-Y-Z- se selecciona de -S-CR⁴=CR⁵-, -CR⁴=CR⁵-S-, -O-CR⁴=CR⁵-, -CR⁴=CR⁵-O-, -N=CR⁴-S-, -S-CR⁴=N-, -NR⁶-CR⁴=CR⁵- y -CR⁴=CR⁵-NR⁶;

R¹ se selecciona de hidrógeno halo, nitró, ciano, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamilo, mercapto, sulfamilo, ureido, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alqueno, C₂₋₆alquino, C₁₋₆alcóxido, C₁₋₆alcanólo, C₁₋₆alcanolóxido, N-(C₁₋₆alquilo)amino, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂amino, C₁₋₆alcanolamino, N-(C₁₋₆alquilo)carbamilo, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂carbamilo, C₁₋₆alquiloS(O)_a en donde a es 0 a 2, C₁₋₆alcóxicarbonilo, C₁₋₆alcóxicarbonilamino, N-(C₁₋₆alquilo)sulfamilo, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂sulfamilo, C₁₋₆alquilsulfonilamino, C₁₋₆alquilsulfonil-N-(C₁₋₆alquilo)amino, C₃₋₆cicloalquilo, C₃₋₆cicloalquiloC₁₋₆alquilo, arilo, arilC₁₋₆alquilo, grupo heterocíclico y (grupo heterocíclico)C₁₋₆alquilo; en donde R¹ pueden sustituirse opcionalmente por uno o más grupos seleccionados de P y en donde el dicho grupo heterocíclico contiene una mitad -NH- ese nitrógeno puede sustituirse opcionalmente por un grupo seleccionado de R;

R² se selecciona de hidrógeno halo, nitró, cloro, hidroxilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, trifluorometoxi, amino, carboxilo, carbamilo, mercapto, sulfamilo, ureido, C₁₋₆alquilo, C₂₋₆alqueno, C₂₋₆alquino, C₁₋₆alcóxido, C₁₋₆alcanólo, C₁₋₆alcanolóxido, N-(C₁₋₆alquilo)amino, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂amino, C₁₋₆alcanolamino, N-(C₁₋₆alquilo)carbamilo, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂carbamilo, N-(C₁₋₆alquilo)-N-(C₁₋₆alcóxido)carbamilo, C₁₋₆alquiloS(O)_a en donde a es 0 a 2, C₁₋₆alcóxicarbonilo, C₁₋₆alcóxicarbonilamino, N-(C₁₋₆alquilo)sulfamilo, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂sulfamilo, sulfamollamino, N-(C₁₋₆alquilo)sulfamollamino, N,N-(C₁₋₆alquilo)₂sulfamollamino, C₁₋₆alquilsulfonilamino, C₁₋₆alquilsulfonilaminocarbonilo, C₁₋₆alquilsulfonil-N-(C₁₋₆alquilo)amino y un grupo -E-F-G-H;

R³ es hidrógeno o C₁₋₆alquilo;

n se selecciona de 0-4; en donde los valores de R¹ pueden ser los mismos o diferentes; y en donde los valores de R³ pueden ser los mismos o diferentes;

o su sal de aceptación farmacéutica o éster hidrolizable *in vivo*; con condiciones.

**D CUMENT F ASSIGNMENT F
PATENT APPLICATI N**

ASSIGNMENT

The Undersigned Julie B BARTLETT; Sue
FREEMAN; Peter KENNY; Andrew
MORLEY; Paul WHITTAMORE

acting as Inventors

of the invention entitled "BICYCLIC
PYRROLYL AS GLUCOSEN
PHOSPHORYLASE INHIBITORS"

with domicile in AstraZeneca R&D
Alderley, Mereside, Alderley Park,
Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Untied
Kingdom

hereby declares that it assigns all rights of
ownership as well as all rights and
privileges relating thereto without
exception over the following patent
application in Colombia:

Application No. 03 018 834

To AstraZeneca AB

domiciled in SE-151 85 Södertälje, Sweden

The assignor and the assignee sign this
document as proof of their acceptance of
the assignment.

Given and signed on the 8th day of ~~July~~
of 2003

Signature of Assignor

Julie B BARTLETT Julie B Bartlett

Sue FREEMAN Sue Freeman

Peter KENNY Peter Kenny

Andrew MORLEY Andrew Morley

Paul WHITTAMORE Paul Whittamore

Signature of Assignee

Kevin BILL Kevin Bill

AUTHORISED OFFICER - ASTRAZENECA
AB

**DOCUMENT DE TRASPASO DE
S LICITUD DE PATENTE**

CESI N

El(los) Suscrito(s) Julie B BARTLETT; Sue
FREEMAN; Peter KENNY; Andrew
MORLEY; Paul WHITTAMORE

en calidad de Inventores

de la invención titulada "PIRROLILAMIDAS
BICICLICAS COMO INHIBIDOTES DE
GLUCOGENO FOSFORILASA

con domicilio en AstraZeneca R&D
Alderley, Mereside, Alderley Park,
Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Untied
Kingdom

declaran por el presente documento que
cede todos los derechos de propiedad que
le correspondan, así como las
prerrogativas, sin excepción alguna, sobre
la siguiente solicitud de patente en
Colombia:

Sol.No.03 018 834

A AstraZeneca AB

domiciliada en SE-151 85 Södertälje,
Sweden

El cedente y el cesionario firman este
documento como prueba de su aceptación
de la cesión.

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

1. Country: United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays: Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

This public document / Le présent acte public

2. Has been signed by **J B Hodgson**
a été signé par
3. Acting in the capacity of **Notary Public**
agissant en qualité de
4. Bears the seal/stamp of **The Said Notary Public**
est revêtu du sceau/timbre de

Certified/Attesté

5. at London/à Londres

6. the/le **15 October 2003**

7. by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal de Sa Majesté aux Affaires Etrangères et du Commonwealth.

8. Number/sous No **G268633**

9. Stamp:
timbre:

10. Signature: **J. Ireland**



For the Secretary of State / Pour le Secrétaire d'Etat

If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961,
it should be presented to the consular section of the mission representing that country.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

231
272

On this 8th day of October of 2003 personally appeared before me KEVIN BILL

to me known, and known to me to be the person who signed the foregoing instrument who being by me duly sworn did depose and say that he (she) is the

AUTHORISED OFFICER OF ASTRAZENECA AB of

ASTRAZENECA AB

Which is legally constituted for a term not yet expired, that deponent is authorized by said Company to confer this Assignment document: that the seal affixed hereunto by the deponent in the name and on behalf of said Corporation is the corporate seal thereof; and that the purpose for which this instrument is granted is included within the corporate purpose of company.

The undersigned Notary Public attests that he has seen the documents that prove the existence of the company.

State of under date of

and that he (she) who grants the present Assignment document is its Representative.

Notary Public (Seal)

Hoy de de personalmente compareció ante mí

a quien conozco, y de quien me consta que firmó el anterior documento, debidamente juramentado declaró y dijo que él es

de

Sociedad legalmente constituida para un período de duración que aún no ha terminado; que el declarante está autorizado por dicha compañía para conferir este documento de Cesión; que el sello estampado por él al pie de tal Cesión, en nombre y representación de la expresada compañía, es el sello oficial de ella; y que el objeto para el cual se confiere este instrumento está comprendido dentro del de la sociedad.

El suscrito Notario hace constar que tuvo a la vista las pruebas de la existencia de la sociedad.

Estado de con fecha

y que quien confiere el presente documento de Cesión es su representante.

Notario Público (sello)

NOTARIAL CERTIFICATE
NATURAL PERSON

CERTIFICADO NOTARIAL
PERSONA NATURAL

On this 8th day of October 2003 personally appeared before me Julie B. Baggett of Paul Whittamony & Ken... who is(are) known to me and who I attest executed the foregoing document and he (they) declared he (they) grant(s) the document for the uses and purposes therein expressed.

Notary Public (Seal)

Hoy de de compareció(eron) ante mí

a quien (es) conozco y me consta que es(son) la(s) persona(s) firmante(s) del documento que precede y quien(es) declara(n) que otorgan el mismo para los fines y propósitos que en él se expresan.

Notario Público (sello)

PCT

273

272

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 100168-1 WO		FOR FURTHER ACTION	See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA416)
International application No. PCT/SE01/01680	International filing date (day/month/year) 31/08/2001	Priority date (day/month/year) 06/08/2000	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D485/04			
Applicant ASTRAZENECA AB et al.			
1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet. ☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e. sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 907 of the Administrative Instructions under the PCT). These annexes consist of a total of sheets.			
3. This report contains indications relating to the following items: - I ☒ Basis of the report - II ☐ Priority - III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability - IV ☐ Lack of unity of invention - V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement - VI ☐ Certain documents cited - VII ☐ Certain defects in the international application - VIII ☐ Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 15/03/2002		Date of completion of this report 07.06.2002	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80286 Munich Tel: +49 89 2369 - 0 Tx: 523655 opmu d Fax: +49 89 2369 - 4465		Authorized officer Friebe, F Telephone No. +49 89 2369 8552 	

Form PCT/IPEA406 (cover sheet) (January 1994)

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/SE01/01880

1. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rules 70.16 and 70.17):*)

Description, pages:

1-119 as originally filed

Claims, No.:

1-9 as originally filed

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language: , which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of the international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages:
- ☐ the claims, Nos.:
- ☐ the drawings, sheets:

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed (Rule 70.2(o)):

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/SE01/01880

(Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.)

6. Additional observations, if necessary:

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non-obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

- ☐ the entire international application.
- ☒ claims Nos. 8.

because:

- ☒ the said international application, or the said claims Nos. 8 - IA relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (specify):
see separate sheet
- ☐ the description, claims or drawings (indicate particular elements below) or said claims Nos. are so unclear that no meaningful opinion could be formed (specify):
- ☐ the claims, or said claims Nos. are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.
- ☐ no international search report has been established for the said claims Nos. . . .

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

- ☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.
- ☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims 1-9
	No: Claims
Inventive step (IS)	Yes: Claims 1-9
	No: Claims
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims 1-7,9

276

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. PCT/SE01/01880

No: Claims

2. Citations and explanations
see separate sheet

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET**

International application No. PCT/SE01/01880

point III:

Claim 8 relates to subject-matter considered by this Authority to be covered by the provisions of Rule 67.1(iv) PCT. Consequently, no opinion will be formulated with respect to the industrial applicability of the subject-matter of this claim (Article 34(4)(a)(i) PCT).

point V:

The instant application claims bicyclo pyrrolyl amides which possess glycogen phosphorylase inhibitory activity and may be used in particular for the treatment of type 2 diabetes.

The characteristic structural feature of the compounds claimed is a pyrrolo-2-carboxamide core structure annelated with a heterocyclic 5-ring denoted in the generic formula (I) by the -X-Y-Z- substructure. The moiety attached to the amide nitrogen is defined very broad and preferably contains a cyclo moiety $\Rightarrow$ the definition of $R^2 = E-F-G-H$ and the specific meaning of H.

Compounds showing a combination of such structural features are already known from the prior art, however, in connection with a different indication; see for instance the document ES 2081747 briefly referred to on page 2 of the description. The compounds disclosed therein are said to be useful in the treatment of gastric secretion disorders.

Known compounds are excluded via various provisos at the end of Claim 1. Novelty is therefore acknowledged; Art.33(2) PCT.

As concerns inventive step reference is made to the documents WO 9639384 and EP 846464 which relate to the same field; viz. glycogen phosphorylase inhibition. The compounds disclosed therein are also bicyclo carboxamides however based on a 2-carboxy indole core structure in contrast to the annelated pyrroles according to the instant application. As there is no hint in the prior art which would motivate the art skilled person when looking for new phosphorylase inhibitors to replace the benzene part of the prior art indoles by a heterocyclic 5-ring substructure, inventive step is also acknowledged; Art.33(3) PCT.

For the assessment of the present claim 8 on the question whether it is industrially

INTERNATIONAL PRELIMINARY

International application No. PCT/SE01/01880

EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET

applicable, no unified criteria exist in the PCT Contracting States. The patentability can also be dependent upon the formulation of the claims. The EPO, for example, does not recognize as industrially applicable the subject-matter of claims to the use of a compound in medical treatment, but may allow, however, claims to a known compound for first use in medical treatment and the use of such a compound for the manufacture of a medicament for a new medical treatment.

As concerns the document EP 1088824 the IPEA assumes that the present application is entitled to the priority date claimed.

TRATADO SOBRE COOPERACIÓN INTERNACIONAL
EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(Artículo 36 y Regla 70 PCT)

288
289

No. de Expediente del Solicitante o Apoderado 100166-1 WO	PROCEDIMIENTO POSTERIOR véase comunicación sobre el envío del Informe de examen preliminar internacional (Formulario PCT/IPEA/416)	
No. de Expediente Internacional PCT/SE01/01880	Fecha Internacional de Presentación (día/mes/año) 31/08/2001	Fecha de Prioridad (día/mes/año) 06/09/2000
Clasificación Internacional de Patente (IPC) o Clasificación Nacional e IPC C07D495/04		
Solicitante ASTRAZENECA AB et al.		

1. Este informe de examen preliminar internacional fue elaborado por la Oficina Encargada del Examen Preliminar Internacional y se envía al solicitante según Artículo 36.

2. Este INFORME comprende un total de 6 hojas, inclusive esta portada

☐ Además se adjuntan ANEXOS al Informe; en este caso se trata de hojas con descripciones, reivindicaciones y/o dibujos, que se modificaron y que sirven de base a este Informe, y/o hojas con correcciones efectuadas por esta oficina (véase Regla 70.16 y Sección 607 de las Instrucciones administrativas al PCT).

Estos anexos comprenden en total de hojas.

3. Este informe contiene datos con respecto a los siguientes puntos:

I ☒ Base del Informe

II ☐ Prioridad

III ☒ Sin elaboración de un dictamen sobre novedad, actividad inventiva y posibilidad de aplicación industrial

IV ☐ Uniformidad deficiente de la invención

V ☒ Declaración justificada según Artículo 35(2) con respecto a la novedad, la actividad inventiva y la posibilidad de aplicación industrial; documentos y explicaciones que sustentan esta declaración

VI ☐ Ciertos documentos enumerados

VII ☐ Ciertas deficiencias del registro internacional

VIII ☐ Ciertas observaciones relacionadas con la solicitud internacional

Fecha de presentación de la petición 15/03/2002	Fecha de la conclusión de este informe 07.06.2002
Nombre y dirección postal de la Oficina Encargada del Examen Preliminar Internacional(IPEA)  Oficina Europea de Patentes D-80298 Munich Tel.: +49 89 2399 - 0 Tx.: 523856 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Empleado Autorizado Friebe, F  Teléfono No. +49 89 2399 8552

**INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL**

Solicitud Internacional No. PCT/SE01/01880

I. Base del Informe

1. Con respecto a los elementos de la solicitud internacional (*hojas intercambiables que se han suministrado a la oficina receptora en respuesta a una invitación bajo Artículo 14 se tienen en este informe por "presentadas originalmente" y no se anexan a este informe puesto que no contienen correcciones (Reglas 70.16 y 70.17)*):

Descripción, páginas:

1-119 versión original

Reivindicaciones, No.:

1-9 versión original

2. En lo concerniente al idioma: Todos los elementos indicados más arriba estuvieron a disposición de la oficina o le fueron enviados en el idioma en el cual se radicó la solicitud internacional, salvo indicación en contrario consignada bajo este punto.

Estos elementos estuvieron a disposición de esta oficina o le fueron enviados en el idioma siguiente: en este caso se trata de:

- ☐ el idioma de la traducción enviada para efectos de la búsqueda internacional (según la regla 23.1 (b)).
☐ el idioma de publicación de la solicitud internacional (según la regla 48.3 (b)).
☐ el idioma de la traducción enviada para los efectos del examen preliminar internacional (según la regla 55.2 y/o 55.3).

3. En lo que concierne a la secuencia de nucleótidos y/o aminoácidos, divulgada en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional se llevó a cabo sobre la base del listado de secuencias:

- ☐ contenido en la solicitud internacional, por escrito.
☐ Presentado con la solicitud internacional, en formato de lectura por computador.
☐ remitido posteriormente a la oficina, por escrito.
☐ remitido posteriormente a la oficina, en formato de lectura por computador.
☐ se ha rendido la declaración, según la cual el listado de secuencias por escrito y suministrado posteriormente no va más allá de la divulgación hecha en la solicitud en el momento en que se radicó.
☐ se ha rendido la declaración, según la cual las informaciones registradas en formato de lectura por computador corresponden al listado de secuencias, presentados por escrito.

4. Las modificaciones han acarreado la anulación:

- ☐ de la descripción, páginas:
☐ de las reivindicaciones, Nos.:
☐ de los dibujos, hojas:

5. ☐ El presente informe se preparó sin tener en cuenta (algunas de) las modificaciones, ya que éstas, por las razones aducidas, en concepto de la oficina van más allá del contenido de divulgación en la versión presentada originalmente (Regla 70.2 (c))

**INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL**

Solicitud Internacional No. PCT/SE01/01880

281 280

(Hojas intercambiables que incluyan modificaciones de esta índole deben indicarse en el punto 1 y anexarse al presente informe.)

6. Observaciones adicionales, si son necesarias:

III. Sin elaboración de un dictamen sobre novedad, actividad inventiva y posibilidad de aplicación industrial

1. Los interrogantes en cuanto a si la invención reivindicada parece ser novedosa, implicar una actividad inventiva (no ser obvia), o tener posibilidad de aplicación industrial no se han examinado con respecto a:

- ☐ la solicitud internacional en su totalidad,
☒ reivindicaciones, Nos. 8

porque:

- ☒ la aplicación internacional citada, o las reivindicaciones citadas Nos. 8 - IA se refieren al asunto en cuestión que no requieren un examen preliminar internacional (*especificar*):
véase hoja separada
- ☐ la descripción, reivindicaciones o dibujos (*indicar elementos particulares más adelante*) o las reivindicaciones citadas Nos. son tan ambiguas que no pudo formarse un concepto significativo (*especificar*):
- ☐ las reivindicaciones, o las reivindicaciones citadas Nos. están tan inadecuadamente fundamentadas por la descripción que no pudo formarse un concepto significativo.
- ☐ no se ha establecido un reporte de búsqueda internacional par alas citadas reivindicaciones Nos. .
2. No puede llevarse a cabo un examen preliminar internacional significativo debido a que el listado de secuencia de aminoácidos y/o nucleótidos no cumple la norma contemplada en Anexo C de las Instrucciones Administrativas:
- ☐ la forma escrita no se ha suministrado o no cumple la norma.
- ☐ el formato de lectura en computador no se ha suministrado o no cumple la norma.

V. Declaración motivada bajo Artículo 35(2) en cuanto a la novedad, la actividad inventiva y la posibilidad de aplicación industrial; documentos y explicaciones que sustentan esta declaración

1. DECLARACIÓN

Novedad (N)	Si: Reivindicaciones 1-9 No: Reivindicaciones
Actividad Inventiva (IS)	Si: Reivindicaciones 1-9 No: Reivindicaciones
Posibilidad de Aplicación Industrial (IA)	Si: Reivindicaciones 1-7, 9

**INF RME DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL**

Solicitud Internacional No. PCT/SE01/01880

No: Reivindicaciones

2. Documentos y explicaciones
Véase hoja separada

punto III:

Reivindicación 8 se refiere al objeto que esta Oficina considera que está cubierto por las disposiciones de la Regla 67.1(iv) PCT. Por consiguiente, no se formulará concepto con respecto a la posibilidad de aplicación industrial del objeto de esta reivindicación (Artículo 34(4)(a)(i) PCT).

punto V:

La presente solicitud reivindica pirroliil amidas bicíclicas que poseen actividad inhibidora de glucógeno fosforilasa y pueden usarse en particular para el tratamiento de diabetes tipo 2.

El rasgo estructural característico de los compuestos reivindicados es una estructura central pirrolo-2-carboxamida anillada con un anillo 5 heterocíclico denotada en la fórmula general (I) por la subestructura. La fracción unida a la amida nitrogenada se define en forma muy amplia y preferiblemente contiene una fracción cíclica $\rightarrow$ la definición de $R^2 = E-F-G-H$ y el significado específico de H.

Compuestos que muestran una combinación de tales rasgos estructurales son ya conocidos del arte previos, no obstante, en conexión con una indicación diferente; véase por ejemplo el documento ES 2081747 brevemente mencionado en página 2 de la descripción. Se afirma que los compuestos divulgados allí son útiles en el tratamiento de trastornos de secreción gástrica.

Compuestos conocidos se excluyen mediante diferentes salvedades al final de Reivindicación 1. Por consiguiente se reconoce la novedad; Art.33(2) PCT.

En lo que respecta a la actividad inventiva, se hace referencia a los documentos WO 9639384 y EP 846464 que se relacionan con el mismo campo; a saber, inhibición de glucógeno fosforilasa. Los compuestos divulgados allí son también carboxamidas bicíclicas basadas sin embargo en una estructura central 2-carboxi indol en contraste con los pirroles anillados de acuerdo con la presente solicitud. Puesto que no existe indicación en el arte previo que motive a la persona experta en el arte cuando busque nuevos inhibidores de fosforilasa para sustituir la parte benceno de los indoles del arte previo por una subestructura de anillo 5 heterocíclico, se reconoce igualmente actividad inventiva; Art.33(3) PCT.

Para la evaluación de la presente reivindicación 8 acerca de la cuestión

**INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL – HOJA SEPARADA**

Solicitud Internacional No. PCT/SE01/01880

283
284
1.1

de si es aplicable industrialmente, no existen criterios unificados en los países firmantes del PCT. La patentabilidad puede depender igualmente de la formulación de las reivindicaciones. La Organización Europea de Patentes (EPO), por ejemplo, no reconoce como industrialmente aplicable el objeto de reivindicaciones para uso de un compuesto en tratamiento médico, pero puede admitir, sin embargo, reivindicaciones para un compuesto conocido para primer uso en tratamiento médico y el uso de dicho compuesto para la manufactura de un medicamento para un tratamiento médico nuevo.

En lo que concierne al documento EP 1088824 la IPEA asume que la presente solicitud tiene derecho a la fecha de prioridad reclamada.



**2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION
SOLICITUD PCT**

Folio 284

Radicación no 03-018834

Concepto Técnico no 972

Clasificación Internacional de Patentes: A61K 31/407

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI ☒ NO ☐ Contiene un resumen de la invención (Art.26-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la Invención (Art.27-d).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción de la invención (Art.26-b).
- SI ☒ NO ☐ NO ES APLICABLE ☐ Contiene los dibujos necesarios para comprender la Invención (Art.26-d)
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afro americanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-l).
- SI ☐ NO ☒ La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-J).
- SI ☐ NO ☐ NO ES APLICABLE ☒ La prioridad coincide con la materia reivindicada.
- SI ☒ NO ☐ CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

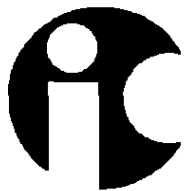
OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Cesión del Inventor en folios 270-271

Traducción de anexos del examen preliminar en folios 278-283

EXAMINADOR TÉCNICO
202052

Bogotá D. C., diciembre 22 de 2003.



2020
Bogotá DC

Doctor(a)
RAMIRO CASTRO DUQUE
Apoderado(a)
ASTROZENECA AB.

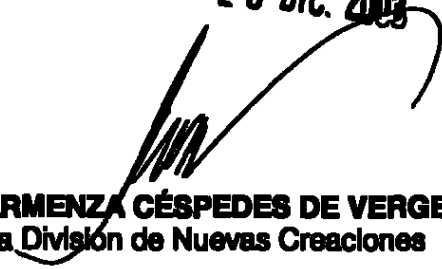
REFERENCIA:	Radicación No.	03-018834
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	1512
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase

Dado en Bogotá DC,

26 DIC. 2003


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

202052