

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

— SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Radicacion : 04050432 00000005

Folios: 13

Fecha (AMB): 2005-04-15 15:51:20

Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLEMEN

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: P1.-WYETH.-Solicitud de Patente de Invención Fase Nacional PCT para "INHIBIDORES DE FOSFOLIPASA A₂ CITOSOLICA".-Clase C07D 209/00.-Expediente número 04-050.432.-

1. Me refiero a mi memorial presentado el 25 de Noviembre de 2004.
2. Anexo me permito presentar a usted documento completo del Reporte de Examen Preliminar Internacional, expedido el 29 de Enero de 2004, correspondiente a la solicitud Internacional número PCT/US02/38311, actualmente en trámite de Fase Nacional en ese Despacho, bajo el número de la referencia.
3. Ruego a usted tomar atenta nota de lo anterior y proceder de conformidad.

Señor Superintendente,



ALICIA LLOREDA RICAURTE

T.P. 53.215

705

TRATADO DE COOPERACION DE PATENTES
PCT
REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

(PCT Artículo 36 y Regla 70)

Registro de referencia del solicitante o agente AM100831	PARA FUTURAS ACCIONES Ver Notificación de Transmisión del Reporte de Examen Preliminar Internacional (Forma PCT/IPEA/416)	
Solicitud internacional No. PCT/US 02/38311	Fecha de registro internacional (día/mes/año) 02.12.2002	Fecha de prioridad (día/mes/año) 03.12.2001
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC C07D209/14		
Solicitante WYETH		

1. Este reporte de examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Autoridad Examinadora Preliminar Internacional y se transmite al solicitante de conformidad con el Artículo 36. 2. Este REPORTE consta de un total de <u>6</u> hojas, incluyendo esta carátula. ☐ Este reporte también está acompañado de ANEXOS, es decir, hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos los cuales han sido modificados y son la base para este reporte y/o hojas que contienen rectificaciones hechas ante esta Autoridad (ver Regla 70.16 y la Sección 607 de las Instrucciones Administrativas de conformidad con el PCT). Estos anexos constan de un total de hojas.	
3. Este reporte contiene indicaciones relacionadas con los siguientes ítems: I ☒ Bases del reporte II ☐ Prioridad III ☒ No establecimiento de opinión respecto a novedad, nivel inventivo y aplicabilidad industrial IV ☐ Falta de unidad de invención V ☒ Afirmación razonada según Regla 66.2(a)(ii) con respecto a novedad, nivel inventivo o aplicabilidad industrial; citas y explicaciones que sustentan dicha afirmación VI ☐ Ciertos documentos citados VII ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional VIII ☐ Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional	
Fecha de presentación de la demanda 24.06.2003	Fecha de terminación de este reporte 29.01.2004
Nombre y dirección de correo de la autoridad de examen preliminar internacional: Oficina de Patentes Europea D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Funcionario autorizado Bérillon, L Teléfono No. +49 89 2399-7076

I. Bases del reporte

1. Respecto a los elementos de la solicitud internacional: (Hojas de remplazo las cuales han sido suministradas a la Oficina receptora en respuesta a una invitación bajo el Artículo 14 están referenciados en este reporte como "presentados originalmente" y no están anexos a este reporte dado que no contienen modificaciones (Reglas 70.16 y 70.17)):

Descripción, Páginas

1-240 como se presentaron originalmente

Reivindicaciones, Números

1-46 como se presentaron originalmente

2. Respecto al idioma, todos los elementos marcados anteriormente estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el idioma en el cual la solicitud internacional fue presentada, a menos que se indique lo contrario bajo este ítem.

Estos elementos estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta Autoridad en el idioma: , el cual es:

- ☐ el idioma de una traducción suministrada para una búsqueda internacional (según la Regla 23.1 (b)).
- ☐ el idioma de una publicación de la solicitud internacional (según la Regla 48.3 (b)).
- ☐ el idioma de la traducción suministrada para el examen preliminar internacional (según las Reglas 55.2 y/o 55.3).

3. Respecto al nucleótido y/o secuencia amino ácida revelado en la solicitud internacional, se llevó a cabo el examen preliminar internacional según el listado de secuencia:

- ☐ contenido en la solicitud internacional en forma escrita.
- ☐ registrado junto con la solicitud internacional en forma legible por computador.
- ☐ proporcionado subsiguientemente a esta Autoridad en forma escrita.
- ☐ proporcionado subsiguientemente a esta Autoridad en forma legible por computador.
- ☐ Se ha proporcionado la afirmación respecto a la cual el listado de secuencia escrito proporcionado subsiguientemente no va más allá de la revelación en la solicitud internacional según se presentó.
- ☐ Se ha proporcionado la afirmación respecto a la cual la información presentada en forma legible por computador es idéntica al listado de secuencia escrita.

4. Las modificaciones han resultado en la cancelación de:

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

5. ☐ Este reporte ha sido establecido como si (algunas de) las modificaciones no se hubiesen hecho, ya que se ha considerado que van más allá de la revelación según se presentó, como se indicó en Casilla Suplementaria (Regla 70.2 (c)).

(Cualquier hoja de remplazo que contenga tales modificaciones debe ser referida bajo el ítem 1 y anexada a este reporte).

6. Observaciones adicionales, si son necesarias:

III. No establecimiento de opinión respecto a la novedad, nivel inventivo y aplicabilidad industrial

1. Las preguntas como quiera que la invención reivindicada parezca ser novedosa, involucrar un nivel inventivo (para no ser obvio), o para ser aplicable industrialmente no se han examinado en relación con:

☐ toda la solicitud internacional,

☒ las reivindicaciones Nos. 31-37
porque:

☒ dicha solicitud internacional, o dichas reivindicaciones Nos. 31-37 se relacionan con la siguiente materia objeto la cual no requiere examen preliminar internacional (*especificar*):

ver hoja separada

☐ la descripción, reivindicaciones o dibujos (*indican elementos particulares a continuación*) o dichas reivindicaciones Nos. son tan imprecisas que no pudo formarse una opinión significativa (*especifique*):

☐ las reivindicaciones o dichas reivindicaciones Nos. están sustentadas tan inadecuadamente por la descripción que no pudo formarse una opinión significativa.

☐ no se ha establecido un reporte de búsqueda internacional para dichas reivindicaciones Nos.

2. Un examen preliminar internacional significativo no puede llevarse a cabo debido a la falla del nucleótido y/o listado de secuencia amino ácida para cumplir con el estándar preparado en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas:

☐ el formulario escrito no ha sido proporcionado o no cumple con el Estándar.

☐ la forma legible por computador no ha sido proporcionado o no cumple con el Estándar.

V. Afirmación razonada bajo el Artículo 35(2) respecto a novedad, nivel inventivo o aplicabilidad industrial; citas y explicaciones que sustentan dicha afirmación

1. Afirmación

Novedad (N)	Si:	Reivindicaciones 1-37
	No:	Reivindicaciones
Nivel Inventivo (IS)	Si:	Reivindicaciones
	No:	Reivindicaciones 1-37
Aplicabilidad Industrial (IA)	Si:	Reivindicaciones 1-30, 38-45
	No:	Reivindicaciones

2. Citaciones y explicaciones

ver hoja separada

Item III

Las reivindicaciones 31-37 se relacionan con la materia objeto que esta Autoridad considera que está cubierta por las disposiciones de la Regla 67.1(iv) PCT. Por consiguiente, no se formulará ninguna opinión respecto de la aplicabilidad industrial de la materia objeto de estas reivindicaciones (Artículo 34(4)(a)(i) PCT).

Item V**1. Técnica anterior**

Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1: WO 99 43651

D2: WO 98 25893

2. Novedad (Artículo 33(2) PCT)

Parece que los compuestos presentes de fórmula (I) y los intermediarios útiles para su preparación (ver reivindicaciones 38-45) son novedosos.

Los compuestos revelados en D1 difieren de los compuestos reivindicados en que ninguna mitad del aminosulfonil está presente en el sustituyente en la posición 2 del anillo indol (ver D1, definición de R3 y R4).

Los compuestos revelados en D2 difieren de los compuestos reivindicados en vista de su mitad del arilsulfonamida.

En concordancia, se reconoce la novedad para la presente solicitud.

3. Nivel Inventivo (Artículo 33(3) PCT)**3.1. Reivindicaciones 1-37 y 46**

El problema que sustenta a las reivindicaciones 1-37 y 46 yace en la disposición de los inhibidores de fosfolipasa A2. D1 que represente la técnica anterior más cercana revela derivados de indol que igualmente tienen dicha actividad. Sin embargo, su estructura es bastante distinta de la de los compuestos reivindicados. Como se mencionó en el ítem 2, los compuestos de D1 pierden una mitad del aminosulfonil en el sustituyente en posición 2 del anillo de indol. Además, también difieren sustancialmente en vista del sustituyente en posición 3 del anillo de indol que en el caso de los compuestos presentes siempre incluye una mitad del anillo sustituido por un grupo de fórmula $-(CH_2)_m-CO_2H$. En vista de estas diferencias estructurales la persona versada no hubiese considerado los compuestos presentes como soluciones del problema técnico mencionado anteriormente. Un nivel inventivo podría ser por lo tanto en teoría reconocido por las presentes reivindicaciones 1-37 y 46. Sin embargo, se le recomienda al Solicitante que únicamente deben reivindicarse aquellos compuestos que solucionan realmente el presente problema, es decir que tienen dicha actividad. Parece que todos los compuestos ejemplificados son indoles N-benzidrilo mientras que la definición de R es extremadamente amplia. Parece que dicho sustituyente de benzidrilo es una característica esencial y por lo tanto debe incorporarse en las reivindicaciones.

3.2. Reivindicaciones 38-45

Los compuestos reivindicados en las reivindicaciones 38-45 son intermediarios utilizados para la preparación de productos finales reivindicados en las reivindicaciones 1-29. Dichos intermediarios proporcionan una contribución estructural significativa (es decir, no revelada en la técnica anterior) y por lo tanto son considerados inventivos mientras lo sean los productos finales subsiguientes (ver el ítem 3.1).

4. Claridad de las Reivindicaciones (Artículo 6 PCT)

La definición funcional "ácido mímico o mimético farmacéuticamente aceptable" que no tiene ningún significado preciso aceptado por la persona versada en la técnica debe ser eliminada o clarificada por ejemplo por restricción de los significados particulares especificados en la descripción.

5. Aplicabilidad Industrial (Artículo 33(4) PCT)

Para la evaluación de las presentes reivindicaciones 31-37 sobre la pregunta de si son aplicables industrialmente, no existen criterios unificados en los Estados Contratantes del PCT. La patentabilidad también puede depender de la formulación de las reivindicaciones. La EPO, por ejemplo, no reconoce como aplicable industrialmente la materia objeto de las reivindicaciones en cuanto al uso de un compuesto en el tratamiento médico, pero puede permitir, sin embargo, reivindicaciones de un compuesto conocido para primer uso en el tratamiento médico y el uso de dicho compuesto para la fabricación de un medicamento para un nuevo tratamiento médico.

711 P

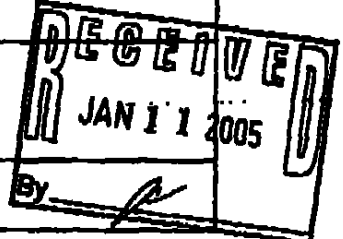
PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT
(PCT Article 36 and Rule 70)

RECEIVED 03 FEB 2004 WIPO PCT

Applicant's or agent's file reference AM100831	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/PEAS18)	
International application No. PCT/US 02/88311	International filing date (day/month/year) 02.12.2002	Priority date (day/month/year) 03.12.2001
International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC C07D209/14		
Applicant WYETH		



- This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 38.
- This REPORT consists of a total of 8 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 70.18 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
 These annexes consist of a total of _____ sheets.

EPO - DG 1

18. 03. 2004

- This report contains indications relating to the following items:
 - I ☒ Basis of the opinion
 - 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 Rule 66.2(a)(3) 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

(36)

JAN 12 2005

Date of submission of the demand 24.05.2003	Date of completion of this report 29.01.2004
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80295 Munich Tel. +49 89 2399-0 Fax +49 89 2399-4445	Authorized Officer Bérillon, L. Telephone No. +49 89 2399-7075 

Patent Law Department

CC: N1

712

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**International application No. **PCT/US 02/38311****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

1-240 as originally filed

Claims, Numbers

1-48 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)).

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

6. Additional observations, if necessary:

713

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**International application No. **PCT/US 0238311****II. 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. 31-37
because:
- ☒ the said international application, or the said claims Nos. 31-37 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	1-37
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	
	No: Claims	1-37
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-30, 38-45
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

INTERNATIONAL PRELIMINARY International application No. **PCT/US02/38311**
EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET

Item III

Claims 31-37 relate to subject-matter considered by this Authority to be covered by the provisions of Rule 57.1(iv) PCT. Consequently, no opinion will be formulated with respect to the industrial applicability of the subject-matter of these claims (Article 34(4)(a)(i) PCT).

Item V

1 Prior art

Reference is made to the following documents:

D1: WO 99 43651

D2: WO 98 25893

2 Novelty (Article 33(2) PCT)

The present compounds of formula (I) and intermediates useful for their preparation (see claims 38-45) appear to be novel.

The compounds disclosed in D1 differ from the claimed compounds in that no aminosulfonyl moiety is present in the substituent at position 2 of the indole ring (see D1, definition of R3 and R4).

The compounds disclosed in D2 differ from the claimed compounds in view of their

arylsulfonamide moiety.

Accordingly, novelty is acknowledged for the present application.

3 Inventive step (Article 33(3) PCT)

3.1 Claims 1-37 and 46

The technical problem underlying claims 1-37 and 46 lies in the provision of phospholipase A2 inhibitors. D1 which represents the closest prior art discloses indole derivatives which equally have said activity. However, their structure is quite distinct

715

INTERNATIONAL PRELIMINARY International application No. PCT/US02/38311
EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET

from those of the claimed compounds. As mentioned in item 2, the D1 compounds miss an amino sulfonyl moiety in the substituent at position 2 of the indole ring. In addition, they also differ substantially in view of the substituent at position 3 of the indole ring which in the case of the present compounds always include a ring moiety substituted by a group of formula $-(CH_2)_m-CO_2H$. In view of these structural differences the skilled person would not have considered the present compounds as solutions of the above mentioned technical problem. An inventive step could therefore be in theory acknowledged for present claims 1-37 and 46. However, the Applicant is reminded that only those compounds should be claimed which actually solve the present problem, i.e. which have said activity. It appears that all the exemplified compounds are N-benzhydryl indoles whereas the definition of R is extremely broad. Said benzhydryl substituent appears to be an essential feature and should therefore be incorporated in the claims.

3.2 Claims 38-45

The compounds claimed in claims 38-45 are intermediates used for the preparation of end products claimed in claims 1-29. Said intermediates provide a significant structural contribution (i.e. not disclosed in the prior art) and are therefore considered inventive as long as the subsequent end products are (see item 3.1).

4 Clarity of the claims (Article 6 PCT)

The functional definition "pharmaceutically acceptable acid mimic or mimetic" which does not have any precise meaning accepted by the person skilled in the art should be either removed or clarified for example by restriction to the particular meanings specified in the description.

5 Industrial applicability (Article 33(4) PCT)

For the assessment of the present claims 31-37 on the question whether they are industrially applicable, no unified criteria exist in the PCT Contracting States. The patentability can also be dependent upon the formulation of the claims. The EPO,

716

INTERNATIONAL PRELIMINARY International application No. **PCT/US02/36311**
EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET

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.

2020
Bogotá D C

Doctor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE.
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación N°	04-50432
	Solicitud internacional	PCT/US02/38311
	Fecha limite de inicio en fase nacional	03/07/2004
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio N°	916
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en el asunto, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486, de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y comercio, 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 dispone el artículo 40 de la referida Decisión 486.

Cúmplase

Dado en Bogotá D C, **30 SET. 2005**


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe División de Nuevas Creaciones.

202028

Al contestar favor indique el número de radicación consignado en el sticker

Sede Central: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Commutador: 3 820840 Fax: 3 505220
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 3153265 al 69
Fax: 3 505220. Línea 9800-010 165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. - Colombia