



No. 04-076121- -00007-0000

Fecha: 2007-11-01 15:13:46 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 2

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES
2000-10

1

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de error material

☒

Modificación a una Solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: **mitsubishi tanabe pharma corporation**

Dirección: Dosho - Mashi, 3 Chome , Chou - Ku

Teléfono: Fax:

E-Mail:

Domicilio: **Osaka , Japon**

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☒

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **Ernesto Caveller Franco**

Dirección: Carrera 9 No. 74 - 08 Of. 504

Teléfono: 3764500 Fax: 3761707

E-Mail: **Ernesto.Cavelier@prc-laws.com**

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número **19.081.620 Bogotá**
TP **11519**

4

Número de Expediente:

04.076.121

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Cambio de nombre del Solicitante, así:

De: **TANABE SEIYAKU CO., LTD.**

A: **mitsubishi tanabe pharma corporation**

6

Comprobante de Pago No.:

Fecha

...

Anexos:

☒

Comprobante de pago de la tasa.

☐

Poderes, si fuere el caso.

☐

Certificado de existencia y representación legal, si fuere el caso.

7

NOMBRE: **Ernesto Cavelier Franco**

FIRMA:

Ernesto Cavelier
C.C. **19.081.620 Bogotá TP. 11519**

150
150
2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 04-076121- -00007-0000

Fecha: 2007-11-01 15:13:46 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 89,670
FECHA : NOVIEMBRE 1 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
PARRA RODRIGUEZ & CAVELIE	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	59041021	01/11/2007	99,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12	MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	99,000.00
	TOTAL :	\$ 99,000.00

SOM: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

D1 152

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
14 August 2003 (14.08.2003)

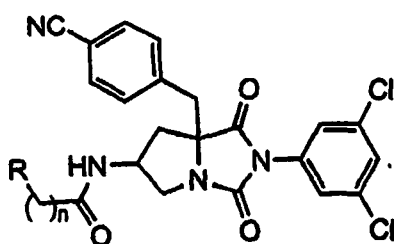
PCT

(10) International Publication Number
WO 03/066636 A1

- (51) International Patent Classification⁷: C07D 487/04, A61K 31/4188, A61P 29/00 // (C07D 487/04, 235:00, 209:00)
- (74) Agent: MURPHY, Jr., Gerald, M.; Birch, Stewart, Kolasch & Birch, LLP., P.O. Box 747, Falls Church, VA 22040-0747 (US).
- (21) International Application Number: PCT/US03/03449
- (22) International Filing Date: 6 February 2003 (06.02.2003)
- (25) Filing Language: English
- (26) Publication Language: English
- (30) Priority Data:
60/354,309 7 February 2002 (07.02.2002) US
- (81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (71) Applicant (*for all designated States except US*): TAN-ABE SEIYAKU CO., LTD. [JP/JP]; 2-10 Dosho-machi 3-chome, Chuo-ku, Osaka 541-8505 (JP).
- (72) Inventors; and
- (75) Inventors/Applicants (*for US only*): SIRCAR, Ila [US/US]; 4832 Riding Ridge Road, San Diego, CA 92130 (US). MORNINGSTAR, Marshall [US/US]; 16R Hodder Lane, Framingham, MA 01702 (US). KAKUSHIMA, Masatoshi [JP/JP]; 13-12, Shin-ishikawa 2-chome, Aoba-ku, Yokohama-shi, Kanagawa 225-0003 (JP). KAJI, Hidefumi [JP/JP]; 3-8-416, Kawagishi 2-chome, Toda-shi, Saitama 335-0015 (JP). KAWAGUCHI, Takayuki [JP/JP]; 24-5-2005, Kita-ohtsuka 2-chome, Toshima-ku, Tokyo 170-0004 (JP). KUME, Toshiyuki [JP/JP]; 1151-2, Ooaza-Nakao, Saitama-shi, Saitama 336-0932 (JP).
- Declaration under Rule 4.17:**
— of inventorship (Rule 4.17(iv)) for US only
- Published:**
— with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments
- For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.*

WO 03/066636 A1

(54) Title: INHIBITORS OF ALPHA L BETA 2 INTEGRIN MEDIATED CELL ADHESION

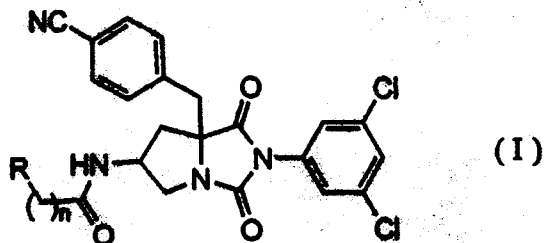


(I)

(57) Abstract: The present invention relates to a compound of formula (I): wherein R is hydrogen atom, hydroxyl group or carbamoyl group, and n is 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

Claims

1. A compound of the formula (I):



- 5 wherein R is hydrogen atom, hydroxyl group or carbamoyl group, and n is 1 or 2, or a pharmaceutically acceptable salt thereof.

2. The compound or salt according to claim 1, wherein R is hydrogen atom.

10

3. The compound or salt according to claim 1, wherein R is hydroxyl group.

4. The compound or salt according to claim 1, wherein R is carbamoyl group.

15

5. The compound or salt according to any one of claims 1-4, wherein n is 1.

6. The compound or salt according to any one of claims 1-4, wherein n is 2.

20

7. The compound or salt according to claim 1, wherein R is hydrogen atom and n is 1.

25

8. The compound or salt according to claim 1, wherein R is hydroxyl group and n is 1.

9. The compound or salt according to claim 1, wherein R is carbamoyl group and n is 2.

30

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau

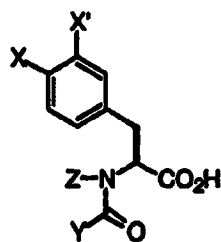


D2 154

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁶: C07C 233/87, 235/52, 237/36, 317/50, 323/39, C07D 215/50, 233/32, 295/088, 487/04, A61K 31/165, 31/33 // C07D 487:04, 239:00, 231:00		A1	(11) International Publication Number: WO 99/10312 (43) International Publication Date: 4 March 1999 (04.03.99)
(21) International Application Number: PCT/EP98/05135 (22) International Filing Date: 13 August 1998 (13.08.98) (30) Priority Data: 60/056,718 22 August 1997 (22.08.97) US (71) Applicant: F. HOFFMANN-LA ROCHE AG [CH/CH]; Gren- zacherstrasse 124, CH-4070 Basle (CH). (72) Inventors: CHEN, Li; 6 Drummond Road, Westfield, NJ 07090 (US). GUTHRIE, Robert, William; 102 Alberta Drive, Saddle Brook, NJ 07663 (US). HUANG, Tai-Nang; 67 Sherburne Road South, Lexington, MA 02173 (US). HULL, Kenneth, G.; 143 River Road, Clifton, NJ 07014 (US). SIDDURI, Achytharao; 22 Washington Court, Livingston, NJ 07039 (US). TILLEY, Jefferson, Wright; 19 Evergreen Drive, North Caldwell, NJ 07006 (US). (74) Agent: LOESCHNER, Thomas; Grenzacherstrasse 124, CH-4070 Basle (CH).		(81) Designated States: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published <i>With international search report.</i> <i>With amended claims.</i>	

(54) Title: N-ALKANOYLPHENYLALANINE DERIVATIVES



(1)

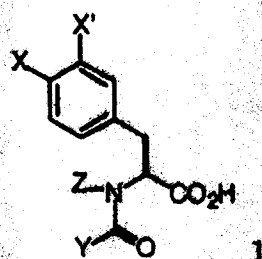
(57) Abstract

Compounds of formula (1) as well as their salts and esters are disclosed wherein X, X', Z and Y are as described in the specification and which have activity as inhibitors of binding between VCAM-1 and cells expressing VLA-4. Such compounds are useful for treating diseases whose symptoms and/or damage are related to the binding of VCAM-1 to cells expressing VLA-4.

- 118 -

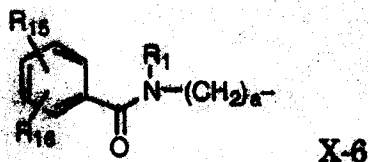
Claims

1. A compound of the formula:



5 wherein:

one of X and X' is hydrogen, halogen, or lower alkyl, the other is a group of the formula:



wherein:

10 R₁ is hydrogen or lower alkyl,

R₁₅ is halogen, nitro, lower alkyl sulfonyl, cyano, lower alkyl, OH, lower alkoxy, lower alkoxy carbonyl, carboxy, lower alkyl aminosulfonyl, perfluorolower alkyl, lower alkylthio, hydroxy lower alkyl, alkoxy lower alkyl, halo lower alkyl, alkylthio lower alkyl, alkylsulfinyl lower alkyl, alkylsulfonyl
 15 lower alkyl, lower alkylsulfinyl, lower alkanoyl, aroyl, aryloxy or a group of the formula R₁₇-C≡C-,

R₁₆ is hydrogen, halogen, nitro, cyano, lower alkyl, OH, perfluorolower alkyl, or lower alkylthio,

R₁₇ is hydrogen, aryl, heteroaryl, or lower alkyl which is unsubstituted or
 20 substituted by OH, aryl, or heteroaryl, and

a is 0 or 1;

or one of X and X' is a group of the formula:

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISI3N DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogot3, D.C., Enero 15 de 2008

Abogado
Ernesto Cavelier

ASUNTO	Radicaci3n	04-76121
	Tr3mite	002
	Evento	001
	Actuaci3n	430
	Oficio	- 3979
	Folios	008

Patente de Invenci3n	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Via Nacional	☐		
Via PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐ Cap. II
No. Sol. Internacional		<u>PCT/US03/03449</u>	
Fecha de Presentaci3n Internal.		<u>6 de Febrero de 2003</u>	

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el art3culo 45 de la Decisi3n 486 de la Comisi3n de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripci3n: Folios: 37 a 67 (como se radic3 inicialmente)
- 1.2. Reivindicaciones: Folios: 68 a 73 (como se radic3 inicialmente)
- 1.3. Prioridad: US 60/354.309 de 7 de Febrero de 2002.

2. Objeto de la invenci3n

- T3tulo de la solicitud: INHIBIDORES DE ADHESI3N CELULAR MEDIADA POR INTEGRINA $\alpha_L\beta_2$, folio 1, campo 54.
- El objeto de la presente solicitud de patente de invenci3n consiste en compuestos inhibidores de la adhesi3n celular mediada por integrina $\alpha_L\beta_2$ que podr3an ser 3tiles para para el tratamiento de condiciones inflamatorias mediadas por dicha integrina, para lo que se presentan 22 reivindicaciones as3:

Reivindicaciones 1-10: Un compuesto de la f3rmula (I).
Reivindicaciones 11-13: Proceso para preparar compuesto de f3rmula Ia, Ib y Ic.
Reivindicaci3n 14: Composiciones farmac3uticas que los contienen.
Reivindicaciones 15-22: M3todos para tratamiento

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos útiles para tratar enfermedades inflamatorias como asma , artritis reumatoide, enfermedad inflamatoria intestinal, cistitis y otros trastornos gástricos (folio 42, línea 5).

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición que contiene un derivado de campotecina, un glicérido poliglicolizado y un excipiente (lecitina, fosfolípido, aceite, PEG, mono, di ó tri glicérido).

- La invención se catalogó en la categoría C07D487/04, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

- Las reivindicaciones 15 a 22 presentan métodos de tratamiento. A la luz de la decisión 486 los métodos terapéuticos no son patentables.
- Por lo anterior las reivindicaciones 15 a 22 no pueden ser patentadas.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es la fecha de presentación de la solicitud prioritaria 7 de Febrero de 2002

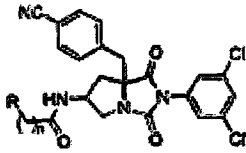
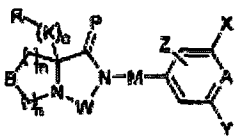
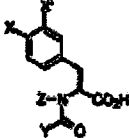
Teniendo en cuenta la fecha indicada se realizó la búsqueda en el estado de la técnica de documentos relacionados con la solicitud encontrándose los siguientes documentos más relevantes:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO0130781	INHIBITORS OF alpha L beta 2 MEDIATED CELL ADHESION	2001-05-03
D2	WO9910312	N-ALKANOYLPHENYLALANINE DERIVATIVES	1999-03-04

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

- En la primera reivindicación se presentan compuestos de fórmula (I).
- El documento del estado de la técnica más cercano es D1 ya que presenta compuestos inhibidores de la adhesión celular.

CARACTERÍSTICAS TÉCNICAS ESENCIALES		
SOLICITUD	D1	D2
Compuesto de fórmula (I)	Compuesto de fórmula (I)	Compuesto de fórmula
 (I) R es H, OH o carbamoilo N es 1 ó 2	 A es C o N X y Y son H, X , NO2 Z es H, OH, X..... M es un enlace sencillo.... W es CQ (P y Q son O ó S) m y n son = 1 B es CR1R2 (R1 y R2 son independientemente H...o NR3R6) R3 es H...aril sustituido R6 es H o K es	 (I)
o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo	o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo	o una sal o ester farmacéuticament e aceptable del mismo

- La única diferencia con D1 es que la solicitud menciona un grupo carbamoilo en la posición B del compuesto en D1. Esta no parece conceder un efecto técnico inesperado porque estos compuestos siguen siendo inhibidores de adhesión celular.
- El problema técnico planteado en esta solicitud, es decir la búsqueda de compuestos inhibidores de adhesión celular y actividad antiinflamatoria se había resuelto previamente mediante el mismo tipo de compuestos ya conocidos. Por esta razón se considera que las sustituciones en la posición B reivindicadas son evidentes para una persona medianamente versada en la materia.
- Además, puesto que tanto D1 como D2 divulgaban previamente compuestos inhibidores de adhesión celular, una persona conocedora de la materia motivada por tal sugerencia lograría los compuestos de esta solicitud, también inhibidores de adhesión celular; de manera que para una persona medianamente versada en la materia sería obvio combinar estos dos documentos. Por lo cual puede no reconocerse Nivel Inventivo.

6. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO0130781	1 y dependientes	Nivel Inventivo
D2	WO9910312	1 y dependientes	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.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
14 MAR. 2008

CONCEPTO TÉCNICO No.113	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202074
-----------------------------------	---