

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94-76 - Of. 305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tels: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

48
88

2855/PCT.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E.

S.

D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 05091245 00000002

Folios: 12

Fecha (HDI): 2005-12-26 15:23:37

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE HDI 444 RESPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: Expediente No. 05.091,245

Solicitud de patente a nombre de
NOVARTIS AG

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 94-76, of. 305, obrando como apoderada de la sociedad NOVARTIS AG, domiciliada en Basilea, Suiza, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 10664 notificado por fijación en lista el día 11 de noviembre de 2005, atentamente me permito presentar copia del examen preliminar internacional junto con sus anexos y traducción al español.

Espero con esto haber dado cabal cumplimiento a lo solicitado por ese despacho y de conformidad con lo indicado en los artículos 3º., inciso 3, 35 inciso 2 y 59 inciso 2 del CCA, al analizar este memorial, atentamente ruego se traten todas las cuestiones planteadas con motivo del mismo.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C.39.779.452 de Usaquén
T.P. 68228

TRATADO DE COOPERACION EN MATERIA DE PATENTES PCT

INFORME EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL (PCT artículo 36 y regla 70)

89

Referencia del solicitante o agente 4 -32897/USN	Ver notificación de la transmisión del examen preliminar Internacional (formato PCT/IPEA/416) PARA PROSEGUIR	
No. Solicitud Internacional PCT/UP2004/001981	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 27/02/2004	Fecha de prioridad (día/mes/año) 28/02/2003
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC C07D215/26		
Solicitante NOVARTIS AG		

1. Este examen preliminar internacional ha sido preparado por esta Autoridad encargada del Examen Preliminar Internacional y es transmitida al solicitante de acuerdo con el artículo 36. 2. Este INFORME consiste de un total de 4 páginas, incluyendo esta hoja. 3. Este reporte también se acompaña con los siguientes anexos, que comprenden: a. ☐ enviados al solicitante y a la Oficina Internacional, un número total de ☐ hojas, de la siguiente forma : ☐ hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos los cuales han sido modificados y que son la base de este reporte y/o hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta autoridad (ver regla 70.16 y sección 607 de las Instrucciones administrativas). ☐ hojas que fueron presentadas con esta solicitud inicial, pero que dicha autoridad consideran que contienen modificaciones que van más allá de la revelación de la solicitud Internacional como fue presentada, como se indica en el ítem 4, casilla 4 No. 1 y la casilla suplementaria. b. ☐ (enviado a la Autoridad Internacional únicamente) un total de (indicar tipo y número de carreras (s) electrónicas (s)), ☐ que contienen una lista de secuencias o tablas relacionadas con la misma, leíbles únicamente en computador, como se indica en la casilla suplementaria relacionada con la lista de secuencias /ver sección 802 de las instrucciones administrativas).	
4. Este informe contiene indicaciones que se relacionan con los siguientes puntos: I. ☒ Base del Informe II. ☒ Prioridad III. ☐ El no-establecimiento de opinión en relación con la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial IV. ☐ Falta de unidad de invención V. ☒ Declaración motivada bajo el Art. 35(2) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación Industrial; citas y explicaciones que soportan dicha declaración VI. ☐ Ciertos documentos citados VII. ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional VIII. ☐ Ciertas observaciones en la solicitud internacional	

Fecha de presentación de la demanda 24/09/2004	Fecha en que se completó este informe 17/01/2005
Nombre y dirección de la autoridad encargada del examen preliminar internacional: Oficina de Patentes Europea D-80298 Munich Tel. +49 89 2399-0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Oficial autorizado Jonson, C Teléfono: +49 89 2399-8287

INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional No. PCT/EP2004/001981

90

I. BASE DEL INFORME

1. En relación con el idioma, este reporte se basa en una solicitud internacional en el idioma en que este fue presentado, a menos que se indique otra cosa bajo este ítem.

___ Este reporte se basa en las traducciones del idioma original al siguiente idioma, el cual es una traducción de este idioma para los siguientes propósitos de :

- ___ Búsqueda internacional (bajo las reglas 12.3 y 23.1 (b)).
___ Publicación de la solicitud internacional (bajo las reglas 12.4)
___ Examen preliminar internacional (bajo las reglas 55.2 y 55.3

2. En relación con los elementos de la solicitud Internacional, este reporte se basa en (reemplazar las hojas que han sido suministradas a la oficina receptora como respuesta a la invitación bajo el artículo 14, los cuales son referidos en este reporte como "presentadas originalmente" y no están anexados a este reporte):

DESCRIPTIVO, PAGINAS:

1-22 Como originalmente fueron presentadas.

REIVINDICACIONES, No.:

1-22 Como originalmente fueron presentadas.

3. Las modificaciones han resultado en la cancelación de:

- ___ El capítulo descriptivo páginas:
___ Las reivindicaciones Nos.:
___ Los dibujos hojas:
___ Lista de secuencias
___ Cualquier tabla relacionada con la lista de secuencias

4. ___ Este informe ha sido establecido como si (algunas de) las modificaciones no hubieran sido efectuadas debido a que se ha considerado que van más allá de lo reivindicado mediante la solicitud internacional (Regla 70.2 (c)):

- ___ El capítulo descriptivo páginas:
___ Las reivindicaciones Nos.:
___ Los dibujos hojas:
___ Lista de secuencias
___ Cualquier tabla relacionada con la lista de secuencias

* Si el ítem 4 aplica algunas o todas de estas hojas que estén marcadas deben ser " reemplazadas."

**INFORME DEL EXAMEN
PRELIMINAR INTERNACIONAL**

Solicitud internacional No. PCT/EP2004/001981

Casilla No. II Prioridad

1. ☒ Este reporte ha sido establecido o como si ninguna prioridad hubiese sido reivindicada dada a una falla en el cumplimiento de tiempo prescrito :
☒ una copia de la primera solicitud cuya prioridad ha sido reivindicada (regla 66.7 (a)).
☐ La traducción de la primera solicitud cuya prioridad ha sido reivindicada (regla 66.7 (b)).
2. ☐ Este reporte ha sido establecido como si ninguna prioridad hubiese sido reivindicada debido a que la reivindicación de prioridad hubiese sido invalida (regla 64.1). Por lo tanto, para el propósito de este reporte, la fecha de presentación internacional indicada arriba es considerada como la fecha relevante.

V. Declaración motivada conforme a la Regla 66.2 (a)(II) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación Industrial; citas y explicaciones que sustentan dicha declaración

1. Declaración

Novedad (N)	Reivindicaciones	1-22
	Reivindicaciones	
Nivel Inventivo (IS)	Reivindicaciones	4,5,14,20-22 1,3,6-13,15-19
	Reivindicaciones	
Aplicación Industrial (IA)	Reivindicaciones	1-22
	Reivindicaciones	

2. Citaciones y explicaciones (regla 70.7)

Ver hoja anexa

95
92

V. Declaración Argumentada.

Se hace referencia al siguiente documento:

D1: WO 00/75114

Novedad.

Los procesos presentes de las reivindicaciones 1-19 difieren de aquel de D1 porque el producto O-protegido se aísla como su sal (fórmula (V)), mientras que en D1 el producto O-protegido se aísla como la base libre (ejemplos 2 y 21).

Los compuestos de las reivindicaciones 20 y 21 difieren de aquellos divulgados en D1 porque ellos son sales del producto O-protegido. En D1 la desprotección ocurre antes de que se preparen las sales.

El compuesto de la reivindicación 22 cae en el alcance general de la fórmula (I) de D1, puesto que esta fórmula abarca sales, y las sales representativas en p. 9 incluyen la sal del ácido benzoico. Sin embargo, como no hay divulgación del compuesto específico como su sal benzoato, la reivindicación 22 se puede considerar como una selección novedosa a partir de D1.

Las reivindicaciones 1-22 llenan completamente los requerimientos del Artículo 33(2) PCT.

92
93

Nivel Inventivo.

El problema técnico que subrayan las reivindicaciones presentes se puede tomar como el suministro de un proceso alternativo para preparar sales del agonista del adrenoreceptor conocido a partir de D1. D1 es el arte previo más cercano. Este problema se resuelve mediante la preparación de la sal del producto O-protegido seguida de la desprotección, en contraste a D1 en donde la desprotección ocurre antes de la formación de la sal.

En cuanto al proceso presente, es simplemente una alternativa, el proceso reivindicado parece ser una modificación de rutina del proceso del arte previo, lo cual sería un camino obvio para solucionar el problema técnico formulado antes.

De acuerdo con la descripción, el proceso presente permite un aislamiento simplificado y con alto rendimiento del intermedio O-protegido como su sal, mientras que el intermedio O-protegido como su base libre es difícil de purificar sin pérdida de producto. En este caso el problema técnico se puede tomar como el suministro de un proceso mejorado. Hasta donde el proceso sobre su alcance total permite una cristalización simple y de alto rendimiento de la sal O-protegida, se puede reconocer un nivel inventivo, puesto que los productos de D1 son aislados por cromatografía, y la cristalización claramente es un método de aislamiento ventajoso, particularmente a gran escala. Sin embargo, se señala que el proceso presente solamente está ejemplificado para productos en donde la sal es la sal benzoato, mientras que en la reivindicación 1 el ácido usado puede ser cualquier ácido, en la reivindicación 2 puede ser cualquier ácido carboxílico, y en la reivindicación 3

94

puede ser una variedad de ácidos carboxílicos disimilares estructuralmente. No parece que sea cualquier base la que extrapola los resultados obtenidos utilizando ácido benzoico u otros ácidos carboxílicos, menos aún sin mencionar a todos los ácidos. Por lo tanto al momento, se consideran inventivos, solamente aquellos procesos que han mostrado ser ventajosos, que son aquellos nombrados en las reivindicaciones 4, 5 y 14.

Como la buena cristalizabilidad de las sales benzoato O-protegidas es la responsable por el reconocimiento del nivel inventivo para el proceso, las sales benzoato O-protegidas de las reivindicaciones 20 y 21 también son inventivas. Con el propósito de preparar los productos finales deseados a partir de éstas sales benzoato, es necesario proceder por vía de la sal benzoato desprotegidas de la reivindicación 22. Por lo tanto éste compuesto también se puede considerar inventivo.

Las reivindicaciones 4, 5, 14 y 20-22 llenan completamente los requerimientos del Artículo 33(3) PCT.

Aplicabilidad Industrial.

Las reivindicaciones 1-22 llenan completamente los requerimientos del Artículo 33(4) PCT.

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 4 -32897AUSN	FOR FURTHER ACTION		See Form PCT/PEAA18
International application No. PCT/EP2004/001981	International filing date (day/month/year) 27.02.2004	Priority date (day/month/year) 28.02.2003	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D215/26			
Applicant NOVARTIS AG			
1. This report is the International preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☐ sent to the applicant and to the International Bureau a total of sheets, as follows: ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.18 and Section 807 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (Indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).			
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the opinion ☒ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement ☐ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 24.08.2004		Date of completion of this report 17.01.2005	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx 523858 epmu d Fax +49 89 2399 - 4485		Authorized Officer Johnson, C Telephone No. +49 89 2399-6267 	

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2004/001981

96.

Box No. I Base of the report

1. With regard to the language, this report is based on the International application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.
 - ☐ This report is based on translations from the original language into the following language, which is the language of a translation furnished for the purposes of:
 - ☐ International search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ International preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
2. With regard to the elements* of the International application, this report is based on (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):

Description, Pages

1-22 as originally filed

Claims, Numbers

1-22 as originally filed

- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing
3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing (specify):
 - ☐ any table(s) related to sequence listing (specify):
 4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing (specify):
 - ☐ any table(s) related to sequence listing (specify):

* If item 4 applies, some or all of these sheets may be marked "superseded."

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2004/001981

101
97

Box No. II Priority

1. ☒ This report has been established as if no priority had been claimed due to the failure to furnish within the prescribed time limit the requested:
☒ copy of the earlier application whose priority has been claimed (Rule 66.7(a)).
☐ translation of the earlier application whose priority has been claimed (Rule 66.7(b)).
2. ☐ This report has been established as if no priority had been claimed due to the fact that the priority claim has been found invalid (Rule 64.1). Thus for the purposes of this report, the international filing date indicated above is considered to be the relevant date.
3. Additional observations, if necessary:

Box No. 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	1-22
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	4,5,14,20-22
	No: Claims	1-3,6-13,15-19
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-22
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

V. Reasoned statement

Reference is made to the following document:

D1: WO 00/75114

Novelty

The present processes of claims 1-19 differ from that of D1 because the O-protected product is isolated as its salt (formula (V)), whereas in D1 the O-protected product is isolated as the free base (examples 2 and 21).

The compounds of claims 20 and 21 differ from those disclosed in D1 because they are salts of the O-protected product. In D1 deprotection occurs before the salts are prepared.

The compound of claim 22 falls within the general scope of formula (I) of D1, as this formula encompasses salts, and representative salts on p. 9 include the benzoic acid salt. However, as there is no disclosure of the specific compound as its benzoate salt claim 22 may be considered as a novel selection from D1.

Claims 1-22 fulfil the requirements of Article 33(2) PCT.

Inventive step

The technical problem underlying the present claims may be taken as the provision of an alternative process for preparing salts of the adrenoceptor agonist known from D1. D1 is the closest prior art. This problem is solved by preparing the salt of the O-protected product followed by deprotection, in contrast to D1 wherein deprotection occurs before salt formation.

Insofar as the present process is simply an alternative, the claimed process appears to be a routine modification of the prior art process, which would be an obvious way of solving the above-formulated technical problem.

According to the description, the present process allows a simplified and high-yielding isolation of the O-protected intermediate as its salt, whereas the O-protected intermediate as its free base is difficult to purify without loss of yield. In

103
99

this case the technical problem may be taken as the provision of an improved process. Insofar as the process over its entire scope allows a simple and high-yielding crystallisation of the O-protected salt, an inventive step may be recognised, as the products of D1 are isolated by chromatography, and crystallisation is clearly an advantageous isolation method, particularly on the large scale. However, it is noted that the present process is exemplified solely for products wherein the salt is a benzoate salt, whereas in claim 1 the acid used may be any acid, in claim 2 it may be any carboxylic acid, and in claim 3 it may be a variety of structurally dissimilar carboxylic acids. There does not appear to be any basis for extrapolating the results obtained using benzoic acid to other carboxylic acids, let alone to all acids. Thus at present only those processes which have been shown to be advantageous, namely those of claims 4, 5 and 14 are considered inventive.

As the good crystallisability of the O-protected benzoate salt is responsible for the recognition of inventive step for the process, the O-protected benzoate salts of claims 20 and 21 are also inventive. In order to prepare the desired final products from these benzoate salts, it is necessary to proceed via the deprotected benzoate salt of claim 22. This compound may thus also be considered inventive.

Claims 4, 5, 14 and 20-22 fulfil the requirements of Article 33(3) PCT.

Industrial applicability

Claims 1-22 fulfil the requirements of Article 33(4) PCT.

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

100.

Folio 105

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
ESCOBAR URIBE JIMENA
Apoderado(a) y/o Representante de
NOVARTIS AG

REFERENCIA	Radicación No.	05 91245
	Solicitud internacional	PCT/EP2004/001981
	Fecha inicio fase nacional	28/09/2005
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	2650
	Folios	1

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 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.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

27 FEB 2007

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

adpa10