

AS: 101.907

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-088125- -00002-0000
Rec: 2008-12-20 17:14:30 Dep. 2008 NUEVAS CREACIONES
REL 11 PATENTE/118
Env: 3/11 FASENACIONAL/118
Folios: 3/

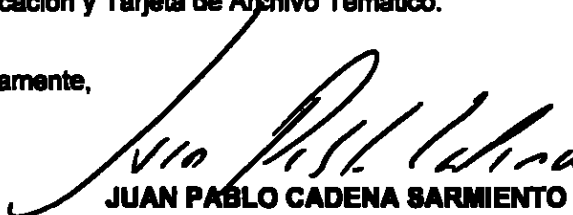
RESPUESTA A OFICIO 12395 DE OCTUBRE 27, 2008

REF: Expediente No. 06 088.125 - Solicitud de Patente Entrada en Fase Nacional
Corresp. a la Solicitud Internacional PCT/JP2005/004152
a favor de KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.
Titulada: DERIVADOS HETEROCÍCLICOS FUSIONADOS, COMPOSICIONES
MEDICINALES QUE LOS COMPRENDEN, Y SU USO MÉDICO

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO, vecino de Bogotá, portador de la tarjeta profesional No. 57492, obrando como apoderado de la sociedad KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD., según lo acredita el documento de poder anexo al presente escrito, para dar cumplimiento al requerimiento notificado por fijación en lista el 27 de Octubre de 2008, 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 allegar:

1. Documento donde consta la cesión del derecho a la Patente otorgado por los inventores al solicitante, debidamente apostillado, junto con su correspondiente traducción al castellano.
2. Fotocopia autenticada del documento de poder conferido por el solicitante, incluyendo el Certificado que acredita la existencia y representación legal de KISSEI PHARMACEUTICAL CO., debidamente apostillado, junto con su correspondiente traducción al castellano.
3. Copia del Reporte de Examen Preliminar efectuado por la IPEA (forma PCT/IPEA/409), junto con su correspondiente traducción al castellano.
4. Extracto para publicación y Tarjeta de Archivo Temático.

De la señora jefe atentamente,

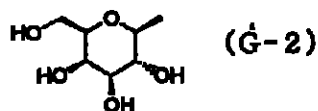
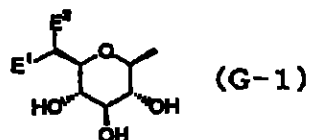
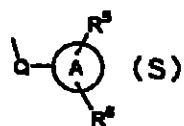
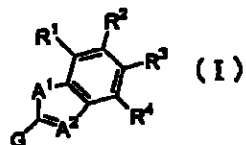

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO
C.C. No. 80.410.337 de Usaquén
Cra 7 No. 71-21 TORRE B - Piso 4

Bogotá, 19 de Diciembre de 2008
CHP/MEV/har.

387

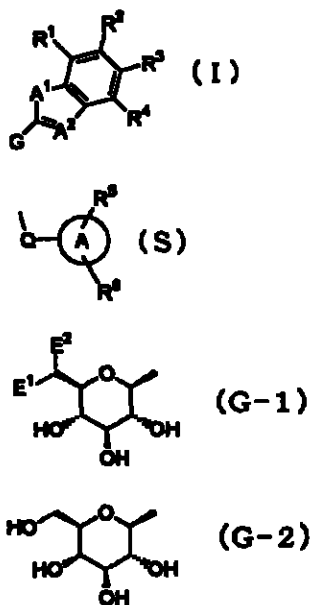
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES TARJETA ARCHIVO TEMÁTICO			
PATENTE DE INVENCION <u>X</u> PCT <u>X</u> MODELO DE UTILIDAD		DISEÑO INDUSTRIAL			
(21) N° de solicitud: 06 088.125		(22) Fecha de solicitud: 04-09-2006			
(541) Clasificación Internacional:		FIGURA CARACTERISTICA 6 x 6 cm			
(71) Solicitante(s) KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.					
(72) Inventor(es) Nobuhiko Fushimi, Hideki Fujikura, Masayuki Isaji					
(74) Agente: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO					
(30) Prioridad (31) No. Prioridad (32) Fecha (33) País					
		2004-61429		04-03-2004 JP	
(85) Fecha inicio fase nacional: 04-10-2006		(87) Publicación Internacional:			
(86) Datos relativos a la presentación de la solc. PCT		Fecha: 15-09-2005			
Fecha de presentación de la solicitud: 03-03-2005		No. Publicación: WO 2005/085265 A1			
No. de solicitud PCT/JP2005/004152					
(54) Título: DERIVADOS HETEROCÍCLICOS FUSIONADOS, COMPOSICIONES MEDICINALES QUE LOS COMPRENDEN, Y SU USO MÉDICO					
Resumen: Un derivado de anillo fusionado nitrogenado representado por la siguiente fórmula general (I), su sal o profármaco farmacológicamente aceptables. Estos poseen actividad inhibidora de SGLT humano y son útiles como agentes preventivos o terapéuticos para enfermedades atribuibles a hiperglucemia, tales como diabetes, hiperglucemia posprandial, tolerancia anormal a la glucosa, complicaciones de diabetes y obesidad.					
CONTINUA AL RESPALDO ...					

[En la fórmula (I), uno de R¹ y R⁴ representa un grupo representado por la siguiente fórmula general (S) (en donde R⁵ y R⁶ cada uno representa H, OH, halógeno, etc.; Q representa alquileo, etc.; y anillo A representa arilo, etc.) y el otro representa H, OH, amino, etc.; R² y R³ cada uno representa H, OH, amino, halógeno, alquilo sustituido de manera opcional, etc.; A¹ representa O, S, etc.; A² representa CH ó N; y G representa un grupo representado por la siguiente fórmula general (G-1) (en donde E¹ es H, F, ó OH y E² representa H, F, metilo, etc.) o el grupo representado por la siguiente fórmula general (G-2).]

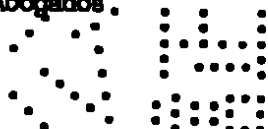


 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud: 06 088.125 (22) Fecha de solicitud: 04-08-2006 (30) Prioridad (31) No. Prioridad 32) Fecha (33) País 2004-81429 04-03-2004 JP		(51) Int Cl: (71) Solicitante(s) KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD. (72) Inventor(es) Nobuhiko Fushimi, Hideo Fujikura, Masayuki Isaji (74) Agente: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO	
(85) Fecha inicio fase nacional: 04-10-2006 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 03-03-2005 No. De solicitud PCT/JP2005/004152		(87) Publicación internacional Fecha: 15-09-2005 N° publicación: WO 2005/085285 A1	
(54) Título: DERIVADOS HETEROCÍCLICOS FUSIONADOS, COMPOSICIONES MEDICINALES QUE LOS COMPRENDEN, Y SU USO MÉDICO			

Resumen:



Un derivado de anillo fusionado nitrogenado representado por la siguiente fórmula general (I), su sal o profármaco farmacológicamente aceptables. Estos poseen actividad inhibidora de SGLT humano y son útiles como agentes preventivos o terapéuticos para enfermedades atribuibles a hiperglucemia, tales como diabetes, hiperglucemia posprandial, tolerancia anormal a la glucosa, complicaciones de diabetes y obesidad. [En la fórmula (I), uno de R¹ y R⁴ representa un grupo representado por la siguiente fórmula general (S) (en donde R⁵ y R⁶ cada uno representa H, OH, halógeno, etc.; Q representa alquileo, etc.; y anillo A representa anillo, etc.) y el otro representa H, OH, amino, etc.; R² y R³ cada uno representa H, OH, amino, halógeno, alquilo sustituido de manera opcional, etc.; A¹ representa O, S, etc.; A² representa CH ó N; y G representa un grupo representado por la siguiente fórmula general (G-1) (en donde E¹ es H, F, ó OH y E² representa H, F, metilo, etc.) o el grupo representado por la siguiente fórmula general (G-2).]



389

**DOCUMENT OF ASSIGNMENT OF
PATENT APPLICATION**

ASSIGNMENT

The Undersigned
Nobuhiko FUSHIMI, Hideki FUJIKURA and
Masayuki ISAJI
acting as **INVENTORS**

of Colombian Patent Appln. No. 06 088 125
Titled:

**FUSED HETEROCYCLIC DERIVATIVE,
MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME,
AND MEDICINAL USE THEREOF**

with domicile in c/o Central Research
Laboratories, Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.,
4365-1, Hotaka-Kashiwabara, Azumino-shi, Nagano 399-8304,

Japan hereby declare(s) that they (it) assign(s) all
rights of ownership as well as all rights and
privileges relating thereto without
exception over the following patent
application in Colombia:

No.
Titled:

to **KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.**

domiciled in
19-48, Yoshino, Matsumoto-shi,
Nagano 399-8710 Japan

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

Given and signed on the _____ day of
of 200_

**DOCUMENTO DE TRASPASO DE
SOLICITUD DE PATENTE**

CESIÓN

El(los) Suscrito(s)

en calidad de

de la Sol. de Patente en Colombia No.
Títulada:

con domicilio en

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

No.
Títulada:

a

domiciliada en

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

Dado y firmado a los _____ días del mes de
de 200_

Nobuhiko Fushimi Hideki Fujikura Masayuki Isaji
Nobuhiko FUSHIMI Hideki FUJIKURA Masayuki ISAJI

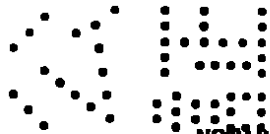
Signature of Assignor

Firma del Cedente

Mutsuo Kanzawa
Mutsuo Kanzawa, President

Signature of Assignee

Firma del Cesionario



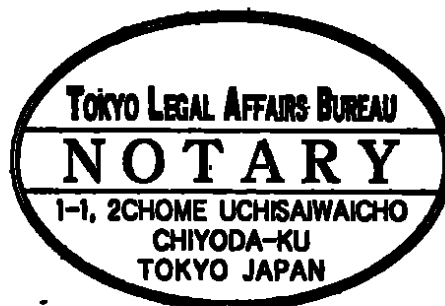
NOTARIAL CERTIFICATE

Registration No

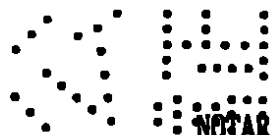
390
2161

This is to certify that the signatures on the foregoing document
are genuine and authentic signatures of Nobuhiko FUSHIMI, Hideki FUJIKURA
and Masayuki ISAJI.

DEC - 7 2006



Masayuki Ikeda
MASAZU IKEDA
NOTARY



NOTARIAL CERTIFICATE

Registration No

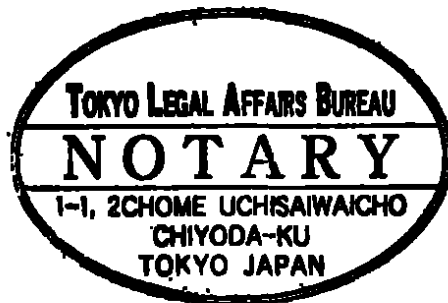
391
65161

This is to certify that the signature on the foregoing document
is genuine and authentic signature of

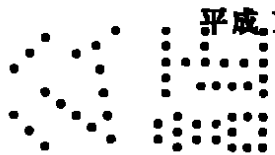
Mutsuo KANZAWA, President of KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.,

a corporation existing and organized under the laws of Japan,
who has produced sufficient proof of his power to execute the
said instrument on behalf of the above-mentioned corporation.

DEC - 7 2006




MAKAZU IKEDA
NOTARY



平成18年登録第



2767 号

認

証

X

392

囑託人キッセイ薬品工業株式会社代表取締役神澤陸雄、伏見信彦、藤倉秀紀及び伊佐治正幸の代理人城野喬は、本公証人に対し、囑託人が別添文に署名したことを自認している旨陳述した。



よって、これを認証する。

平成18年 12 月 7 日、本公証人役場において
東京都千代田区内幸町2丁目1番1号

東京法務局所属

公証人
Notary

池田真一
MAKAZU IKEDA



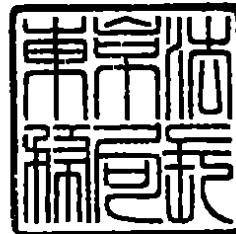
証 明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、
真実のものであることを証明する。

平成18年 12 月 7 日

東京法務局長

戸田信久



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: JAPAN

This public document

2. has been signed by MAKAZU IKEDA

3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of MAKAZU IKEDA

Certified

5. at Tokyo

6. DEC - 7 2006

7. by the Ministry of Foreign Affairs

8. 06- No 000580

9. Seal/stamp:

10. Signature



K. Oyabe

Kazutoyo OYABE

For the Minister for Foreign Affairs

2/ 393

**TRADUCCION AL ESPAÑOL del Documento de Cesión a KISSEI
PHARMACEUTICAL CO., LTD. firmada por el cedente y el cesionario.**

Registro No. 2161

CERTIFICADO NOTARIAL

**La presente es para certificar que las firmas en el documento precedente son firmas
genuinas y autenticas de Nobuhiko FUSHIMI, Hideki FUJIKURA y Masayuki ISAJI.**

DIC – 7 2006

Hay un sello que dice:

AGENCIA DE ASUNTOS LEGALES DE TOKYO

Notaría

1-1, 2CHOME UCHISAIWAICHO

CHIYODA-KU

TOKYO, JAPÓN

(firma)

Makazu Ikeda

Notario

394

g

Registro No. 2161

CERTIFICADO NOTARIAL

**La presente es para certificar que la firma en el documento precedente es la firma genuina y autentica de
Mutsuo KANSAWA, Presidente de KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.,**

una corporación existente y organizada bajo las leyes del Japón, que ha producido suficientes pruebas de su poder para ejecutar dicho instrumento en representación de la corporación anteriormente mencionada.

DIC – 7 2006

Hay un sello que dice:

AGENCIA DE ASUNTOS LEGALES DE TOKYO

Notaría

**1-1, 2CHOME UCHISAIWAICHO
CHIYODA-KU
TOKYO, JAPÓN**

**_____ (firma)
Makazu Ikeda
Notario**

395

- Este documento público**

- 3. actuando en capacidad de Notario de la Agencia de Asuntos Legales de Tokyo**

- ## Certificado

- ## 6. DIC-7 2006

- 8. 06- No. 000580**

- ## 10. Firma

(firma)

Kazutoyo OYABE
Para el Ministro de
Relaciones Exteriores

PODER

POWER OF ATTORNEY

Yo (nosotros) KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.

I (We) KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.

domiciliado(s) en: 19-48, Yoshino, Matsumoto-Shi, Nagano 399-8710, JAPON

domiciled in: 19-48, Yoshino, Matsumoto-Shi, Nagano 399-8710, JAPAN

Nombro(amos) a: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO y/o CARLOS H. PALACIO EASTMAN y/o MARTÍN E. TORRES CARDOZO, de Bogotá, Colombia, apoderados verdaderos y legales con poder especial, amplio y suficiente, para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía, en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, registros de marcas, diseños industriales, modelos de utilidad, depósitos de nombres comerciales, lemas comerciales y enseññas, registros de derechos de autor y contratos sobre los mismos, obtención de certificados de obtentor de variedades vegetales, así como sus prórrogas, renovaciones, anotaciones de traspaso, cambios de nombre y/o domicilio; elaborar, tramitar y registrar contratos de licencia y licencias de cualesquiera clases; intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso ante cualquier juez, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía tales como: oposiciones al registro de marcas; acciones de caducidad, cancelación y nulidad; acciones reivindicatorias, acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias; acciones de competencia desleal; demandas penales; acciones de indemnización de perjuicios, reclamos y observaciones a solicitudes de patentes, diseños industriales, modelos de utilidad, en el ejercicio de medidas cautelares y en otras acciones o medidas similares.

Hereby appoints JUAN PABLO CADENA SARMIENTO and/or CARLOS H. PALACIO EASTMAN and/or MARTÍN E. TORRES CARDOZO, of Bogotá, Colombia, my (our) true and lawful attorneys with special, ample and sufficient power to obtain from the Colombian administrative, judicial and police offices and authorities, in any instance, privileges of patents of invention, registration of trademarks, industrial designs and utility models; registration of commercial names, slogans and emblems, registration of copyright and contracts related thereto, certificates of obtainers of vegetables varieties, as well as extensions, renewals and recordal of assignments and changes of name and domicile related to the above; to prepare, prosecute and register licenses of any kind; to act as plaintiff or defendant in any instance or recourse, and before any judge, corporation, public official or authority in judicial, administrative and police actions, such as: oppositions to the registration of trademarks; caducity, cancellation and nullity actions; claim actions derived from the obtaining or exploitation of licenses, action of unfair competition; criminal proceedings, actions for payment of damages; claims or observations on patent applications, models, industrial designs and utility models; in the exercise of preventive measures and in other actions or similar proceedings.

A este efecto, lo(s) faculto(amos) para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, nulidades, apelaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la ley; renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores, dando el descargo respectivo, y, en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeren conducentes al resguardo de mis (nuestros intereses), con todas las demás facultades legales necesarias.

To that effect they hereby empowered to file applications, formulate descriptions, amendments, protests, declarations, oppositions, cancellations, nullities, appeals and claims; to pay taxes, quotas and assessments prescribed by law, renounce or waive the rights granted or in the process of granting; to receive all kinds of documents and valuables, giving the respective release of receipt, and, in general, to take before said authorities the necessary steps to such effect, and any measures that they may deem pertinent to the safeguard of my (our) interest(s) with all the other necessary legal powers.

Este poder comprende la facultad de ratificar o confirmar en mi (nuestro) nombre lo actuado, así como la facultad de desistir, transigir, comprometer y la de sustituirlo en todo o en parte y revocar sustituciones. Asimismo nombro(amos) a: JUAN PABLO CADENA SARMIENTO y/o CARLOS H. PALACIO EASTMAN y/o MARTÍN E. TORRES CARDOZO, domiciliado(s) en la Carrera 7 N° 71 - 21 Torre B - Oficina 402, mis (nuestros) apoderados en Colombia, con facultades para recibir notificaciones y designar apoderados, judiciales y extrajudiciales.

This power includes the faculty to ratify or confirm dealt, settle and compromise on my (our) behalf, and to substitute this power in whole or in part and to revoke substitutions. At the same time I (We) hereby appoint JUAN PABLO CADENA SARMIENTO and/or CARLOS H. PALACIO EASTMAN and/or MARTÍN E. TORRES CARDOZO, domiciled in Carrera 7 No. 71-21 Torre B - Oficina 402, my (our) attorney(s) in fact, with powers to receive notifications and to designate judicial and extrajudicial attorneys.

Otorgado y firmado en

hoy

de

Firma

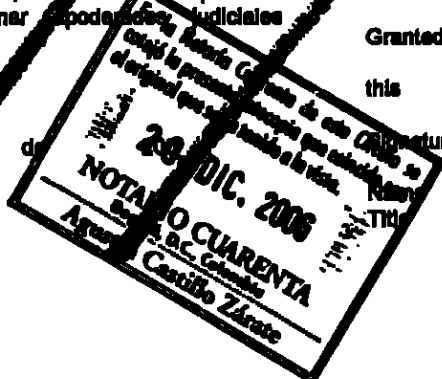
Nombre
Cargo

Granted and signed in

this day of 200_

Signature

Mutsuo Kanzawa
President



NOTARIAL CERTIFICATE

Registration No

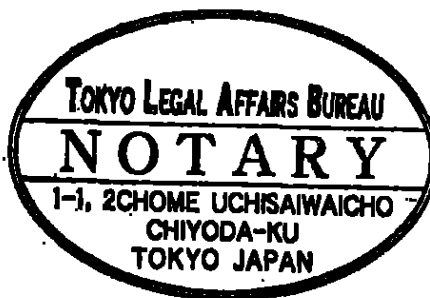
12
2160

399

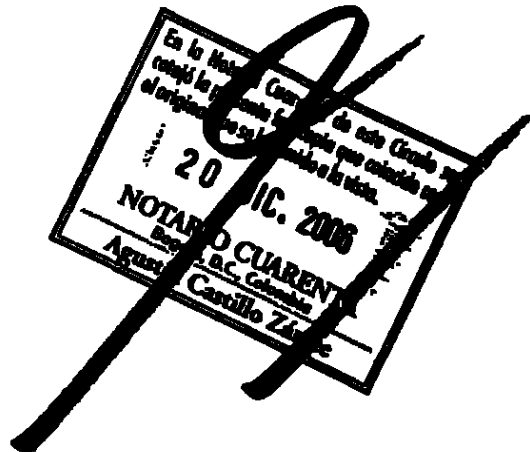
This is to certify that the signature on the foregoing document
is genuine and authentic signature of
Mutsuo KANZAWA, President of KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.,

a corporation existing and organized under the laws of Japan,
who has produced sufficient proof of his power to execute the
said instrument on behalf of the above-mentioned corporation.

DEC - 7 2006



Makazu Ikeda
MAKAZU IKEDA
NOTARY



嘱託人キッセイ薬品工業株式会社代表取締役神澤陸雄の代理人城野喬は、本公証人
に対し、嘱託人が別添文書に署名したことを自認している旨陳述した。



よって、これを認証する。

平成18年 12 月 7 日、本公証人役場において
東京都千代田区内幸町2丁目1番1号
東京法務局所属

公 証 人
Notary

池田真一
MAKAZU IKEDA



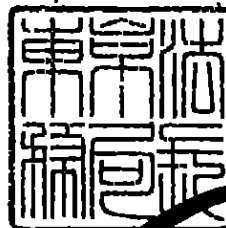
証 明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、
真実のものであることを証明する。

平成18年 12 月 7 日

東京法務局長

戸田信久



APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

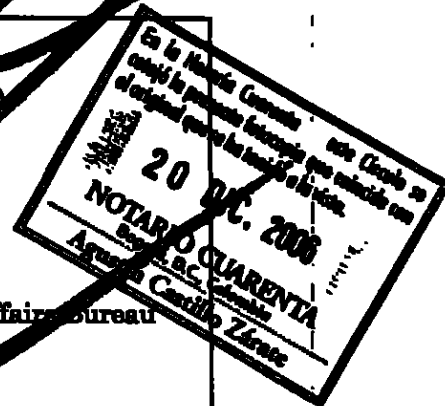
1. Country: JAPAN
This public document
2. has been signed by MAKAZU IKEDA
3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau
4. bears the seal/stamp of MAKAZU IKEDA
Certified
5. at Tokyo
6. DEC - 7 2006
7. by the Ministry of Foreign Affairs
8. 06- N^o 000579
9. Seal/stamp:
10. Signature



K. Oyabe

Kazutoyo OYABE

For the Minister for Foreign Affairs



399

Handwritten mark resembling a stylized 'H' or 'K'.

TRADUCCION AL ESPAÑOL del Documento de Poder otorgado por KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD. , con domicilio en 19-48, Yoshino, Matsumoto-Shi, Pagano 399-8710.

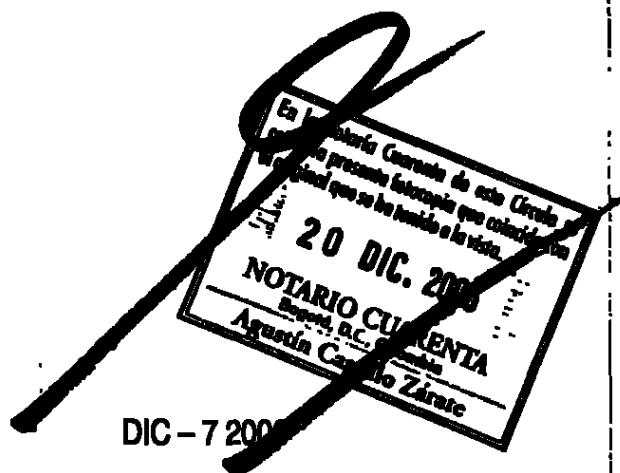
Registro No. 2161

CERTIFICADO NOTARIAL

La presente es para certificar que las firma en el documento precedente es la firma genuina y autentica de

Mutsuo KANSAWA, Presidente de KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.,

una corporación existente y organizada bajo las leyes del Japón, que ha producido suficientes pruebas de su poder para ejecutar dicho instrumento en representación de la corporación anteriormente mencionada.



Hay un sello que dice:

AGENCIA DE ASUNTOS LEGALES DE TOKYO

Notaría

1-1, 2CHOME UCHISAIWAICHO

CHIYODA-KU

TOKYO, JAPÓN

(firma)

Makazu Ikeda

Notario

H

APOSTILLA
(Convención de la Haya de Octubre 5 de 1961)

2. País: Japón

Este documento público

6. ha sido firmado por MAKAZU IKEDA

7. actuando en capacidad de Notario de la Agencia de Asuntos Legales de Tokyo

8. lleva el sello/timbre de MAKAZU IKEDA

Certificado

9. en Tokio

6. DIC-7 2006

10. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

11. 06- No. 000579

12. Sello/timbre:
hay un sello que dice:

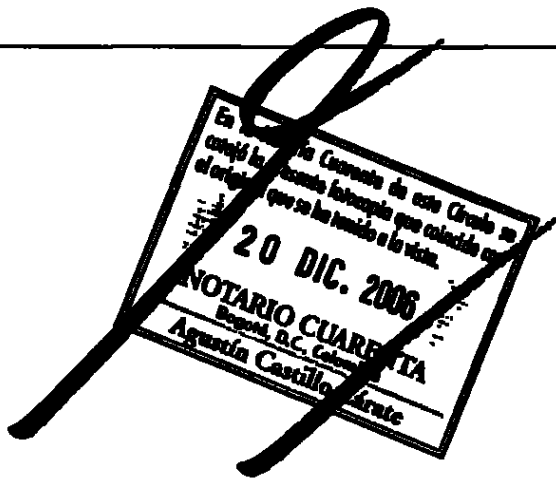
10. Firma

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

(firma)

JAPÓN

Kazutoyo OYABE
Para el Ministro de
Relaciones Exteriores



16-12-08:06:00PM;

2/15

PATENT COOPERATION TREATY

Issuer: Japan Patent Office (International Preliminary Examining Authority)

Applicant's agent Intellectual Property Division, Kissei Pharmaceutical Co., Ltd. Addressee 19-48, Yoshino, Matsumoto-shi, Nagano, Japan, 399-8710		PCT INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT (PCT Chapter 2) (Law Enforcement Regulations Article 57) (PCT Rule 71.1)	
		Date of issue (day/month/year): 24 January 2006 (24.01.2006)	
Applicant's or agent's file reference PCT-A0510-00		Important communication	
International application No. PCT/JP2005/004152	International filing date (day/month/year): 03 March 2005 (03.03.2005)	Priority date (day/month/year): 04 March 2004 (04.03.2004)	
Applicant (Name or title of company/department) Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.			

1. The International Preliminary Examining Authority informs the applicant that, in the event that an international preliminary examination report and annexed documents relating to the patentability of this international application have been produced, such documents will be sent accompanying this notification.

2. In the event that an international preliminary examination report and annexed documents have been produced, copies will be sent to the International Department to notify all designated offices.

3. If requested by any designated office, the International Department will produce an English translation of the international preliminary examination report (excluding annexed documents) and send it to the relevant designated office.

4. Notes

The applicant must follow the prescribed procedure (submitting translated documents and payment of national fees) with respect to each designated office within 30 months of the priority date (or later depending on the office). (PCT Article 39 Rule 1) (Refer to PCT/IB/301 and notes sent by the International Department)

In the event that a translation of the international application is submitted to a designated office, the translation must also include translations of any annexed documents relating to patentability attached to the international preliminary examination report. It is the responsibility of the applicant to produce such translations and send them directly to the relevant designated office.

For the period and detailed requirements applicable to designated offices, refer to Volume II of the PCT applicant guidelines.

The applicant will observe PCT Article 33, Rule 5. The criteria for determining whether the invention is novel, inventive and industrially applicable, as stipulated in PCT Articles 2 to 4, will be used only for the international preliminary examination. In determining the domestic patentability of the invention detailed within the scope of the claim, the Contracting State may apply additional or different criteria (refer also to PCT Article 27 Rule 5). Such additional criteria include, for example, excluding enablement requirements, clarification of the scope of the patent claim or supporting evidence requirements from patent requirements.

Name and mailing address of the IPEA/IP Japanese Patent Office (IPEA/IP), 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo, 100-8915	Authorized officer Commissioner, Japan Patent Office Telephone No. 03-3581-1101 Ext. 3492
--	---

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Chapter 2)

(Law Article 12 and Law Enforcement Regulations Article 56)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PCT-A0510-00	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA416 for subsequent procedures.	
International application No. PCT/JP2005/004152	International filing date (day/month/year): 03 March 2005 (03.03.2005)	Priority date (day/month/year): 04 March 2004 (04.03.2004)
International Patent Classification (IPC) Int. Cl. C07H17/00 (2006. 01), A61K31/7042 (2006. 01), A61P3/04 (2006. 01), (continued...)		
Applicant Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to PCT Article 36 (Enforcement Regulation Article 57).

2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.

3. This REPORT is also accompanied by ANNEXES.

a. ☐ These annexes consist of a total of _____ sheets.

☐ 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 607 of the Administrative Instructions under the PCT)

☐ Sheets containing rectification beyond the extent of disclosure for application as specified in 4 in Box 1 and Supplemental Box and supplemental forms approved by this Authority

b. ☐ The electronic media consist of _____ (Specify the type and quantity of media).
including the sequence listing in electronic format or tables related thereto as specified in the Supplemental Box concerning the sequence listing (see Section 602 of the Administrative Instructions under the PCT)

4. 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; errors and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain document cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☒ Certain observation on the international application

Date of submission of the demand 21 December 2005 (21.12.2005)	Date of completion of this report 18 January 2006 (18.01.2006)
Name and mailing address of the IPEA/IP Japanese Patent Office (IPEA/JP), 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokyo, 100-8915	Authorized officer Ruka Fuchino Telephone No. 03-3581-1101 Ext. 3492

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2005/004152

I. Basis of the report

1. With regard to language, the basis for the preliminary examination report was as follows.

- ☒ International application in language originally filed
- ☐ Translation of international application, translated from the original language into _____ for the following purposes
- ☐ for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1(b)).
- ☐ for the purposes of international application (Rule 12.4(a))
- ☐ for the purposes of international preliminary examination (Rule 55.2(a) or 55.3(a))

2. With regard to the elements of the international application:

(Supplemental forms submitted for responding to the order under Law Article 6 (PCT Article 14) are treated "as originally filed" in this report and this report does not accompany them.)

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description
- pages _____ as originally filed
- pages* _____ filed with the letter of _____
- pages* _____ filed with the letter of _____
- ☐ the claims
- Nos. _____ as originally filed
- Nos.* _____ as amended (together with any statement under PCT Article 19)
- Nos.* _____ filed with the letter of _____
- Nos.* _____ filed with the letter of _____
- ☐ the drawings
- sheets/fig _____ as originally filed
- sheets/fig* _____ filed with the letter of _____
- sheets/fig* _____ filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description or related tables
- See the Supplemental Box relating to the sequence listing.

3. ☐ The amendment have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____
- ☐ the sequence listing (specify) _____
- ☐ the tables related to the sequence listing (specify) _____

4. ☐ 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, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c))

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____
- ☐ the sequence listing (specify) _____
- ☐ the tables related to the sequence listing (specify) _____

*When 4, is applicable, relevant sheets may have "superseded" printed.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP2005/004152

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

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. 17-20, 27-29

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 17-20, 27-29 relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

The scope of claim 17-20 and 27-29 is "methods of medical treatment for the human body"

☐ 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 (*specify*):

☒ no international search report has been established for said claims Nos. 17-20, 27-29

☐ it was not possible to indicate meaningful opinions due to the absence of any available sequence listing.

Within the designated period, the applicant:

☐ did not submit a sequence listing in written format sufficient to satisfy the requirements provided in Annex C of the Administrative Instructions, making it impossible for the international preliminary examining authority to obtain a sequence listing in an approved format via approved methods.

☐ did not submit a sequence listing in electronic format sufficient to satisfy the requirements provided in Annex C of the Administrative Instructions, making it impossible for the international preliminary examining authority to obtain a sequence listing in an approved format via approved methods.

☐ did not make payment of charges for the delayed submission of the required sequence listing in accordance with instructions provided in Rules 13.3.1(a) or (b) and 13.3.2.

☐ It was not possible to indicate any meaningful opinions due to the absence of any available table relating to the sequence listing. As the applicant did not submit a table in electronic format sufficient to satisfy the technical requirements provided in section 2 of Annex C of the Administrative Instructions within the designated period, it was impossible for the international preliminary examining authority to obtain the said table in an approved format via approved methods.

☐ If the table relating to the sequence listing of nucleotide or amino acid is submitted in electronic format only, the relevant table is insufficient to satisfy the technical requirements provided in section 2 of Annex C of the Administrative Instructions.

☐ See Supplemental Box for details.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2005/004152

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

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-16, 21-26 and 30-32	YES
	Clauses		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-16, 21-26 and 30-32	YES
	Clauses		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-16, 21-26 and 30-32	YES
	Clauses		NO

2. Citations and explanations (PCT Rule 70.7)

Documents

1. WO 2003/000712 A1
2. JP 2003-12686 A
3. JP 2002-193948 A
4. JP 2001-354568 A

The invention relating to the scope of claims 1-16, 21-26 and 30-32 exhibits novelty and progressivity with regard to Documents 1-4 cited in the international examination report. Documents 1-4 refer to compounds that actively inhibit human SGLT2 and are effective in the treatment of diabetic conditions stemming from hyperglycemia, and also compounds that are effective against diabetes. However, they make no mention of compounds with the general formula of the invention.

Even from an expert standpoint, it is not easy to arrive at the compound indicated in the general formula (I) of the invention, which actively inhibits human SGLT and is effective in the treatment of hyperglycemia, from the aforementioned Documents 1-4.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2005/004152

VIII Certain observation on the international application

The following are opinions regarding either the clarity of the scope of the claim, description and drawings or sufficient supporting evidence based on the description of the scope of the claim.

- 1) As it is not possible to establish a clear understanding of the structure of the compound based on the details of the "prodrug" contained in the scope of the claim, the invention is unclear with regard to the compound and its various pharmaceutical uses.
- 2) The compound outlined in the Markush format in the scope of the claim 1 cites various different specific alternatives as its substituent group. The large number of alternatives therefore means that details of certain sections of the claim are not sufficiently concise.
Of the group of compounds included under the invention, only a small minority of the claimed compounds are supported in the description in accordance with PCT Article 6 or disclosed in accordance with PCT Article 5. Consequently, neither the compounds included under the invention, including the aforementioned large number of alternatives, nor any pharmaceutical uses based on the relevant compounds can be said to be fully disclosed or supported in the description.
- 3) It is not possible to establish a clear understanding of the scope of the conditions referred to as "conditions stemming from hyperglycemia" under sections 12, 22 and 31 of the claim.
Furthermore, as conditions usually stem from multiple causes, such as hypertension, even allowing for the details contained in the description and technical common sense, no expert would believe that the drug included under this invention could be effective against all of the aforementioned conditions. Similarly, no expert would believe that every one of the wide range of compounds included within the scope of the claim could be effective with regard to the relevant pharmaceutical uses.

407

06-12-06;06:00PM;

8/ 15

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2005/004152

Supplemental Box

If any of the boxes is short of space

Continued from cover sheet

International Patent Classification (IPC) (continued)

A61P3/06 (2006.01), A61P3/10 (2006.01), A61P7/10 (2006.01), A61P9/10 (2006.01), A61P9/12 (2006.01), A61P19/06 (2006.01)

408

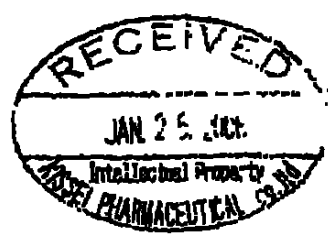
27

06-12-08:06:00PM:

1 8/ 15

特許協力条約

発行人 日本国特許庁 (国際予備審査機関)



代理人
キッセイ薬品工業株式会社 知的財産部

あて名
〒369-8710
日本国長野県松本市芳野19番48号

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章) の
送付の通知書

(施行規則第57条)
[PCT規則71.1]

出願人又は代理人 の登録番号 PCT-A0510-00		発送日 (日.月.年) 24. 01. 2006	
国際出願番号 PCT/JP2006/004152	国際出願日 (日.月.年) 03. 03. 2005	優先日 (日.月.年) 04. 03. 2004	重要な通知
出願人 (氏名又は名称) キッセイ薬品工業株式会社			
1. 国際予備審査機関は、この国際出願に関して特許性に関する国際予備報告及び付属書類が作成されている場合には、それらをこの送付書とともに送付することを、出願人に通知する。 2. 国際予備報告及び付属書類が作成されている場合には、すべての選択官庁に通知するために、それらの写しを国際事務局に送付する。 3. 選択官庁から要求があったときは、国際事務局は国際予備報告 (付属書類を除く) の英語の翻訳文を作成し、それをその選択官庁に送付する。 4. 注 意 出願人は、各選択官庁に対し優先日から80月以内に (官庁によってはもっと遅く) 所定の手続 (翻訳文の提出及び国内手続料の支払い) をしなければならない (PCT39条(1)) (様式PCT/IB/301とともに国際事務局から送付された注を参照)。 国際出願の翻訳文が選択官庁に提出された場合には、その翻訳文は、特許性に関する国際予備報告の付属書類の翻訳文を含まなければならない。この翻訳文を作成し、関係する選択官庁に直接送付するのは出願人の責任である。 選択官庁が適用する期間及び要件の詳細については、PCT出願人の手引き第II巻を参照すること。 出願人はPCT第33条(5)に注意する。すなわち、PCT第33条(2)から(4)までに規定する新規性、進歩性及び産業上利用可能性の基準は国際予備審査にのみ用いるものであり、締約国は、請求の範囲に記載されている発明が自国において特許を受けることができる発明であるかどうかを決定するに当たっては、追加の又は異なる基準を適用することができる (PCT第27条(5)も併せて参照)。そのような追加の基準は、例えば、実施可能要件や特許請求の範囲の明確性又は裏付け要件を、特許要件から免除することを含む。			

名称及びあて名 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8918 東京都千代田区蔵前3丁目4 3号	検閲のある職員 特許庁長官 電話番号 03-3581-1101 内線 3492	4P 9048
---	---	---------

24 409

08-12-08:06:00PM;

10/ 15

特許協力条約

PCT

特許性に關する國際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第 12 条、法施行規則第 66 条)
(PCT 36 条及び PCT 規則 70)

出願人又は代理人 の登録番号 PCT-A0510-00	今後の手続きについては、様式 PCT/ I P E A / 416 を参照すること。	
國際出願番号 PCT/JP2005/004152	國際出願日 (日. 月. 年) 08. 03. 2005	優先日 (日. 月. 年) 04. 03. 2004
國際特許分類 (IPC) $\text{H}1\text{C}1$, $\text{C}07\text{H}17/00$ (2006. 01), $\text{A}61\text{K}31/7043$ (2006. 01), $\text{A}61\text{P}2/04$ (2006. 01), 続きあり		
出願人 (氏名又は名称) キッセイ薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT 35 条に基づきこの國際予備審査機関で作成された國際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条 (PCT 35 条) の規定に従い送付する。
2. この國際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 8 ページからなる。
3. この報告には次の附属書件も添付されている。 a. ☐ 附属書件は全部で ページである。 ☐ 補正されて、この報告の通訳とされた及び/又はこの國際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT 規則 70. 18 及び法施行規則第 607 号参照) ☐ 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における國際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとのこの國際予備審査機関が認定した代替用紙 b. ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に關する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に關するテーブルを含む。 (法施行規則第 502 号参照)
4. この國際予備審査報告は、次の内容を含む。 ☒ 第 I 欄 國際予備審査報告の基礎 ☐ 第 II 欄 優先権 ☒ 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての國際予備審査報告の不作成 ☐ 第 IV 欄 発明の単一性の欠如 ☒ 第 V 欄 PCT 35 条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文獻及び説明 ☐ 第 VI 欄 ある種の引用文獻 ☐ 第 VII 欄 國際出願の不備 ☒ 第 VIII 欄 國際出願に対する意見

國際予備審査の請求書を受領した日 21. 12. 2005	國際予備審査報告を作成した日 18. 01. 2006	
名称及びあて先 日本國際特許庁 (I P E A / J P) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区東千代 4 番 8 号	特許庁審査官 (指図のある職員) 梶野 智香 電話番号 03-3581-1101 内線 3492	4P 9048

様式 PCT/ I P E A / 409 (2005 年 1 月)

25 410

18-12-08;08:00PM:

11/ 15

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2005/004152

第I欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願
☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である _____ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
☐ 国際調査 (PCT規則13(a)及び13.1(a))
☐ 国際公開 (PCT規則14(a))
☐ 国際予備審査 (PCT規則52.2(a)又は55.2(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(附属5条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された若替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項、PCT1.9条の規定に基づき修正されたもの
第 _____ 項、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図、 _____ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 修正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した修正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その修正がされなかったものとして作成した。(PCT規則7C.2(a))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表 (具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に "superceded" と記入されることがある。

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2006/004152

第三編 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

次に關して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 17-20, 27-29

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 17-20, 27-29 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 17-20, 27-29 は「治療による人体の処置方法に関するもの」である。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲が、明細書による十分な高付けを欠くため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☒ 請求の範囲 17-20, 27-29 について、国際審査報告が作成されていない。

☐ 入手可能な配列表が存在せず、有意義な見解を示すことができなかった。

出願人は所定の期間内に、

☐ 実施規則の附属書Cに定める基準を満たす紙形式の配列表を提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法で配列表を入手することができなかった。

☐ 実施規則の附属書Cに定める基準を満たす電子形式の配列表を提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法で配列表を入手することができなかった。

☐ PCT規則13の1.(a)又は(b)及び13の1.2に基づく命令に応じた、要求された配列表の迅速提出手数料を支払わなかった。

☐ 入手可能な配列表に關連するテーブルが存在しないため、有意義な見解を示すことができなかった。すなわち、出願人が、所定の期間内に、実施規則の附属書Cの2に定める技術的な要件を満たす電子形式のテーブルを提出しなかったため、国際予備審査機関は、認められた形式及び方法でテーブルを入手することができなかった。

☐ ステレオ化学又はアミノ酸の配列表に關連するテーブルが電子形式のみで提出された場合において、当該テーブルが、実施規則の附属書Cの2に定める技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

2/ 412.

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2005/004152

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての請求12条(PCT35条(2))に定める見解、それに基づける文献及び説明

1. 見解			
新規性 (N)	請求の範囲	1-16, 21-26, 30-32	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲	1-16, 21-26, 30-32	有
	請求の範囲		無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-16, 21-26, 30-32	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献

- 1. WO 2003/000712 A1
- 2. JP 2003-12686 A
- 3. JP 2002-193948 A
- 4. JP 2001-354568 A

請求の範囲1-16, 21-26, 30-32に係る発明は、国際調査報告で引用された文献1-4に対して新規性・進歩性を有する。文献1-4には、ヒトSGLT2活性阻害作用を有し、高血糖症に起因する糖尿病の疾患の治療に有用な化合物或いは糖尿病に有用な化合物が記載されているが、本発明の一般式を有する化合物については、記載されていない。

そして、ヒトSGLT2活性阻害作用を有し、高血糖症の治療に有用である本発明の一般式(I)で表される化合物は、上記文献1-4から当業者といえども容易に想到し得ないものである。

28

413

2005年4月

特許性に關する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2005/004152

第VIII部 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付けについての意見を次に示す。

1) 請求の範囲に記載の「プロドラッグ」なる記載からは化合物の構造が明確に把握できず、その結果、化合物及びその各種医薬用途に関する本発明が不明確となっている。

2) 請求の範囲1のマーカッシュ形式で記載された化合物は、置換基として、特定の選択肢を多重に引用した記載となっており、結果として選択肢の数が膨大なものとなり、請求項の記載の簡潔性を欠いている。

また、本発明の化合物群の中、PCT6条の意味において明細書に裏付けられまた、PCT5条の意味において開示されているのは、グレースされた化合物のうちのごく一部のものにすぎず、上記のような膨大な選択肢を含む本発明の化合物或いは当該化合物を用いた医薬用途全体が明細書中に開示され、また裏付けられているとはいえない。

3) 請求項12, 22, 31の「高血糖症に起因する疾患」なる記載では疾患の範囲が明確に把握できないし、高血圧など、疾患は複合的な要因で起こることが一般的であるから、本明細書の記載及び技術常識を参酌しても、本発明の医薬が上記のあらゆる疾患に有効であると当業者が理解することはできない。また、請求の範囲に記載の広範な化合物群の全てが当該医薬用途に有効であると当業者は理解できない。

25

415

06-12-06;06:00PM:

15/ 15

特許性に関する国際予備報告

国際出願番号 PCT/JP2005/004152

補記欄

✓ 以下の欄の大きさが足りない場合

新 変換 欄の書き

国際特許分類 (IPC) の書き

A61P3/08 (2006.01), A61P3/10 (2006.01), A61P7/10 (2006.01), A61P9/10 (2006.01), A61P9/12 (2006.01),
A61P19/08 (2006.01)

国際出願番号 PCT/JP2005/004152

3/ 416 **TRATADO SOBRE COOPERACIÓN INTERNACIONAL EN MATERIA DE PATENTES**

Oficina que la Otorga: Oficina de Patentes de Japón (Autoridad Examinadora Preliminar Internacional)

Agente del Solicitante División de la Propiedad Intelectual Kissei Pharmaceutical Co., Ltd. Dirección 19-48, Yoshino, Matsumoto-shi, Nagano, Japan, 399-8710		PCT INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL (PCT Capítulo 2) (Regulaciones para el Cumplimiento de la Ley Artículo 57) (Regla PCT 71.1)	
		Fecha de Expedición (día/mes/año): 24 de enero de 2006 (24.01.2006)	
Referencia del archivo del solicitante o su agente PCT-A0510-00		Comunicación Importante	
Solicitud Internacional No. PCT/JP2005/004152	Fecha de solicitud Internacional: 03 de marzo de 2005 (03.03.2005)	Fecha de prioridad: 04 de marzo de 2004 (04.03.2004)	
Solicitante (Nombre o título de la compañía/departamento) Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.			

1. La Autoridad Examinadora Preliminar Internacional informa al solicitante que, en el evento de que un informe de examen preliminar internacional y documentos adjuntos en relación a la patentabilidad de esta solicitud internacional hayan sido producidos, dichos documentos serán enviados en compañía de esta modificación.
2. En el evento de que un Informe de examen preliminar internacional y documentos anexos hayan sido producidos, se enviarán copias al Departamento Internacional para notificar a todas las oficinas designadas.
3. Si cualquier oficina designada lo solicita, el Departamento Internacional producirá una traducción al Inglés del informe de examen preliminar internacional (excluyendo los documentos anexos) y lo enviará a la oficina designada relevante.
4. Notas
 El solicitante debe seguir el procedimiento prescrito (envío de documentos traducidos y pago de las tasas nacionales) con respecto a cada oficina designada dentro de un periodo de 30 meses a partir de la fecha de prioridad (o después dependiendo de la oficina). (PCT Artículo 39 Regla 1) (referirse al PCT/IB/301 y a las notas enviadas por el Departamento Internacional).

En el evento de que una traducción de la solicitud internacional se envíe a una oficina designada, la traducción debe incluir las traducciones de cualquier documento anexo al informe preliminar de examen internacional en relación a la patentabilidad. Es responsabilidad del solicitante producir dichas traducciones y enviarlas directamente a la oficina designada relevante.

Para el periodo y los requerimientos detallados aplicables a las oficinas designadas, referirse al Volumen II de la guía del solicitante PCT.

El solicitante deberá estudiar el Artículo 33, Regla 5 PCT, Los criterios para determinar si la invención es novedosa, inventiva y aplicable industrialmente, como se estipula en los Artículos 2 a 4 PCT, solo se utilizarán para el examen preliminar internacional. Al determinar la patentabilidad doméstica de la invención detallada en el enfoque de lo que se reclama, el Estado Contratante puede aplicar criterios diferentes o adicionales (referirse también al Artículo 27 Regla 5 PCT). Dichos criterios adicionales pueden incluir, por ejemplo, excluyendo los requerimientos de habilitación, clarificación del enfoque de la reivindicación o requerimientos de patentabilidad con respecto a evidencia de soporte.

Nombre y dirección de correo de la AEPI/JP Oficina de Patentes Japonesa (AEPI/JP) 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokio, 100-8915	Funcionario Autorizado Comisionado, Oficina de Patentes de Japón Teléfono No. 03-3581-1101 Ext. 3492
---	---

Formulario PCT/IPEA/409 (hoja de portada) (Abril de 2005)

32 417

**TRATADO SOBRE COOPERACIÓN INTERNACIONAL
EN MATERIA DE PATENTES**

PCT

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

No. de Expediente del Solicitante o Apoderado PCT-A0510-00	PROCEDIMIENTO POSTERIOR Véase Formulario PCT/IPEA/418	
No. Solicitud Internacional PCT/JP2005/004152	Fecha Internacional de Presentación (día/mes/año) 03 de marzo de 2005 (03.03.2005)	Fecha de Prioridad (día/mes/año) 04 de marzo de 2004 (14.03.2004)
Clasificación Internacional de Patente (IPC) o Clasificación Nacional e IPC Int. Cl. CO7H17/00 (2006.01), A61K31/7042 (2006.01), A61P3/04. (continua..)		
Solicitante Kissei Pharmaceutical Co., Ltd.		

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 <u>6</u> hojas, incluyendo esta portada
3. Este INFORME también viene acompañado de ANEXOS que comprenden: a. ☐ (enviados al solicitante y a la Oficina Internacional) un total de _____ hojas, como sigue: ☐ hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos que han sido corregidas y son la base para este Informe y/o hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Autoridad (ver regla 70.16 y Sección 807 de las Instrucciones Administrativas) ☐ hojas que sustituyen hojas anteriores, pero las cuales esta Autoridad considera contienen una corrección que va más allá de lo divulgado en la solicitud internacional como se presentó, según se indica en el ítem 4 de la casilla I y la Casilla Suplementaria. b. ☐ (enviados solamente a la Oficina Internacional) un total de _____ (Indique tipo y número de portador(es) electrónico(s)) _____ que contienen un listado de una secuencia y/o tablas relacionadas con el mismo, solo en forma legible por computador, como se indica en la casilla suplementaria Relacionada con el Listado de la Secuencia (ver Sección 802 de las Instrucciones Administrativas).
4. Este informe contiene datos con respecto a los siguientes puntos: ☒ Casilla No. I Base del Informe ☐ Casilla No. II Prioridad ☒ Casilla No. III Sin elaboración de un dictamen sobre novedad, actividad inventiva y posibilidad de aplicación industrial ☐ Casilla No. IV Uniformidad deficiente de la invención ☒ Casilla No. 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 ☐ Casilla No. VI Ciertos documentos enumerados ☐ Casilla No. VII Ciertas deficiencias del registro internacional ☒ Casilla No. VIII Ciertas observaciones relacionadas con la solicitud internacional

Fecha de presentación de la petición 21 de diciembre de 2005 (21.12.2004)	Fecha de la preparación de este informe 18 de enero de 2006 (18.01.2006)
Nombre y dirección postal de la IPEA/US Oficina de Patentes Japonesa (IPEA/JP) 3-4-3, Kasumigaseki, Chiyoda-ku, Tokio, 100-8915	Empleado Autorizado Ruka Fuchino Teléfono No. 03-351-1101 Ext. 3492

Formulario PCT/IPEA/409 (hoja de portada) (Abril de 2005)

27

INF RME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud Internacional No.
PCT/JP2005/004152

Casilla No. I Bases para este Informe.

1. Respecto al idioma, la base para el examen preliminar fue:

- ☒ Solicitud Internacional en el idioma en el que fue presentada originalmente
- ☐ Traducción de la solicitud internacional, traducida del idioma original al _____ para los objetos siguientes
- ☐ con el objeto de la búsqueda Internacional (Reglas 12.3(a) y 23.1(b))
- ☐ con el objeto de la solicitud internacional (Regla 12.4(a))
- ☐ con el objeto del examen preliminar internacional (bajo las Reglas 55.2 y/o 55.3)

2. Respecto a los elementos de la solicitud internacional:

(Las hojas de reemplazo que han sido presentadas a la Oficina receptora en respuesta a una invitación bajo el Artículo 14 se referencian en este informe como "presentadas originalmente" y no se anexan a este informe):

- ☒ La solicitud internacional como se presentó originalmente
- ☐ la descripción:
páginas _____ como se presentaron originalmente
páginas* _____ presentadas con la carta de _____
páginas* _____ presentadas con la carta de _____
- ☐ las reivindicaciones:
páginas _____ como se presentaron originalmente
páginas* _____ como se corrigieron (junto con cualquier declaración) bajo el Artículo 19
páginas* _____ presentadas con la carta de _____
páginas* _____ presentadas con la carta de _____
- ☐ Los dibujos:
Páginas/fig _____ como se presentaron originalmente
Páginas/fig* _____ presentadas con la carta de _____
Páginas/fig* _____ presentadas con la carta de _____
- ☐ Un listado de una secuencia y/o cualquier tabla relacionada – Ver Casilla Suplementaria relacionada con el Listado de la Secuencia.
3. ☐ Las correcciones han dado como resultado la cancelación de
- ☐ la descripción, páginas _____
- ☐ las reivindicaciones, Nos. _____
- ☐ los dibujos, hojas/figuras _____
- ☐ el listado de la secuencia _____
- ☐ cualquier tabla relacionada con el listado de la secuencia (especifique): _____
4. ☐ Este informe se ha establecido como si (algunas de) las correcciones anexas a este informe, y enumeradas debajo no se hubieran hecho, ya que se consideran como que van más allá de la divulgación, según se indica en la casilla Suplementaria (Regla 70.2(c))
- ☐ la descripción, páginas _____
- ☐ las reivindicaciones, Nos. _____
- ☐ los dibujos, hojas/figuras _____
- ☐ el listado de la secuencia _____
- ☐ cualquier tabla relacionada con el listado de la secuencia (especifique): _____

* Si el ítem 4 aplica, alguna de estas hojas pueden marcarse "sobrescridas"

INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL	Solicitud Internacional No. PCT/JP2005/004152
Casilla No. III Sin elaboración de un dictamen sobre novedad, nivel inventivo o aplicabilidad industrial.	
a cuestión de si la invención reivindicada parece ser novedosa, involucrar nivel inventivo (no ser obvia), o ser aplicable industrialmente no ha sido examinada respecto a:	
☐ la totalidad de la solicitud internacional, ☒ las reivindicaciones No. <u>17-20, 27-29</u> porque: ☒ dicha solicitud internacional, o dichas reivindicaciones No. <u>17-20, 27-29</u> se relaciona con la siguiente materia la cual no requiere un examen preliminar internacional (especificar): El enfoque de las reivindicaciones 17-20 y 27-29 es a un "método para el tratamiento médico del cuerpo humano"	
☐ la descripción, reivindicaciones o dibujos (<i>indicar elementos particulares debajo</i>) o dichas reivindicaciones No. son tan poco claras que no se puede formar una opinión coherente (especificar): ☐ las reivindicaciones, o dichas reivindicaciones No. _____ están sustentadas tan inadecuadamente por la descripción que no se puede formar una opinión significativa. ☒ no se ha establecido un informe de búsqueda internacional para dichas reivindicaciones No. <u>17-20, 27-29</u>	
☐ No fue posible proporcionar opiniones significativas como resultado de un listado de secuencias disponible Dentro del período designado, el solicitante: ☐ no presentó un listado de secuencias en formato escrito para satisfacer los requerimientos detallados en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, haciendo que la obtención de un listado de secuencias en un formato aprobado vía métodos aprobados fuese imposible ☐ no presentó un listado de secuencias en un formato electrónico suficiente para satisfacer los requerimientos dados en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, haciendo que la obtención de un listado de secuencias en un formato aprobado vía métodos aprobados fuese imposible ☐ no hizo pago de las tasas por la presentación tardía del listado de secuencias requerida de acuerdo con las Instrucciones detalladas en las reglas 13.3.1(a) o (b) y 13.3.2 ☐ las tablas relacionadas con el listado de la secuencia de nucleótidos y/o aminoácidos, si se presentan solo en forma legible por computador, no cumplen con los requerimientos técnicos proporcionados en el Anexo C-bis de las Instrucciones Administrativas. ☐ no fue posible formar ninguna opinión significativa como resultado de la falta de una tabla relacionada con el listado de secuencias. Como el solicitante no presentó una tabla en formato electrónico suficiente para satisfacer los requerimientos detallados en la sección 2 del Anexo C de las Instrucciones Administrativas, haciendo que la obtención de dicha tabla en un formato aprobado vía métodos aprobados fuese imposible ☐ ver Casilla Suplementaria para detalles adicionales.	

420

INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

No de Solicitud Internacional
PCT/JP2005/004152

Casilla No. V **Declaración concluyente de acuerdo a el Artículo 32(2) con relación a la novedad, el nivel inventivo o la aplicabilidad Industrial; citas y explicaciones**

1. DECLARACIÓN

Novedad (N)	Reivindicaciones <u>1-16, 21-28 y 30-32</u>	Si
	Reivindicaciones _____	No
Nivel Inventivo (IS)	Reivindicaciones <u>1-16, 21-28 y 30-32</u>	Si
	Reivindicaciones _____	No
Aplicabilidad Industrial (IA)	Reivindicaciones <u>1-16, 21-28 y 30-32</u>	Si
	Reivindicaciones _____	No

2. CITAS Y EXPLICACIONES (Regla PCT 70.7)

Documentos

1. WO 2003/000712 A1
2. JP 2003-12686 A
3. JP 2002-193948 A
4. JP 2001-354568 A

La invención relacionada con las reivindicaciones 1-16, 21-28 y 30-32 muestran novedad y progresividad con respecto a los documentos citados en el examen preliminar internacional 1-4. Los documentos 1-4 se refieren a compuestos que inhiben la SGLT2 humana activamente y que son efectivos en el tratamiento de enfermedades diabéticas que resultan de la hiperglicemia, y también compuestos que son efectivos contra la diabetes.

Aún desde el punto de vista de un experto, no es fácil llegar al componente indicado en la formula general (I) de la invención, el cual inhibe la SGLT2 humana activamente y que es efectivo en el tratamiento de la hiperglicemia, partiendo de los documentos 1-4 ya mencionados.

Casilla No. VIII Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional

Las siguientes son opiniones con respecto a la claridad del enfoque de lo reivindicado, la descripción y dibujos, o a la suficiencia de la evidencia de soporte basada en la descripción del enfoque de lo que se reivindica.

- 1) Como no es posible establecer una comprensión clara de la estructura del compuesto basándose en los detalles de la "promedicamento" contenida en el enfoque de lo que se reivindica, la invención no es clara con respecto al compuesto y sus usos farmacéuticos.
- 2) El compuesto descrito en el formato Markush en el enfoque de la reivindicación 1 cita varias alternativas específicas como su grupo sustituyente. El gran número de alternativas significa, como resultado, que detalles de ciertas secciones de la reivindicación no son lo suficientemente concisas.
- 3) No es posible establecer una comprensión clara del enfoque de las enfermedades a las que se refiere como "enfermedades que resultan de la hiperglicemia" bajo las secciones 12, 22 y 31 de la reivindicación. Además, como las enfermedades generalmente surgen por varias causas, como la hipertensión, aún permitiendo los detalles contenidos en la descripción y sentido común técnico, ningún experto creería que el medicamento incluido en esta invención pudiese ser efectivo contra todas las enfermedades ya mencionadas. Igualmente, ningún experto creería que cualquiera del amplio rango de compuestos incluidos en el enfoque de la reivindicación pudiesen ser efectivos con respecto a los usos farmacéuticos relevantes.

INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

No de Solicitud Internacional
PCT/JP2005/004152

Casilla suplementaria

Si al cualquiera de las casillas les falta espacio

Continuación de la página de la portada

Clasificación Internacional de Patentes (IPC) (continua)

A61P3/06 (2006.01), A61P3/10 (2006.01), A61P7/10 (2006.01), A61P9/10 (2006.01), A61P9/12 (2006.01), A61P19/06 (2006.01)