



No. 07-136791- -00003-0000

Fecha 2008-04-30 17:10:24 Dep. 2020 NULCREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eje 279 FASE NACIONAL II
Act 444 RESPUESTA REGULA Folios: 30

SEÑORES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref.: Expediente No. 07-136.791

Solicitud de Patente de Invención titulada: "FORMULACIONES FARMACÉUTICAS DE LIBERACIÓN INMEDIATA Y CON UNA CARGA DE DROGA ELEVADA DE (4-CLOROFENIL)[4-(4-PIRIDILMETIL)FTALAZIN-1-IL] NO MICRONIZADO, Y SUS SALES".

Solicitante: BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT.

Nuestra Ref.: P2007/000211

RESPUESTA AL OFICIO No. 2315 NOTIFICADO
POR FIJACION EN LISTA No. 41 DE FECHA 15 DE FEBRERO DE 2008.
(EXAMEN DE FORMA)

J. IAN RAISBECK, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito dar respuesta al auto proferido por ese Despacho, dentro del término de prórroga solicitado en mi memorial de fecha 28 de Marzo de 2008, en los siguientes términos:

1. En respuesta a la primera observación del Examinador, me permito adjuntar a la solicitud el documento de cesión debidamente legalizado, junto con su correspondiente traducción, según lo previsto en el Art. 26- k de la Decisión 486.
2. En respuesta a la segunda observación del Examinador, me permito aclarar al despacho que la presente solicitud entra en Fase Nacional Capítulo I y no Capítulo II como inicialmente se

~~145~~
2
150

presentó. Para tal efecto, adjunto copia del Reporte Preliminar Internacional de Patentabilidad, junto con su correspondiente traducción.

Atentamente,



J. IAN RAISBECK
C. C. N° 79.376.996 de Bogotá
T.P. 135.799 CSJ

Anexo: Documento de cesión
Reporte Preliminar Internacional de Patentabilidad

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	PLANILLA DE RADICACIÓN - DIGITALIZACIÓN DIARIA RELACIÓN DE ANEXOS			
Dependencia: PROPIEDAD INDUSTRIAL	Fecha: 1008 / 04 / 30 AAAA MM DD 13:10:29		Recorrido:	
Tipo de Radicación: Entrada: ☐ Salida: ☐ Traslado: ☐ Convenio: ☐				
Radicador:			Planilla:	

ID	No. Radicación	Consecutivo	Item
1	07-136791	151	16.
2			
3			
4			
5			
6			
7			
8			
9			
10			
11			
12			
13			
14			
15			
16			
17			

Item	Unidad de Conservación
1	Bolsa
2	Caja
3	Libro
4	Sobre
5	Tomo
6	Otro
Item	Soporte Documental
7	CD
8	Disquete
9	DVD
10	Folleto
11	Foto
12	Periódico
13	Plano
14	Publicación Periódica
15	USB
16	Otro

Observaciones:

Se encuentra 4 folios unidos con cinta roja y blanca de Documenta de cesión Assignment Document.

Protocolo No. R 750/2007

He explicado la prohibición de intervención según § 3 párrafo 1 No. 7 Ley de Documentación. A mi pregunta, si existe alguna versión previa en sentido de la norma, se contesto de forma negativa.

Yo certifico las firmas rendidas ante mi persona:

Del señor Dr. Torsten **W a g n e r**,

Nacido el 29 de marzo de 1962

Del señor Dr. Adrian **F u n k e**, nacido Serwe

Nacido el 13 de enero de 1972

- ambos conocidos en persona -

Del señor Dr. Kai **J ü r g e n s**,

Nacido el 11 de octubre de 1972

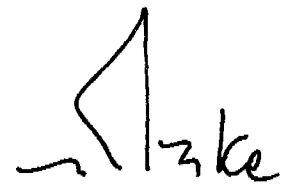
- identificado con presentación de su documento de identificación no.
2511136393

con domicilio de negocios en 13353 Berlín, Müllerstrasse 178.

Berlín, 5 de diciembre de 2007

Firma

Notario


Adolf Watzke
Traductor oficial
Res. 2433 Min. Justicia

151
8-153

Calculo de gastos según §§ 141, 154 reglamento de costos

Valor comercial: 12.000,00 Euros

Tarifa de legalización §§ 32,45 I	15,00 Euro
Tarifa de gestión § 58	15,00 Euro
Gastos papelería §§ 136, 152	2,00 Euro
Gastos correo §§ 137, 152	<u>1,45 Euro</u>
	33,45 Euro
19 % IVA	<u>6,36 Euro</u>
	39,81 Euro

Berlin, 5 de diciembre de 2007

Firma

Notario

Watzke

Adolf Watzke
Traductor oficial
Res. 2433 Min. Justicia

157
154

He explicado la prohibición de intervención según § 3 párrafo 1 No. 7 Ley de Documentación. A mi pregunta, si existe alguna versión previa en sentido de la norma, se contesto de forma negativa.

Yo certifico las firma rendida ante mi persona:

Del señor Dr. Thomas **Backensfeld**,

Nacido el 22 de diciembre de 1959

- conocido en persona -

con domicilio de negocios en 13353 Berlín, Müllerstrasse 178.

Berlín, 5 de febrero de 2008

Firma

Notario

Calculo de gastos según §§ 141, 154 reglamento de costos

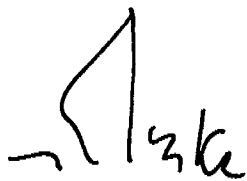
Valor comercial: 12.000,00 Euros

Tarifa de legalización §§ 32,45 I	15,00 Euro
Tarifa de gestión § 58	15,00 Euro
Gastos papelería §§ 136, 152	2,00 Euro
Gastos correo §§ 137, 152	<u>4,35 Euro</u>
	36,35 Euro
19 % IVA	<u>6,91 Euro</u>
	43,26 Euro

Berlín, 5 de febrero de 2008

Firma

Notario



Adolf Watzke
Traductor oficial
Res. 2433 Min. Justicia

155 153
110

APOSTILLA

(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. está firmado por Dimitri R e m p e n

3. en su calidad de Notario en Berlín

4. el documento está proveído con el sello del Notario

confirmado

5. en Berlín

6. el 8 de febrero de 2008

7. por el presidente de la audiencia provincial en Berlín

8. bajo el no. 9101 a E-F – 815/08

9. Sello:

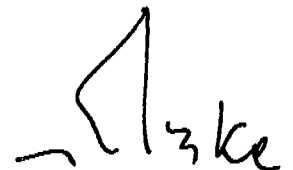
10. Firma

Por orden

Firma ilegible

Hartmann

Juez presidente de la audiencia



Adolf Watzke

Traductor oficial

Res. 2433 Min. Justicia

NOTARÍA 103

ARMANDO GÁLVEZ PÉREZ ARAGÓN

LA RATIFICACION DE FIRMA, QUE REALIZA ANTE MI EL SEÑOR KAI
THODE.

124,468

4,340

2,008

**DOCUMENTO DE CESIÓN
ASSIGNMENT DOCUMENT**

Los suscritos,
(We, the undersigned)

JUERGENS, Kai
con domicilio en Berlín, Alemania
(domiciled in)

BACKENSFELD, Thomas
con domicilio en Berlín, Alemania
(domiciled in)

WAGNER, Torsten
con domicilio en Berlín, Alemania
(domiciled in)

FUNKE, Adrian
con domicilio en Berlín, Alemania
(domiciled in)

THODE, Kai
con domicilio en Mexico
(domiciled in)



declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título
(declare that we are the inventors of the invention titled)

"FORMULACIONES FARMACÉUTICAS DE LIBERACIÓN INMEDIATA Y CON UNA
CARGA DE DROGA ELEVADA DE (4-CLOROFENIL)[4-(4-PIRIDILMETIL)FTALAZIN-1-
ILO] NO MICRONIZADO, Y SUS SALES"

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los
privilegios
(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its
privileges)

y anexidades a favor de
(and attachments, to)

BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT
Berlín, Rep. Fed. de Alemania

1)

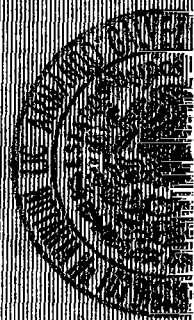
2)

3)

4)

5) -X *K. Thode*
Sr. Thode Kai

SIN TEXTO





156
13 158

--- LICENCIADO ARMANDO GALVEZ PEREZ ARAGON, Titular de la Notaría Pública Número Ciento Tres del Distrito Federal y Notario del Patrimonio Inmobiliario Federal, CERTIFICO: _____

--- Que ante mí compareció el señor **KAI THODE**, quien se identificó debidamente en los términos de ley y en mi presencia reconoció como suya la firma que calza el documento que antecede, por haber sido puesta de su puño y letra y manifestó que dicha firma es la misma que usa en todos y cada uno de sus actos jurídicos, en los términos del artículo ciento treinta y cinco de la Ley del Notariado para el Distrito Federal. _____

--- De lo anterior levanté acta en mi protocolo, bajo el número ciento veinticuatro mil cuatrocientos sesenta y ocho, de fecha diez de marzo del año dos mil ocho. DOY FE. ---

LICENCIADO ARMANDO GALVEZ PEREZ ARAGON
NOTARIO PUBLICO No. 103



GOBIERNO DEL DISTRITO FEDERAL
CONSEJERIA JURIDICA Y
DE SERVICIOS LEGALES
DIRECCION GENERAL JURIDICA
Y DE ESTUDIOS LEGISLATIVOS

SIN TEXTO

En Mexico el presente documento publico ha sido firmado
por LIT. ARMANDO GALVEZ PEREZ ABAGON.
quien actua en calidad de NOTARIO No. 103 DISTRITO FEDERAL.
y esta revestido del sello correspondiente a NOTARIA No. 103 DISTRITO FEDERAL, MEXICO.
Certificado en MEXICO, D.F. por NORMA LETICIA AGUIAR ESTRADA, JEFE DE LA UNIDAD DEPARTAMENTAL CONSULTIVA DE LA
SECRETARIA DE LA CONSEJERIA JURIDICA Y DE SERVICIOS LEGALES
el 14 de MARZO de 2008.

4175 No. Orden
Derechos \$ 57.00
(Convention de la Haya du 5 octobre 1961)
Apostille
D. F.

GOBIERNO DEL DISTRITO FEDERAL
CONSEJERIA JURIDICA Y
DE SERVICIOS LEGALES
Dirección General Jurídica
y de Asesoría Legal
México, D.F.

ESTADO LIBRE UNIDO MEXICANO

Firma
aemb-E0895960



TRATADO DE COOPERACIÓN INTERNACIONAL EN MATERIA DE PATENTES

Del ORGANISMO DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

PCT

A

ver formulario PCT/ISA/220

INFORME ESCRITO
DEL ORGANISMO DE
BÚSQUEDA INTERNACIONAL

(regla PCT N° 43bis.1)

Fecha de envío (día/mes/año)

ver formulario PCT/ISA/210 (hoja 2)

Referencia del Solicitante o Agente

ver formulario PCT/ISA/220

PROCEDER

Ver abajo, punto 2

Referencia Internacional

PCT/EP 2006/005600

Fecha de Presentación Internacional
(día/mes/año)

06.06.2006

Fecha de Prioridad
(día/mes/año)

07.06.2005

Clasificación Internacional de Patentes (IPK) o clasificación nacional e IPK
INV. A61K31/502, A61K9/16, A61K9/20, A61K9/28, A61P35/00

Solicitante

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT

1. Este informe contiene indicaciones acerca de los siguientes puntos:

- ☒ Campo N° I Fundamento del informe
- ☐ Campo N° II Prioridad
- ☒ Campo N° III No realización de dictamen alguno sobre novedad, actividad inventiva y aplicabilidad Industrial
- ☐ Campo N° IV Falta de unidad de la invención
- ☒ Campo N° V Declaración fundada según regla PCT 43bis.1(a)(i) con respecto a la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad Industrial; documentos y declaraciones destinados a apoyar esta resolución.
- ☐ Campo N° VI Documentos específicos expuestos
- ☐ Campo N° VII Falencias específicas de la solicitud internacional
- ☐ Campo N° VIII Observaciones específicas a la solicitud internacional

2. PROCEDER

Cuando se solicita un Examen Preliminar Internacional, este informe es válido como informe escrito del organismo encargado de la búsqueda internacional ("IPEA"); esto no es así cuando, según la regla 66.1bis(b), el solicitante elige otro organismo distinto a este como IPEA y el IPEA elegido informó a la Oficina Internacional que los informes escritos de este organismo de búsqueda internacional no serán reconocidos.

Cuando este informe es válido como informe escrito de IPEA, tal como está previsto arriba, el solicitante es intimado a presentar ante IPEA una posición por escrito, y cuando corresponde, modificaciones, en el plazo de 3 meses a partir de la fecha en la que fue remitido el formulario PCT/ISA/220 o en el plazo de 22 meses a partir de la fecha de prioridad, según el plazo que venza más tarde.

Para otras opciones, ver formulario PCT/ISA/220.

3. Para otros detalles, ver las instrucciones del formulario PCT/ISA/220.

Nombre y Dirección Postal del ISA
Oficina de Patentes Europea
D-80298 München
Tel.: +49 89 2399; Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Formulario PCT/ISA/237 (carátula) (abril 2005)

Fecha de confección de
este informe:
ver formulario
PCT/ISA/210

Funcionario autorizado

Borst, Markus

Teléfono N° +49 89 1399 - 8648

**INFORME ESCRITO DEL
ORGANISMO DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL**

Referencia Internacional
PCT/EP 2006/005600

Campo Nº I Fundamento del Informe

1. Con respecto al idioma, el informe se basa sobre
- ☒ La solicitud internacional en el idioma en que fue presentada
 - ☐ una traducción del idioma original al siguiente idioma , el que se trata del idioma de la traducción presentada a los efectos de la búsqueda internacional (según las reglas 12.3 y 23.1 b)).
2. Con respecto a la **secuencia de nucleótidos y/o aminoácidos** revelada en la solicitud internacional y requerida para la invención reivindicada, el informe fue confeccionado sobre la siguiente base:
- a. Tipo de material
 - ☐ listado de secuencias
 - ☐ tablas del listado de secuencias
 - b. Forma del material
 - ☐ en forma escrita
 - ☐ en forma legible por computadora
 - c. Momento de la presentación
 - ☐ comprendido en la presentación internacional tal como fue presentada
 - ☐ presentado, junto con la solicitud internacional, en forma legible por computadora
 - ☐ suministrado posteriormente ante el organismo a los efectos de la búsqueda
3. ☐ Habiendo presentado más de una versión o copia de un protocolo de secuencias y/o la tabla correspondiente se deben presentar adicionalmente las declaraciones requeridas de que la información de las copias presentadas posteriormente o adicionales coincide con la versión original de la solicitud o que no la supera.
4. Observaciones adicionales

**INFORME ESCRITO DEL
ORGANISMO DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL**

Referencia Internacional
PCT/EP 2008/005600

Campo Nº III **No confección de un Informe con respecto a la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad Industrial**

La cuestión acerca de si la invención reivindicada parece ser novedosa, involucra actividad inventiva (no obvia) o es aplicable industrialmente no fue examinada con respecto a:

- ☐ toda la solicitud internacional
- ☒ las reivindicaciones Nº: 63

porque

- ☒ las mencionadas solicitud internacional completa o reivindicaciones Nº: 63 se refieren al siguiente objeto, el que no requiere un examen preliminar internacional (especificar):

ver hoja adjunta

- ☐ la descripción, reivindicaciones o ilustraciones (indicar elementos particulares abajo) o las mencionadas reivindicaciones Nº: son tan poco claras que no se puede confeccionar un informe coherente (especificar):
- ☐ las reivindicaciones o las mencionadas reivindicaciones Nº: está apoyadas tan inadecuadamente por la descripción que no se puede confeccionar un informe coherente.
- ☐ no se confeccionó ningún informe de búsqueda para toda la solicitud o para las mencionadas reivindicaciones.
- ☐ no se pudo confeccionar un informe coherente sin el listado de secuencias; el solicitante, en el plazo prescripto:
- ☐ no suministró sobre papel un listado de secuencias que cumpla con el estándar provisto para ello en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, y tal listado no estaba disponible para el Organismo de Búsqueda Internacional en un formulario y manera aceptable.
- ☐ no suministró en forma electrónica un listado de secuencias que cumpla con el estándar provisto para ello en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, y tal listado no estaba disponible para el Organismo de Búsqueda Internacional en un formulario y manera aceptable.
- ☐ no pagó la tasa requerida por la presentación tardía de un listado de secuencias en respuesta a una invitación según las reglas 13ter.1(a) o (b).
- ☐ no se pudo confeccionar un informe coherente sin las tablas relacionadas con el listado de secuencias; el solicitante no suministró en el plazo prescripto tales tablas en forma electrónica para cumplir con los requisitos técnicos provistos para ello en el Anexo C de las Instrucciones Administrativas, y tal listado no estaba disponible para el Organismo de Búsqueda Internacional en un formulario y manera aceptable.
- ☐ las tablas relacionadas con el listado de secuencias de nucleótidos y/o aminoácidos, si están sólo en forma legible por computadora, no cumplen con los requerimientos técnicos provistos por el Anexo C-bis de las Instrucciones Administrativas.
- ☐ para otros detalles, ver campo suplementario

**INFORME ESCRITO DEL
ORGANISMO DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL**

Referencia Internacional
PCT/EP 2006/005600

167
162
161

Campo N° V Resolución fundada según regla PCT 43bis.1(a)(i) con respecto a la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad industrial; documentos y declaraciones destinados a apoyar esta resolución

- | | | | | |
|----|----------------------------|----|-------------------|-----------------|
| 1. | Resolución | | | |
| | Novedad | Si | Reivindicaciones: | 1-63 |
| | | No | Reivindicaciones: | |
| | Actividad inventiva | Si | Reivindicaciones: | 35, 37-57 |
| | | No | Reivindicaciones: | 1-34, 36, 58-63 |
| | Aplicabilidad industrial | Si | Reivindicaciones: | 1-62 |
| | | No | Reivindicaciones: | |
| 2. | Menciones y declaraciones: | | | |
| | ver hoja adjunta | | | |

163
20
163

Con respecto al ítem III

No realización de dictamen alguno sobre novedad, actividad inventiva y aplicabilidad industrial

1. Objetos excluidos del examen preliminar internacional

Regla PCT 67.1(iv):

La reivindicación 63 se orienta a un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante una terapia y, en consecuencia, se refieren a un objeto considerado por este Organismo como cubierto por los preceptos de la regla PCT 67.1(iv). Por lo tanto, no se confecciona ningún informe en la sección V con respecto a la aplicabilidad industrial del objeto de estas reivindicaciones (artículo PCT 34(4)(a)(i)).

2. Claridad (artículo PCT 6)

2.1. Las reivindicaciones no son claras. La expresión "**no micronizado**", tal como se utiliza en la presente reivindicación, otorga un significado especial, diferente del generalmente aceptado en el estado de la técnica (cotejar página 6, primer párrafo). La contradicción conduce a una carencia de claridad para el ámbito de protección presentado en las reivindicaciones.

En tal caso, la definición particular (*poseer un D_{90} de al menos $50 \mu\text{m}$ determinado a partir de la curva de distribución en volumen, presuponiendo que sean partículas esféricas y se utilicen difracción de láser y las condiciones expuestas en la sección titulada "Determination of particle size distribution"*) constituye parte de las reivindicaciones independientes.

2.2. Las realizaciones de la invención de acuerdo con los ejemplos **4 y 8** no caen en ámbito de las reivindicaciones. Esta inconsistencia entre las reivindicaciones y la descripción conduce a una duda concerniente a la extensión de la protección presentada en las reivindicaciones, haciendo carentes de claridad a las reivindicaciones. Se requiere del solicitante la remoción de la inconsistencia, sea por enmienda de las reivindicaciones o eliminando de la descripción y las ilustraciones las correspondientes realizaciones (cotejar también *Guidelines*, C-III, 4.3(iii)).

Con respecto al ítem V

Declaración fundada según regla PCT 66.2(a)(ii) con respecto a la novedad, la actividad inventiva y la aplicabilidad industrial; menciones y declaraciones destinadas a apoyar esta resolución.

1. Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1: WO 98/35958 A (NOVARTIS AG; NOVARTIS-ERFINDUNGEN VERWALTUNGSGESELLSCHAFT M.B.H.; BOLD,) 20 de agosto de 1998 (1998.08.20)

D2: BOLD G ET AL: "CGP 797870 (PTK787/ZK222584), CGP 84738, NVP-AAC789, NVP-AAD777 AND RELATED 1-ANILINO-(4-PYRIDYMETHYL)PHTHALAZINES AS INHIBITORS OF VEGF- AND BFGF-INDUCED ANGIOGENESIS" DRUGS OF TGE FUTURE, BARCELONA, ES, vol. 27, N° 1, 2002, páginas 43-55, XP008018115, ISSN: 0377-8282

169
169
21

Se adhiere a la numeración en el resto del procedimiento.

1. Novedad (artículo PCT 33(2))

El objeto de las presentes reivindicaciones parece ser novedoso a la luz del estado de la técnica disponible.

D1 (ejemplo 87) da a conocer una composición que consiste en 0,7 % de pinasunato micronizado y 0,5 % hidroxipropilcelulosa en agua, estando el tamaño medio de la partícula de pinasunato en un rango entre aproximadamente 3 a 12 μm .

La composición de D1 aparentemente no es sólida y los valores d_{90} y d_{50} son inferiores a 15 μm .

D2 (figura 5; tabla III) da a conocer vatalanib, pero no una formulación del mismo.

2. Actividad inventiva (artículo PCT 33(3))

2.1. El objeto de las reivindicaciones independientes 1 y 58 no involucra una actividad inventiva.

Como se aprecia en los datos experimentales de la presentación (ejemplo comparativo 1-3 vs. 4), seleccionando un tamaño partícula d_{90} en el rango 119 a 169 μm e inferior a 374 μm se resuelve el problema de la liberación rápida/inmediata. Más aún, los datos (ejemplo 5-7. 9 vs. 8) muestran que los gránulos producidos por granulación vía húmeda pueden ser comprimidos satisfactoriamente en formas dosificables exhibiendo las propiedades de liberación deseadas, en tanto que una formulación consistente en 100 % de agente activo no micronizado no puede ser convertida en una forma dosificable debido a problemas de adhesividad. La adhesión a los equipos productivos es uno de los problemas básicos en la solicitud presentada (página 3, renglón 27 - página 4, renglón 5) que se intenta resolver con la invención acorde con las reivindicaciones. Las reivindicaciones independientes 1 y 58 están orientadas a composiciones que pueden contener hasta 100 % de ingrediente activo y, por lo tanto, abarcan la realización insatisfactoria acorde con el ejemplo 8 de la presentación. En tanto dichas reivindicaciones no restrinjan la proporción de agente activo a menos de 100 %, por ejemplo, definiendo un *rango de 50 a 95 % en la cantidad de droga* (cotejar página 7, renglones 19-23) o requiriendo la *presencia de un excipiente* (cotejar página 8, renglones 12-17), (una parte de) el problema planteado no está resuelto para todo el ámbito de las reivindicaciones. Al no estar resuelto el problema, no se puede reconocer actividad inventiva.

2.2. Una vez que las reivindicaciones estén definidas de manera de resolver el problema en todo el ámbito de la invención, parece darse la actividad inventiva.

La solicitud presentada (página 3, renglón 27 – página 4, renglón 28) está orientada al problema de formular satisfactoriamente vatalanib en formas dosificadas que proveen una liberación inmediata y una elevada carga de droga. Tal problema se resuelve mediante el uso de vatalanib "no micronizado" junto con un excipiente.

**INFORME ESCRITO DEL
ORGANISMO DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL
(HOJA ADJUNTA)**

Solicitud Internacional N°

PCT/EP 2006/005600

Ninguno de los documentos disponibles en el estado de la técnica apunta al problema mencionado ni a la solución definida con la solicitud.

PCT

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

(PCT Rule 44bis)

156 116
AB

Applicant's or agent's file reference 53311AWO	FOR FURTHER ACTION	See item 4 below
International application No. PCT/EP2006/005600	International filing date (<i>day/month/year</i>) 06 June 2006 (06.06.2006)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 07 June 2005 (07.06.2005)
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237		
Applicant BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a).

2. This REPORT consists of a total of 8 sheets, including this cover sheet.

In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.

3. This report contains indications relating to the following items:

- | | |
|---|---|
| ☒ Box No. I | Basis of the report |
| ☐ 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 |

4. The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).

Date of issuance of this report
11 December 2007 (11.12.2007)

Authorized officer

Ellen Moyse

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail: pt05.pct@wipo.int

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

~~167~~
PCT 167 24

To:

see form PCT/ISA/220

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY
(PCT Rule 43b/s.1)

Date of mailing
(day/month/year) see form PCT/ISA/210 (second sheet)

Applicant's or agent's file reference
see form PCT/ISA/220

FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 below

International application No.
PCT/EP2006/005600

International filing date (day/month/year)
06.06.2006

Priority date (day/month/year)
07.06.2005

International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC
INV. A61K31/502 A61K9/16 A61K9/20 A61K9/28 A61P35/00

Applicant
SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT

1. This opinion 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 Rule 43b/s.1(a)(i) 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

2. FURTHER ACTION

If a demand for international preliminary examination is made, this opinion will usually be considered to be a written opinion of the International Preliminary Examining Authority ("IPEA") except that this does not apply where the applicant chooses an Authority other than this one to be the IPEA and the chosen IPEA has notified the International Bureau under Rule 66.1bis(b) that written opinions of this International Searching Authority will not be so considered.

If this opinion is, as provided above, considered to be a written opinion of the IPEA, the applicant is invited to submit to the IPEA a written reply together, where appropriate, with amendments, before the expiration of 3 months from the date of mailing of Form PCT/ISA/220 or before the expiration of 22 months from the priority date, whichever expires later.

For further options, see Form PCT/ISA/220.

3. For further details, see notes to Form PCT/ISA/220.

Name and mailing address of the ISA:



European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523655 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4465

Date of completion of
this opinion

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Borst, Markus

Telephone No. +49 89 2399-8648



**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

168 168
International application No.
PCT/EP2006/005600
25

Box No. 1 Basis of the opinion

1. With regard to the **language**, this opinion has been established on the basis of:
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1 (b)).
2. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this opinion has been established on the basis of:
 - a. type of material:
 - ☐ a sequence listing
 - ☐ table(s) related to the sequence listing
 - b. format of material:
 - ☐ on paper
 - ☐ in electronic form
 - c. time of filing/furnishing:
 - ☐ contained in the international application as filed.
 - ☐ filed together with the international application in electronic form.
 - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purposes of search.
3. ☐ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
4. Additional comments:

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

159 169
International application No.
PCT/EP2006/005600

Box No. 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. 63

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 63 (no examination as to industrial applicability) relate to the following subject matter which does not require an international search (specify):

see separate sheet

☐ the description, claims or drawings (Indicate particular elements below) or said claims Nos. are so unclear that no meaningful opinion could be formed (specify):

☐ the claims, or said claims Nos. are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed (specify):

☐ no international search report has been established for the whole application or for said claims Nos.

☐ a meaningful opinion could not be formed without the sequence listing; the applicant did not, within the prescribed time limit:

☐ furnish a sequence listing on paper complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ furnish a sequence listing in electronic form complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ pay the required late furnishing fee for the furnishing of a sequence listing in response to an invitation under Rules 13ter.1(a) or (b).

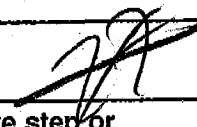
☐ a meaningful opinion could not be formed without the tables related to the sequence listings; the applicant did not, within the prescribed time limit, furnish such tables in electronic form complying with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions, and such tables were not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in electronic form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.

☐ See Supplemental Box for further details

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

170 170
International application No.
PCT/EP2006/005600


Box No. V Reasoned statement under Rule 43*bis*.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or
industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	1-63
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	35,37-57
	No: Claims	1-34, 36, 58-63
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-62
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Re Item III

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

**1. Subject-matter excluded from international preliminary examination
(Rule 67.1(iv) PCT)**

Claim 63 is directed to a method for the treatment of the human or animal body by therapy and, thus, relates to subject-matter considered by this Authority to be covered by the provisions of Rule 67.1(iv) PCT. Consequently, no opinion will be formulated under Section V with respect to industrial applicability of the subject-matter of this claim (Article 34(4)(a)(i) PCT).

2. Clarity (Article 6 PCT)

- 2.1. The claims are not clear. The term "**non-micronized**" as used in the present claims is given a particular meaning different from that generally accepted in the art (cf. page 6, 1st para). This contradiction leads to a lack of clarity as to the scope of protection afforded by the claims. In such a case the particular definition (*having a d_{90} of at least 50 μm as determined from the volume distribution curve under the presumption of spherical particles using laser diffraction and the conditions set forth in the section entitled "Determination of particle size distribution"*) is to be made part of the independent claims.
- 2.2. The embodiments of the invention according to **example 4 and 8** does not fall within the scope of the claims. This inconsistency between the claims and description leads to a doubt concerning the extent of the protection afforded by the claims, thus rendering the claims unclear. The Applicant is requested to remove the inconsistency, either by amending the claims, or by deleting the embodiment/s concerned from the description and drawings (cf. also the Guidelines, C-III, 4.3(iii)).

Re Item V

Reasoned statement under Rule 66.2(a)(ii) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

Documents (D) considered to be relevant to novelty and inventive step

D1: WO 98/35958 A (NOVARTIS AG; NOVARTIS-ERFINDUNGEN VERWALTUNGSGESELLSCHAFT)

WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)

172 172
International application No.

PCT/EP2006/005600

M.B.H; BOLD,) 20 August 1998 (1998-08-20)

D2: BOLD G ET AL: "CGP 79787D (PTK787/ZK222584), CGP 84738, NVP-AAC789, NVP-AAD777 AND RELATED 1-ANILINO-(4-PYRIDYLMETHYL)PHTHALAZINES AS INHIBITORS OF VEGF- AND BFGF-INDUCED ANGIOGENESIS" DRUGS OF THE FUTURE, BARCELONA, ES, vol. 27, no. 1, 2002, pages 43-55, XP008018115 ISSN: 0377-8282

The numbering will be adhered to in the rest of the procedure.

1. **Novelty (Article 33(2) PCT)**

The subject-matter of the present claims appears to be new in the light of the prior art available.

D1 (example 87) discloses a composition consisting of 0.7% micronized pynasunate and 0.5% hydroxypropylcellulose in water, the mean particle size of pynasunate being 5 μm within a range of about 3 to 12 μm .

The composition of D1 is apparently not solid and the d_{90} and d_{50} values are below 15 μm .

D2 (figure 5; table III) does disclose vatalanib, but not a formulation thereof.

2. **Inventive step (Article 33(3) PCT)**

2.1. The subject-matter of independent **claims 1 and 58** does not involve an inventive step.

As shown with the experimental data on file (example 1-3 vs. 4), by selecting a particle size d_{90} in the range of 119 to 169 μm and below 374 μm the problem of fast/immediate release is solved. Moreover, the data (example 5-7, 9 vs. 8) show that granules produced via wet granulation can be successfully compressed into dosage forms showing the desired release properties, whereas a formulation consisting of 100% non-micronized active agent cannot be converted into a dosage form due to problems of stickiness. Adhesion to production equipment is one of the basic problems the application on file (page 3, line 27 - page 4, line 5) intends to solve with the invention according to the claims. Independent claims 1 and 58 are directed to compositions that may contain up to 100% of active ingredient and, thus, encompass the not successful embodiment according to example 8 on file. As long as said claims do not restrict the proportion of active agent to below 100%, e.g. by defining a *range of 50 to 95% for the amount of drug* (cf. page 7, line 19-23) or by requiring the *presence of an excipient* (cf. page 8, line 12-17), (part of) the problem posed is not solved for the whole scope of the claims. The problem not being solved, inventive

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

~~77~~ 173
International application No.

PCT/EP2006/005600
30

step cannot be acknowledged.

- 2.2. Once the claims are defined such as to solve the problem over the whole scope, inventive step appears to be given.

The application on file (page 3, line 27 - page 4, line 28) is directed to the problem of successfully formulating vatalanib into dosage forms providing immediate release and high drug load. Said problem is solved by the use of "non-micronized" vatalanib together with an excipient.

None of the prior art documents available points to the above problem nor to the solution defined with the application.

129

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Folio 174

2020
Bogotá D.C.,

Doctor(a)
RAISBECK J. IAN
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	7 136791
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/005600
	Fecha inicio fase nacional	07/01/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	7290
	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,

15 DIC. 2008

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

adpall