

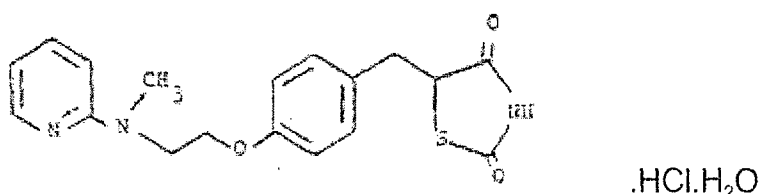
RESOLUCIÓN Nº 25365

Exp. N° 00028928

1. Objeto de la invención

La invención propone:

En las reivindicaciones 1 - 6, 9 y 10, monohidrato de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona de fórmula:



En la reivindicación 7 un proceso para preparar el monohidrato de la reivindicación 1, caracterizado porque se trata: (a) un compuesto de la reivindicación 1 con una fuente de iones clorhidrato en ácido acético; (b) una suspensión de un compuesto de la reivindicación 1 con una fuente de iones clorhidrato en un solvente orgánico a una temperatura de 20 - 30 °C, ó (c) una solución de un compuesto de la reivindicación 1 con una fuente de iones clorhidrato en un solvente orgánico. Inducir la cristalización y recuperar el compuesto requerido.

En la reivindicación 8 una composición que contiene un hidrato de la reivindicación 1 y un vehículo.

En la reivindicación 11 el uso del hidrato.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de proporcionar un nuevo producto farmacéutico, para tratamiento y/o profilaxis de diabetes mellitus.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona el monohidrato de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona.

2. Determinación del estado de la técnica

2.1 Fecha determinante para el análisis comparativo

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 20 de abril de 1999, que corresponde a la fecha de la prioridad reclamada con respecto a la solicitud GB 9909075.5. La fecha de la prioridad fue tomada en cuenta para el estudio de patentabilidad, según obra a folios 111 y 126 del expediente en estudio.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° 25365
Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

2.2 Documentos del estado de la técnica

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de la prioridad invocada y relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

No.	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	EP 0 306 228	Derivados de Tiazolidindiona sustituidos	Mar 8, 1989
D2	WO 94 05659	Derivados de Tiazolidindiona sustituidos	Mar 17, 1994
D3	WO 95 210608	Uso de sensibilizadores de insulina para tratar enfermedades renales	Ag. 17, 1995

3. Novedad

El artículo 16 de la Decisión 486 establece que "una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica".

En la misma disposición se establece que "el estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público, por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".

En reciente fallo, el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha dicho sobre la novedad que:

"Concretando aún más el concepto de novedad como requisito de las invenciones, este Tribunal ha precisado el concepto de novedad absoluta como requisito esencial para la concesión de una patente, de la siguiente manera:

"El concepto de novedad absoluta respecto de una invención implica que para que un invento sea nuevo y no se encuentre en el estado de la técnica, no puede haber sido conocido ni dentro del territorio en el que se solicita la patente, ni en ningún otro país. Es lo que se conoce como el alcance universal de la novedad, pues no basta que un invento sea nuevo y no esté en el estado de la técnica de un territorio dado, sino que tampoco lo esté en el resto del mundo, salvo el año de prioridad a que se refiere el artículo 12 de la Decisión 344. La novedad absoluta, como criterio para determinar la patentabilidad de una invención, se ha venido abriendo camino en el ámbito internacional. Así en el Reino Unido a partir de 1977 (Patents Act inglesa). En la República Federal Alemana se empezó a exigir la novedad absoluta



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 25365

Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

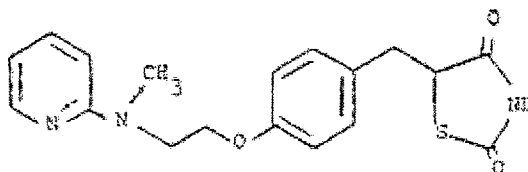
a partir de la Ley de 16 de diciembre de 1980. En la actualidad, en los Estados Miembros de las Comunidades Europeas se ha impuesto la exigencia de la novedad absoluta como una de las consecuencias de las patentes europeas, según Tratado de Munich de 5 de Octubre de 1963. (Bercovitz, Alberto, "PROTECCIÓN DE LA TECNOLOGÍA", en Revista del Derecho Industrial N° 35, Depalma 1990, pág. 321)." (Proceso N° 1-AI-1996. Sentencia de 30 de octubre de 1996, publicada en Gaceta Oficial del Acuerdo de Cartagena N° 234 de 21 de abril de 1997).

"Una vez delimitado el concepto de novedad, es pertinente destacar que el Tribunal ha definido algunas reglas con el objetivo de determinar la novedad del invento:

- a) Concretar cual es la regla técnica aplicable a la solicitud de la patente, para lo cual el examinador técnico deberá valerse de las reivindicaciones, que en últimas determinarán este aspecto.
- b) Precisar la fecha con base en la cual deba efectuarse la comparación entre la invención y el Estado de la Técnica, la cual puede consistir en la fecha de la solicitud o la de la prioridad reconocida.
- c) Determinar cuál es el contenido del Estado de la Técnica (anterioridades) en la fecha de prioridad.
- d) Finalmente deberá compararse la invención con la regla técnica."¹

En el presente caso, una vez efectuado el análisis comparativo siguiendo las reglas definidas por el Tribunal andino, se estableció que la materia reclamada en la presente solicitud fue anticipada en las anterioridades D1, D2 y D3, es decir, la invención se encontraba en el estado del arte previo.

En efecto, D1 enseña de manera previa el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona de fórmula:



.HCl.H₂O

Enseña, además, que dentro de los solvatos farmacéuticamente aceptables se incluyen los hidratos (página 43). Y menciona las sales farmacéuticamente aceptables y los solvatos farmacéuticamente aceptables de estos compuestos (Ver reivindicación 1). El ejemplo 30 enseña el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)

¹TRIBUNAL DE JUSTICIA DE LA COMUNIDAD ANDINA, Proceso 88-IP-2005, sentencia de interpretación prejudicial del 26 de julio del 2005.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 25365

Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona (ver folio 74) y también se incluye en la reivindicación 12 que enseña el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona y sus sales y solvatos farmacéuticamente aceptables (ver folio 78). La reivindicación 14 enseñaba una composición que contiene este compuesto y un vehículo.

D2 enseña *de manera previa* la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona (ver página 2). La página 10 enseña una composición que contiene este compuesto y un vehículo. Se enseña un proceso para preparar un polimorfo que se caracteriza porque el compuesto se disuelve en etanol a elevada temperatura y luego se enfría de manera que se produce la cristalización del polimorfo, después de lo cual se recuperan los cristales (ver página 8, ejemplo 2).

Y, D3 enseña *de manera previa* la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona, sus formas tautómeras y las sales farmacéuticamente aceptables, incluyendo la sal del ácido clorhídrico, y los solvatos farmacéuticamente aceptables de este compuesto (ver páginas 4 y 6).

Se observa, entonces, que el compuesto de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona de las reivindicaciones 1 - 6, 9, 10 de esta solicitud, ya se había obtenido en D1, D2 y D3. Se aclara, además, que el ser un polimorfo es una característica inherente al compuesto y el hecho de definirla ahora en esta solicitud no lo hace nuevo, de manera que el compuesto reivindicado definitivamente no es nuevo.

Con referencia a la reivindicación 8 que se refiere a una composición que contiene un compuesto de la reivindicación 1 y un vehículo, se observa que debido a que el compuesto que caracteriza a la composición no es nuevo, tampoco lo es la composición. Además, esta composición ya se había enseñado en D1 y D2, de manera que no es nueva.

Dado lo anterior, no cabe duda que la invención propuesta en las reivindicaciones 1 a 6, 8, 9 y 10 se considera dentro del estado de la técnica definido en el mencionado artículo 16 de la Decisión 486 y, por ello, no es nueva y consecuentemente no puede acceder al privilegio solicitado.

4. Nivel inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma Decisión 486, "se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° 25365
Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

El estado de la técnica, al tenor de lo dispuesto en el artículo 16 de la misma Decisión, comprende "todo lo que haya sido accesible al público, por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".

El Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina recientemente ha dicho sobre este requisito, lo siguiente:

"El artículo 4 de la Decisión 344, al referirse al nivel inventivo manifiesta, que éste se considera que existe *"si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*.

"Según el tratadista José Antonio Gómez Segade, el inventor debe acreditar los méritos que le tornen al invento susceptible de ser amparado por una patente; en tal sentido, sólo si la invención fruto de su investigación y desarrollo creativo constituye "un salto cualitativo en la elaboración de la regla técnica", actividad intelectual mínima que le permitirá que su invención no sea evidente (no obvia) del estado de la técnica, le posibilitará alcanzar tal propósito. Es decir que, con el requisito del nivel inventivo, lo que se pretende es dotarle al examinador técnico de un elemento que le permita concluir que a la invención objeto de estudio no se habría podido llegar a partir de los conocimientos técnicos existentes en ese momento dentro del estado de la técnica, con lo cual la invención se constituye en un "paso" más allá de lo existente.

"En consecuencia, el nivel inventivo se configura en consideración de dos elementos:

- a) el estado de la técnica y,
- b) la persona experta en la técnica incorporada en el invento cuya protección se solicita, quien, mediante el examen integral que lleve a cabo de la respectiva descripción, debe determinar si dicha innovación es o no susceptible de ser legalmente patentada.

"Sobre este tema Daniel Zuccherino ha sostenido que:

"El *estado de la técnica* es el conjunto de elementos técnicos que se han hecho públicos antes de la fecha de presentación de la patente,

"El *experto en la técnica* es una figura ficticia a la que se recurre con el propósito de obtener un parámetro objetivo que permita distinguir la actividad verdaderamente inventiva de la que no lo es. Se tratará de una persona normalmente versada en el ámbito tecnológico a que se refiere el pretendido

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° 25365
Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

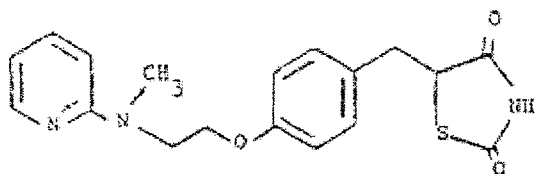
invento. Su nivel de conocimientos es más elevado en comparación con el nivel de conocimientos del público en general, pero no excede lo que puede esperarse de una persona debidamente calificada. Se busca la figura de un técnico de conocimientos medios, pero no especializados².

“El mismo autor ha dicho:

“Se reconoce que hay invento cuando se utilizan medios ya conocidos, pero combinados por primera vez en forma tal, que de su combinación deriva un resultado distinto del dado por cada uno de los medios, o por otras combinaciones conocidas... También existe la posibilidad de que el resultado sea conocido, pero se llegue a él a través de nuevos medios. El titular de una patente no tiene el derecho de evitar que un tercero obtenga el mismo resultado por medios distintos”².

Visto lo anterior, se advierte que la invención en estudio no cumple el requisito de nivel inventivo, toda vez que para *un experto medio en la materia* se deriva de manera evidente del estado de la técnica, pues los conocimientos integrantes del estado del arte, anteriores a la fecha de la prioridad invocada, conducen de manera obvia a la invención propuesta, hasta el punto de que la invención no se constituye en un “paso” más allá de lo existente.

En efecto, D1 enseña *de manera previa* el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona de fórmula:



.HCl.H₂O

Enseña, además, que dentro de los solvatos farmacéuticamente aceptables se incluyen los hidratos (página 43). Y, menciona las sales farmacéuticamente aceptables y los solvatos farmacéuticamente aceptables de estos compuestos (Ver reivindicación 1). La reivindicación 14 enseñaba una composición que contiene este compuesto y un vehículo.

D2 enseña *de manera previa* la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona (ver página 2). La página 10 enseña una composición que contiene este compuesto y un vehículo. Se enseña un proceso para preparar un polimorfo que se caracteriza porque el compuesto se disuelve en etanol a elevada temperatura y luego se enfría de manera que se produce la

² TRIBUNAL DE JUSTICIA DE LA COMUNIDAD ANDINA, Proceso 49-IP-05.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° - 25365

Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

cristalización del polimorfo, después de lo cual se recuperan los cristales (ver página 8, ejemplo 2).

Y, D3 enseña *de manera previa* la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona, sus formas tautómeras y las sales farmacéuticamente aceptables, incluyendo la sal del ácido clorhídrico, y los solvatos farmacéuticamente aceptables de este compuesto (ver páginas 4 y 6).

Se observa, entonces, que la combinación de las enseñanzas de estas anterioridades, sugiere el monohidrato de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona. De esa manera, las reivindicaciones 1 - 6, 9 y 10 no tienen nivel inventivo.

Con respecto al proceso de la reivindicación 7 para preparar el monohidrato de la reivindicación 1, caracterizado porque se trata un compuesto de la reivindicación 1 con una fuente de iones clorhidrato, después de lo cual se recupera la sal, se observa que D2 ya enseñaba (ver página 8, ejemplo 1) un proceso para preparar una sal que se caracteriza porque el compuesto se trata con ácido maléico y etanol, después de lo cual se recupera la sal. De esa manera, para una persona conocedora de la materia esto sugiere, junto con la mención de la sal de ácido clorhídrico del folio 82 ó del folio 91 de D3, el proceso para tratar el compuesto 1 con una fuente de iones clorhidrato en lugar de la fuente de iones maléico. De manera que el proceso reivindicado no tiene nivel inventivo.

Respecto a la reivindicación 8, que se refiere a una composición que contiene un hidrato de la reivindicación 1 y un vehículo, como quiera que el compuesto activo que caracteriza a la composición carece de nivel inventivo, tampoco lo tiene la composición.

Adicionalmente, las reivindicaciones no mencionan una característica que conceda un efecto diferente o especial al compuesto ni a las composiciones, así que son obvias y evidentes para una persona versada en la materia.

Entonces, debido a que: (a) el compuesto, las composiciones y el proceso de esta solicitud, a partir de las anterioridades, son evidentes para una persona conocedora de la materia; porque siendo conocidos la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona, las composiciones que la contienen y el proceso para prepararla, para una persona conocedora de la materia era evidente el realizarlos de manera similar, teniendo en cuenta estas anterioridades; (b) las reivindicaciones de esta solicitud no mencionan una característica que conceda un efecto diferente o especial al compuesto, las composiciones ó el proceso, que pueda considerarse como un aporte a la técnica, en



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° 25365

Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

comparación con las anterioridades, así que estas son obvias para una persona versada en la materia; y, (c) el problema planteado en esta solicitud que era la necesidad de proporcionar un nuevo producto farmacéutico para tratamiento y/o profilaxis de diabetes mellitus se resuelve proporcionando el monohidrato de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona, es decir de manera similar a como se resolvía en las anterioridades D1, D2 y D3, entonces esta solicitud no tiene nivel inventivo.

Como se advierte, la propuesta de esta solicitud puede ser realizada por *un experto medio en la materia* y no genera un efecto sorprendente que represente un salto tecnológico sobre lo conocido. Más bien, se encuentra dentro de la línea normal de avance tecnológico.

5. Reivindicaciones de usos

El artículo 14 de la Decisión 486 establece: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

El artículo 21 de la Decisión 486 establece: "Los productos o procedimientos ya patentados, comprendidos en el estado de la técnica, de conformidad con el Artículo 16 de la presente Decisión, no serán objeto de nueva patente, por el simple hecho de atribuirse un uso distinto al originalmente comprendido por la patente inicial".

La reivindicación 11 se refiere al *uso* del hidrato. Además, este uso no es nuevo, porque ya se enseñaba en D3 (ver reivindicación 9, en el folio 94).

En consecuencia, la mencionada reivindicación 11, referida a un *uso* del hidrato, no es susceptible de protección mediante patente en virtud de los artículos 14 y 21 de la norma supranacional andina.

6. Respuesta del solicitante

Sobre los comentarios del solicitante expuestos en la respuesta a la notificación de fondo, basta realizar las siguientes precisiones:

- Dice el solicitante en el folio 118 que D1 revela el compuesto de esta solicitud (Rosiglitazona) como base libre, pero no menciona la sal de adición de ácido clorhídrico ni su forma solvatada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° **25365**
Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

Se aclara al solicitante que D1 enseña tanto la base libre como la sal de adición de ácido clorhídrico y su forma solvatada. Menciona que los solvatos farmacéuticamente aceptables incluyen los hidratos (página 43). Y, menciona concretamente las sales farmacéuticamente aceptables y los solvatos farmacéuticamente aceptables de estos compuestos en la reivindicación 1, en la reivindicación 12 y en el ejemplo 30, pues allí se nombra el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona (ver folios 74, 78, 82 y 91).

- Dice el solicitante en el folio 118 que D2 “revela la opción de preparar sales de los compuestos abarcados por la fórmula genérica I usando ácidos minerales como bromhídrico, clorhídrico y sulfúrico ó ácidos orgánicos...” y además “D2 indica que el alcance de la invención cubre solvatos de compuestos de la fórmula genérica I, incluidos los hidratos”. Y agrega que “no obstante, no se revelan explícitamente hidratos, ni sales específicas del ácido clorhídrico ...la enseñanza real con respecto a la Rosiglitazona es preparar la sal del ácido maléico” (subrayados y resaltados fuera del texto).

Se aclara al solicitante que lo anterior encierra una contradicción. Queda claro que, puesto que D2 anticipaba el hidrato de la sal clorhidrato del compuesto Rosiglitazona: 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona, este no es nuevo.

- Dice el solicitante en el folio 118 que D3 no es relevante, porque no enseña el polimorfo de esta solicitud.

Se aclara al solicitante que tal afirmación no es cierta, porque en los folios 89 - 91 se observa que se enseña el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona y sus sales inorgánicas de adición ácida farmacéuticamente aceptables, tales como sulfato, nitrato, fosfato, borato clorhidrato y bromhidrato, de tal manera que no es nuevo.

- Sobre la información del interesado relacionada con la concesión extranjera para esta invención, la cual, fue suministrada en la respuesta a la notificación de fondo, es importante aclararle que la circunstancia de un previo reconocimiento mediante patente de la invención objeto de ésta solicitud en otro país no obliga a ésta Superintendencia. Y, ello se debe en gran medida al principio de independencia de las patentes, según el cual, las patentes solicitadas en un país son independientes de las patentes obtenidas para la misma invención en otro país. Este principio se consagra en el artículo 4 bis del Convenio de París para la Protección de la Propiedad Industrial, vigente en Colombia desde el 3 de septiembre de 1996.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
RESOLUCIÓN N° **25365**
Por la cual se niega una patente de invención

Exp. N° 00028928

Por lo demás, para realizar el análisis de patentabilidad de que trata la Decisión 486, se tomaron en consideración las anterioridades D1 a D3, las cuales, demuestran de manera fehaciente que la invención propuesta carece no solo de novedad sino también de nivel inventivo.

En conclusión, no obstante los comentarios formulados por el solicitante con motivo de la notificación de fondo, la invención definida por las reivindicaciones 1 a 10 de la solicitud, no cumple con lo dispuesto en los artículos 16 y 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención a la creación denominada: "NUEVAS COMPOSICIONES ANTIDIABETICAS CON BASE EN HIDRATO DE HIDROCLORURO".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente al doctor German Castillo Grau en su calidad de apoderado de la sociedad Smithkline Beecham PLC, el contenido de la presente resolución, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición ante el Superintendente de Industria y Comercio al momento de notificarse o dentro de los 5 días hábiles siguientes.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los

30 SET. 2005

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E)


GIANCARLO MARCENARO JIMENEZ

Doctor
GERMAN CASTILLO GRAU
Carrera 13 N° 37- 43 P 12°
Bogotá D.C.

145 X
125

Señores
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
Ciudad

20030911080501

2003-11-09

16:28:33

... y propuesto son válidas las siguientes consideraciones:

- Mi cliente piensa que el problema al que se refiere la invención se expresa más correctamente de la siguiente manera:

La necesidad de suministrar una nueva forma de rosiglitazona (compuesto I 6 5- teniendo la estructura mostrada en la resolución como " la materia concreta de la invención" (infortunadamente no se puede reproducir aquí la estructura), la cual es adecuada para la manufactura en una escala comercial/industrial de un producto farmacéutico teniendo la misma actividad como la rosiglitazona.

- La solución es:

El compuesto rosiglitazona $\text{HC1.H}_2\text{O}$, el cual puede ser obtenido en una forma estable cristalina adecuada para procesamiento a escala comercial, y la cual está caracterizada por la información técnica suministrada en la reivindicación 1.

- Este es el monohidrato descubierto por el solicitante- concibiéndose otros hidratos que pueden ser descubiertos y que no satisfacen la información de la reivindicación 1. Así, el solicitante ya ha descubierto un compuesto de hidrato, el cual es materia de otra solicitud de patente bajo Expediente No. 00- 29.933.
- Esta solución al problema, que es la rosiglitazona $\text{HC1.H}_2\text{O}$ caracterizada por la información técnica suministrada en la reivindicación 1 y que puede ser obtenida en una forma cristalina estable, no ha sido revelada ni sugerida en el estado del arte o la técnica.

La alegada "enseñanza" del estado de la técnica como se indica en la Resolución que se está recurriendo es de hecho más bien una revelación del estado de la protección reclamada para la invención de los documentos del arte previo.

- El estado actual de la técnica revela varios compuestos útiles, incluyendo rosiglitazona en su forma de base libre. El alcance de la invención de rosiglitazona está indicada de incluir sales y solventes, incluyendo sales de ácido ^{clorhídrico} ~~hidroclórico~~ e hidratos.

- No hay ninguna revelación específica del compuesto rosiglitazona HC1.H₂O como un compuesto preparado, ó por una revelación técnica que capacite al lector para preparar el compuesto. Adicionalmente, no hay una revelación de una forma cristalina estable de rosiglitazona HC1.H₂O caracterizada por la información técnica suministrada en la reivindicación 1.
- La relación de la actual reivindicación 1 al estado de la técnica es análoga a la relación entre la citada EP 0306228 y la EP 0658161 (citada como WO 94/05659). Tal como se demuestra en las copias anexas de las reivindicaciones otorgadas como EP 0306228 B1 y EP 0658161 B1.

La reivindicación 1 de EP 0306228 B1 se refiere a rosiglitazona y/o una... sal de lo mismo y/o un ... solvente del mismo.

A pesar de esta revelación de que sales y solventes están en el alcance de la invención de EP 0306228, la reivindicación 1 de EP 0658161 B1 se otorga refiriéndose a rosiglitazona de sal de ácido maleico.

En otras palabras, una revelación general que incluya un compuesto dentro de su alcance pero sin suministrar una revelación técnica completa y capacitadora de un compuesto específico, no puede destruir la novedad de una solicitud de patente posterior para el compuesto específico.

- El principio de la independencia de las patentes es reconocido completamente por el solicitante. Sin embargo es digno de atención que discutiendo el principio de novedad absoluta, la Resolución recurrida se refiera a la práctica de la Oficina de Patentes Europea, la cual ha reconocido

la novedad de la rosiglitazona HC1.H₂O caracterizada por la información técnica suministrada en la reivindicación 1, en el otorgamiento de la Patente Europea EP 1173437B1.

- Mi cliente estaría dispuesto, a estas alturas, a desistir de las reivindicaciones del proceso de manufactura y uso del compuesto para evitar distraer al Sr. Examinador de la novedad y no "obviedad" de la reivindicación 1.

Pero si ello no es posible, recabaremos el hecho que el método y el uso están basados en el hacer y usar un compuesto novedoso e inventivo como la base de novedad y altura inventiva de tales reivindicaciones.

Le ruego entonces revocar la providencia recurrida y disponer en su lugar el otorgamiento del privilegio de patente de invención solicitado.

Recibiré notificaciones en la Secretaría de su Despacho y en mi oficina de abogado, Carrera 13 No. 37-43, Piso 12 en esta ciudad.

De Usted Atentamente,

GERMAN CASTILLO GRAU
C.C. 17.017.671 de Bogotá
T.P. 2978 del C.S.J



El anterior memorial fue presentado personalmente por

Germán del Real Castillo Garv-
quien se identificó con C. de C. No. 17.017.671-
de Bogotá
Tarjeta Profesional No. 2978-AS, de INJ-
Bogotá, D. E., -9 NOV 2005



[0040] The following Example illustrates the invention but does not limit it in any way.

Example 1

5-[4-[2-(N-Methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione, maleic acid salt

[0041] 5-[4-[2-(N-Methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione (470g) and maleic acid (137g) were dissolved in ethanol (41.) at boiling. The hot solution was filtered via diatomaceous earth and was then allowed to cool slowly with gentle agitation. After leaving in a refrigerator at 0-5°C for several hours, the maleate salt was filtered off, washed with ethanol and dried in vacuo at 50° to give 446g (73%) of product, m. p. 120-121°C.

[0042] ¹H NMR δ (d₆-DMSO): 3.0-3.35 (2H, complex); 3.10 (3H, s); 3.95 (2H, t); 4.15 (2H, t); 4.85 (1H, complex); 6.20 (2H, s); 6.65 (1H, t); 6.85 (3H, complex); 7.15 (2H, d); 7.65 (1H, t); 8.05 (1H, complex); 11.85-12.1 (1H, broad, exchanges with D₂O).

[0043] A very broad signal was observed in the range 2-5ppm which is thought to be due to residual water from the solvent and the exchangeable carboxylic acid protons.

Example 2

5-[4-[2-(N-Methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione, maleic acid salt

[0044] 5-[4-[2-(N-Methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione, maleic acid salt (294.6g, 0.825M) and maleic acid (95.8g 0.825m) were stirred in refluxing ethanol (2.71) until all the solid had dissolved. Decolourising charcoal was added and the hot solution filtered through celite, allowed to cool to room temperature with stirring. After cooling in a refrigerator at 0-5°C for several hours, the title compound was filtered, collected and dried at 50°C under vacuum overnight to give 364.1g (87%) of product, m.p. 119 - 119.5°C.

[0045] The ¹H NMR spectra was as for Example 1.

Claims

1. A compound 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt or an isomer or tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof.
2. A process for preparing 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt, or an isomer or tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, which process comprises reacting 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]

thiazolidine-2,4-dione with a source of maleate ion HOOC.CH=CH.COO⁻; and thereafter if required preparing a pharmaceutically acceptable solvate thereof.

3. A pharmaceutical composition, comprising 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt or an isomer or tautomeric form thereof, and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, and a pharmaceutically acceptable carrier therefor.
4. 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt or an isomer or tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, for use as an active therapeutic substance.
5. 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt or an isomer or tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, for use in the treatment of and/or prophylaxis of hyperglycaemia, hyperlipidaemia, hypertension and cardiovascular disease.
6. The use of 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidine-2,4-dione maleic acid salt or an isomer or tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, for the manufacture of a medicament for the treatment and/or prophylaxis of hyperglycaemia, hyperlipidaemia, hypertension and cardiovascular disease.

Patentansprüche

1. 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidin-2,4-dion-Maleinsäuresalz oder eine isomere Verbindung oder tautomere Form davon und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Solvat davon.
2. Verfahren zur Herstellung von 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidin-2,4-dion-Maleinsäuresalz oder einer isomeren Verbindung oder tautomeren Form davon und/oder eines pharmazeutisch verträglichen Solvats davon, umfassend die Umsetzung von 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidin-2,4-dion mit einer Quelle für Maleationen HOOC.CH=CH.COO⁻; und anschließend, falls erforderlich, Herstellung eines pharmazeutisch verträglichen Solvats davon.
3. Arzneimittel, umfassend 5-[4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl]thiazolidin-2,4-dion-Maleinsäuresalz oder eine isomere Verbindung

[0144] The title compound (m.p. 177-9°C) was obtained from 4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzaldehyde (3.2g) and 2,4-thiazolidinedione (1.1g) by a similar procedure to that described in Reference Example 2.

¹H NMR δ (DMSO-D₆O)

3.1 (3H, s); 3.9 (2H, t); 4.2 (2H, t); 6.4-7.5 (7H, complex); 7.7 (1H, s); 8.1 (1H, d)

DEMONSTRATION OF EFFICACY OF COMPOUNDS

Obese Mice, Oral Glucose Tolerance Test

- [0145] C57bl/6 obese (ob/ob) mice were fed on powdered oxid diet. After at least one week, the mice continued on a powdered oxid diet or were fed powdered oxid diet containing the test compound. After 8 days on the supplemented diet all of the mice were fasted for 5 hours prior to receiving an oral load of glucose (3 g/kg). Blood samples for glucose analysis were taken 0, 45, 90 and 135 minutes after glucose administration and the results expressed as the percentage reduction in area under the blood glucose curve where test compound treated groups are compared with the control groups. 7 mice were used for each treatment.

Toxicology

- [0146] No toxicological effects were indicated for any of the compounds of the invention in any of the abovementioned tests.

Claims

1. A compound 5-(4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl)-2,4-thiazolidinedione or a tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable salt thereof, and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof.
2. A pharmaceutical composition comprising a compound according to claim 1, or a tautomeric form thereof and/or a pharmaceutically acceptable salt thereof and/or a pharmaceutically acceptable solvate thereof, and a pharmaceutically acceptable carrier therefor.
3. A compound according to claim 1, for use as an active therapeutic substance.
4. A compound according to claim 3, for use in the treatment and/or prophylaxis of hyperglycaemia, hyperlipidaemia or hypertension.
5. The use of a compound according to claim 1, for the manufacture of a medicament for the treatment and/or prophylaxis of hyperglycaemia, hyperlipidaemia or hypertension.

Patentansprüche

1. Eine Verbindung 5-(4-[2-(N-methyl-N-(2-pyridyl)amino)ethoxy]benzyl)-2,4-thiazolidindion oder eine tautomere Form davon und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Salz davon, und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Solvat davon.
2. Arzneimittel, umfassend eine Verbindung nach Anspruch 1, oder eine tautomere Form davon und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Salz davon und/oder ein pharmazeutisch verträgliches Solvat davon, und einen pharmazeutisch verträglichen Träger dafür.
3. Verbindung nach Anspruch 1 zur Verwendung als eine wirksame therapeutische Substanz.
4. Verbindung nach Anspruch 3 zur Verwendung bei der Behandlung und/oder Prophylaxe von Hyperglykämie, Hyperlipidämie oder Hypertension.
5. Verwendung einer Verbindung nach Anspruch 1 zur Herstellung eines Arzneimittels für die Behandlung und/oder Prophylaxe von Hyperglykämie, Hyperlipidämie oder Hypertension.

6. A fin de iniciar una gestión de registro deberemos recibir una orden por escrito, con la siguiente información:

- a.- Nombre y domicilio completo del solicitante.
- b.- Dirección de correspondencia de quien ordena la gestión.
- c.- El nombre de la marca o signo a registrar; en caso de renovación se requiere también el número de certificado y la clase correspondiente.
- d.- La lista de productos, servicios o actividades a proteger.
- e.- Un poder cuyo formato remitiremos al confirmar la orden.
- f.- Un certificado de Cámara de Comercio, si el solicitante es persona jurídica.

Es recomendable, antes de presentar la solicitud de registro de la marca, efectuar una búsqueda oficial previa con el fin de determinar si existen marcas similares o iguales previamente registradas o solicitadas para comercializar los mismos productos o servicios.

Por favor no dude en ponerse en contacto con nosotros si tienen alguna inquietud sobre este u otro asunto conexo.

Cordialmente,

CASTILLO GRAU & ASSOCIATES

1341

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RADICACIÓN: 0-28928

EDICTO No. 5812

LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:

Que esta Superintendencia profirió **Resolución No. 7008 de 27-MAR-2006**. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue: El Superintendente de Industria y Comercio.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución 25365 de 30 de septiembre de 2005 por medio de la cual se negó una patente de invención.

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Germán Castillo Grau, en su calidad de apoderado de la sociedad SMITHKLINE BEECHAM PLC, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D. C., a los **27 MAR. 2006**

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),


GIANCARLO MARCENARO JIMENEZ

Para notificar a los interesados, se fija el presente EDICTO en lugar visible al público en la SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO, por el término de (10) diez días hábiles contados a partir de las 8:30 a.m. de hoy.

Secretaría General Ad-Hoc **12-ABR-2006**
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 5812

Este edicto se desfija hoy **27-ABR-2006** a las cinco (5:00 p.m.)