

Señores
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
División de Signos Distintivos
Bogotá

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 88028928 00000006 Folios: 8
Fecha (AMD): 2005-08-09 10:36:12
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2820 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re.: Expediente No. 00 – 28.928
Solicitud De Patente

Por el presente escrito me permito manifestarle que descorro el traslado que se me ha hecho del Concepto Técnico No. 612.

Por mi intermedio, mi cliente desea formular al Sr. Examinador los siguientes comentarios.

Para avanzar en el procedimiento de examen mi cliente procede a eliminar las reivindicaciones 9 a 12, de modo que las reivindicaciones se concreten a un compuesto novedoso, un proceso para hacerlo y una composición farmacéutica que contenga el compuesto novedoso.

El Examinador está consciente de que el objeto de la presente invención es una sal solvatada de un compuesto tiazolidinediona único, el cual es en efecto un complejo que comprende una molécula de tiazolidinediona base (conocida como rosiglitazona), una molécula de ácido clorhídrico y una molécula de agua.

En otras palabras, el compuesto tiene la siguiente estructura:

rosiglitazona·HCl·H₂O

El Examinador ha deducido correctamente la estructura del compuesto de la presente invención como un MONO-hidrato. No obstante, en algunos casos el texto en inglés enviado a los apoderados por SmithKline Beecham (hoy GSK) incluyó por error reivindicaciones que se referían al DI-hidrato, objeto de la familia de patentes P32286 de SB/GSK

D1 – EP 0326 228

En la discusión del requisito de novedad, el Examinador parece suponer que este compuesto ha sido revelado en D1. De hecho, D1 revela una fórmula I genérica que cubre un gran número de compuestos de tipo tiazolidinediona y también enseña el compuesto específico rosiglitazona en el Ejemplo 30. La revelación de la rosiglitazona es únicamente de la base libre y no hay revelación que enseñe cómo hacer una sal clorhídrica de la rosiglitazona o una sal hidratada de ácido clorhídrico.

La reivindicación 1 de D1 define una fórmula I genérica y se refiere a una sal farmacéuticamente aceptable de la misma y a un solvato farmacéuticamente aceptable de la misma. Éstas son meras referencias a la fórmula genérica, y en el contexto de la reivindicación esto sencillamente significa que es posible hacer dichas sales o solvatos (lo cual en realidad se refiere a o bien una sal de la fórmula genérica o bien un solvato de la fórmula genérica y no a una sal solvatada), cuando dichas sales y solvatos se considera que caen dentro del alcance de la invención para los propósitos de valorar si existe o no una infracción de la patente. La redacción de una reivindicación no da ninguna enseñanza a la persona versada en la técnica y no da medios para preparar ninguna sal o solvato específico. Además, cuando la descripción explora las sales potenciales en la página 4, líneas 41 a 49, allí no se hace mención alguna de sales de adición de ácido en general, o sales del ácido clorhídrico en particular. En la línea 50 se hace una referencia a que los solvatos apropiados incluyen los hidratos, pero esto se refiere a la fórmula genérica I y no a las sales previamente reveladas, las cuales de cualquier manera no incluyen las sales de adición de ácido.

Según esto, aunque se revela la rosiglitazona de base libre, no hay revelación de una sal de adición de ácido de la rosiglitazona, o de una forma solvatada de una sal de adición de ácido.

D2 – WO 94/05659

El documento D2 también revela una fórmula genérica que también incluye sales de adición de ácido de un gran número de compuestos incluida la rosiglitazona. Los ejemplos 1 y 2 de D2 revelan específicamente la sal del ácido maleico de la rosiglitazona. D2 además revela la opción de preparar sales de los compuestos abarcados por la fórmula genérica I usando ácidos minerales como bromhídrico, clorhídrico y sulfúrico, o ácidos orgánicos como metanosulfónico, tartárico y maleico (véase la página 2, líneas 12-14 y página 4, líneas 14-16). Además, D2 indica que el alcance de la invención cubre solvatos de compuestos de la fórmula genérica I, incluidos los hidratos. No obstante, no se revelan explícitamente hidratos, ni sales específicas del ácido clorhídrico. Según esto, aunque D2

enseña que puede ser posible preparar sales del ácido clorhídrico de algunos de los compuestos dentro de la fórmula genérica I, la enseñanza real con respecto a la rosiglitazona es preparar la sal del ácido maleico. • 81 40

D3 – WO 95/21608

D3 revela el uso de compuestos de una fórmula genérica I, la cual incluye un gran número de compuestos incluida la rosiglitazona, para el tratamiento de ciertos trastornos renales. En las pruebas biológicas informadas por D3 el compuesto examinado es la rosiglitazona. Los resultados de las pruebas no mencionan las sales o solvatos de adición de ácido. La descripción en el párrafo que sirve de puente a las páginas 4 y 5 menciona que un compuesto preferido de la fórmula genérica es la rosiglitazona o una sal o solvato de la misma, haciendo mención específica una sal del ácido maleico. No se menciona un solvato específico. 1190
si ↑

Novedad

Según esto, en el estado de la técnica no se hace mención explícita de una sal del ácido clorhídrico de la rosiglitazona, o de una sal hidratada del ácido clorhídrico, y por cierto que tampoco del compuesto rosiglitazona·HCl·H₂O. Por tanto, el compuesto de la invención a todas luces es novedoso con respecto al estado de la técnica citado.

También deseamos corregir la observación del Examinador en el último párrafo de una de sus valoraciones de novedad, en la cual se refiere al compuesto de la presente invención como un polimorfo de los compuestos del estado de la técnica. Esto es incorrecto. El compuesto más cercano del estado de la técnica es la sal del ácido maleico de la rosiglitazona. El presente compuesto no es un polimorfo sino una sal novedosa y distinta que es la rosiglitazona·HCl·H₂O.

Nivel inventivo

El compuesto de la presente invención de hecho muestra una ventaja sorprendente sobre el compuesto más cercano del estado de la técnica, la sal del ácido maleico de la rosiglitazona, lo cual establece un nivel inventivo por encima del compuesto más cercano del estado de la técnica, como se discute más adelante.

Un problema que la presente invención busca resolver es la provisión de rosiglitazona (5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]benzil]tiazolidine-2,4-diona) en una forma que es particularmente apropiada para la preparación y el manejo a granel, como se afirma en la descripción de la presente solicitud, página 1.

La solución al problema reside en la provisión de una sal específica (clorhidrato) de la rosigitazona en una forma solvatada particular (el monohidrato).

No hay nada en D2 que revele un clorhidrato de rosigitazona; es más, no hay sugerencia del monohidrato específico de la presente invención de preferencia sobre algún otro solvato.

De forma incidental, informo al Sr. Examinador que la solicitud Europea de patente correspondiente con esta solicitud ha sido otorgada bajo el No. EP 1 173 437 B1.-

Conforme lo anterior, me permito acompañar al presente escrito un capítulo de reivindicaciones revisado, el cual debe tenerse como el correspondiente a esta solicitud. Por motivo de la modificación planteada y por la suma de \$91.000.00, acompaño el comprobante de pago de tasas. R 1 59180

Le ruego autorizar esta solicitud de patente de privilegio de invención.

De Ustedes Atentamente,

GERMAN CASTILLO GRAU
T.P. No. 2.978 del C.S.J.

Reivindicaciones

1. Clorhidrato de 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]benzil]tiazolidine-2,4-diona monohidratado, **que se caracteriza porque:**
 - (i) proporciona un espectro infrarrojo que contiene picos a 3358, 2764, 1245, 833 y 760 cm^{-1} ; o bien
 - (ii) proporciona una difracción de rayos x en polvo (XRPD) que contiene picos en 15,0, 17,7, 23,0, 30,0 y 31,4°2 θ .
2. Un hidrato conforme a la reivindicación 1, el cual proporciona posiciones pico a: 3358, 3124, 2764, 1762, 1747, 1707, 1644, 1614, 1587, 1544, 1511, 1414, 1333, 1302, 1268, 1245, 1181, 1154, 1142, 1108, 1075, 1054, 1033, 1012, 988, 938, 905, 859, 833, 817, 760, 738, 716, 663, 652, 636, 620, 605, 564, 540, 525 y 505 cm^{-1} .
3. Un hidrato conforme a la reivindicación 1, o la reivindicación 2, el cual proporciona un patrón de difracción de rayos x en polvo (XRPD) que contiene picos en 8,8, 12,1, 14,1, 14,3, 15,0, 16,5, 17,7, 19,1, 20,7, 21,3, 21,7, 23,0, 23,8, 24,3, 24,9, 25,6, 27,0, 27,6, 28,9, 30,0, 31,4, 32,2 y 33,1 °2 θ .
4. Un hidrato conforme a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en forma pura o cuando está mezclado con otros materiales.
5. Un hidrato conforme a la reivindicación 4, en forma pura.
6. Un hidrato conforme a cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en forma cristalina.
7. Un proceso para preparar un hidrato conforme a la reivindicación 1, **que se caracteriza porque** o bien:
 - (a) La 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]benzil]tiazolidine-2,4-diona (el Compuesto 1) es tratada con una fuente de iones clorhídricos en ácido acético como solvente, o bien,
 - (b) Una suspensión del Compuesto (I) en un solvente orgánico acuoso es tratada con una fuente de iones clorhídricos a una temperatura en el intervalo de 20 a 30°C; o bien
 - (c) Se hace reaccionar una solución del compuesto (I) en un solvente orgánico con una fuente de iones clorhídricos para dar unos reactivos sustancialmente disueltos, y entonces se induce la cristalización para dar el clorhidrato hidratado; y entonces se recupera el compuesto requerido.
8. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva, no tóxica, de un hidrato conforme a la reivindicación 1, y un vehículo farmacéuticamente aceptable para el mismo;
9. Un hidrato conforme a la reivindicación 1, para usarlo como una sustancia terapéutica activa.

10. Un hidrato conforme a la reivindicación 1, para usarlo en el tratamiento o la profilaxis de la diabetes mellitus, afecciones asociadas con la diabetes mellitus y ciertas complicaciones de la misma compuestas por enfermedad renal, nefropatía diabética, glomerulonefritis, glomeruloesclerosis, síndrome nefrótico, nefroesclerosis hipertensiva y enfermedad renal en etapa terminal.
11. El uso de un hidrato conforme a la reivindicación 1, para la manufactura de un medicamento para el tratamiento o la profilaxis de la diabetes mellitus, afecciones asociadas con la diabetes mellitus y ciertas complicaciones de la misma compuestas por enfermedad renal, nefropatía diabética, glomerulonefritis, glomeruloesclerosis, síndrome nefrótico, nefroesclerosis hipertensiva y enfermedad renal en etapa terminal.

f) 4.

Tabla 1.

Ángulos de difracción de rayos X del polvo y espacios calculados del la cuadrícula característicos del clorhidrato hidratado	
Ángulo de difracción	Espacios de cuadrícula (Angstrom)
2,2	10,06
12,1	7,31
14,1	6,30
14,3	6,17
15,0	5,90
16,5	5,38
17,7	5,01
19,1	4,62
19,9	4,46
20,7	4,28
21,3	4,17
21,7	4,09
23,0	3,86
23,8	3,73
24,3	3,66
24,9	3,57
25,6	3,48
27,0	3,30
27,6	3,23
28,9	3,08
30,0	2,97
31,4	2,85
32,2	2,78
33,1	2,71

124/104

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 59,180
FECHA : AGOSTO 9 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CASTILLO GRAU Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	33200965	08/08/2005	364,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	91,000.00
		TOTAL :	\$ 91,000.00

SON: NOVENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

8

125 / 105

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

Expediente 00 028 928

Título de la solicitud: "Nuevas composiciones antidiabéticas con base en hidrato de hidrocioruro".

Como resultado del examen de patentabilidad de la solicitud de patente de invención, realizado según lo establece el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se encuentra que:

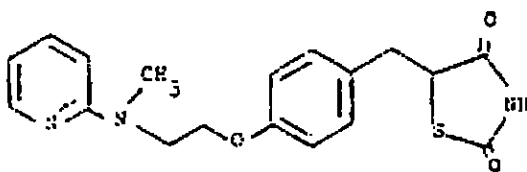
1. Documentos estudiados

Para el presente estudio se tuvieron en cuenta el nuevo capítulo descriptivo comprendido en los folios 48 - 59 y el nuevo capítulo reivindicatorio de los folios 121 - 122 de la solicitud en estudio.

2. Objeto de la Invención

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:

Las reivindicaciones 1 - 6, 9 y 10 se refieren al 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:



La reivindicación 7 menciona 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.

La reivindicación 8 se refiere a una composición que contiene un hidrato de la reivindicación 1 y un vehículo.

La reivindicación 11 se refiere al 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.

106 486

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la IPC: A 61 K 31/12 // 31/425 // 31/44; C 07 D 417/12.

También se reivindica prioridad de la Solicitud de Patente de Gran Bretaña 9909075.5 de abril 20 de 1999, con respecto a la cual la fecha de presentación de la actual solicitud cumple el plazo máximo permitido.

3. Reivindicaciones de Uso

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina 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 de la Comisión de la Comunidad Andina 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.

Se observa que el uso del hidrato, de la reivindicación 11, que no es una invención de producto ni de procedimiento, no es patentable de acuerdo con las normas citadas, que especifican que los usos no son patentables.

El uso comprendido en la patente inicial se enseñaba en D3 (ver Reivindicación 9, en el folio 94).

De manera que la reivindicación 11, de acuerdo con los artículos 14 y 21 no es patentable.

4. Determinación del Estado de la Técnica

El artículo 16 de la decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina que 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"*.

Solo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40".

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es abril 20 de 1999, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

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

5. Evaluación de los requisitos de Patentabilidad

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

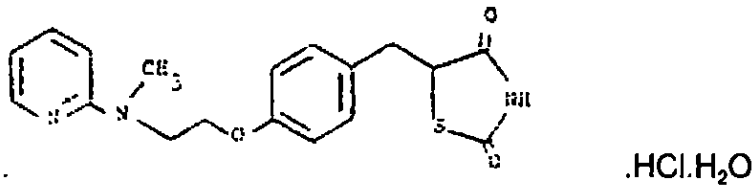
En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486, se procedió a evaluar el cumplimiento de los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial, con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

Evaluación de la Novedad

El Art. 16 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica. 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."*

Solo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el Art 40".

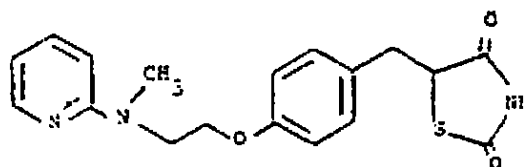
Las reivindicaciones 1 - 6, 9 y 10 se refieren al monohidrato de la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona de fórmula:



La reivindicación 8 se refiere a una composición que contiene un hidrato de la reivindicación 1 y un vehículo.

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

108/28



.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 ej. 30 enseña el compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)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 la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona. Ver pág 2. La pág 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).

D3 enseña 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 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 no es nuevo.

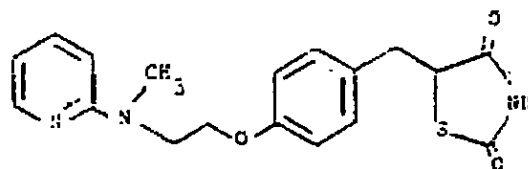
Con referencia a la reivindicación 8 que se refiere a una composición que contiene un compuesto de la reivindicación 1 y un vehículo, se observa que puesto que el compuesto que caracteriza a la composición no es nuevo, tampoco lo es la composición. Además esta composición ya se había enseñado en D1 y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

Evaluación del Nivel Inventivo

El artículo 18 de la Décisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que *Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, 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.*

Las reivindicaciones 1 - 6, 9 y 10 se refieren al 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:

109/209

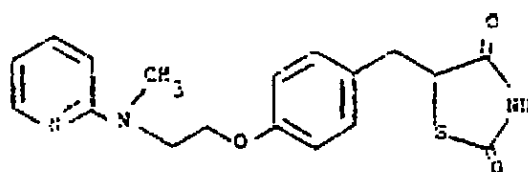


.HCl.H₂O

La reivindicación 7 menciona un proceso para preparar el monohidrato de la reivindicación 1, caracterizado porque 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona se trata con "una fuente adecuada de iones contrarios de hidrocloreuro" (¿?) y agua después de lo cual se recupera el monohidrato de clorhidrato.

La reivindicación 8 se refiere a una composición que contiene un hidrato de la reivindicación 1 y un vehículo.

D1 enseña 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 la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona. Ver pág 2. La pág 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).

D3 enseña 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 que la combinación de las enseñanzas de estas anterioridades: D1 que enseña los solvatos farmacéuticamente aceptables que incluyen los hidratos (página 43); D2 que enseña la sal del ácido clorhídrico de la 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]-tiazolidin-2,4-diona. Ver pág 2; D3 que enseña 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); 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 manera que 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. 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. Puesto que el compuesto activo que caracteriza a la composición no tiene nivel inventivo, tampoco lo tiene la composición.

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 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**.

6. Respuesta a los Argumentos del solicitante

En atención a los argumentos del solicitante se hacen las siguientes aclaraciones:

1. 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.

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 ej. 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, 91).

2. 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

111 131

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”.

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.

- 3. 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 manera que no es nuevo.

- 4. Dice el solicitante en el folio 120 que en Europa se concedió una patente correspondiente a esta solicitud, bajo el número EP 1 173 437 B1.

Se aclara al solicitante que los conceptos son independientes. Y, como ya se aclaró, en esta oficina se encontraron los documentos D1, D2 y D3 que afectan la novedad y el nivel inventivo.

7. Conclusión

En conclusión, los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 0 306 228	1 a 11	Novedad y nivel inventivo
D2	WO 94 05659	1 a 11	Novedad y nivel inventivo
D3	WO 95 210608	1 a 11	Novedad y nivel inventivo

Teniendo en cuenta lo anterior, se recomienda negar el privilegio solicitado para las reivindicaciones 1 a 11, folios 121 - 122.

Bogotá, D. C., Agosto 12 de 2005

CONCEPTO TÉCNICO 1231	EXAMINADOR TÉCNICO 202007
--------------------------	------------------------------

132 112

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RADICACIÓN: 0-28928

EDICTO No. 14292

**LA SECRETARÍA GENERAL AD-HOC
HACE SABER:**

Que esta Superintendencia profirió Resolución No. 25365 de 30-SEP-2005. Que el contenido de la parte resolutive es como sigue:
Superintendente de Industria y Comercio Ad-Hoc.

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

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 19-OCT-2005  Este edicto se desfija hoy 01-NOV-2005 a las cinco (5:00 p.m.) 
Secretaría General Ad-Hoc
EDICTO No. 14292