

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020  
Bogotá, D.C.,

Abogado  
**LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**  
[cavelier@cavelier.com](mailto:cavelier@cavelier.com), [clientes@cavalier.com](mailto:clientes@cavalier.com)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
  
**No. 10-012795- -00005-0000**  
Fecha: 2012-10-04 13:05:07 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 7

ASUNTO                      Radicación              10-12795  
                                    Trámite                      011  
                                    Evento                      378  
                                    Actuación                519  
                                    Oficio                      **EE- 17 8 5 4**  
                                    Folios                      07

|                         |                                     |                               |                                     |
|-------------------------|-------------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------|
| Patente de Invención    | <input checked="" type="checkbox"/> | Patente de Modelo de Utilidad | <input type="checkbox"/>            |
| Vía Nacional            | <input type="checkbox"/>            |                               |                                     |
| Vía PCT (fase nacional) | <input checked="" type="checkbox"/> | Cap.I                         | <input checked="" type="checkbox"/> |
|                         |                                     | Cap. II                       | <input type="checkbox"/>            |

No. Solicitud Internacional PCT/EP2008/060736  
Fecha de Presentación Internacional 15 de agosto de 2008

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

|                   |                  |                       |
|-------------------|------------------|-----------------------|
| Descripción:      | Folios 106 a 180 | 05 de febrero de 2010 |
| Reivindicaciones: | Folios 181 a 188 | 05 de febrero de 2010 |
|                   | Folios 213 a 217 | 17 de agosto de 2011  |
| Dibujos:          | Folios 190 a 191 | 05 de febrero de 2010 |
| Prioridad:        | EP 07114459.6    | 16 de agosto 2007     |

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque:  
Esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486).  
Y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Composición Farmacéutica Que Comprende un Derivado de Benceno Sustituido con Glucopiranosilo Junto Con un Inhibidor de DPP IV" (modificado en el folio 206).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar composiciones útiles para tratar la diabetes mellitus tipo 2.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona composiciones que comprenden un derivado de benceno sustituido con glucopiranosilo de fórmula (I) con un inhibidor de la DPP IV

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 61 K 31/000, A61P 3/10, 3/04, A61K 31/70.

#### 4. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de Presentación de la Solicitud de Prioridad: 16 de agosto de 2007

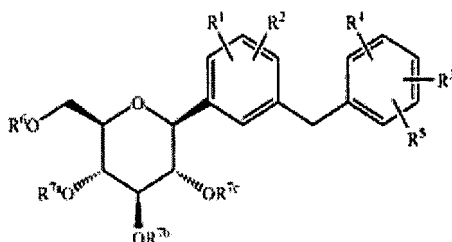
Y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Item | Documento    | Título                                                                                                                              | Fecha de Publicación*    |
|------|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| D1   | US2005209166 | Glucopyranosyl-substituted phenyl derivatives, medicaments containing such compounds, their use and process for their manufacture   | 22 de septiembre de 2005 |
| D2   | US2005234108 | 8-[3-amino-piperidin-1-yl]-xanthines, their preparation and their use as pharmaceutical compositions                                | 20 de octubre de 2005    |
| D3   | US2005020574 | New substituted imidazo-pyridinones and imidazo-pyridazinones, the preparation thereof and their use as pharmaceutical compositions | 27 de enero de 2005      |

D1

[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2005092877&KC=&FT=E&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2005092877&KC=&FT=E&locale=en_EP)

La invención se refiere a Derivados de Benceno Sustituido con Glucopiranosilo de la

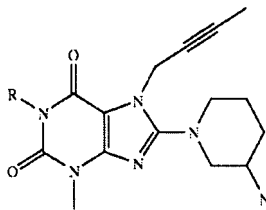


fórmula general (I), Los compuestos de la invención son útiles para tratar enfermedades metabólicas.

D2

[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005234108A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20051020&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005234108A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20051020&DB=EPODOC&locale=en_EP)

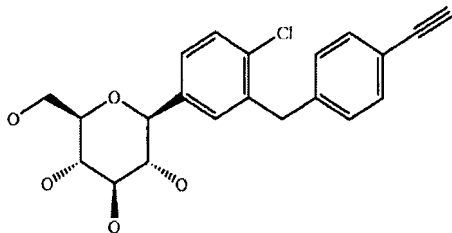
La presente invención se refiere a xantinas sustituidas de la fórmula general



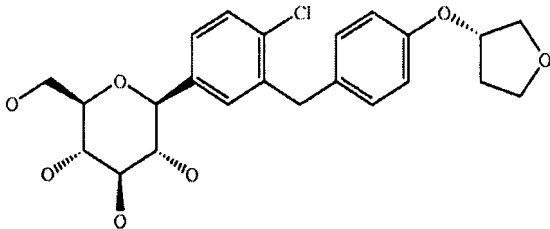
en donde R se define como en la reivindicación 1, sus tautómeros, sus estereoisómeros, las mezclas de los mismos y las sales de los mismos, que tienen propiedades farmacológicas valiosas, en particular un efecto inhibidor sobre la actividad de la enzima dipeptidilpeptidasa -IV (DPP-IV).

D3

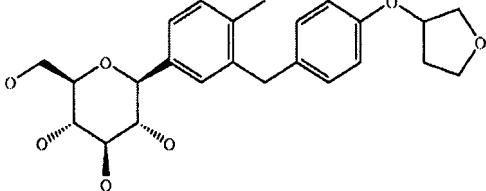
[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005020574A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20050127&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005020574A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20050127&DB=EPODOC&locale=en_EP)



compuesto (1-cloro-4-(β-D-glucopiranos-1-il)-2-(4-etinil-bencil)-bencene) (párrafo 451) de conformidad con el compuesto 7 de la



reivindicación 2, el compuesto 1-cloro-4-(β-D-glucopiranos-2-[4-((S)-tetrahidrofuran-3-iloxi)-bencil]-benceno (párrafo 406) de conformidad con el compuesto 8 y 9 de la reivindicación 2, el compuesto



(párrafo 423) de conformidad con el compuesto 10 y 11 de la reivindicación 2,

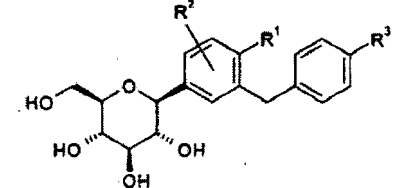
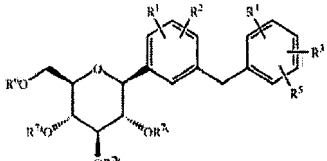
En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva o carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicación dependiente 2 no menciona alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

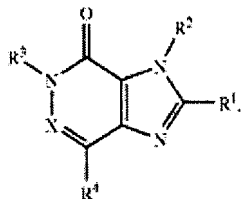
**Nivel inventivo** (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste una composición farmacéutica que comprende un derivado de benceno sustituido con glucopiranosilo de fórmula uno con un inhibidor de DPP IV.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

| Características <b>esenciales</b>                                                                                                                                                                                                                                              | D1                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Una composición farmacéutica que comprende                                                                                                                                                                                                                                     | Una composición farmacéutica que comprende                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| Un compuesto de fórmula (I)                                                                                                                                                                                                                                                    | Un compuesto de fórmula (I)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|  <p>donde R1 es Cl, Metilo, o ciano<br/>R2 es H, Metilo, metoxi, o hidroxilo.<br/>R3 es etilo, ciclopropilo, etinilo, etoxi, (R)-tetrahidrofurano-3-iloxi, (S)-tetrahidrofurano-3-iloxi</p> |  <p>Donde R<sup>6</sup>, R<sup>7a</sup>, R<sup>7b</sup>, R<sup>7c</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> es H (párrafos 167-170)<br/>R<sup>1</sup> el equivalente de R<sup>2</sup> es preferiblemente H, Cl, metil, metoxi (párrafo 164),<br/>R<sup>2</sup> el equivalente de R<sup>1</sup> cloro metilo y ciano (párrafos 144 y 145)<br/>R<sup>3</sup> el equivalente de R<sup>3</sup> es tetrahidrofuran-3-iloxi, etinil, etil, ciclopropil, etoxy (párrafos 152 y 166)</p> |
| Un inhibidor de DPP IV: sitagliptina, vidagliptina                                                                                                                                                                                                                             | Un inhibidor de DPP IV: sitagliptina(MK-0431), vidagliptina (LAF-237) (párrafo 253)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |

La presente invención se refiere a imidazo-piridinonas y imidazo-piridazinonas



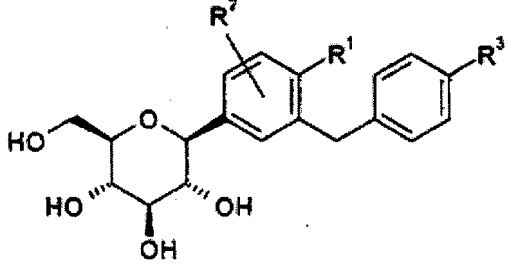
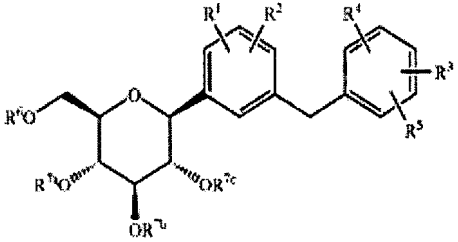
sustituidas de la fórmula general que tienen valiosas propiedades farmacológicas, en particular un efecto inhibitor sobre la actividad de la enzima dipeptidil peptidasa-IV (DPP-IV).

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

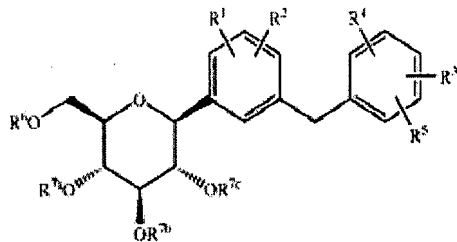
Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste una composición farmacéutica que comprende un derivado de benceno sustituido con glucopiranosilo de fórmula uno con un inhibidor de DPP IV.

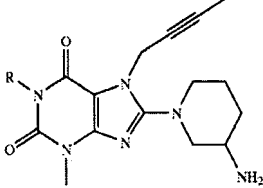
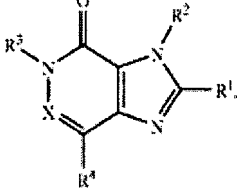
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

| Características <b>esenciales</b>                                                                                                                                                                                                                                                                   | D1                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Una composición farmacéutica que comprende                                                                                                                                                                                                                                                          | Una composición farmacéutica que comprende                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
| Un compuesto de fórmula (I)<br><br>donde R1 es Cl, Metilo, o ciano<br>R2 es H, Metilo, metoxi, o hidroxi.<br>R3 es etilo, ciclopropilo, etinilo, etoxi, (R)-tetrahidofurano-3-iloxi, (S)-tetrahidofurano-3-iloxi | <br>Donde R <sup>6</sup> , R <sup>7a</sup> , R <sup>7b</sup> , R <sup>7c</sup> , R <sup>4</sup> y R <sup>5</sup> es H (párrafos 167-170)<br>R <sup>1</sup> el equivalente de R <sup>2</sup> es preferiblemente H, Cl, metil, metoxi (párrafo 164),<br>R <sup>2</sup> el equivalente de R <sup>1</sup> cloro metilo y ciano (párrafos 144 y 145)<br>R <sup>3</sup> el equivalente de R <sup>3</sup> es tetrahidofuran-3-iloxi, etinil, etil, ciclopropil, etoxy (párrafos 152 y 166) |
| Un inhibidor de DPP IV: sitagliptina, vidagliptina                                                                                                                                                                                                                                                  | Un inhibidor de DPP IV: sitagliptina(MK-0431), vidagliptina (LAF-237) (párrafo 253)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |

Las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual divulga composiciones de un compuesto de

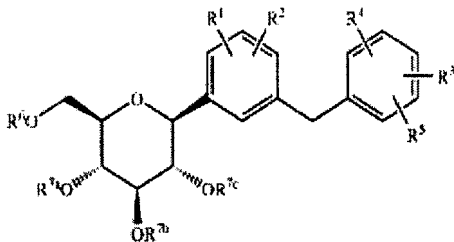


fórmula (I) donde R<sup>6</sup>, R<sup>7a</sup>, R<sup>7b</sup>, R<sup>7c</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> equivalen a H (párrafos 167-170), R<sup>1</sup> el equivalente de R<sup>2</sup> es preferiblemente H, Cl, metil, metoxi (párrafo 164), R<sup>2</sup> el equivalente de R<sup>1</sup> cloro metilo y ciano (párrafos 144 y 145), R<sup>3</sup> el equivalente de R<sup>3</sup> es tetrahidofuran-3-iloxi, etinil, etil, ciclopropil, etoxy (párrafos 152 y 166), en combinación con inhibidores de DPP IV como sitagliptina(MK-0431), vidagliptina (LAF-237) (párrafo 253), divulga además el

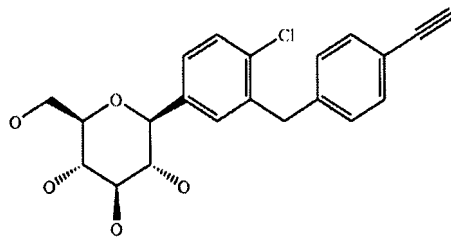
| D2                                                                                | D3                                                                                     |
|-----------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------|
| Composiciones que comprenden                                                      | Composiciones que comprenden                                                           |
| un compuesto de fórmula                                                           | un compuesto de fórmula                                                                |
|  |      |
| En combinación con inhibidores de SLGT (párrafo 54)                               | En combinación con otros medicamentos para el tratamiento de la diabetes (párrafo 133) |

D1 con D2 o D3

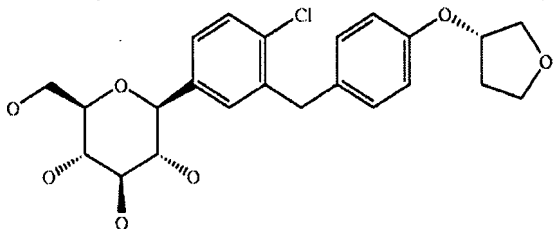
El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulga composiciones de un compuesto de



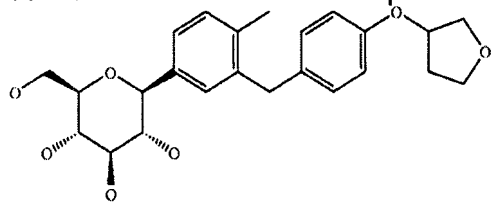
fórmula (I) donde R<sup>6</sup>, R<sup>7a</sup>, R<sup>7b</sup>, R<sup>7c</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> equivalen a H (párrafos 167-170), R<sup>1</sup> el equivalente de R<sup>2</sup> es preferiblemente H, Cl, metil, metoxi (párrafo 164), R<sup>2</sup> el equivalente de R<sup>1</sup> cloro metilo y ciano (párrafos 144 y 145), R<sup>3</sup> el equivalente de R<sup>3</sup> es tetrahidrofuran-3-iloxi, etinil, etil, ciclopropil, etoxy (párrafos 152 y 166), en combinación con inhibidores de DPP IV como sitagliptina(MK-0431), vidagliptina (LAF-237) (párrafo 253), divulga además el



compuesto (1-cloro-4-(β-D-glucopiranos-1-il)-2-(4-etinil-bencil)-benceno) (párrafo 451) de conformidad con el compuesto 7 de la



reivindicación 2, el compuesto 1-cloro-4-(β-D-glucopiranos-2-[4-((S)-tetrahidrofuran-3-iloxi)-bencil]-benceno) (párrafo 406) de conformidad con el compuesto 8 y 9 de la reivindicación 2, el compuesto

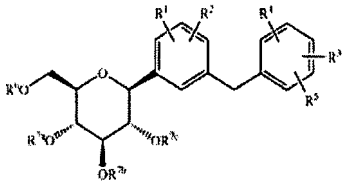


(párrafo 423) de conformidad con el compuesto 10 y 11 de la reivindicación 2, los cuales son útiles en el tratamiento de la diabetes.

La diferencia entre D1 y la actual solicitud, es que en la actual solicitud se incluyen

inhibidores de DPP IV diferentes de gliptinas.

El efecto que logra la diferencia consiste en obtener composiciones farmacéuticas

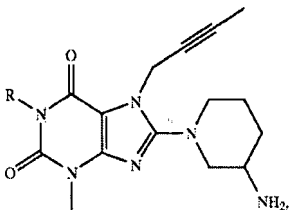


que comprenden un compuesto de fórmula (I) en combinación con Inhibidores DPP IV diferentes de gliptinas.

Por lo tanto, el Problema técnico objetivo a resolver consiste en “cómo proveer composiciones alternativas a las composiciones conocidas en D1 que incluyan compuestos de formula (I) e inhibidores de DPP IV diferentes de gliptinas”

D2

Sin embargo, D2 divulga xantinas sustituidas de fórmula general

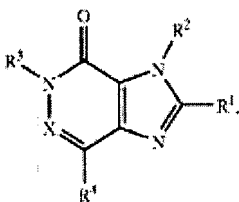


las cuales tienen efecto inhibidor sobre la actividad de la enzima dipeptidilpeptidasa -IV (DPP-IV) (resumen), las cuales pueden usarse en combinación con inhibidores de SLGT (párrafo 54).

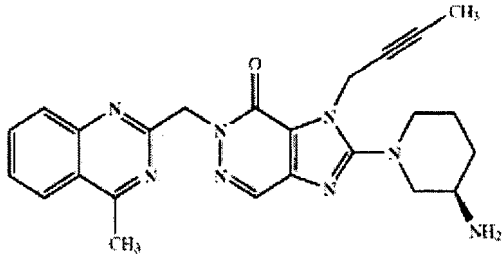
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría los inhibidores de dipeptidilpeptidasa IV conocidos en D2, en composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de fórmula (I) conocido en D1, llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la actual solicitud, por lo cual se considera obvia.

D3

Sin embargo, D3 divulga imidazo-piridinonas y imidazo-piridazinonas de fórmula



general las cuales tienen efecto inhibidor sobre la actividad de la enzima dipeptidilpeptidasa -IV (DPP-IV) (resumen), una realización preferida es



(párrafo 80), estos compuestos utilizarse en combinación con otros medicamentos útiles en el tratamiento de la diabetes (párrafo 133).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría

los inhibidores de dipeptidilpeptidasa IV conocidos en D3, en composiciones farmacéuticas que comprenden un compuesto de fórmula (I) conocido en D1, llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la actual solicitud, por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), sin embargo, desde la perspectiva de D1, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a combinar los derivados de benceno sustituidos con glucopiranosilo con inhibidores de la dipeptidilpeptidasa IV (DPP IV), como las gliptinas de D1, o las xantinas sustituidas de D2, o las imidazo-piridinonas y imidazo-piridazinonas de D3, para llegar de manera obvia al objeto de la actual solicitud, y por tal motivo no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Las reivindicación dependientes 2-10 no incluyen características que hagan nueva o inventiva la reivindicación 1 por lo tanto, también se consideran obvias.

6. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

| Item | Documento    | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|--------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | US2005209166 | 1-2                        | Novedad              |
|      |              | 1-10                       | Nivel Inventivo      |
| D2   | US2005234108 | 1-10                       | Nivel Inventivo      |
| D3   | US2005020574 | 1-10                       | Nivel Inventivo      |

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



**JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 10 9 OCT 2012

Elaborado por: Harvey Alonso Jaramillo  
Revisado Por: Jacqueline Alfonso *oct*