

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES.

2020
Bogotá, D.C., 28-09-2007

Abogado
CARLOS R. OLARTE
Solicitante: SMITHKLINE BEECHMAN P.L.C.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-018885- -00005-0000

Fecha: 2007-10-11 12:21:06 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	03-018885
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	13050
	Folios	013

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 le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripción: Folios: 17-37 y 40 como se radicó inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: Folios:38-39 como se radicó inicialmente
- 1.3. Dibujos: Folios:61-64 como se radicó el 19-09-2003
- 1.4. Prioridad: 06-09-2000, GB, 0021865.1 (folio 1)

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: LA SAL DE CLORHIDRATO DE 5-[4-[2-(N-METIL-N-(2-PIRIDIL)AMINO)ETOXI]BENCIL]TIAZOLIDIN-2,4-DIONA.

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

Reivindicaciones 1– 6 y 9: la sal de clorhidrato del compuesto (I) o 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidin-2,4-diona.

Reivindicación 7: un procedimiento para preparar el clorhidrato del compuesto (I)

Reivindicación 8: una composición farmacéutica que comprende el clorhidrato del compuesto (I) y un portador farmacéuticamente aceptable.

Reivindicación 10: el uso del clorhidrato del compuesto (I).

El problema técnico planteado en esta solicitud esta relacionado con la necesidad de obtener otra sal del compuesto (I), que posea mejores propiedades de estabilidad y solubilidad que la base, y que brinde ventajas para la formulación y procesamiento a nivel industrial.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona la sal de clorhidrato del compuesto (I), un procedimiento para prepararla y una composición farmacéutica que la contiene.

La presente invención se cataloga en A61K 31/44, A61K31/4439, A61K31/4427, C07D417/00, C07D417/12, A61P3/00, A61P3/04, A61P3/10, A61P5/50, A61P9/10, A61P9/12 de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. De la solicitud de Patente

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

Esta Oficina se permite señalar que dentro de la descripción se encontraron las siguientes observaciones:

Los términos “particularmente estable, buena solubilidad, buenas propiedades de flujo, aspecto favorecido,” no son claros ni concisos y deben ser sustituidos por términos precisos o concretos y explicados de forma que permitan una clara definición.

Los términos no técnicos no permiten dar claridad al documento, tales como “preparación y manejo globales, propiedades de flujo global, en forma global, punto de fusión en la escala de, agentes llenadores”. Se solicita revisar el documento y usar términos técnicos adecuados.

No hay claridad en la traducción de la frase “La recuperación del compuesto requerido generalmente comprende cristalización de un solvente apropiado, (folio 21)”, en “cloruro acido (ejemplos 1-4, folio 29-31). Se solicita revisión de la traducción y aclaración al respecto.

No hay claridad cuando no se da el significado de las siglas utilizadas como “CLAR”. Se solicita aclaración al respecto.

En el folio 35-36, se divulga la estabilidad y solubilidad de la sal de clorhidrato del compuesto (I). Sin embargo, no se da a conocer si fue comparado con el estado de la técnica más cercano como la sal de maleato del compuesto (I), así como tampoco se brindan datos comparativos que permitan conocer y sustentar las ventajas que se obtienen. Se requiere al solicitante para que anexe la información relacionada.

De acuerdo con las anteriores observaciones se concluye que en la descripción existe falta de claridad, concisión y sustento de la información de acuerdo con los requisitos del artículo 28 Decisión 486,

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

De la revisión del capítulo reivindicatorio esta Oficina se permite hacer las siguientes observaciones:

En la reivindicación 1 los términos “sustancialmente de conformidad con” no dan un significado definido y se pierde claridad en la reivindicación.

En las reivindicaciones 1-6, se está solicitando la sal de clorhidrato del compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil] tiazolidin-2,4-diona. Sin embargo, se encuentran algunas reivindicaciones dependientes que no están aportando adecuadamente a la caracterización de un compuesto, tales:

- La reivindicación 4 que da como característica de tal clorhidrato, que está en forma solida de dosificación.
- La reivindicación 5 que da como característica de tal clorhidrato, que está en una forma farmacéuticamente aceptable capaz de ser molida o en forma molida.
- La reivindicación 6 que da como característica de tal clorhidrato, que está en una forma farmacéuticamente aceptable y tiene buenas propiedades de flujo.
- La reivindicación 9 que da como característica de tal clorhidrato, su uso como una sustancia terapéuticamente activa.

Por lo que se requiere al solicitante para que caracterice dicho clorhidrato únicamente por los elementos técnicos esenciales que lo conforman.

En cuanto al sustento de la solicitud, se encuentra que en la descripción no se aportan datos de estudios comparativos con el estado de la técnica más cercano, que sería la sal de maleato del mismo compuesto, de modo que permita reconocer las ventajas de la materia reivindicada. Se requiere al solicitante para que anexe la información relacionada.

Por lo anterior, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de tener claridad, concisión y sustento de acuerdo con las exigencias del artículo 30 de la Decisión 486.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un uso distinto (artículos 14 y 21 D 486)

De acuerdo con los artículos citados la reivindicación 10, relacionada con uso de la sal de clorhidrato del compuesto (I), no se considera objeto de protección porque el uso no es un producto o un procedimiento tecnológico. Por lo tanto se recomienda al solicitante eliminarla del alcance de la invención.

5. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 06-09-2000, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a ésta.

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 9405659	Substituted thiazolidinedione derivates	17-03-1994
D2	EP 0306228	Substituted thiazolidinedione derivates	08-03-1989

Anterioridad **D1** en folios 78-81, y **D2** en folios 82-83

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La presente solicitud de patente busca protección en las reivindicaciones 1-9 para la sal de clorhidrato del compuesto (I) o 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidin-2,4-diona, un procedimiento para preparar el clorhidrato del compuesto (I) y una composición farmacéutica que comprende el clorhidrato del compuesto (I) y un portador farmacéuticamente aceptable.

SOLICITUD	D1	D2
Sal de clorhidrato de 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidin-2,4-diona (compuesto I).	Sal del ácido maléico de 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidin-2,4-diona (folio 8, ejemplos 1 y 2). Sales obtenidas por medio de ácidos farmacéuticamente aceptables: (folio 79, columna 2, línea 7-14) -Ácidos minerales como bromhídrico, clorhídrico y sulfúrico. -Ácidos orgánicos como metanosulfónico, tartárico y maléico . Para tratamiento diabetes tipo II, hiperglicemia, hiperlipidemia, hipertensión y enfermedad cardiovascular (folio 79, columna 1).	5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidin-2,4-diona (folio 84, ejemplo 30) o sus sales y/o sus solvatos farmacéuticamente aceptables. Para tratamiento de hiperglicemia, hiperlipidemia, otras enfermedades cardiovasculares, en particular para diabetes tipo II. (folio 82, columna 2)
Procedimiento para preparar la sal del (compuesto I). -dispersar o disolver el compuesto (I) en un solvente adecuado. -hacer reaccionar con fuente de ion cloruro -recuperar el clorhidrato	Procedimiento para obtener una sal, mezclando: -compuesto (I) en forma de sal protonada. -con la fuente del contra ion -en un solvente (generalmente etanol) a una temperatura adecuada para cristalización del producto (folio 80, columna 1).	-----
EFEECTO: -Mejor estabilidad (acuosa y en forma solida) que su base. -Mayor solubilidad acuosa que su base -Mejor manejo para la formulación y el procesamiento a nivel industrial.	EFEECTO: -Mejor estabilidad (acuosa y en forma solida) que su base. -Mayor solubilidad acuosa que su base -Proporciona ventajas para la formulación y el procesamiento a nivel industrial (folio 79, columna 1 y folio 80, columna 2).	-----

De la sal de clorhidrato del compuesto (I)

El documento del estado de la técnica más próximo es D1 que divulga la formación de sales del compuesto (I), obtenidas con ácidos farmacéuticamente aceptables como los minerales (ácido bromhídrico, **clorhídrico** y sulfúrico) y los orgánicos (metanosulfónico, tartárico y maléico); siendo la sal preferida la obtenida con el ácido maléico (folio 78-81).

Además, D1 menciona que las sales de este compuesto (I) presentan mejor estabilidad (acuosa y en forma sólida) y solubilidad acuosa, que la base correspondiente proporcionando ventajas para la formulación y la manipulación a granel (folio 79 y 80).

El documento D2, por su parte divulga el compuesto (I) y señala que este y/o sus sales y/o sus solvatos son adecuadas para el tratamiento de hiperglicemia e hiperlipidemia, otras enfermedades cardiovasculares y en particular para diabetes tipo II (folio 82).

La diferencia con D1 es que esta solicitud divulga específicamente la sal de clorhidrato del compuesto (I), pero esto no parece conceder un efecto técnico inesperado o sorprendente, ya que esta sal estaba sugerida por D1 y además porque no se presentan resultados que permita determinar las ventajas obtenidas mediante estudios comparativos de estabilidad y solubilidad de la sal de clorhidrato del compuesto (I) con el estado de la técnica más cercano (la sal de maleato de tal compuesto). Por lo que no se considera que la sal de clorhidrato tenga nivel inventivo.

Así, el problema técnico planteado en esta solicitud, relacionado con la necesidad de obtener otra sal del compuesto (I), que posea mejores propiedades de estabilidad y solubilidad que la base, y que brinde ventajas para la formulación y procesamiento a nivel industrial, ya se había resuelto previamente mediante la obtención de la sal de maleato del compuesto (I) y la solución propuesta por la presente solicitud es una alternativa obvia de las que un experto en la materia lograría, sin que tuviera que emplear una actividad inventiva para resolver el problema propuesto.

Del procedimiento para preparar la sal de clorhidrato del compuesto (I)

El documento D1 divulga un proceso para preparar una sal del compuesto de fórmula (1), en el que se mezcla una sal del compuesto, una fuente del contra-ion apropiado en un solvente adecuado (etanol preferiblemente) a una temperatura dada para cristalizar el producto requerido (folio 80).

La diferencia con D1 es que esta solicitud divulga particularmente una fuente de ion cloruro para formar la sal, pero esto no parece conceder un efecto técnico inesperado o sorprendente, ya que este contra-ion estaba sugerido por D1 y se hace obvio para un experto en la materia, por lo cual no se considera que dicho procedimiento tenga nivel inventivo.

De la composición farmacéutica que contiene el clorhidrato del compuesto (I)

Dado que la sal de clorhidrato del compuesto (I) no tiene nivel inventivo, la composición farmacéutica que la contiene tampoco lo posee.

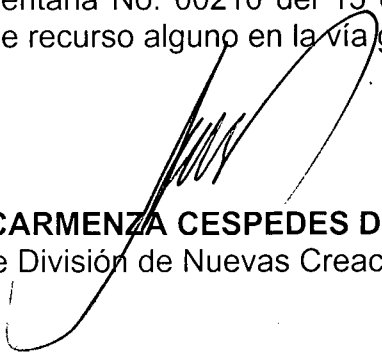
7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 9405659	1-9	Nivel inventivo
D2	EP 0306228	1-9	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 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 artículo 8 de la resolución reglamentaria No. 00210 del 15 de enero de 2001, advirtiéndole que contra él no procede recurso alguno en la vía gubernativa.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
12 OCT. 2007

CONCEPTO TECNICO No. 1761	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202079
-------------------------------------	--

