

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISI3N DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogot3, D.C., 21 de septiembre de 2007

Abogado
CARLOS R OLARTE
Apoderado

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-008178- -00005-0000

Fecha: 2007-10-18 10:27:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

Solicitante: **SMITHKLINE BEECHAM PLC**

ASUNTO	Radicaci3n	03-008178
	Tr3mite	002
	Evento	001
	Actuaci3n	430
	Oficio	13292
	Folios	07

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el art3culo 45 de la Decisi3n 486 de la Comisi3n de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Descripci3n: Folios: 22 a 41 y 45 como se radic3 inicialmente
- 1.2. Reivindicaciones: 1 a 11 Folios 42 a 44 como se radic3 inicialmente
- 1.3. Dibujos Folios 54 a 57
- 1.3. Prioridad: Folio 01: Agosto 04 de 2000,GB,0019228.6

2. Objeto de la invenci3n

- T3tulo de la solicitud: **“SALES DE TARTRATO DERIVADOS DE TIAZOLIDINODIONA”**- T3tulo modificado antes **“COMPUESTOS FARMAC3UTICOS NOVEDOSOS”** (Ver folio 53)

El objeto de la presente solicitud de patente de invenci3n consiste en la obtenci3n de un compuesto novedoso D(-) tartrato de 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona, o un solvato del mismo, un procedimiento para preparar dicho compuesto, la composici3n farmac3utica y el uso de dicho compuesto.

- Reivindicaciones 1– 7: Un compuesto
- Reivindicaci3n 8: Procedimiento de preparaci3n
- Reivindicaci3n 9: Composici3n farmac3utica
- Reivindicaci3n 10: Un compuesto
- Reivindicaci3n 11: Uso del compuesto

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos derivados de tiazolidinodiona que posean buenas propiedades de flujo global para su uso a gran escala y estable para la profilaxis de las condiciones asociadas con diabetes mellitus, incluyendo el tratamiento de las condiciones tales como resistencia a la insulina, hiperinsulinemia y diabetes gestacional.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una sal D(-)tartrato del compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino) etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona, derivado de tiazolidinodiona.

- **Clasificación Internacional de Patentes (IPC):** A61K31/4439, C07D417/12, A61K31/4427, C07D417/00, A61K31/44

3. De la solicitud de Patente (según el caso)

3.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

- El solicitante no anexa datos comparativos de las ventajas técnicas y el efecto inesperado en las propiedades de flujo, rendimiento y estabilidad frente a los compuestos reportados en el estado de la técnica que demuestren el salto tecnológico alcanzado.
- El solicitante no anexa datos comparativos de las ventajas técnicas y el efecto inesperado en el rendimiento y uso a gran escala de los procedimientos de preparación reportados en el estado de la técnica, que demuestren el salto tecnológico alcanzado

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La reivindicación 10 se encuentra caracterizada por el uso como sustancia terapéuticamente activa.

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

Las reivindicación 11 se refiere al uso del compuesto D(-) tartrato del compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona o su solvato.

Se recuerda al solicitante conforme al artículo citado, que no se puede otorgar patente a usos según los artículos citados de la normatividad.

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: 04/08/2000, se encontraron los siguientes documentos del estado de la técnica relacionados, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 94/05659	"Substituted thiazolidinedione derivatives"	17/03/1994

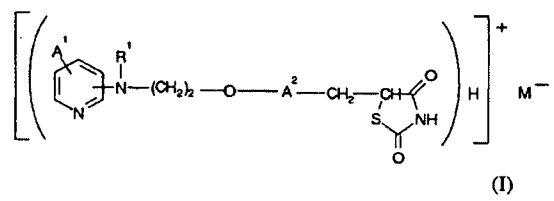
6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Novedad (artículo 16 D486)

Compuesto D(-)tartrato del compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona o su solvato.

La solicitud presentada en la reivindicación 1 se refiere a un compuesto D(-) tartrato de 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona, o un solvato del mismo, el cual comprende un ión tartrato (-) proveniente de un ácido orgánico y un ión (+) correspondiente a 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona, útiles para el tratamiento de la diabetes mellitus tipo II

El documento D1 previamente divulgaba compuestos derivados de tiazolidindionas sustituidas con la fórmula (I)



Al realizar los reemplazos siguientes en la molécula correspondiente al ión (+) donde A¹ es hidrógeno, R¹ es un grupo alquilo (metilo) y A² es un anillo de benceno, la estructura final corresponde al compuesto 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona. (Ver página 09 líneas 5-19, D1)

En D1 el ión (-) corresponde a un ácido farmacéuticamente aceptable con un pKa en el rango entre 0.1 y 4.5 (Ver página 09, líneas 21 y 22). Los ácidos farmacéuticamente aceptables incluyen los ácidos minerales, como los ácidos bromhídrico, clorhídrico y sulfúrico, ácidos orgánicos como el metanosulfónico, tartárico y maleato, especialmente tartárico y maleico. (Ver página 02, líneas 7-14) Al realizar el reemplazo del ión M (-) encontramos el ión tartrato.

En D1 se divulgaba adicionalmente el solvato y tautómeros de la fórmula (I)

Conforme al análisis anterior el compuesto correspondiente a las reivindicaciones 1-7 y 10, y sus composiciones farmacéuticas de la reivindicación 09 carecen de novedad y por lo tanto de nivel inventivo.

Procedimiento de preparación

En la solicitud presentada el procedimiento de preparación se caracteriza porque 5-[4-[2-(N-metil-N-(2-piridil)amino)etoxi]bencil]tiazolidino-2,4-diona compuesto (I) o una sal del mismo de preferencia dispersado o disuelto en un solvente adecuado, se hace reaccionar con una fuente de ión D(-) tartrato y después si se requiere, se prepara un solvato de D(-) tartrato. El solvente es un alcohol (etanol) o un hidrocarburo como tolueno, acetona, acetato de etilo, diclorometano, agua, ácido acético

La fuente del ión es el ácido D(-) tartárico o una sal soluble como D(-) tartrato de amonio o de una amina como etilamina o dietilamina

La concentración del compuesto I es 2-25% 5-20% y del ácido tartárico es de 5-130%P/V y se realiza a temperatura ambiente o de reflujo con posterior cristalización en etanol o propan-2-ol (Ver folios 25 y 26-Descripción)

En D1 se divulgaba previamente el procedimiento de preparación del compuesto de fórmula (I) donde la reacción se realiza entre el compuesto de fórmula (I) y la fuente del contraión M⁺, adecuadamente en cantidades equimolares aproximadamente, usando un ligero exceso de la fuente del contraión M⁺ en un solvente, generalmente alcanólico C₁₋₄ como etanol a cualquier temperatura, generalmente a temperatura elevada por ejemplo a reflujo del solvente y posterior cristalización. Los solvatos son preparados usando los procedimientos químicos convencionales (Ver página 04 líneas 18-27)

Conforme a lo anteriormente descrito al hacer la comparación de D1 y la reivindicación 08 de la solicitud presentada, poseen los mismos elementos técnicos característicos por lo tanto carece de novedad y nivel inventivo

7. Conclusión:

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

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 94/05659	1-10	Novedad

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 numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única Nº 10 de 2001.

ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

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

CONCEPTO TÉCNICO No.01670	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202070
---------------------------	---

10043