

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C., 30 de Noviembre de 2007

Abogado

CARLOS R OLARTE

Apoderado

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-037181- -00002-0000

Fecha: 2007-12-20 12:34:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO

Radicación	03-037181
Trámite	002
Evento	001
Actuación	430
Oficio	16518
Folios	05

Patente de Invención ☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☐ Cap.I ☐ Cap. II ☐

No. Sol. Internacional	<u>PCT/IB01/02213</u>
Fecha de Presentación Internat.	19 DE Noviembre de 2001

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: 63 a 95 y 116 como se radicó inicialmente

1.2. Reivindicaciones: Folios 96 a 115 como se radicó inicialmente

1.3. Prioridad: Folios: 01
30 de Noviembre de 2000, US, 60/250.069

2. Análisis de la Prioridad

La prioridad con fecha de 30 de Noviembre de 2000 se ha tomado como referencia aceptada para el análisis de patentabilidad.

3. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: **“COMBINACIONES DE AGONISTAS DE GABA E INHIBIDORES DE SORBITOL-DESHIDROGENASA”**.
- El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en composiciones farmacéuticas que comprenden una cantidad de agonista de

GABA, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho agonista de GABA o dicho profármaco y una cantidad de SDI, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho SDI o dicho profármaco

Reivindicación 1-14: Una composición farmacéutica

Reivindicación 15: Uso

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de combinaciones útiles de aditivos y sinérgicas **para el tratamiento de complicaciones como neuropatía, nefropatía, cardiomiopatía, retinopatía, microangiopatía, macroangiopatía, y cataratas o úlceras en los pies de los pacientes diabéticos**

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición de un agonista de GABA sus profármacos o una sal farmacéuticamente aceptable y un compuesto inhibidor de la enzima sorbitol deshidrogenasa (SDI), sus profármacos o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

- **Clasificación Internacional de Patentes (IPC):** A61K31/195, A61K31/197, A61K31/36, A61K31/4166, A61K31/4453, A61K31/4535, A61K31/505, A61K31/506, A61K31/5377, A61K31/55, A61K38/08, A61K45/06

4. De la solicitud de Patente

4.1. Descripción (artículo 28 D. 486)

- No se encontraron datos y ejemplos comparativos que demuestren y sustenten el efecto inesperado de las composiciones farmacéuticas para el tratamiento de complicaciones como neuropatía, nefropatía, cardiomiopatía, retinopatía, microangiopatía, macroangiopatía y cataratas o úlceras en los pies de los pacientes diabéticos frente a las composiciones farmacéuticas previamente divulgadas en el estado de la técnica.
- El término "profármaco" para cada uno de los compuestos se encuentra de forma amplia y no especifica el tipo o clase, tanto para los agonistas de GABA como los inhibidores SDI

El solicitante debe sustentar en la descripción que el problema técnico se ha resuelto combinando sinérgicamente un agonista de GABA sus profármacos o una sal farmacéuticamente aceptable y un compuesto inhibidor de la enzima sorbitol deshidrogenasa (SDI), sus profármacos o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

4.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- La reivindicación 1 referente a composición farmacéutica se encuentra de forma general y amplia cuando se mencionan "los agonistas de GABA" y "los inhibidores de la enzima sorbitol deshidrogenasa".

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

- La reivindicación 15 respectivamente se refieren al uso de la composición farmacéutica.

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

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: 30 de Noviembre de 2000

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 30/11/2000 se encontraron los siguientes documentos del estado de la técnica relacionados, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

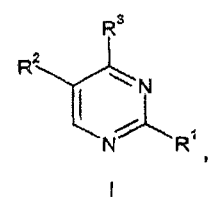
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 00/59510	"Aminopyrimidines as sorbitol dehydrogenase inhibitors"	12/10/2000

12. Análisis de patentabilidad (según requisito) (artículo 14 D486)

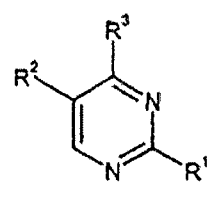
12.1 Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La reivindicación 1 se refiere a una composición farmacéutica que comprende: una cantidad de un agonista de GABA o un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho agonista de GABA o dicho profármaco y una cantidad de SDI, un profármaco del mismo o una sal farmacéuticamente aceptable de dicho SDI o dicho profármaco.

Los compuestos SDI son descritos en la reivindicación 7 con fórmula I:



El estado de la técnica más cercano es D1, pues enseña previamente compuestos de aminopirimidinas como inhibidores de sorbitol deshidrogenasa de fórmula I y sus composiciones con inhibidores de aldosa reductasa para tratar las complicaciones de los pacientes diabéticos. (Ver resumen, línea 6)



La única diferencia con la solicitud presentada es la asociación con un compuesto agonista de GABA.

El solicitante debe demostrar el efecto inesperado y el aporte al estado de la técnica, de la composición farmacéutica de los agonistas de GABA con inhibidores de sorbitol deshidrogenasa en comparación con las composiciones previamente divulgadas en

.D1.

El problema técnico a resolver como es la necesidad de combinaciones útiles de aditivos y sinérgicas **para el tratamiento de complicaciones como neuropatía, nefropatía, cardiomiopatía, retinopatía, microangiopatía, macroangiopatía, y cataratas o úlceras en los pies de los pacientes diabéticos** había sido previamente resuelto en D1 con composiciones con inhibidores de aldosa reductasa.

13. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 00/59510	1-14	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 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 N° 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 21 DIC. 2007

CONCEPTO TÉCNICO No.02467	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202070
----------------------------------	--

10293

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁷:

A61K 31/505, A61P 3/10, C07D 241/44, 498/04, 401/14, 239/42, 451/02, 451/14, 471/04, 491/10, 487/08, 409/12, 405/12, 491/04, 401/04, 417/12, 409/14, 487/04, 513/10, 417/14 // (C07D 498/04, 213:00, 263:00) (C07D 471/04, 221:00, 231:00) (C07D 491/10, 221:00, 311:00) (C07D 471/04, 221:00, 239:00) (C07D 487/08, 209:00, 209:00) (C07D 491/04, 221:00, 307:00), 487:04) (C07D 241/00, 251:00)

A1

(11) International Publication Number:

(WO 00/59510)

(43) International Publication Date:

12 October 2000 (12.10.00)

(21) International Application Number:

PCT/IB00/00296

(22) International Filing Date:

16 March 2000 (16.03.00)

(30) Priority Data:

60/127,437

1 April 1999 (01.04.99)

US

Research Division, Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US). ZEMBROWSKI, William, James [US/US]; Pfizer Inc., Central Research Division, Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US).

(74) Agents: SPIEGEL, Allen, J. et al.; Simpson, Alison, Urquhart-Dykes & Lord, 91 Wimpole Street, London W1M 8AH (GB).

(71) Applicant (for all designated States except US): PFIZER PRODUCTS INC. [US/US]; Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US).

(72) Inventors; and

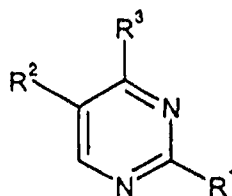
(75) Inventors/Applicants (for US only): CHU-MOYER, Margaret, Yuhua [US/US]; Pfizer Inc., Central Research Division, Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US). MURRY, Jerry, Anthony [US/US]; Pfizer Inc., Central Research Division, Eastern Point Road, Groton, CT 06340 (US). MYLARI, Banavara, Lakshman [US/US]; Pfizer Inc., Central

(81) Designated States: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published

With international search report.

(54) Title: { AMINOPYRIMIDINES AS SORBITOL DEHYDROGENASE INHIBITORS }



(I)

(57) Abstract

This invention is directed to sorbitol dehydrogenase inhibitory compounds of formula (I), wherein R¹, R² and R³ are as defined in the specification. This invention is also directed to pharmaceutical compositions containing those compounds and methods of treating or preventing diabetic complications, particularly diabetic neuropathy, diabetic nephropathy, diabetic microangiopathy, diabetic macroangiopathy and diabetic cardiomyopathy by administering such compounds to a mammal suffering from diabetes and therefor at risk for developing such complications. This invention is also directed to pharmaceutical compositions comprising a combination of a compound of formula (I) of this invention with an aldose reductase inhibitor and to methods of treating or preventing diabetic complications therewith. This invention is also directed to pharmaceutical compositions comprising a combination of a compound of formula (I) of this invention with an NHE-1 inhibitor and to methods of treating cardiomyopathy and other heart-related problems therewith. This invention is also directed to certain intermediates used in the synthesis of the compounds of formula (I) and to processes for preparing those intermediates.