

CASTELLANOS & CO.

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-038072- -00009-0000

Fecha: 2008-09-02 14:26:04 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Evt: 379 FASENACIONALI
Act 449 RESPUESOPOSICI Folios. 7

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E. S. D.

Ref.: Expediente No. **06.038.072**

Solicitud de Patente de Invención para: **USO DE UN DERIVADO DE PIRAZOL
PARA PREPARAR MEDICAMENTOS PARA LA PREVENCION Y EL
TRATAMIENTO DE LAS DISLIPIDEMIAS Y LAS ENFERMEDADES ASOCIADAS
CON LAS DISLIPIDEMIAS Y/O LA OBESIDAD**

Solicitante: **SANOFI-AVENTIS**

Opositor: **PROCABS S.A.**

RESPUESTA A OPOSICION

LUIS PATIÑO LEYVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio No. **7298** notificado por fijación en lista el 6 de junio de 2008 correspondiente a la oposición presentada por **PROCABS S.A.** estando dentro del término legal en los siguientes términos:

En primer lugar, me presento un nuevo pliego modificadorio modificado en donde se han eliminado las referencias a "usos". Encuentren adjunto el formato de modificaciones y el recibo por la tasa correspondiente.

Con respecto al arte previo citado por el opositor, el solicitante manifiesta su desacuerdo toda vez que, como se explica a continuación, dichos documentos no afectan ni la novedad ni el nivel inventivo de la presente solicitud.

252
232

CASTELLANOS & CO.

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Novedad de la solicitud

El documento D1 (FR2758723) se enfoca en el uso de antagonistas del receptor CB1 para el desarrollo de medicamentos útiles en el tratamiento de desórdenes del apetito. El hecho que se describa la utilidad de los antagonistas del receptor CB1 en el tratamiento de desórdenes del apetito no implica que éstos necesariamente sean también eficientes en el tratamiento de enfermedades relacionadas con obesidad. En el área farmacéutica se sabe que es difícil predecir el efecto de un medicamento, aún cuando se tenga un indicio terapéutico.

D1 también enseña que los antagonistas del receptor CB1 pueden combinarse con un compuesto para regular desórdenes metabólicos. Más específicamente, se cita la combinación de antagonistas del receptor CB1 con un agonista receptor $\beta 3$ adrenérgico. Sin embargo el documento D1 no revela específicamente todas y cada una de las características técnicas reivindicadas por la presente solicitud de patente y, en consecuencia, no podría afectar el requisito de novedad.

Nivel Inventivo

El solicitante considera que las enseñanzas del documento D2 no podrían afectar el nivel inventivo de las combinaciones propuestas por presente solicitud. D2 (WO0228346) enseña el uso de una combinación de antagonista CB1 con sibutramina, un agente anti-obesidad, en el tratamiento de obesidad o ingesta de alimentos. D2 no enseña la aplicación de la combinación en el tratamiento de síndrome metabólico o esteatosis y, por lo tanto, dicho documento no motivaría al experto en el campo técnico a desarrollar un medicamento que comprenda antagonista CB1 para el tratamiento de éstas enfermedades

Por otra parte, D2 cita Rimonabant entre una larga lista de posibles antagonistas CB1 y no muestra ejemplos del efecto sinérgico de la combinación. Este documento únicamente se centra en la reducción del consumo de alimentos y no llevaría a una persona versada en la materia a desarrollar la presente invención, ya que no enseña ni sugiere las combinaciones específicas aquí divulgadas.

253
753

En vista de lo anterior, solicito respetuosamente a su Despacho declarar infundada la oposición de **Procabs S.A.** toda vez que las reivindicaciones de la presente solicitud cumplen con los requisitos de novedad y nivel inventivo tal como se describió a lo largo del presente memorial.

De la Señora Jefe,



Luis Patiño Leyva
C.C. No. 2.930.616 de Bogotá
T.P.A. No. 2698 del C. Sup. de la Judicatura
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Tel.: 610 7420 – 610 7480

PATENTES/DR. PATIÑO/P20207/MEMORIAL RESPUESTA OPOSICION

254
253
254

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

① SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud

② SOLICITANTE	Nombre: SANOFI - AVENTIS	IDENTIFICACIÓN	
	Dirección: 174 avenue de France 75013 PARIS FRANCIA	C.C. ☐	NIT ☐
	Nacionalidad o Domicilio: Paris, FRANCIA	C.E. ☐	Otro ☐
	Lugar de Constitución: FRANCIA		Cual _____
	Teléfono: _____ Fax: _____	Número _____	
	E-mail: _____		
③ REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: LUIS PATIÑO LEYVA	IDENTIFICACIÓN	
	Dirección: Calle 94A No. 7A - 09	C.C. ☒	NIT ☐
	Teléfono: 610 74 20 Fax: 610 07 06	C.E. ☐	Otro ☐
	E-mail: info@castellanosyco.com		Cual _____
		Número 2.930.616	TPA 2698

④ Número de Expediente: **06.038.072**

⑤ Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio sobre el cual solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud.

⑥ Comprobante de pago No. **08 - 65,156** Fecha **14/08/2008**

⑦ Anexos:

☒ Comprobante de pago de la tasa.
☐ Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.
☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas
☒ Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE	LUIS PATIÑO LEYVA	FIRMA	
		CC 2.930.616 de Bogotá - TPA 2698 CSJ	

255
255

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-038072- -00009-0000

Fecha: 2008-09-02 14:26:04 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 449 RESPUESOPOSICI Folios: 7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800174009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 65,156
: AGOSTO 14 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	80927151	14/08/2008	5,398,000.00

***** CONCEPTO *****

RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50009-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	103,000.00
	TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

256.
254

REIVINDICACIONES

1. Rimonabant para la preparación de medicamentos útiles en el tratamiento y prevención de las enfermedades asociadas con la obesidad y/o con las dislipidemias elegidas entre el síndrome metabólico y esteatosis.
2. Rimonabant para la prevención y el tratamiento del síndrome metabólico.
3. Rimonabant para la prevención y el tratamiento de esteatosis.
4. Rimonabant usado en combinación con otro principio activo elegido entre una de las clases terapéuticas siguientes:
 - un antagonista de los receptores AT₁ de la angiotensina II, solo o asociado con un diurético o con un antagonista cálcico;
 - un inhibidor de la enzima de conversión, solo o asociado con un diurético;
 - un antagonista cálcico;
 - un beta-bloqueante, solo o asociado con un diurético o con un antagonista cálcico;
 - un agente reductor de lípidos en sangre o un agente reductor de colesterol en sangre;
 - un agente antidiabético;
 - otro agente anti-obesidad.
5. Rimonabant según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, utilizado en una dosis comprendida entre 5 mg y 50 mg.
6. Una composición farmacéutica que contiene en combinación, rimonabant y un antagonista de los receptores AT₁ de la angiotensina II, solo o asociado con un diurético.
7. Una composición farmacéutica según la reivindicación 6, que contiene en combinación, rimonabant e irbesartán.

D₁

258
258

① RÉPUBLIQUE FRANÇAISE
INSTITUT NATIONAL
DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE
PARIS

⑪ N° de publication : **2 758 723**

(à n'utiliser que pour les
commandes de reproduction)

⑫ N° d'enregistrement national : **97 00870**

⑬ Int Cl⁶ : A 61 K 31/445 // (A 61 K 31/445, 31:22)

⑭ **DEMANDE DE BREVET D'INVENTION**

A1

⑮ Date de dépôt : 28.01.97.

⑯ Priorité :

⑰ Date de mise à la disposition du public de la
demande : 31.07.98 Bulletin 98/31.

⑱ Liste des documents cités dans le rapport de
recherche préliminaire : *Se reporter à la fin du
présent fascicule*

⑲ Références à d'autres documents nationaux
apparentés :

⑴ Demandeur(s) : SANOFI SOCIETE ANONYME — FR.

⑵ Inventeur(s) : MARUANI JEANNE et SOUBRIE PHI-
LIPPE.

⑶ Titulaire(s) :

⑷ Mandataire(s) : CABINET BEAU DE LOMENIE.

⑸ **UTILISATION DES ANTAGONISTES DES RECEPTEURS AUX CANNABINOIDES CENTRAUX POUR LA
PREPARATION DE MEDICAMENTS.**

⑹ L'invention concerne l'utilisation d'un antagoniste des
récepteurs aux cannabinoïdes centraux, seul ou en asso-
ciation avec un composé régulateur des désordres métabo-
liques, notamment un agoniste du récepteur β_3 -
adrénergique, pour la préparation de médicaments utiles
dans le traitement des troubles de l'appétence. §

FR 2 758 723 - A1



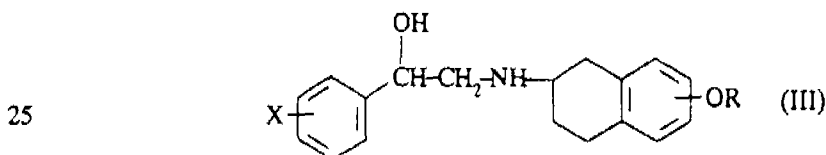
radical hétérocyclique choisi parmi pyrrolidin-1-yle, pipéridin-1-yle, morpholin-4-yle et pipérazin-1-yle, non substitué ou substitué par un (C₁-C₄)alkyle ; ainsi que leurs sels et leurs solvates.

5 Plus particulièrement, la présente invention concerne l'utilisation du N-pipéridino-5-(4-chlorophényl)-1-(2,4-dichlorophényl)-4-méthylpyrazole-3-carboxamide, de ses sels pharmaceutiquement acceptables et de leurs solvates pour la préparation de médicaments utiles pour le traitement des troubles de l'appétence.

10 Selon la présente invention, on peut également utiliser les antagonistes des récepteurs CB1 en association avec un autre principe actif pour préparer des médicaments utiles pour le traitement des troubles de l'appétence, notamment pour le traitement des troubles des conduites alimentaires ; on peut utiliser une composition pharmaceutique comprenant en association un antagoniste des récepteurs CB1 et un composé régulateur des désordres métaboliques, notamment un agoniste du récepteur β₃-adrénergique ci-après dénommé β₃-agoniste.

15 Ainsi la présente invention a également pour objet des compositions pharmaceutiques contenant un antagoniste des récepteurs CB1 et un régulateur des désordres métaboliques, comme par exemple des hypolipémiants, hypolypémiants ou lipolytiques. Plus particulièrement, la présente invention a pour objet des compositions pharmaceutiques contenant un antagoniste des récepteurs CB1 et un β₃-agoniste.

20 Des β₃-agonistes utiles pour l'utilisation selon la présente invention sont les composés de formule :



dans laquelle

- X représente l'hydrogène, un halogène, un trifluorométhyle ou un (C₁-C₄)alkyle;
- R représente l'hydrogène ou un méthyle, non substitué ou substitué par un carboxy ou un alcoxycarbonyle dans lequel l'alcoxy est en (C₁-C₆),

30 et leurs sels pharmaceutiquement acceptables, indiqués dans EP 0 211 721 et EP 0 303 546 comme spasmolytiques intestinaux.

Parmi les composés de formule (III), les composés:

- 2-[(7-hydroxy-1,2,3,4-tétrahydronapht-2-yl)amino]-1-phényléthanol;
- 35 • 2-[(7-hydroxy-1,2,3,4-tétrahydronapht-2-yl)amino]-1-(3-chlorophényl)éthanol;

D₂260
260

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
23 October 2003 (23.10.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/087037 A1(51) International Patent Classification⁷: C07C 233/05,
C07D 311/04, 215/02, 471/02, 277/62, 235/02, 401/04,
495/02, A61K 31/165, 31/34, 31/47, 31/44, 31/425,
31/415, 31/38(74) Common Representative: MERCK & CO., INC.; 126
East Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065-0907 (US).

(21) International Application Number: PCT/US03/09800

(22) International Filing Date: 1 April 2003 (01.04.2003)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/370,553 5 April 2002 (05.04.2002) US(81) Designated States (*national*): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GI, GM,
KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).(71) Applicant (*for all designated States except US*): MERCK
& CO., INC. [US/US]; 126 East Lincoln Avenue, Rahway,
NJ 07065-0907 (US).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (*for US only*): HAGMANN,
William, K. [US/US]; 126 East Lincoln Avenue, Rahway,
NJ 07065-0907 (US). LIN, Linus, S. [CN/US]; 126 East
Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065-0907 (US). SHAH,
Shrenik, K. [US/US]; 126 East Lincoln Avenue, Rahway,
NJ 07065-0907 (US).

Published:

- with international search report
- before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.



WO 03/087037 A1

(54) Title: SUBSTITUTED ARYL AMIDES

(57) Abstract: Novel compounds of structural formula (I) are antagonists and/or inverse agonists of the Cannabinoid-1 (CB1) receptor and are useful in the treatment, prevention and suppression of diseases mediated by the CB1 receptor. The compounds of the present invention are useful as psychotropic drugs in the treatment of psychosis, memory deficits, cognitive disorders, migraine, neuropathy, neuro-inflammatory disorders including multiple sclerosis and Guillain-Barre syndrome and the inflammatory sequelae of viral encephalitis, cerebral vascular accidents, and head trauma, anxiety disorders, stress, epilepsy, Parkinson's disease, movement disorders, and schizophrenia. The compounds are also useful for the treatment of substance abuse disorders, the treatment of obesity or eating disorders, as well as, the treatment of asthma, constipation, chronic intestinal pseudo-obstruction, and cirrhosis of the liver.

261
261

of Formula I is preferred. Accordingly, the pharmaceutical compositions of the present invention include those that also contain one or more other active ingredients, in addition to a compound of Formula I. Examples of other active ingredients that may be combined with a compound of Formula I include, but are not limited to:

- 5 antipsychotic agents, cognition enhancing agents, anti-migraine agents, anti-asthmatic agents, antiinflammatory agents, anxiolytics, anti-Parkinson's agents, anti-epileptics, anorectic agents, serotonin reuptake inhibitors, and other anti-obesity agents, which may be administered separately or in the same pharmaceutical compositions.

- 10 The present invention also provides a method for the treatment or prevention of a CB1 receptor modulator mediated disease, which method comprises administration to a patient in need of such treatment or at risk of developing a CB1 receptor modulator mediated disease of an amount of a CB1 receptor modulator and an amount of one or more active ingredients, such that together they give effective relief.

- 15 In a further aspect of the present invention, there is provided a pharmaceutical composition comprising a CB1 receptor modulator and one or more active ingredients, together with at least one pharmaceutically acceptable carrier or excipient.

- 20 Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided the use of a CB1 receptor modulator and one or more active ingredients for the manufacture of a medicament for the treatment or prevention of a CB1 receptor modulator mediated disease. In a further or alternative aspect of the present invention, there is therefore provided a product comprising a CB1 receptor modulator and one or more active ingredients as a combined preparation for simultaneous, 25 separate or sequential use in the treatment or prevention of CB1 receptor modulator mediated disease. Such a combined preparation may be, for example, in the form of a twin pack.

- 30 It will be appreciated that for the treatment or prevention of eating disorders, including obesity, bulimia nervosa and compulsive eating disorders, a compound of the present invention may be used in conjunction with other anorectic agents.

The present invention also provides a method for the treatment or prevention of eating disorders, which method comprises administration to a patient in

need of such treatment an amount of a compound of the present invention and an amount of an anorectic agent, such that together they give effective relief.

Suitable anorectic agents of use in combination with a compound of the present invention include, but are not limited to, aminorex, amphechloral, amphetamine, benzphetamine, chlorphentermine, clobenzorex, cloforex, clominorex, clortermine, cyclexedrine, dexfenfluramine, dextroamphetamine, diethylpropion, diphenmethoxidine, *N*-ethylamphetamine, fenbutrazate, fenfluramine, fenisorex, fenproporex, fludorex, fluminorex, furfurylmethylamphetamine, levamfetamine, levophacetoperane, mazindol, mefenorex, metamfepramone, methamphetamine, norpseudoephedrine, pentorex, phendimetrazine, phenmetrazine, phentermine, phenylpropanolamine, picilorex and sibutramine; and pharmaceutically acceptable salts thereof.

A particularly suitable class of anorectic agent are the halogenated amphetamine derivatives, including chlorphentermine, cloforex, clortermine, dexfenfluramine, fenfluramine, picilorex and sibutramine; and pharmaceutically acceptable salts thereof.

Particularly preferred halogenated amphetamine derivatives of use in combination with a compound of the present invention include: fenfluramine and dexfenfluramine, and pharmaceutically acceptable salts thereof.

It will be appreciated that for the treatment or prevention of obesity, the compounds of the present invention may also be used in combination with a selective serotonin reuptake inhibitor (SSRI).

The present invention also provides a method for the treatment or prevention of obesity, which method comprises administration to a patient in need of such treatment an amount of a compound of the present invention and an amount of an SSRI, such that together they give effective relief.

Suitable selective serotonin reuptake inhibitors of use in combination with a compound of the present invention include: fluoxetine, fluvoxamine, paroxetine, sertraline, and imipramine, and pharmaceutically acceptable salts thereof.

It will be appreciated that for the treatment or prevention of obesity, the compounds of the present invention may also be used in combination with an opioid antagonist.

The present invention also provides a method for the treatment or prevention of obesity, which method comprises administration to a patient in need of

such treatment an amount of a compound of the present invention and an amount of an opioid antagonist, such that together they give effective relief.

Suitable opioid antagonists of use in combination with a compound of the present invention include: naltrexone, 3-methoxynaltrexone, naloxone and
5 nalmefene, and pharmaceutically acceptable salts thereof.

It will be appreciated that for the treatment or prevention of obesity, the compounds of the present invention may also be used in combination with are inhibitors of the enzyme 11 β -HSD1. Generally, glucocorticoid concentrations are modulated by tissue-specific 11 β -hydroxysteroid dehydrogenase enzymes. The
10 11 β -hydroxysteroid dehydrogenase type 1 enzyme (11 β -HSD1) is a low affinity enzyme that generally uses NADP⁺ as a cofactor rather than NAD⁺ (Agarwal *et al.*, 1989). In vitro studies have shown that 11 β -HSD1 is capable of acting as both a reductase and a dehydrogenase. However, 11 β -HSD1 in vivo generally acts as a reductase, converting 11-ketoglucocorticoids, such as cortisone, to 11 β -
15 hydroxyglucocorticoids such as cortisol.

Excessive levels of cortisol have been associated with obesity, perhaps due to increased hepatic gluconeogenesis. Thus, the administration of an effective amount of an 11 β -HSD1 inhibitor in combination with a CB1 antagonist of the present invention may be useful in the treatment or control of obesity. Particular
20 inhibitors of 11 β -HSD1 useful in combination with the compounds of the present invention include: 3-(1-adamantyl)-4-ethyl-5-(ethylthio)-4H-1,2,4-triazole, 3-(1-adamantyl)-5-(3,4,5-trimethoxyphenyl)-4-methyl-4H-1,2,4-triazole, and 3-adamantany-4,5,6,7,8,9,10,11,12,3a-decahydro-1,2,4-triazolo[4,3-a][11]annulene.

It will be appreciated that for the treatment or prevention of obesity,
25 the compounds of the present invention may also be used in combination with another anti-obesity agent.

The present invention also provides a method for the treatment or prevention of obesity, which method comprises administration to a patient in need of such treatment an amount of a compound of the present invention and an amount of
30 another anti-obesity agent, such that together they give effective relief.

Suitable anti-obesity agents of use in combination with a compound of the present invention, include, but are not limited to: 1) growth hormone secretagogues, such as those disclosed and specifically described in U.S. Patent 5,536,716; 2) growth hormone secretagogue receptor agonists/antagonists, such as

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES2020
Bogotá, D.C.,Abogado
LUIS PATIÑO LEYVA

ASUNTO	Radicación	06-038072
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	11 - 9382

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT/FR2004/002715
Fecha de Presentación Internal.	Octubre 22 de 2004

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: 35 a 50 | como se radicó inicialmente |
| 1.2. Reivindicaciones: | Folios: 51 a 54 | como se radicó inicialmente |
| | Folios: 108 a 109 | modificadas |
| | Folios: 256 a 257 | modificadas |
| 1.3. Oposiciones: | Folios: 110 a 247 | PROCAPS S.A. |
| 1.4. Prioridad: | FR No. 0312553 del 24 de Octubre de 2003 | |
| | FR No. 0314763 del 15 de Diciembre de 2003 | |
| | FR No. 0401193 del 05 de Febrero de 2004 | |
| | FR No. 0403252 del 26 de Marzo de 2004 | |
| 1.5. Respuesta del solicitante: A la Oposición: | Folios: 251 a 257 | |

2. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: " USO DE UN DERIVADO DE PIRAZOL PARA PREPARAR MEDICAMENTOS PARA LA PREVENCIÓN Y EL TRATAMIENTO DE LA DISPLIDEMIA Y LAS ENFERMEDADES ASOCIADAS CON LA DISPLIDEMIA Y/O LA OBESIDAD".

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

- Reivindicaciones 1 a 3 y 5: Compuesto Rimonabant
- Reivindicaciones 4 y 6 a 14: Composición farmacéutica

El problema a planteado en esta solicitud es la necesidad de usar un compuesto de pirazol derivado, que es un antagonista para los receptores de cannabinoides CB1; los cuáles son útiles en la prevención y el tratamiento de dislipidemias y enfermedades relacionadas con dislipidemias y/o con obesidad.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio presenta un compuesto de Rimonabant y su composición farmacéutica.

- El objeto de la invención definido anteriormente se clasifico de acuerdo con la IPC: A61K 31/454, A61K 31/4178, A61K 31/5415, A61K 31/366 y A61P 45/06

3. De la solicitud de Patente

3.1 Título

Se recomienda no mencionar el uso ni la la aplicación terapéutica en el titulo, ya que estas no son patentables; ajustar el titulo a lo que se desea proteger a través del capítulo reivindicatorio.

3.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

- Las Reivindicaciones 1 a 3 y 5; están definiendo un compuesto (Rimonabant) no por sus estructura química, sino por su uso.
- La Reivindicación 4; en esta se esta reivindicando una combinación del Rimonabant con otros agentes terapéuticos; la misma no se acepta porque no se encuentra soportada de manera suficiente en el capítulo descriptivo.
- Las Reivindicaciones 6 a 14; reivindican la combinación del compuesto (Rimonabant) con otros ingredientes activos; las mismas no se aceptan porque no se encuentran soportadas de manera suficiente en el capítulo descriptivo.

Por lo anteriormente expuesto, es preciso que señale el alcance de su invención.

4. Análisis de la Oposición: (artículo 43 D. 486):

4.1 OPOSICION DE PROCAPS S.A. (Folios 118 a 247; del 15-04-2008):

El opositor argumenta que la presente solicitud no sería patentable, ya que los Usos y Métodos de tratamiento no son patentables con base a la normatividad vigente.

De igual manera presenta el opositor, dos (2) anterioridades que con base al capítulo reivindicatorio anterior, las afectaría. Estos son:

- ✓ D1= FR 2758723 del 31 de Julio de 1998
- ✓ D2= WO 02/28346 del 11 de Abril de 2002

Por consiguiente, carece la solicitud carece de:

- ✓ Novedad: porque el documento D1, enseña la combinación de un compuesto farmacéutico que es un antagonista de receptores CB1 canabinoide como por ejemplo el Rimonabant para el tratamiento de la obesidad con un hipolipemico.
- ✓ Nivel Inventivo: al combinar los documentos D1 y D2, puede llegar de manera evidente que el Rimonabant es útil en dicho tratamiento sólo o en combinación con otro activo anti-obesidad tales como los revelados en D2 para tratar la obesidad.

4.2 RESPUESTA DEL SOLICITANTE SANOFI-AVENTIS (folios 251 a 257; del 02-09-2008):

El solicitante en su respuesta frente a lo argumentado por el opositor, presenta un nuevo capítulo reivindicatorio, en donde se han eliminado las referencias de los "usos".

Con respecto al arte previo presentado por el opositor, el solicitante manifiesta su desacuerdo ya que dichos documentos aportados por el opositor, no afectan la Novedad ni el Nivel Inventivo; como a continuación explica con respecto a:

- ✓ Novedad: el documento D1, se enfoca en el uso de antagonistas del receptor CB1 para el desarrollo de medicamentos útiles en el tratamiento de trastornos de apetito; y esto no implica que los mismos sean eficientes en tratamientos de enfermedades relacionadas con la obesidad. Sin embargo D1 no revela específicamente todas y cada una de las características técnicas reivindicadas por la presente solicitud, y en consecuencia no podría afectar el requisito de novedad.
- ✓ Nivel Inventivo: el documento D2 enseña el uso de una combinación de antagonista CB1 con Sibutramina, un agente antiobesidad en el tratamiento de la obesidad o ingesta de alimentos; pero D2 no enseña la aplicación de la combinación en el tratamiento del síndrome metabólico y por lo tanto esto no motiva al experto a desarrollar la solicitud de patente. Por otra parte D2 cita el Rimonabant entre una posible lista de antagonistas CB1 pero no muestra efectos del efecto sinérgico de la combinación; en consecuencia no podría afectar el requisito de nivel inventivo.

4.3 RESPUESTA DEL EXAMINADOR TECNICO A OPOSICION DE PROCAPS S.A. Y AL SOLICITANTE SANOFI-AVENTIS

Esta oficina considera que la Oposición presentada por PROCAPS S.A., tiene fundamento y que para la evaluación de patentabilidad se tendrán en cuenta los documentos por este presentados.

5. 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: Octubre 24 de 2003

Teniendo en cuenta la fecha indicada 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; aclarando, que esta búsqueda se realizó únicamente para aquellas partes que parecen ser claras y/o concisas:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	FR 2758723	UTILISATION DES ANTAGONISTES DES RECEPTEURS AUX CANNABINOIDES CENTRAUX POUR LA PREPARATION DE MEDICAMENTS	Julio 31 de 1998
D2	WO 03/087037	SUBSTITUTED ARYL AMIDES	Octubre 23 de 2003

6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1 Novedad (artículo 16 D486)

- Reivindicación 1: Compuesto Rimonabant

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 06-038072	D1 = FR 2758723
Compuesto Rimonabant	Compuesto N-piperidin-5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-4-metilpirazol-3-carboxamida
	Folio 145.

Teniendo en cuenta el objeto de la invención, el documento D1 ya divulga el compuesto Rimonabant correspondiente al nombre químico de N-piperidin-5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-4-metilpirazol-3-carboxamida, el cual corresponde al compuesto Rimonabant reclamado, por lo que no es nuevo.

- Reivindicación 4: Composición farmacéutica

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES DE LA SOLICITUD COLOMBIANA No. 06-038072	D2 = WO 03/087037
Rimonabant usado en combinación con:	Compuesto modulador del receptor CB1 en combinación con:
- Agentes antiobesidad	- Agentes antiobesidad
	Págs. 37 a 39 del Documento.

Teniendo en cuenta el objeto de la invención, el documento D2 ya divulga la combinación de un compuesto modulador del receptor CB1 con agentes antiobesidad, como lo reclama la solicitud; por lo tanto la combinación reivindicada no es nueva.

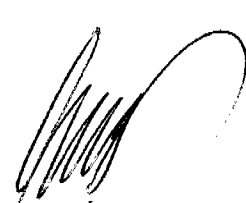
7. Conclusión:

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	FR 2758723	1 a 3 y 5	Novedad
D2	WO 03/087037	4 y 6 a 14	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 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 CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

CONCEPTO TÉCNICO No. 2386

EXAMINADOR TÉCNICO
Código No. 202080