

Señor Director
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-117646-A-00004-0000

Fecha: 2013-05-28 16:22:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 24

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 444

Referencia	Expediente No. 08.117.646 A
Asunto	Solicitud de patente para: MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE INHIBIDORES DE DPP IV
Solicitante	BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH
Fecha de solicitud	5 de noviembre de 2008

1. Yo, LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, obrando como apoderada del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al oficio No. **307** notificado por fijación en lista de 22 de enero de 2013. Mediante memorial radicado el 17 de abril de 2013 solicité un plazo adicional de treinta (30) días para atender dicho requerimiento.
2. Mediante oficio No. **307** se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

“EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS”

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel. (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 652 - Tel: (57-4) 604 4794 Ext. 6729 / 6731 - Fax: (57-4) 604 4731- COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

2.1. Excepción a la patentabilidad

Ese Despacho considera que el objeto de las reivindicaciones 15 a 18 no es patentable de acuerdo con el Artículo 20 de la Decisión 486.

A este respecto, si bien se presenta un nuevo pliego reivindicatorio junto con este escrito, el solicitante consiente en eliminar las reivindicaciones dirigidas a métodos de tratamiento de dicho pliego, de acuerdo con lo requerido por ese Despacho.

2.2. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso

Ese Despacho refiere que el uso de las reivindicaciones 1 a 13 no es patentable y que no obstante la reivindicación 14 y su dependiente 15 se encabezan como medio de aislamiento y conservación, este se define en términos de su uso para el refuerzo de la vitalidad y de la capacidad de secreción de células β o islotes de langerhans y por lo tanto no es patentable, según el Art. 14.

Agrega el señor Examinador que los compuestos de formula (I) y (II) ya se encontraban divulgados en los documentos D1 y D2, y que por otra parte, el documento D3 revela composiciones que comprenden combinaciones de inhibidores de DPP IV y biguanidas como la metformina (Pág. 1, Líneas 6 - 9) y el documento D4 ya enseñaba que los inhibidores de DPP-IV aumentan la neogénesis y la supervivencia de células β , y la biosíntesis de insulina (Pág. 741, resumen).

Respecto a esta observación, el nuevo pliego que adjunto a este escrito ha sido modificado para resaltar y definir de mejor manera los métodos objeto de la presente invención.

Cabe resaltar que los métodos reivindicados no son un segundo uso de los compuestos divulgados en los documentos citados por ese Despacho y por lo tanto, dichas reivindicaciones deben ser estudiadas en cuanto al cumplimiento de los requisitos de patentabilidad: novedad, nivel inventivo y aplicación industrial.

Ya que la presente invención no se refiere a un nuevo uso de un producto o proceso ya conocido, sino que involucra mejoras, adaptaciones o avances respecto a un producto o proceso con un nuevo y útil propósito inventivo del mismo, las nuevas reivindicaciones que presento son objeto de patente de acuerdo con la normatividad andina.

Por otra parte, ninguno de los documentos citados por el señor Examinador divulga específicamente la utilidad de un inhibidor de DPP-4 particular de acuerdo con las nuevas reivindicaciones con la aplicación deseada. La persona versada que estuviera buscando solucionar este problema, no hubiera sido guiada de forma directa y sin esfuerzo intelectual, al método reivindicado en la presente invención.

Por lo tanto, solicito a ese Despacho realizar el respectivo estudio de fondo de las reivindicaciones que se anexan a este memorial.

2.3. **De la solicitud de patente**

El Señor Examinador menciona que el título de la solicitud nombra usos, los cuales no son objeto de patentabilidad, y hace una observación respecto a la repetición de la enumeración de la reivindicación 15.

Con relación a esta objeción, presento un nuevo título como sigue:

**MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE
INHIBIDORES DE DPP IV**

Igualmente presento el formulario de modificaciones correspondiente, que contiene el nuevo título, así como el pago correspondiente por modificaciones en la solicitud.

Por otra parte, se ha corregido la doble enumeración de la reivindicación 15, de acuerdo con la observación de ese Despacho, ya que se está presentando un nuevo pliego reivindicatorio.

2.4. Respuesta del examinador técnico a la oposición y respuesta del solicitante a la misma

Menciona ese Despacho que puesto que el capítulo reivindicatorio presentado en la divisional solo reclama usos y métodos de tratamiento, los cuales no son objeto de patentabilidad según los artículos 14 y 20 literal d, los documentos no se utilizan para análisis de novedad o nivel inventivo. Añade que sin embargo, estos pueden llegar a ser relevantes en el transcurso del trámite de la solicitud.

Al respecto quiero resaltar de nuevo que las nuevas reivindicaciones que presento junto con este escrito no se dirigen ni a un uso ni a un método de tratamiento sino a un método de preparación de un medicamento que contiene un inhibidor de DPP-IV. Así, la presente invención no se refiere a un nuevo uso de un producto o proceso ya conocido, sino que involucra mejoras, adaptaciones o avances respecto a un producto o proceso con un nuevo y útil propósito inventivo del mismo.

Con dicho nuevo pliego reivindicatorio, ese Despacho puede realizar el examen de patentabilidad de la invención, es decir, analizar si la misma es novedosa, inventiva y si tiene aplicación industrial, con base en los documentos que ha citado el señor Examinador.

A este respecto cabe notar que el examen de fondo debe basarse en las consideraciones técnicas requeridas para demostrar la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial de las reivindicaciones que delimitan el alcance de la invención.

3. Modificación de la solicitud en trámite

Con el objeto de subsanar las objeciones presentadas por su Despacho y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, donde se establece que la modificación de una solicitud es posible en cualquier momento del trámite mientras no implique una ampliación de la solicitud inicial, me permito presentar un nuevo capítulo reivindicatorio, dirigido al método de preparación de un medicamento que contiene un inhibidor de DPP-IV.

Estas modificaciones están completamente sustentadas en la descripción originalmente presentada y no representan una ampliación de la invención.

4. De acuerdo con los argumentos y modificaciones presentados con este escrito, la presente solicitud cumple a cabalidad con los requerimientos exigidos en la Decisión 486 y las objeciones formuladas por el Examinador se ven superadas.

Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por el Examinador, se solicita atentamente proceder al otorgamiento de la solicitud de patente. En este sentido, respetuosamente recordamos al Examinador que la patente no podrá ser negada con base en objeciones diferentes a las expuestas en la acción oficial No. **307**, toda vez que al no haber sido trasladadas a mi representada, dicha decisión violaría tanto el tenor literal del artículo 45 de la Decisión 486 como el derecho constitucional al debido proceso. En este evento, y con base en el inciso 2 del artículo 45, respetuosamente solicitamos al Examinador expedir una nueva acción oficial que permita a mi representada contra argumentar las mismas o modificar la solicitud con el fin de cumplir los requisitos de patentabilidad.

5. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 35 reivindicaciones
- Formulario para modificaciones
- Recibo de pago por 17 reivindicaciones adicionales

Señor Director,

Luiz Clemencia de Páez
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. No. 23.555

COLO-09255-0841-171-3
RBL\RBL\ID-243021\WPCL9255
No. M-2013-243021\RBL

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	Espacio reservado para el adhesivo de radicación
---	--

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite	
☐ Error material	☒ Modificación a una Solicitud en trámite
☒ Patente de Invención	
☐ Patente de Modelo de Utilidad	
☐ Registro de Diseño Industrial	
☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados	

2. Datos del solicitante												
Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒												
BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH												
Nombre o denominación / Nombre o razón social completa												
Nombre representante legal												
Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐												
Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____												
<table><tr><td>Nacionalidad/País de constitución</td><td>Dirección y domicilio del titular</td><td>Ciudad</td></tr><tr><td>Alemania</td><td>55216 Ingelheim am Rheim, Alemania</td><td>Ingelheim am Rheim</td></tr><tr><td>Dirección electrónica</td><td>No. Fax</td><td>Número telefónico</td></tr><tr><td>clientes@cavelier.com</td><td>2 11 86 50</td><td>3 47 36 11</td></tr></table>	Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad	Alemania	55216 Ingelheim am Rheim, Alemania	Ingelheim am Rheim	Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico	clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11
Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad										
Alemania	55216 Ingelheim am Rheim, Alemania	Ingelheim am Rheim										
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico										
clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11										

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:										
Apellidos y Nombre De Páez Luz Clemencia	Documento de identificación C.C. 35.456.344	Tarjeta profesional T.P.A. 23.555								
<table><tr><td>Dirección y domicilio</td><td>Ciudad</td></tr><tr><td>Carrera 4ª No. 72 –35</td><td>Bogotá</td></tr><tr><td>Dirección electrónica</td><td>No. Fax</td><td>Número telefónico</td></tr><tr><td>cavelier@cavelier.com</td><td>2 11 86 50</td><td>3 47 36 11</td></tr></table>	Dirección y domicilio	Ciudad	Carrera 4ª No. 72 –35	Bogotá	Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico	cavelier@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11
Dirección y domicilio	Ciudad									
Carrera 4ª No. 72 –35	Bogotá									
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico								
cavelier@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11								
En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general										

4. Datos del trámite**Corrección:****Expediente No** **08.117.646 A****Aparece****Debe ser****Modificación:****Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 35 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.

Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y además se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

**Modificación al capítulo descriptivo.****Modificación al resumen.****Modificación a los dibujos.****Modificación al Título**

Solicito respetuosamente a su despacho tener en cuenta que el nuevo título de esta solicitud de patente ha quedado como sigue: **“MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE INHIBIDORES DE DPP IV”**

5. Anexos

Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.



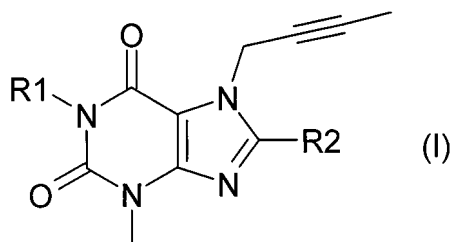
Comprobante de pago por 17 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$510.000, teniendo en cuenta que ya se cancelaron 8 reivindicaciones con la presentación de la solicitud divisional

6. Firma	
Nombre y apellidos	Firma
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555

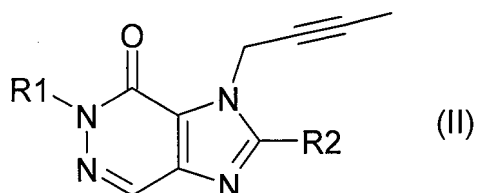
RBL\RBL\NCA\ID-AF243057\WPCL9255

REIVINDICACIONES

1. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I)



o de la fórmula (II)



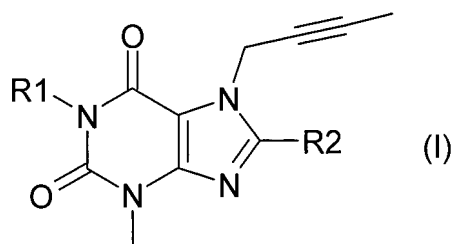
o una de sus sales, en donde

R1 significa ([1,5]naftiridin-2-il)metilo, (quinazolin-2-il)metilo, (quinoxalin-6-il)metilo, (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, 2-ciano-bencilo, (3-ciano-quinolin-2-il)metilo, (3-ciano-piridin-2-il)metilo, (4-metil-pirimidin-2-il)metilo o (4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metilo y

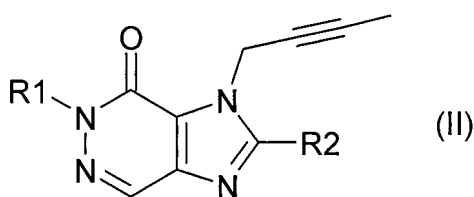
R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo, (2-amino-2-metil-propil)-metilamino o (2-(S)-amino-propil)-metilamino,

preferiblemente en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral, para el tratamiento terapéutico de un paciente, al que le fue diagnosticado un trastorno funcional fisiológico, elegido del grupo de pre-diabetes, intolerancia a la glucosa, glucosa en ayunas patológica, pie diabético, úlcera asociada a diabetes, hiperlipidemia diabética, dislipidemia diabética, diabetes de tipo 1 de nuevo diagnóstico, diabetes de gestación, hiperglucemia, síndrome postprandial adrenérgico e insuficiencia cardíaca, o para el tratamiento terapéutico de un paciente con islotes de Langerhans o células beta trasplantados, en donde el método está caracterizado porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

2. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I)



o de la fórmula (II)



o de una de sus sales, en donde

R1 significa ([1,5]naftiridin-2-il)metilo, (quinazolin-2-il)metilo, (quinoxalin-6-il)metilo, (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, 2-ciano-bencilo, (3-ciano-quinolin-2-il)metilo, (3-ciano-piridin-2-il)metilo, (4-metil-pirimidin-2-il)metilo o (4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metilo y

R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo, (2-amino-2-metil-propil)-metilamino o (2-(S)-amino-propil)-metilamino,

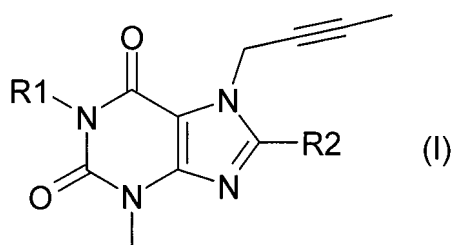
preferiblemente en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral,

para el tratamiento de pacientes, en los que ha sido diagnosticada una pre-diabetes o una diabetes de tipo 2 manifiesta, en donde el uso del medicamento se alcanza una reducción del riesgo de una situación metabólica empeorada de la glucosa a pesar de terapia, de un valor de HbA1c incrementado a pesar de terapia, de un empeoramiento de la glucosa en ayunas a pesar de terapia, de la necesidad de una terapia con insulina, de una diabetes de tipo 2 manifiesta, de un pie diabético, de una úlcera asociada a diabetes, de una hiperlipidemia diabética, de una dislipidemia diabética o de una complicación macrovascular,

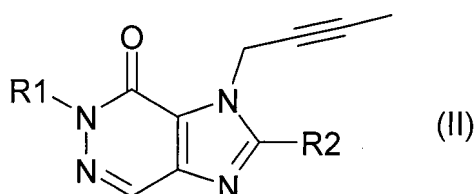
en donde el método está caracterizado porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

3. Método según la reivindicación 2, caracterizado porque la complicación macrovascular se elige del grupo de infarto de miocardio, síndrome coronario agudo, angina de pecho inestable, angina de pecho estable, apoplejía hemorrágica o isquémica, enfermedad oclusiva arterial periférica, cardiomiopatía, insuficiencia cardiaca izquierda, insuficiencia cardiaca derecha, insuficiencia cardiaca global, trastornos del ritmo cardiaco y restenosis vascular.
4. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque el medicamento sirve para el tratamiento terapéutico de un paciente al que le fue diagnosticado una pre-diabetes, intolerancia a la glucosa o glucosa en ayunas patológica.
5. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque el medicamento sirve para el tratamiento terapéutico de un paciente al que le fue diagnosticada una hiperlipidemia diabética o dislipidemia diabética.
6. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque el medicamento sirve para el tratamiento terapéutico de una diabetes de gestación.
7. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque el medicamento sirve para el tratamiento terapéutico de una hiperglicemia o de un síndrome postprandial adrenérgico.
8. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque el medicamento sirve para el tratamiento terapéutico de una insuficiencia cardiaca.
9. Método según la reivindicación 2, caracterizado porque mediante el uso del medicamento se reduce el riesgo de un aumento adicional del valor de HbA1c, de un empeoramiento de la glucosa en ayunas y de la necesidad de una terapia con insulina.
10. Método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes en donde el inhibidor de DPP IV se combina con un principio activo seleccionado de otros antidiabéticos; principios activos que disminuyen el nivel de azúcar en la sangre; principios activos que disminuyen el nivel lípido en la sangre; principios activos que elevan el nivel HDL en la sangre; principios activos que disminuyen la presión sanguínea; y principios activos indicados en el tratamiento de la aterosclerosis u obesidad.

11. Método de acuerdo con la reivindicación 10, en donde el inhibidor de DPP IV se combina con otro principio activo antidiabético u otro principio activo que disminuye la presión sanguínea.
12. Método de acuerdo con la reivindicación 11 en donde el inhibidor de DPP IV se combina con metformina, pioglitazona, miglitol, atorvastatina, metoprolol, amlodipina, ramipril, valsartan o telmisartan.
13. Un método para la preparación de una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I)



o de la fórmula (II)



o de una de sus sales, en donde

R1 significa ([1,5]naftiridin-2-il)metilo, (quinazolin-2-il)metilo, (quinoxalin-6-il)metilo, (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, 2-ciano-bencilo, (3-ciano-quinolin-2-il)metilo, (3-ciano-piridin-2-il)metilo, (4-metil-pirimidin-2-il)metilo o (4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metilo y

R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo, (2-amino-2-metil-propil)-metilamino o (2-(S)-amino-propil)-metilamino,

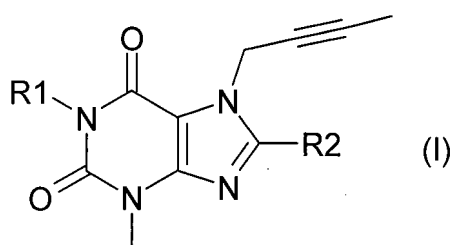
en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral,

con un principio activo seleccionado del grupo de otros antidiabéticos; principios activos que reducen el nivel de azúcar en sangre; principios activos que reducen el nivel de lípidos en la sangre; principios activos que aumentan el nivel de HDL en la

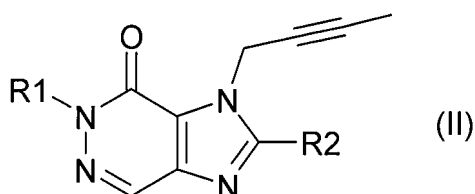
sangre; principios activos que reducen la presión sanguínea; y principios activos que están indicados en el tratamiento de la aterosclerosis u obesidad, en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV en combinación con el otro principio activo junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada entre comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

14. Método según la reivindicación 13, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con otro agente antidiabético o un principio activo que reduce la presión sanguínea.
15. Método según la reivindicación 13, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con metformina, pioglitazona, miglitol, atorvastatina, metoprolol, amlodipina, ramipril, valsartan o telmisartan.
16. Método según la reivindicación 13, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con metformina, pioglitazona, miglitol, atorvastatina, valsartan o telmisartan.
17. Método según la reivindicación 13, caracterizado porque la combinación de medicamentos sirve para el tratamiento terapéutico de un paciente, al que le fue diagnosticado un trastorno funcional fisiológico, elegido del grupo de pre-diabetes, intolerancia a la glucosa, glucosa en ayunas patológica, pie diabético, úlcera asociada a diabetes, hiperlipidemia diabética, dislipidemia diabética, diabetes de tipo 1 de nuevo diagnóstico, diabetes de gestación, insuficiencia cardíaca, hiperglucemia y síndrome postprandial adrenérgico.
18. Método según la reivindicación 13, caracterizado porque la combinación de medicamentos sirve para el tratamiento terapéutico de un paciente, al que le fue diagnosticada una pre-diabetes o una diabetes de tipo 2 manifiesta, en donde el uso de la combinación de medicamentos da como resultado una reducción del riesgo de una situación metabólica empeorada de la glucosa a pesar de terapia, de un valor de HbA1c incrementado a pesar de terapia, de un empeoramiento de la glucosa en ayunas a pesar de terapia, de la necesidad de una terapia con insulina, de una diabetes de tipo 2 manifiesta, de un pie diabético, de una úlcera asociada a diabetes, de una hiperlipidemia diabética, de una dislipidemia diabética o de una complicación macrovascular.

19. Método según la reivindicación 18 en donde la complicación macrovascular se selecciona del grupo de infarto de miocardio, síndrome coronario agudo, angina de pecho inestable, angina de pecho estable, apoplejía hemorrágica o isquémica, enfermedad oclusiva arterial periférica, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca izquierda, insuficiencia cardíaca derecha, insuficiencia cardíaca global, trastornos del ritmo cardíaco y restenosis vascular.
20. Medio de aislamiento y conservación para islotes de Langerhans o células beta, caracterizado porque el medio para el refuerzo de la vitalidad y de la capacidad de secreción de las células contiene 1 nmol/l a 1 μ mol/l de un inhibidor de DPP IV.
21. Medio según la reivindicación 20, caracterizado porque la estructura del inhibidor de DPP IV se describe por la fórmula (I)



o la fórmula (II)



así como de una de sus sales, caracterizado porque

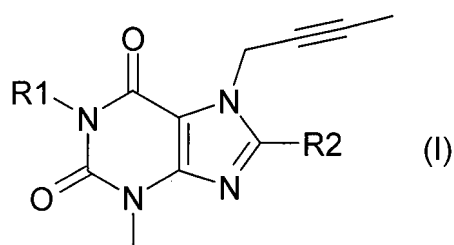
R1 significa ([1,5]naftiridin-2-il)metilo, (quinazolin-2-il)metilo, (quinoxalin-6-il)metilo, (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, 2-ciano-bencilo, (3-ciano-quinolin-2-il)metilo, (3-ciano-piridin-2-il)metilo, (4-metil-pirimidin-2-il)metilo o (4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metilo y

R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo, (2-amino-2-metil-propil)-metilamino o (2-(S)-amino-propil)-metilamino.

22. Procedimiento para reforzar la vitalidad y capacidad de secreción de islotes de Langerhans o células beta, caracterizado porque durante la fase de aislamiento y trasplante de los islotes de Langerhans o células beta se añade al medio de aislamiento o conservación un inhibidor de DPP IV en una concentración entre 1 nmol/l y 1 μ mol/l.

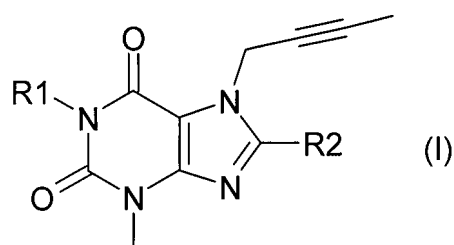
23. Método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV según la reivindicación 13 para ser utilizado en el tratamiento de pre-diabetes o diabetes tipo 2, en combinación con metformina, o una glitazona o tiazolidindiona (por ejemplo pioglitazona), en donde el método está caracterizado porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.
24. Método según uno de las reivindicaciones precedentes, en donde el inhibidor de DPP IV se selecciona a partir de
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(1,5-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- o una sal terapéuticamente activa del mismo.

25. Una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV obtenida según la reivindicación 13 con un principio activo seleccionado de entre otros antidiabéticos; principios activos que disminuyen el nivel de azúcar en la sangre; principios activos que disminuyen el nivel lípido en la sangre; principios activos que elevan el nivel HDL en la sangre; principios activos que disminuyen la presión sanguínea; y principios activos indicados en el tratamiento de la aterosclerosis u obesidad.
26. Una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con metformina, en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)



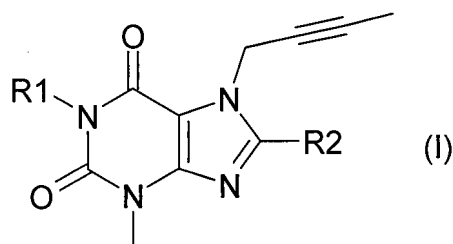
O una sal del mismo, caracterizado en que
 R1 significa (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, y
 R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo.

27. Una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con una glitazona o tiazolidindiona (por ejemplo pioglitazona), en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)



O una sal del mismo, caracterizado en que
 R1 significa (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, y
 R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo.

28. Una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con telmisartan, en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)



O una sal del mismo, caracterizado en que

R1 significa (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, y

R2 significa 3-(R)-amino-piperidin-1-ilo.

29. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV seleccionado de

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(1,5]-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

- 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
o una sal terapéuticamente activa del mismo,
en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral, para uso en el tratamiento de pre-diabetes o diabetes tipo 2, en combinación con metformina, o una glitazona o tiazolidindiona (por ejemplo pioglitazona), ya sea en combinación libre o en una combinación fijada en un comprimido,
en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.
30. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV seleccionado de
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(1,5]-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,
para prevenir o reducir el riesgo de una complicación macrovascular en un paciente con pre-diabetes o diabetes tipo 2,
en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

31. El método según la reivindicación 30, en donde la complicación macrovascular se elige del grupo de infarto de miocardio, síndrome coronario agudo, angina de pecho inestable, angina de pecho estable, apoplejía hemorrágica o isquémica, enfermedad oclusiva arterial periférica, cardiomiopatía, insuficiencia cardíaca, trastornos del ritmo cardíaco y restenosis vascular.
32. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV seleccionado de
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(1,5]-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
 - 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
 - 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,
 en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral, para uso en el tratamiento de diabetes tipo 2,
 en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

33. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV seleccionado de

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(1,5]-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,

en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral,

para uso en el tratamiento de un paciente con pre-diabetes o diabetes tipo 2 o síndrome metabólico, en combinación con un inhibidor ACE (por ejemplo 2,5 mg a 15 mg de ramipril), un antagonista de receptor AT1 (por ejemplo 20 mg a 160 mg de telmisartan), un bloqueador beta (por ejemplo de 50 mg a 200 mg de metoprolol), o un diurético (por ejemplo 12,5 mg a 25 mg de hidroclorotiazida), ya sea en combinación libre o en una combinación fijada en un comprimido,

en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

34. Un método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV seleccionado de

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(1,5-naftiridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 2-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-3-(but-2-inilo)-5-(4-metil-quinazolin-2-ilmetil)-3,5-dihidro-imidazo[4,5-d]piridazin-4-ona,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-quinolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-(2-ciano-bencil)-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-[(S)-(2-amino-2-metil-propil)-metilamino]-xantina,
- 1-[(3-ciano-piridin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4-metil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,
- 1-[(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

- 1-[(quinoxalin-6-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-((R)-3-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,

en una dosis de 0,5 mg a 50 mg para administración oral, preferiblemente de 2,5 mg a 50 mg, particularmente de 0,5 mg a 10 mg (tal como por ejemplo 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg) para administración oral,

para tratar un paciente con insuficiencia cardiaca, opcionalmente en combinación con un inhibidor ACE (por ejemplo 2,5 mg a 15 mg de ramipril), un antagonista de receptor AT1 (por ejemplo 20 mg a 160 mg de telmisartan), un bloqueador beta (por ejemplo de 50 mg a 200 mg de metoprolol), un bloqueador alfa/beta combinado (por ejemplo de 3,25 mg a 100 mg de carvedilol), un diurético (por ejemplo 12,5 mg a 25 mg de hidroclorotiazida), un antagonista de receptor mineralcorticoide (por ejemplo de 25 mg a 100 mg de eplerenona), y/o un péptido natriurético tipo B (BNP) (por ejemplo 2 µg/kg como un bolo seguido de 0,01 µg/kg/min de nesiritida), un péptido derivado de BNP o un producto de fusión de BNP, ya sea en combinación libre o en una combinación fijada en un comprimido,

en donde el método se caracteriza porque se formula el inhibidor de DPP IV junto con una o más sustancias de soporte y/o diluyentes en una preparación galénica seleccionada de comprimidos, comprimidos recubiertos, cápsulas, polvos, suspensiones y supositorios.

35. El método o medicamento de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde el inhibidor de DPP IV está presente en una dosis de 0,5 mg, 1 mg, 2,5 mg, 5 mg o 10 mg.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 13 - 0050830

Bogotá D.C., Mayo 27 de 2013 - 15:48:15

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS NI 860.041.367

R

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO
RECIBO DE CA	999999999	32909	09/04/2013		480.000.00
RECIBO DE CA	999999999	43135	08/05/2013		330.000.00
RECIBO DE CA	999999999	43185	08/05/2013		745.000.00
RECIBO DE CA	999999999	43201	08/05/2013		5.000.00
RECIBO DE CA	999999999	49033	22/05/2013		20.000.00
RECIBO DE CA	999999999	49105	22/05/2013		125.000.00
RECIBO DE CA	999999999	49134	22/05/2013		505.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
17 50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION PATENTE UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INIC	30.000.00	510.000.00
			\$510.000.00

SON: **QUINIENTOSDIEZ MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-117646-A-00004-0000

Fecha: 2013-05-28 16:22:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 24

0020: 09255-841-171-3

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Mayo 27 de 2013 - 15:48:16