



No. 08-117646-A-00009-0000

Fecha: 2013-08-12 17:21:43 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 25

Señor Superintendente
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 412

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

I. RECURSO VÍA GUBERNATIVA

Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH** solicitante de la patente de la referencia, por el presente escrito atentamente manifiesto a usted que debidamente notificada de la Resolución No. **36892** del 20 de junio de 2013, interpongo en su contra el recurso de **REPOSICIÓN**, para que sea revocada y en consecuencia se conceda totalmente el privilegio de patente de invención para "**MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE INHIBIDORES DE DPP IV**" a favor de **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**.

II. OPORTUNIDAD DE LA IMPUGNACIÓN

La Resolución No. **36892** del 20 de junio de 2013, fue notificada el doce (2) de julio de dos mil trece (2013), por lo que el término para interponer el recurso de reposición

"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

vence el doce (12) de agosto de dos mil trece (2013). En consecuencia, me encuentro dentro de la oportunidad legal.

III. LA DECISIÓN RECURRIDA

3.1 Mediante la Resolución objeto de la presente impugnación, el Superintendente de Industria y Comercio decidió:

3.1.1 Denegar la patente de invención para **“MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE INHIBIDORES DE DPP IV”**.

3.2 En la parte motiva de la providencia, se mencionaron, entre otros, los siguientes fundamentos:

3.2.1 La solicitud reclama usos y métodos de tratamiento, los cuales no son susceptibles de patentabilidad según los artículos 14 y 20 de la D. 486, por lo que de acuerdo con lo expuesto, los argumentos presentados por las sociedades opositoras prosperan como elementos que permiten desvirtuar la patentabilidad de la solicitud que aquí se analiza.

3.2.2 No se acepta el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que no se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486, comoquiera que en la reivindicación 13 reclama métodos de preparación de una combinación de medicamentos: de un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I) o (II) con un 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.

3.2.3 Analizada la divulgación que acompaña a la solicitud se encuentra que el capítulo descriptivo si bien menciona que los compuestos inhibidores de DPP IV eventualmente están en combinación con otra sustancia activa, junto con una o varias sustancias de soporte y/o agentes diluyentes habituales (Pág. 12, Líneas 20

a 26, Fl. 17), no se encuentra divulgación suficiente para un método de preparación caracterizado porque se formulan un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I) O (II) con otra sustancia activa, es decir, caracterizado por la mezcla de agentes.

- 3.2.4 Es de resaltar que el eje central de la solicitud es el uso de compuestos inhibidores de DPP-IV de fórmula (I) en combinación con otros medicamentos y no el desarrollo de un método de preparación. Por lo tanto, se tendrán en cuenta los argumentos relacionados con el capítulo reivindicatoria que fue objeto de examen definitivo radicado bajo el N° 08-117616-A-00000-0000.
- 3.2.5 Que en el presente caso la(s) reivindicación(es) 1 a 15 visible(s) en el escrito radicado bajo el N° 08-117646-A-00000-0000 no puede(n) ser objeto de patente de acuerdo con lo establecido en el artículo 14, por cuanto reclaman un uso. Aunque el solicitante encabeza las reivindicaciones 14 y 15 como un "medio", en realidad está(n) referida(s) al uso inhibidores de DPP-IV en islotes de Langerhans o células beta, y por lo tanto no es posible conceder para ella(s) el privilegio de patente solicitado.
- 3.2.6 Tal como está contemplado en el artículo 14 de la Decisión 486, los usos no son susceptibles de protección, se protegen los productos o procedimientos, donde el producto esté correctamente definido por su conformación o su composición y los procedimientos por la serie de etapas que busquen un fin. El uso no corresponde ni a un producto ni a un procedimiento, sino que es simplemente la aplicación industrial de esos productos o procedimientos.
- 3.2.7 Que por su parte, no se acepta(n) la(s) reivindicación(es) 15 (segunda) a 18 visible(s) en el escrito radicado bajo el No 08-117646-A-00000-0000, por cuanto está(n) referida(s) a un método de tratamiento de un paciente con inhibidores de DPP-IV. El método reclamado en la(s) reivindicación(es) 15 a 18, es un método de tratamiento terapéutico, el cual no puede ser objeto de patente de conformidad con lo dispuesto en el artículo 20 lit. d) de la referida Decisión 486, en razón a que allí se establece que no serán patentables: " Los métodos terapéuticos o quirúrgicos

para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o animales".

3.2.8 En referencia al argumento de la solicitante, según el cual el capítulo reivindicatorio se modificó para resaltar y definir de mejor manera los métodos objeto de la presente invención, es pertinente resaltar que, como ya se mencionó los métodos para la preparación de una composición reclamados constituyen una ampliación de la materia divulgada inicialmente. De la lectura del capítulo descriptivo es claro que el objeto de la solicitud consiste esencialmente en el uso de inhibidores DPP-IV ya conocidos en el estado de la técnica y no en el desarrollo de un método de preparación de una composición.

IV. OBJETO DEL RECURSO

De acuerdo con los argumentos que expongo a continuación, solicito atentamente a su Despacho lo siguiente:

1. Revocar la Resolución No. 36892 del 05 de Abril de 2013 en su artículo segundo.
2. Conceder el privilegio total de patente de invención para "MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE INHIBIDORES DE DPP IV" a favor de BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH.

V. PRESENTACIÓN DE UNA SOLICITUD DIVISIONAL Y MODIFICACIÓN DE UNA SOLICITUD EN TRÁMITE

En virtud del Artículo 36 de la Decisión 486 mediante el cual se establece la posibilidad de dividir la solicitud en dos o más fraccionarias, se presenta en esta oportunidad una solicitud divisional, junto con un pliego reivindicatorio conformado por 48 reivindicaciones, el cual es una parte de la solicitud originalmente presentada.

Teniendo en cuenta que se cumplen con los requerimientos exigidos por el artículo mencionado, se solicita atentamente dar trámite a esta solicitud divisional.

VI. FUNDAMENTOS DEL RECURSO

Respetuosamente me permito disentir de lo expuesto por ese Despacho en la Resolución objeto del presente recurso, ya que el estudio de la presente solicitud fue llevado a cabo en contravención de la legislación aplicable y porque la conclusión de que el nuevo pliego reivindicatorio presentado no encuentra sustento en la descripción no corresponde a los hechos del caso, por lo que dicho pliego debió haber sido aceptado y examinado.

6.1 El pliego reivindicatorio no aceptado sí encuentra sustento en el capítulo descriptivo de la solicitud

El solicitante desea aclarar que el soporte de los métodos de preparación de una combinación o composición de la presente invención puede ser encontrado por la persona versada en la materia en la descripción, como también en el ejemplo 11.

Por ejemplo, en las páginas 13 y 14 del capítulo descriptivo de la solicitud actual, se listan los procedimientos adecuados para la preparación de formulaciones farmacéuticas de los inhibidores de DPP-IV de acuerdo con la invención. Por su parte, el ejemplo 11 hace referencia a un método para la preparación de comprimidos con película de inhibidor de DPP IV.

De esta manera, una persona versada en la materia sí encontraría divulgación suficiente para un método de preparación caracterizado porque se formulan un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I) o (II) con otra sustancia activa en el capítulo descriptivo de la solicitud. Además los métodos reivindicados no constituyen una ampliación de la materia divulgada inicialmente, al encontrarse debidamente soportados en la descripción.

Por consiguiente, los argumentos del examinador según los cuales no se aceptaba el capítulo reivindicatorio radicado bajo el No. 08-117646-A-00004-0000 del 28 de mayo de 2013, porque ampliaban la materia contenida inicialmente, carecen de fundamento y violan los derechos de mi apoderado toda vez que se le negó la posibilidad de que fuera

estudiado un capítulo reivindicatorio que cumple con los requisitos establecidos en la legislación y jurisprudencia vigentes.

5.2 Nuevo capítulo reivindicatorio

Nos permitimos presentar un nuevo capítulo reivindicatorio donde se hace más evidente el soporte que existe en el capítulo descriptivo a los métodos de preparación reivindicados, que incluye las siguientes modificaciones:

- Se eliminaron las antiguas reivindicaciones 1-12, 17-19, 30, 31, 35
- En las demás reivindicaciones se han limitado las modalidades particulares de la invención
- Se adicionaron nuevas reivindicaciones 5, 6, 17, 21, 22, 23 y 25-28

Por favor nótese que el presente capítulo reivindicatorio se encuentra debidamente soportado en la descripción y por consiguiente cumple con todos los requerimientos para que sea aceptado y estudiado.

5.2 La presente solicitud sí tiene nivel inventivo

El solicitante desea, además, insistir en el nivel inventivo de los métodos y las preparaciones reivindicados en la solicitud mediante los siguientes hechos:

Como lo menciona la descripción de la presente solicitud, los inhibidores DPP IV de las reivindicaciones que se anexan "destacan de inhibidores de DPP IV estructuralmente equiparables, dado que unen un extraordinario poder de acción y duración del efecto con favorables propiedades farmacológicas, selectividad del receptor y un favorable perfil de efectos secundarios o determinan, en combinación con otros principios activos farmacéuticos, inesperadas ventajas o mejoras en la terapia" (página 12).

Por ejemplo, de forma benéfica, la linagliptina (BI 1356), un inhibidor DPP IV de fórmula (I) de esta invención (R1= 4-metil-quinazolin-2-ilmetio, R2 = 3R-amino- piperidin-

1-ilo; el primer compuesto mencionado entre los inhibidores DPP IV particularmente preferidos de la presente solicitud), inhibe la actividad DPP-4 in vitro en varios experimentos independientes con valores IC50 de 0.4, 0.5 (Figura 1), 0.9 y 1.1 nM (IC50 media, aproximadamente 1 nM). Cuando se probaron bajo idénticas condiciones experimentales, la vildagliptina, saxagliptina, sitagliptina y alogliptina exhibieron una eficacia máxima comparable para la inhibición in vitro de la proteasa DPP-4. Sin embargo, la potencia de BI 1356 es mayor que para cada uno de los principales inhibidores de DPP-4, lo que da como resultado valores de IC50 de 19 (sitagliptina), 24 (alogliptina), 50 (saxagliptina), y 62 (vildagliptina) nM, respectivamente (Figura 1).

Figura 1. Potencia in vitro de BI 1356 y otros inhibidores de DPP-4

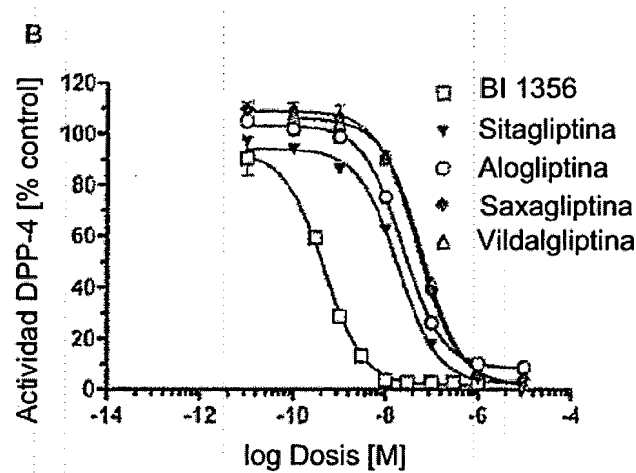


Figura 1: La inhibición de la actividad DPP-IV se midió en extractos de células Caco-2. El 95% de intervalo de confianza para el IC50 de BI1356 en el experimento mostrado es 0.4 a 0.6 nM. Los datos son promedios $\pm$ error estándar de la media de determinaciones duplicadas o triplicadas y son representativos de dos a tres experimentos independientes.

El compuesto IB 1356 también ha demostrado tener una relación de disminución aproximadamente 10 veces menor que la vildagliptina en la inhibición de la enzima DPP-4.

En ratas HansWistar, la inhibición de DPP-4 24 horas después de la administración de BI 1356 es más profunda que con cualquier otro de los inhibidores DPP-4 sitagliptina, vildagliptina, alogliptina y saxagliptina (Tabla 1).

Tabla 1: Valores ED50 para inhibición de actividad DPP-4 de plasma en ratas HanWistar a diferentes horas luego de la dosificación

	Valores ED50				
	BI 1356	Sitagliptina	Alogliptina	Saxagliptina	Vidagliptina
7h post-dosis	0,3	0,1	0,1	0,5	2,3
24 h post-dosis	0,9	2,7	10	14	>30
Razón 24/7 h	3	27	100	28	>13

En conclusión, la linagliptina (BI 1356), un inhibidor DPP-4 particularmente preferido, utilizado de acuerdo con la presente invención, inhibe la DPP-4 de forma más efectiva y con mayor duración que los otros principales inhibidores de DPP-4 vildagliptina, sitagliptina, saxagliptina y alogliptina, y por lo tanto, es potente a dosis terapéuticas bajas y con larga duración.

Dichas características son particularmente apropiadas o favorables para los objetivos de la presente invención y por lo tanto, soportan un largo y verdadero perfil clínico de inhibición DPP-4 de 24 horas, una vez al día, y un aumento de los niveles basales de GLP-1 al usar un inhibidor DPP-4 de acuerdo con el presente pliego reivindicatorio. Lo anterior ofrece el potencial de tener tratamientos individualizados más efectivos y/o un control glucémico sostenido, intensivo y mejorado y/o con efectos beneficiosos pancreáticos y/o extrapancreáticos que van más allá de la disminución de la hiperglucemia, lo cual se traduce en mejores usos terapéuticos particulares y/o beneficios (tal como lo relacionado con la protección beneficiosa micro- o macro-vascular), incluyendo, y en particular, combinaciones con otras sustancias activas y sus efectos glucémicos, metabólicos y/o vasculares, que involucran pacientes en riesgo. Este hecho indiscutiblemente involucra actividad inventiva.

La baja dosis es una característica particular para la provisión de combinaciones o composiciones de las presentes especies de inhibidores de DPP IV de acuerdo con el actual conjunto de reivindicaciones, al igual que para el aislamiento /medio de almacenamiento de acuerdo al presente conjunto de reivindicaciones.

6.3 Conclusión

A la luz de los argumentos expuestos anteriormente, se demuestra que el capítulo reivindicatorio presentado mediante el escrito radicado bajo el No. 08-117646-A-00004-0000 del 28 de mayo de 2013 sí se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486, al estar debidamente soportado en el capítulo descriptivo. Por este motivo, se considera que el Señor Examinador ha cometido un error al no aceptar dicho pliego reivindicatorio y haber examinado el pliego reivindicatorio original de la solicitud. De esta manera, las objeciones presentadas contra el pliego reivindicatorio radicado bajo el No. 08-117646-00000-0000 carecen de validez. Además, al encontrarse el soporte suficiente en el capítulo descriptivo para los métodos de preparación reivindicados, los mismos no constituyen una ampliación de la materia divulgada inicialmente.

Cabe resaltar que las ventajas técnicas de los métodos y las preparaciones reivindicadas son claras a partir de la solicitud y anexos que se han entregado a ese Despacho, e inesperadas frente a lo divulgado por el estado de la técnica, confirmando así el nivel inventivo de la materia en estudio de la presente solicitud.

Por todo lo anterior, considero que la presente solicitud cumple a cabalidad con los requerimientos de patentabilidad exigidos por la legislación actual, por lo que atentamente solicito en consideración lo siguiente:

VII. PETICIÓN

Por todo lo anterior, solicito a ese Despacho lo siguiente:

7.1 Que al considerar las razones precedentes se revoque la decisión contenida en la Resolución No. **36893** del 20 de junio de 2013, en cuanto resuelve negar el privilegio de patente de invención.

7.2 Que se otorgue el privilegio de patente de invención para la invención titulada:
"MÉTODO PARA PREPARAR UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE

INHIBIDORES DE DPP IV” a favor de BOEHRINGER INGELHEIM INTERNACIONAL GMBH.

VIII. NOMBRE Y DIRECCIÓN

El nombre y la dirección del solicitante recurrente son los siguientes:

BOEHRINGER INGELHEIM INTERNACIONAL GMBH

Binger Strasse 173
55216 Ingelheim am Rhein
Alemania

IX. NOTIFICACIONES

Atentamente manifiesto a usted que recibiré notificaciones en la Secretaria de su Despacho o en mi oficina de abogada situada en la Carrera 4ª. No. 72-35, piso 4°, de esta ciudad de Bogotá, D.C.

X. ANEXOS

1. Nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 28 reivindicaciones.
2. Formulario de modificaciones.
3. Recibo por concepto de modificaciones.
4. Formulario de solicitud divisional.
5. Capítulos descriptivo y reivindicatorio de solicitud divisional compuesto por 48 reivindicaciones.

6. Poder.
7. Recibo por concepto de presentación de solicitud divisional.
8. Recibo por concepto de 38 reivindicaciones adicionales a las primera 10, correspondientes a la solicitud divisional.

Señor Superintendente,

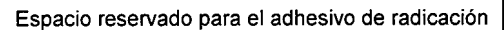

LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

C.C. 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555



COLO-09255-0841-171-3
COLO-09255-0841-176-2
GCH\RBL\ID-248902\WPCL9255
No. M-2013-248902\GCH



1. Identificación del Trámite

- ## 2. Datos del solicitante

Persona Jurídica

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 _____

☐ 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:

Tarjeta profesional
T.P.A. 23.555

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 28 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.****5. Anexos**

Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación por \$125.000.



Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

14

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

 RBL\RBL\NCA\ID-AF248979\WPCL9255



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
CONVERSIÓN, DIVISIÓN Y FUSIÓN DE SOLICITUDES

1. Identificación del Trámite

☐ Conversión

☒ División

☐ Fusión

☒ 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

☐ 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

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

CONVERSION

Expediente

De:
A:

DIVISION

Expediente : 08.117.646 A

De:
A:

FUSION

Expediente

De:
A:

5. Comprobante de Pago No 13-0078085 Fecha 2013/08/06
Comprobante de Pago No 13-0079816 Fecha 2013/08/12

6. Anexos

☒

 Comprobante de pago de la tasa de presentación solicitud por \$450.000.

☒

 Comprobante de pago por 38 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$1.140.000

☒

 Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación

☒

 Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud

☐

 Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético

7. Firma

Nombre y apellidos

Firma

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

C.C. 35.456.344 DE Usaquéen

Tarjeta Profesional 23.555

RBL\RBLINCA\ID-AF248995\WPCL9255

17

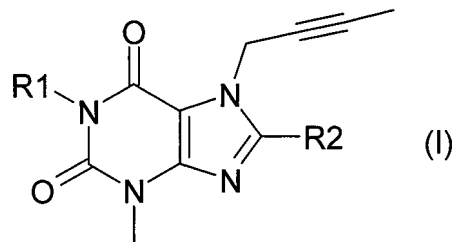
NOTA: Esta es una solicitud de división de la materia contenida originalmente en la solicitud de patente No. 08.117.646 A . La solicitud de división de la materia se hace como consecuencia de la decisión proferida por ese Despacho por medio de la resolución No. 36892 notificado por fijación en lista del 02 de julio de 2013. Por lo tanto pido que esta solicitud de división de materia sea tratada con el beneficio de presentación de la solicitud original, esto es 05 de noviembre de 2008 y la prioridad que allí se reivindica el 04 de mayo de 2006.

Nota: La copia básica original se encuentra en el expediente No. 08.117.646 A

16

REIVINDICACIONES

1. Un método para la preparación de una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV de la fórmula (I)



o de una de sus sales terapéuticamente activas , en donde

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

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

en una dosis 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;

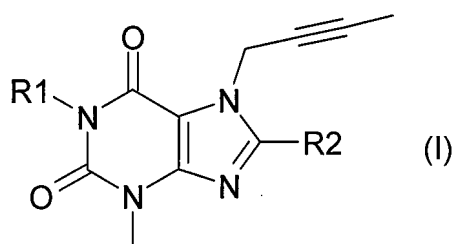
preferiblemente con una sustancia activa seleccionada entre: metformina, sulfonilureas, nateglinida, repaglinida, tiazolidinedionas, inhibidores de alfa-glucosidasas, insulina y análogos de insulina, GLP-1 y análogos de GPL-1, inhibidores ECA, bloqueadores del receptor de la angiotensina II (BRA), beta bloqueadores, diuréticos, estatinas, fibratos, inhibidores de absorción de colesterol e inhibidores de proteínas de transferencia de éteres de colesterol;

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.

2. Método según la reivindicación 1, 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;
preferiblemente con una sustancia activa seleccionada entre: metformina, sulfonilureas, nateglinida, repaglinida, tiazolidinedionas, inhibidores de alfa-

glucosidasas, insulina y análogos de insulina, GLP-1 y análogos de GPL-1, inhibidores ECA, bloqueadores del receptor de la angiotensina II (BRA), beta bloqueadores y diuréticos.

3. Método según la reivindicación 1, 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.
4. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor de DPP IV con metformina, pioglitazona, miglitol, atorvastatina, valsartan o telmisartan.
5. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor DPP IV con metformina.
6. Método según la reivindicación 1, caracterizado porque se prepara una combinación de medicamentos de un inhibidor DPP IV con telmisartan.
7. 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 7, caracterizado porque la estructura del inhibidor de DPP IV se describe por la fórmula (I)



así como de una de sus sales, caracterizado porque

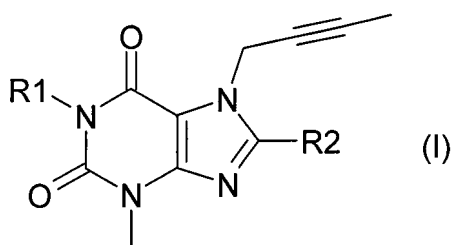
R1 significa (4-metil-quinazolin-2-il)metilo, y

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

9. 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, preferiblemente entre 1nmol/l a 100nmol/l.

10. Método para preparar una composición farmacéutica de un inhibidor de DPP IV según la reivindicación 1, 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.
11. 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
12. Una combinación de medicamentos preparada mediante el método de la reivindicación 1 de un inhibidor de DPP IV obtenida según la reivindicación 1 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 acitvos indicados en el tratamiento de la aterosclerosis u obesidad.
13. Una combinación de medicamentos preparada mediante el método de la reivindicación 1 de un inhibidor de DPP IV como se define en la reivindicación 1 con metformina, en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)

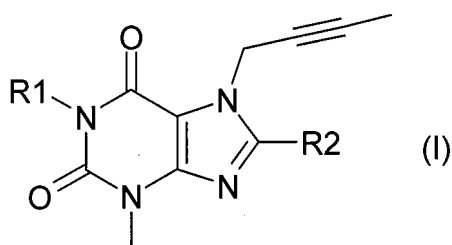


O una sal terapéuticamente activa del mismo, caracterizado en que

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

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

14. Una combinación de medicamentos preparada mediante el método de la reivindicación 1 de un inhibidor como se define en la reivindicación 1 de DPP IV con una glitazona o tiazolidindiona (por ejemplo pioglitazona), en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)

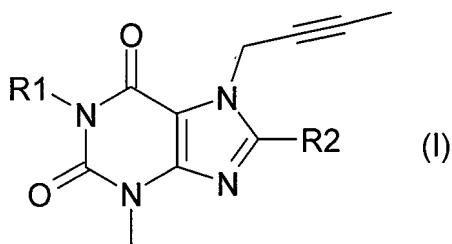


O una sal terapéuticamente activa del mismo, caracterizado en que

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

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

15. Una combinación de medicamentos preparada mediante el método de la reivindicación 1 de un inhibidor de DPP IV con telmisartan, en donde el inhibidor de DPP IV es de fórmula (I)



O una sal terapéuticamente activa del mismo, caracterizado en que

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

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

16. Un método para preparar una composición farmacéutica del siguiente inhibidor de DPP IV:

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,
o una sal terapéuticamente activa del mismo,

22

en una dosis 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, en combinación con metformina, 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.

17. Un método para preparar una composición farmacéutica del siguiente inhibidor de DPP IV:

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,

en una dosis 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, en donde el método se caracteriza por formular el inhibidor DPP IV en combinación con metformina, junto con uno más vehículos y/o diluyentes farmacéuticamente aceptados en una preparación galénica seleccionada de tabletas, tabletas recubiertas y cápsulas.

18. Un método para preparar una composición farmacéutica del siguiente inhibidor de DPP IV:

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,

O una sal terapéuticamente activa del mismo

en una dosis 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, en donde el método se caracteriza por formular el inhibidor DPP IV junto con uno más vehículos y/o diluyentes farmacéuticamente aceptados en una preparación galénica seleccionada de tabletas, tabletas recubiertas y cápsulas.

19. Un método para preparar una composición farmacéutica del siguiente inhibidor de DPP IV:

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,



en una dosis 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,

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.

20. Un método para preparar una composición farmacéutica del siguiente inhibidor de DPP IV:

- 1-[(4-metil-quinazolin-2-il)metil]-3-metil-7-(2-butin-1-il)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-il)-xantina,

o una sal terapéuticamente activa del mismo,

en una dosis 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,

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.

21. El método de preparación o la preparación de medicamentos según las reivindicaciones 5 o 17, en los que la dosis de metformina es de 300mg a 1000mg una o dos veces al día, o liberación retardada de metformina en una dosis de 500mg a 1000mg una o dos veces al día o 500mg a 2000mg una vez al día.

2A

22. El método de preparación o la preparación de medicamentos según las reivindicaciones 5 o 17, en las que la dosis de metformina es de 500mg, 850mg, o 1000mg de metformina como una dosis sencilla, con una dosis total diaria de metformina de 500-2850mg o 500mg, 1000mg, 1500mg, o 2000mg de metformina en forma de liberación retardada.
23. El método de preparación o la preparación de medicamentos según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde la preparación de medicamentos se encuentra en forma de una combinación fijada, por ejemplo una tableta o cápsula,
24. El método de preparación o el 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.
25. El método de preparación o el medicamento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el inhibidor DPP IV está presente en un dosis de 2.5mg o 5mg.
26. El método de preparación o el medicamento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde la dosis oral del inhibidor DPP IV es de 5mg.
27. El método de preparación o el medicamento según cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en donde el inhibidor DPP IV se formula en una formulación farmacéutica junto con vehículos y/o diluyentes adecuados o con excipientes adecuados, tales como por ejemplo diluyentes, aglutinantes, lubricantes y disgregantes.
28. El método de preparación o el medicamento según la reivindicación 20, donde diluyentes adecuados incluyen almidón de maíz, o polvo de celulosa, hidrógeno-fosfato de calcio, eritritol, hidroxipropilcelulosa (poco sustituida), manitol, almidón pregelatinizado o xilitol.
Aglutinantes aceptables incluyen copolímeros de vinilpirrolidona con otros derivados de vinilo (copovidona), hidroxipropilmetilcelulosa (HPMC), hidroxipropilcelulosa (HPC), polivinilpirrolidona (povidona), almidón pregelatinizado o hidroxipropilcelulosa poco sustituida
Lubricantes aceptables incluyen talco, polietilenglicol, behenato de calcio, estearato de calcio, aceite de ricino hidratado o estearato de magnesio; y/o
Disgregantes aceptables incluyen almidón de maíz o crospovidona

29

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

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0079775
		Bogotá D.C., Agosto 12 de 2013 - 10:52:43

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
RECIBO DE CA	999999999	72795	23/07/2013		410.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78095	06/08/2013		505.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78096	06/08/2013		505.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78302	06/08/2013		20.000.00
RECIBO DE CA	999999999	78336	06/08/2013		60.000.00

*** Conceptos Pagados ***			
CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	SOLICITUD MODIFICACIONES CAMBIO SOLICITANTE POR CESION	125.000.00	125.000.00
			\$125.000.00

SON: **CIENTO VEINTICINCO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-117646-A-00009-0000
Fecha: 2013-08-12 17:21:43 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 25

0020: 09255-841-176-2