

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO			
RAD:	11-108511- -6	FECHA:	2013-08-22 15:15:29
DEP:	2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE:	378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA:	11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS:	15
ACT:	519 PRESENTACION		

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA SUAREZ DE PAEZ

Asunto: Radicación: 11-108511- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 15710
 Folios: 15

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/JP2009/004353				
Fecha de Presentación Internacional	03/09/2009				

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado No 11-108511-00000-0000	25/Agosto/2011
Reivindicaciones:	1 – 14 del radicado No 11-108511-00000-0000	25/Agosto/2011
Reivindicaciones:	1 – 14 del radicado No 11-108511-00003-0000	19/Julio/2012
Reivindicaciones:	1 – 8 del radicado No 11-108511-00005-0000	17/Mayo/2013
Dibujos:	Radicado No 11-108511-00000-0000	25/Agosto/2011
Oposiciones:	Radicado No 11-108511-00001-0000	LafrancoI 18/Abril/2012
Respuesta del solicitante	Radicado No 11-108511-00005-0000	17/Mayo/2013

Prioridad:	PCT/JP2009/000985	04/Marzo/2009
------------	-------------------	---------------

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Dado que en la presente solicitud se reclaman tan solo 8 reivindicaciones se procede a estudiar la totalidad del pliego reivindicatorio.

Título de la solicitud: “Derivado Colestanol para uso combinado”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar agentes quimioterapéuticos derivados de colestanol que tienen menos efectos secundarios y una excelente eficiencia. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un agente quimioterapéutico contra el cáncer que incluye un derivado del colestanol representado en la fórmula 1 en donde G representa GlcNAc-Gal-, BlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal, Gal-Glc, Gal-, GlcNAc- o un compuesto de inclusión de ciclodextrina y un agente anti-neoplásico.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 031/704.

4. De la solicitud de patente

Titulo

El título es muy general y no define el objeto de la solicitud, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara cuando menciona los términos “o un compuesto de inclusión de ciclodextrina” y “un agente anti-neoplásico”, porque no define el compuesto específico de la composición farmacéutica sino que se remite a grupos funcionales genéricos que no especifican la materia que se pretende proteger. SE sugiere eliminar tales referencias y especificar los compuestos que componen la composición farmacéutica y las cantidades de cada uno de los mismos.

Lo anterior aplica para las reivindicaciones 2 y 4 cuando mencionan “agente antineoplásico taxano”, “agente antineoplásico de complejo taxano”, “un compuesto pemetrexado”.

Las reivindicaciones 6 y 7 no son claras cuando mencionan “caracterizada porque es un agente compuesto” y “forma de un equipo”, respectivamente, ya que estas expresiones no son características que definan una composición farmacéutica. Se sugiere eliminarlas del pliego reivindicatorio o realizar las aclaraciones necesarias ya que no es posible entender con claridad que es lo que se busca proteger.

5. Análisis de la Oposición

Argumentaciones de Lafrancol

El Opositor afirma que la presente solicitud incumple con los requisitos materiales de Patentabilidad, particularmente Novedad y Nivel Inventivo. El Opositor señala que las composiciones y combinaciones farmacéuticas que se refieren a un agente quimioterapéutico de fórmula 1 (derivado de colestanol), que puede estar en combinación con otros agentes anti-neoplásicos, para el tratamiento de cáncer, son prácticas totalmente conocidas en la industria farmacéutica. El Opositor también señala, en cuanto a las composiciones farmacéuticas, que no se puede otorgar el beneficio patentario a composiciones farmacéuticas que comprenden moléculas que se encuentran descubiertas y plenamente identificadas en el sector químico-farmacéutico, tales como Irinotecan, Pemetrexed, Cisplatino, Docetaxel, Oxaliplatino, entre muchos otros. El Opositor señala que así es como en “The Merck Index” se enseña que el principio activo Irinotecan se encuentra plenamente identificado y bajo conocimiento público desde un tiempo considerable y ostenta beneficios patentarios en las oficinas de Japón y Estados Unidos, con número No. JP Kokai 85 19790 y US4604463 respectivamente. De la misma manera para el principio activo Pemetrexed que ostenta beneficio patentario en la oficina Europea y Estadounidense de patentes No. El Opositor concluye que no se puede conceder una patente a composiciones farmacéuticas que contienen moléculas plenamente identificadas y conocidas, pues no son nuevas ni inventivas y que no se puede conceder reivindicaciones que se refieren a métodos de tratamiento tales como las que se presentan en el pliego reivindicatorio.

Respuestas del Solicitante

En respuesta a la Oposición presentada por la sociedad Lafrancol, el solicitante presenta los siguientes argumentos:

- El solicitante señala que los argumentos presentados por Lafrancol no tienen fundamento alguno, pues en ninguna parte se presentan documentos que mencionen una composición farmacéutica que comprenda la combinación de los compuestos de fórmula 1, junto con agentes antineoplásicos tales como las presentadas en la presente solicitud y por tanto señala que la presente invención sí cumple con los requisitos de novedad y nivel inventivo objetados por el opositor.
- Adicionalmente la solicitante presenta un nuevo pliego reivindicatorio en donde no se presentan de ninguna manera reivindicaciones que reclamen métodos de tratamiento por lo cual queda superada según la solicitante esta objeción.

Respuesta del Examinador Técnico

Frente a los argumentos señalados por la sociedad opositora Lafrancol, se encuentra que si bien es cierto que las moléculas previamente señaladas está plenamente identificado en el campo químico-farmacéutico, como se puede observar en “The Merck Index” y además ostentan beneficios patentarios en las oficinas de Europa, Japón, Alemania y Estados Unidos, no le asiste la razón al Opositor dado que en su oficio de presentación de Oposición no se presentan documentos que anticipen las composiciones farmacéuticas que comprendan el compuestos de fórmula 1 junto con un agente anti-neoplásico. Por lo anterior, las referencias por el Opositor mencionadas no serán consideradas para el análisis de patentabilidad.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de patente nacional: Agosto 25 de 2011, y en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: Marzo 04 de 2009.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente (s) documento (s) que anticipa (n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	CO2010-123058	"Uso de un derivado del colestanol o un clatrato ciclodextrina del mismo en combinación con un agente antitumoral para la quimioterapia contra el cáncer"	Fecha de Presentación Nacional: <u>05/10/2010</u> Fecha de Presentación de Prioridad: <u>05/03/2008</u> Publicada en Gaceta: <u>631 de 22/08/2011</u>
D2	WO2007026869	"Antitumor agent"	08/Marzo/2007
D3	ES2198429	"High drug:lipid formulations of liposomal-antineoplastic agents"	01/Febrero/2004

El documento D1 ¹ (toda la solicitud) divulga agentes quimioterapéuticos derivados de colestanol que tienen menos efectos secundarios y una excelente eficiencia que comprenden un agente quimioterapéutico contra el cáncer que incluye un derivado del colestanol representado en la fórmula 1 en donde G representa GlcNAc-Gal-, BlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal, Gal-Glc, Gal-, GlcNAc-.

El documento D2 ² divulga (Párr. [0002] Fig. 1) un medicamento que contiene un compuesto de azúcar-colestanol como un ingrediente activo.

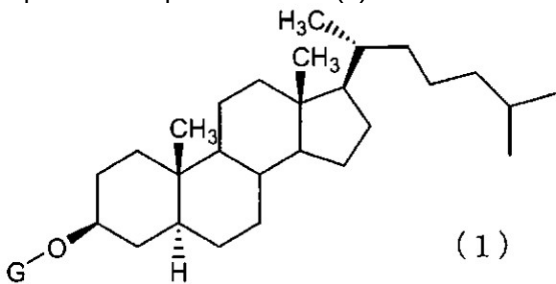
El documento D3 ³ divulga (Col. 13 Líneas 37 a 43) formulaciones y métodos para hacer liposomas que contengan agentes antineoplásicos.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en una composición quimioterapéutica para el cáncer caracterizada porque comprende, en combinación, un derivado de colestanol representado por la fórmula (1)... (en donde G representa GlcNAc-, o GlcNAc-) o un compuesto de inclusión de ciclodextrina y un agente anti-neoplásico.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
Composición quimioterapéutica	Diferentes posibles composiciones farmacéuticas (ver Anexo, pág. 13 – 16)
Derivado del colestanol representado por la formula (1): 	Derivado del colestanol representado por la formula (1):

1 Equivalente a la solicitud Internacional No. WO2009/110235. Este documento se encuentra adjunto a este artículo 45. (ver págs. 1 – 55 y 188 – 210).

2 URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?CC=WO&NR=2007026869A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070308&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2007026869A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070308&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP.

3-URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?CC=ES&NR=2198429T3&KC=T3&FT=D&ND=3&date=20040201&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

CC=ES&NR=2198429T3&KC=T3&FT=D&ND=3&date=20040201&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP.

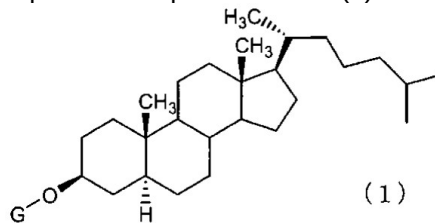
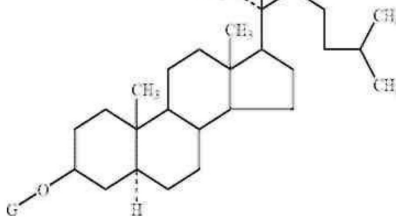
De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva o carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 4 y 5 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

La reivindicación 2 consiste en una composición quimioterapéutica para el cáncer de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizada porque el agente anti-neoplásico es una o más especies seleccionadas del grupo que consiste de un agente antineoplásico taxano, un agente antineoplásico de complejo platino, un compuesto pemetrexado, y fluorouracilo.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2	D3
Composición quimioterapéutica	Composición (párr. [0008])	Composición (resumen)
Derivado del colestanol representado por la fórmula (1):  (en donde G representa GlcNAc-, o GlcNAc-)	Derivado del colestanol representado por la fórmula:  donde G representa GlcNAc-Gal-, GlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal-, Gal-Glc-, or Gal- (Párr. [0002] Fig. 1)	Colestanol (Col. 13 Líneas 37 a 43)
compuesto de inclusión de ciclodextrina	Formulación liposomal o compuesto de inclusión de ciclodextrina (ej. 1 Párr. [0045])	Formulaciones liposomales (Col 1 líneas 5 a 10)
Agentes antineoplásicos seleccionados entre: taxanos, complejos de platino, compuesto pemetrexado y fluorouracilo.	No menciona	5-Fluoroacilo, ciclofosfamida (Col. 1, líneas 30 a 35), o cisplatino. (Ejemplo 33 Col 32 Líneas 37 a

		43)
--	--	-----

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la solicitud porque divulga composiciones que contienen derivados de colestanol representados por la formula I de la presente solicitud (ver la gran similitud), donde G puede ser GlcNAc-Gal-, GlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal-, Gal-Glc-, or Gal- (Párr. [0002] Fig. 1), dichas composiciones son obtenidas en formulaciones liposomales o en compuestos de inclusión de ciclodextrina (Ej. 1, párr. [0045] y párr. [0008]).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2 y la composición del documento D2 consiste en que la solicitud se refiere a composiciones que contienen el derivado de colestanol en combinación con agentes antineoplásicos contra el cáncer.

Según la solicitante el efecto que logra el incluir la combinación de derivados de colestanol con otros agentes anti-cáncer en formulaciones liposomales o compuestos de inclusión de ciclodextrina es que mejora su efectividad. No obstante lo anterior, cuando se realiza una revisión detallada del capítulo descriptivo y particularmente en los ejemplos 1 a 6 se observa que se presentan ensayos de inhibición de la proliferación de varias células de cáncer, pero no se puede observar que esta actividad sea superior cuando se presenta la composición aquí reclamada, que además ya se sugería en el estado del arte. Por lo tanto no se puede evidenciar una real ventaja de la composición frente a las composiciones del estado del arte.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “¿cómo modificar la composición conocida en el documento D2, para potencializar su efecto en la terapia contra cáncer?”.

Sin embargo, la utilización de combinación de agentes anti-cancerígenos es bien conocida en el estado de la técnica ⁴, y es así como el documento D3 divulga formulaciones liposomales que pueden contener colestanol (Col. 13 Líneas 37 a 43) y 5-fluoroacilo, ciclofosfamida (Col. 1 Líneas 30 a 35) o cisplatino (ej. 33, col 32 Líneas 37 a 43).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría otros agentes contra cáncer como los divulgados en el documento D3 en las formulaciones que contienen derivados de colestanol del documento D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 2 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones 3 y 6 – 8 no contienen características inventivas adicionales, se consideran que tampoco son inventivas.

8. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO2010-123058	1, 4 y 5	Novedad
D2	WO2007026869	2, 3 y 6 – 8	Nivel inventivo
D3	ES2198429	2, 3 y 6 – 8	Nivel inventivo

4 US2006165744 divulga formulaciones liposomales de dos o más agente anti cancerígenos entre los que se encuentran 5-Fluoroacilo y cisplatino (Párr. [0022]).

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 (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-08-27

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-123058- -00000-0000

Fecha: 2010-10-05 11:06:35 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 95

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☒ Capítulo I.

☐ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

Nombre: OTSUKA PHARMACEUTICAL
CO., LTD y NATIONAL/
UNIVERSITY CORPORATION
GUNMA UNIVERSITY

Sociedades constituidas y existentes bajo
las leyes de Japón.

Dirección: 2-9 Kanda-Tsukasa-machi,
Chiyoda-ku,
Tokyo 101-8535,
Japón

y

4-2 Aramaki-machi,
Maebashi-shi,
Gunma 371-8510,
Japón

Respectivamente

Domicilio: Tokyo,
Japón

Gunma,
Japón

Respectivamente

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@cavelier.com
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 35.456.344

T.P 23.555

4

**INVENTOR (ES)
(72)**

1. Shin YAZAWA
c/o Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.,
1-7-1, Dosho-machi,
Chuo-ku, Osaka-shi,
Osaka 541-0045,
Japón

3. Takayuki ASAO
2-17-2-505, Shimokoide-machi,
Maebashi-shi,
Gunma 371-0031,
Japón

2. Toyo NISHIMURA
c/o Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd.,
1-7-1, Dosho-machi,
Chuo-ku, Osaka-shi,
Osaka 541-0045,
Japón

5	PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/JP2009/000985</u> Fecha: <u>04 de marzo de 2009</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2009/110235 A1</u> Fecha: <u>11 de septiembre de 2009</u>		
6	Título (54) <u>USO COMBINADO DE UN DERIVADO DEL COLESTANOL</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>A61K 031/704</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>JP</u>	(32) Fecha <u>05 de marzo de 2008</u>
			(31) Número de Solicitud <u>2008-055284</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>10-75,742</u> Fecha: <u>13 de septiembre de 2010</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 554.000.00. ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por. ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes de las sociedades OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD y NATIONAL UNIVERSITY CORPORATION GUNMA UNIVERSITY. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS		

puede ser en un kit que consiste de la forma de dosis respectiva de los ingredientes antes mencionados, cada uno de los cuales está formado independientemente incluyendo cada cantidad efectiva, y que permite que las formas de dosis sean administradas simultáneamente o por separado en intervalos de tiempo (tipo de formulación doble).

[0030]

De forma similar a las formulaciones farmacéuticas generales, no se imponen limitaciones particulares en la forma de dosis de la formulación antes descrita, y la forma puede ser cualquiera de las formas sólidas tales como una tableta, forma líquida tal como una inyección, polvo seco para disolver antes de ser utilizado, etc.

No se impone limitación particular en la ruta de administración de la formulación, y la ruta apropiada puede ser determinada dependiendo en la forma de dosis de los agentes. Por ejemplo, una solución de inyección puede ser aplicada de forma intravenosa, de forma intramuscular, de forma subcutánea, de forma intradérmica, o de forma intraperitoneal, y una forma sólida puede ser administrada oralmente o por vía enteral.

[0031]

La formulación puede ser preparada a través de un método conocido en el arte. Todos los portadores farmacéuticamente aceptables (excipientes o diluyentes tales como un relleno, un agente de volumen, y un aglutinante) generalmente empleados en el arte también pueden ser utilizados.

Por ejemplo, una forma sólida peroral puede ser preparada por medio de mezclar los ingredientes de la droga de la presente invención con un excipiente, y con un aglutinante opcional, un disgregante, un lubricante, un colorante, un agente saborizante, un desodorante, etc., y formando la mezcla en tabletas, tabletas recubiertas, gránulos, polvo, cápsulas, etc. por medio de un método

conocido en el arte. Estos aditivos pueden ser aquellos generalmente empleados en el arte. Ejemplos de excipientes incluyen lactosa, sacarosa, cloruro de sodio, glucosa, almidón, carbonato de calcio, caolín, celulosa microcristalina, y ácido silícico. Ejemplos de un aglutinante incluyen agua, etanol, propanol, jarabe simple, glucosa líquida, almidón líquido, la gelatina líquida, celulosa de carboximetil, celulosa de hidroxipropil, almidón de hidroxipropil, celulosa de metil, etilcelulosa, laca de goma, fosfato de calcio y polivinilpirrolidona. Ejemplos de los disgregantes incluyen almidón seco, alginato de sodio, polvo de agar, bicarbonato de sodio, carbonato de calcio, sulfato de lauril sódico, estearato monoglicerilo, y la lactosa. Ejemplos del lubricante incluyen talco purificado, sales de magnesio, bórax, y el glicol de polietileno. Ejemplos del agente saborizante incluyen la sacarosa, cáscara de naranja, ácido cítrico y ácido tartárico.

[0032]

Una formulación líquida oral puede ser preparada mezclando los ingredientes de la droga de la presente invención con un agente saborizantes, un tapón, un estabilizante, un desodorante, etc., y formando la mezcla en un agente líquido interno, jarabe, elixir, etc. por medio de un método conocido en el arte. El agente saborizantes empleado en la preparación puede ser cualquiera de los miembros mencionados anteriormente. Ejemplos del tapón incluyen el citrato de sodio. Ejemplos del estabilizante incluyen traganth, la goma árabe, y la gelatina.

[0033]

Las soluciones de inyección puede ser preparadas mezclando los ingredientes de la droga de la presente invención con aditivos tales como un regulador de pH, un tapón, un estabilizador, un agente de tonicidad, y un agente anestésico local, etc., y formando la mezcla a través de un método conocido en el arte, para por lo tanto proveer líquidos de inyección subcutáneos, intramusculares, e intravenosos. Ejemplos del regulador de pH y del tapón

incluyen citrato de sodio, EDTA, el ácido tioglicólico, y el ácido thioláctico. Ejemplos de la anestesia local incluyen el clorhidrato de procaína y el clorhidrato de lidocaína. Ejemplos de la agente tonificante incluyen el cloruro de sodio y la glucosa.

5 [0034]

Supositorios puede ser preparados mezclando los ingredientes de la droga de la presente invención con un portador para formulación conocido en el arte tal como el glicol de polietileno, la lanolina, la manteca de cacao, y los ácidos grasos triglicéridos, y con un surfactante opcional como Tween (marca registrada), y la

10 formación de la mezcla en supositorios a través de un método conocido en el arte.

[0035]

Ungüentos pueden ser preparados mezclando los ingredientes de la droga de la presente invención con aditivos opcionales generalmente utilizados en el arte tales como una base, un estabilizante, un humectante, y preservativos, y

15 formando la mezcla en ungüentos a través de un método conocido en el arte.

Ejemplos de la base incluyen parafina líquida, vaselina, cera de abejas blanca, alcohol octildodecilo, y parafina. Ejemplos de los preservativos incluyen metil p-hidroxibenzoato, p-hidroxibenzoato de etilo, y propil p-hidroxibenzoato.

[0036]

20 Cataplasmas puede ser preparados aplicando el ungüento, gel, crema, pasta, etc. mencionados anteriormente a un soporte generalmente utilizado a través de un método de rutina. Ejemplos de soportes apropiados incluyen tela tejida y no tejida hecha de algodón, de fibras discontinuas, o de fibras químicas, y película y hoja de espuma hecha de cloruro de vinilo flexible, polietileno,

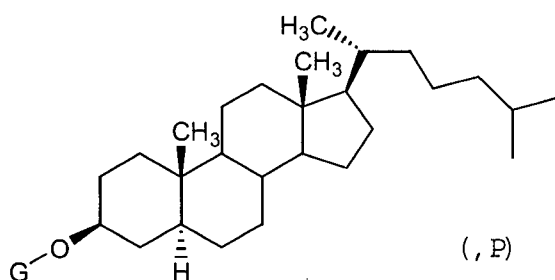
25 poliuretano, etc.

[0037]

Lo que se Reivindica es:

5

1. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer que comprende, en combinación, un derivado del colestanol representado por la fórmula (1):



10 (en donde G representa GlcNAc-Gal-, GlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal-, Gal-Glc-, Gal-, o GlcNAc-) o un compuesto de inclusión de ciclodextrina del mismo, y un agente contra el cáncer.

2. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con la reivindicación 1, en donde, en la fórmula (1), G es GlcNAc-Gal- or GlcNAc-.

15 3. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, en donde el agente contra el cáncer es una o más especies seleccionadas del grupo consistente de un agente contra el cáncer taxano, un agente contra el cáncer de complejo de platino, un compuesto de pemetrexed, y fluorouracilo.

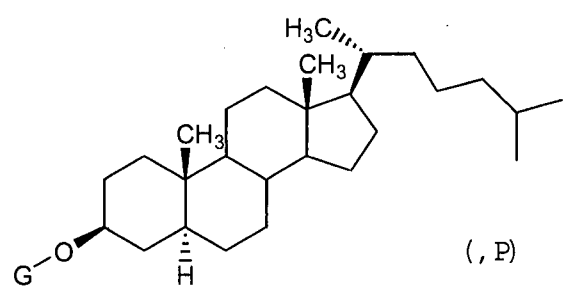
20 4. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el agente contra cáncer es una o más especies seleccionadas del grupo consistente de Paclitaxel, Docetaxcel, Alimta, 5-FU, Cisplatino y Oxaliplatino.

5. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que es un agente de compuesto.

6. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que es en la forma de un kit que incluye una droga
5 que contiene un derivado del colestanol y una droga que contiene un agente contra el cáncer.

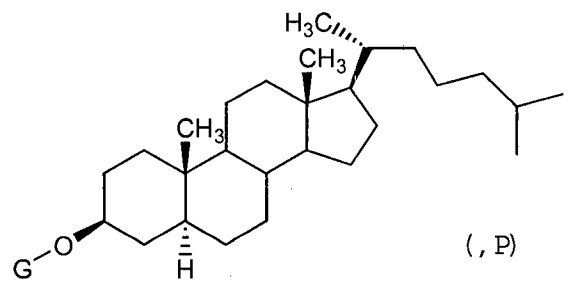
7. Un agente quimioterapéutico contra el cáncer de acuerdo con la reivindicación 6, en donde la droga que contiene un derivado del colestanol es una formulación liposomal.

10 8. El uso, en combinación, de un derivado del colestanol representado por la fórmula (1):



(en donde G representa GlcNAc-Gal-, GlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal-, Gal-Glc-, Gal-,
15 o GlcNAc-) o un compuesto de inclusión de ciclodextrina del mismo y un agente contra el cáncer, para producir un agente quimioterapéutico contra el cáncer.

9. Una quimioterapia contra el cáncer, caracterizada comprender la administración, en combinación, de un derivado del colestanol representado por la fórmula (1):



(en donde G representa GlcNAc-Gal-, GlcNAc-Gal-Glc-, Fuc-Gal-, Gal-Glc-, Gal-, o GlcNAc-) o un compuesto de inclusión de ciclodextrina del mismo y un agente contra el cáncer, a un paciente en necesidad de los mismos.

- 5 10. Una quimioterapia contra el cáncer de acuerdo con la reivindicación 9, en donde el derivado del colestanol o un compuesto de inclusión de ciclodextrina del mismo y el agente contra el cáncer son administrados a un paciente en necesidad de los mismos simultáneamente, o separadamente e intermitentemente.