

70

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS

A B O G A D O S

Carrera 11A No. 94-76 - OL305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tels: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

2744/PCT.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radiazion : 04111533 00000003

Folios: 13

Fecha (MM): 2005-01-19 16:18:46

Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE INCI 444 RESPUESTA

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Re: Expediente No. 04.111.533

Solicitud de patente a nombre de
NOVARTIS AG

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 94-76, of. 305, obrando como apoderada de la sociedad NOVARTIS AG, domiciliada en Basilea, Suiza, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 10589, notificado por fijación en lista el día 19 de noviembre de 2004, atentamente me permito presentar copia del examen preliminar internacional junto con la traducción de sus anexos y las reivindicaciones como fueron modificadas.

De otra parte, manifiesto a ese despacho que modifíco el título de la solicitud para que quede como sigue:

“ Tableta con alta carga de fármaco que comprende 4-(4-metilpiperazin-1-ilmetil)-N-[4-metil-3-(4-piridin-3-il) pirimidin-2-ilamino]fenil]-benzamida o las sales farmacéuticamente aceptables de la misma ”.

Finalmente, en relación con el requerimiento que hace ese despacho para que el solicitante presente el documento de cesión, informo que el mismo fue presentado mediante mi memorial de 1 de diciembre de 2004, del cual adjunto copia.

Espero con esto haber dado cabal cumplimiento a lo solicitado por ese despacho y de conformidad con lo indicado en los artículos 3º., inciso 3, 35 inciso 2 y 59 inciso 2 del CCA, al analizar este memorial, atentamente ruego se traten todas las cuestiones planteadas con motivo del mismo.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE
C.C.39.779.452 de Usaquén
T.P. 68228

ESCOBAR - URIBE ASOCIADOS**A B O G A D O S**

Carrera 11A No. 94-76 - Of. 305 - P.O. Box 94948, Bogotá, D.C. - Colombia

Tel: (571) 6162051 - Fax (571) 6161889

www.escobaruribe.com - info@escobaruribe.com

2744/PCT

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES****E. S. D.****SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO**

Radicación : 04111533 00000002 Folios: 2

Fecha (AMD): 2004-12-01 16:05:13

Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 329 COMPLETADO

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Ref.: Expediente No. 04.111.533

Solicitud de Patente a nombre de
NOVARTIS AG

Yo, JIMENA ESCOBAR URIBE, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 94-76, of. 305, obrando como apoderada de la sociedad Novartis AG, domiciliada en Basilea, Suiza, solicitante de la patente de la referencia, me permito presentar el documento (1) en que consta la cesión del derecho a la patente otorgado por los inventores a favor de mi mandante.

Sobre el particular, es importante resaltar que de conformidad con las normas legales vigentes, artículo 1 de la Resolución 210 de 2001, expedida por el Superintendente de Industria y Comercio y artículo 2 de la Convención de la Haya, el documento en inglés que se pretenda aportar como parte de los trámites de propiedad industrial ante la Superintendencia de Industria y Comercio no requieren traducción. Por otro lado, la legalización consular y/o diplomática de los documentos expedidos en el extranjero no es necesaria. Por lo tanto, el documento de cesión anexo a este memorial es válidamente presentado en idioma inglés y con la correspondiente Apostilla.

Señor Superintendente,


JIMENA ESCOBAR URIBE

C.C.39.779.452 de Usaquén

T.P. 68228

Cód. 5376

TRATADO DE COOPERACION EN MATERIA DE PATENTES
PCT
INFORME EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(PCT artículo 36 y regla 70)

Referencia del solicitante o agente 4-32480A	Ver notificación de la transmisión del examen preliminar Internacional (formato PCT/IPEA/416) PARA PROSEGUIR	
No. Solicitud Internacional PCT/EP03/04151	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 22/04/2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 23/04/2002
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o clasificación nacional e IPC A81K9/16		
Solicitante NOVARTIS AG		

1. Este examen preliminar Internacional ha sido preparado por esta Autoridad encargada del Examen Preliminar Internacional y es transmitida al solicitante de acuerdo con el artículo 36. 2. Este INFORME consiste de un total de 6 páginas, incluyendo esta hoja. ___ Este informe también está acompañado por ANEXOS, esto es hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos, los cuales han sido modificados y son la base para este informe y/o hojas que contienen rectificaciones presentadas ante esta Autoridad (ver Regla 70.16 y Sección 807 de las Instrucciones Administrativas bajo el PCT). Estos anexos consisten en un total de <u>6</u> hojas.
3. Este informe contiene Indicaciones que se relacionan con los siguientes puntos: I. <u>X</u> Base del Informe II. ___ Prioridad III. <u>X</u> El no-establecimiento de opinión en relación con la novedad, nivel inventivo y aplicación Industrial IV. ___ Falta de unidad de Invención V. <u>X</u> Declaración motivada bajo el Art. 35(2) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación Industrial; citaciones y explicaciones que soportan dicha declaración VI. ___ Ciertos documentos citados VII. ___ Ciertos defectos en la solicitud internacional VIII. ___ Ciertas observaciones en la solicitud internacional

Fecha de presentación de la demanda 28/07/2003	Fecha en que se completó este informe 27.08.2003
Nombre y dirección de la autoridad encargada del examen preliminar internacional: Oficina de Patentes Europea D-80298 Munich Tel. +49 89 2399-0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Oficial autorizado GIMÉNEZ MIRALLES, J. Teléfono: +49 89 2399 8331

**INFORME DEL EXAMEN
PRELIMINAR INTERNACIONAL**

Solicitud internacional No. PCT/EP03/04151

I. BASE DEL INFORME

1. En relación con los elementos de la solicitud internacional (las hojas de reemplazo que han sido suministradas a la oficina receptora como respuesta a la invitación bajo el artículo 14 serán referidas como "presentadas originalmente" y no están anexas a este informe debido a que no contienen modificaciones (Regla 70.16 y 70.17)):

CAPITULO DESCRIPTIVO, PAGINAS:

1-13 Como fueron presentadas

REIVINDICACIONES, No.:

1-15 Como fueron presentadas

2. En relación con el idioma, todos los elementos marcados anteriormente fueron suministrados a esta Autoridad en el idioma en que la solicitud internacional fue presentada, a menos que se indique lo contrario bajo este punto.

Estos elementos fueron suministrados o estaban disponibles para esta autoridad en el siguiente idioma, el cual es:

☐ El idioma de la traducción aportada a efectos de la búsqueda internacional (bajo la Regla 23.1(b))

☐ El idioma de publicación de la solicitud internacional (bajo la Regla 48.3(b))

☐ El idioma de la traducción suministrada para efecto del examen preliminar internacional (bajo la Regla 55.2 y/o 55.3)

3. Respecto a cualquier secuencia nucleótido y/o aminoácido revelado en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional fue llevado a cabo con base en la lista de secuencias:

☐ Contenidas en la solicitud internacional de forma escrita

☐ Presentadas junto con la solicitud internacional en forma legible por computador

☐ Aportada posteriormente a esta Autoridad en forma escrita

☐ Suministrada posteriormente a esta Autoridad en forma legible por computador

☐ La declaración de que la lista de secuencias aportada posteriormente en forma escrita no va más allá que lo revelado en la solicitud internacional como fue presentada.

☐ La declaración de que la información inscrita en forma legible por computador es idéntica a la lista de secuencias en forma escrita aportada.

INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional No. PCT/EP03/04151

4. Las modificaciones han resultado en la cancelación de:

El capítulo descriptivo **páginas:**

Las reivindicaciones **Nos.:**

Los dibujos **hojas:**

5. Este informe ha sido establecido como si (algunas de) las modificaciones no hubieran sido efectuadas debido a que se ha considerado que van más allá de lo reivindicado mediante la solicitud internacional.

(A cualquier hoja de reemplazo que contenga dichas modificaciones debe hacerse referencia bajo el punto 1 y ser anexada a este informe)

6. Observaciones adicionales, si necesarias:

III. El no establecimiento de opinión en relación con la novedad, nivel inventivo y aplicación industrial

1. La pregunta de si la presente invención reivindicada aparenta ser novedosa, si tiene altura inventiva, o es aplicable industrialmente no ha sido examinada en relación a:

toda la solicitud internacional

X reivindicaciones Nos. 15 como IA

Porque:

X dicha solicitud internacional, o dichas reivindicaciones Nos. 9,10 se relacionan a la siguiente materia, la cual no requiere ser objeto del examen preliminar internacional (especificar): **ver hoja anexa**

— la memoria descriptiva, las reivindicaciones, o los dibujos (indicar abajo los elementos específicos) o las reivindicaciones Nos. son tan confusas que ninguna opinión sustancial pudo ser establecida (especificar):

___ las reivindicaciones, o dichas reivindicaciones Nos. no están soportadas adecuadamente por la memoria descriptiva, lo cual no permite que una opinión significativa sea formada.

las reivindicaciones Nos. no han sido objeto de búsqueda internacional.

2. Un examen preliminar internacional significativo no pudo llevarse a cabo debido a que la lista de secuencias nucleótido y/o aminoácido no cumple con los estándares provistos por el Anexo C de las Instrucciones Administrativas:

la forma escrita no ha sido suministrada o no cumple con los estándares.

☐ la forma legible por computador no ha sido suministrada o no cumple con los estándares.

**INFORME DEL EXAMEN
PRELIMINAR INTERNACIONAL**

Solicitud internacional No. PCT/EP03/04151

V. Declaración motivada, bajo el Art. 35(2) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial; citas y explicaciones que sustentan dicha declaración

Declaración

Novedad	SI:	Reivindicaciones 1-15
	NO:	Reivindicaciones
Nivel Inventivo	SI:	Reivindicaciones 1-15
	NO:	Reivindicaciones
Aplicación Industrial	SI:	Reivindicaciones 1-14
	NO:	Reivindicaciones 9,10

2. CITACIONES Y EXPLICACIONES

Ver hoja separada.

I. Re Item III

La presente reivindicación 15 se refiere a la materia objeto considerada por esta Autoridad para ser cubierta mediante las condiciones de la Regla 67.1 (iv) del PCT, en especial un método para el tratamiento terapéutico del cuerpo humano o animal. En consecuencia, ninguna opinión será formulada con respecto a la aplicación industrial de la materia objeto de esta reivindicación (Artículo 34(4)(a)(I) del PCT). (véase Item V-3 más abajo).

Re Item V

1) Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1: WO-A-99 03854 (NOVARTIS AG)

D2: WO-A-01 47507 (NOVARTIS AG)

2) La presente solicitud parece cumplir con los requerimientos del Artículo 33(2) y (3) del PCT.

La técnica anterior más cercana (D1 ó D2) revela directamente tabletas de 100 mg comprimidas de mesilato de imatinib ("GleevecTM") que contienen ca. 22% p/p del agente activo basado en el peso total de la tableta. Las cápsulas de 100 mg que contienen ca. 31% p/p del agente activo son también divulgadas.

El problema técnico es el proporcionar tabletas que posean dosis más altas del agente activo (p. ej. 400 mg, que es la dosis diaria habitual), esto es, tabletas que comprenden ca. 50% p/p de agente activo. Las tabletas estables que superan los problemas de alta friabilidad y pobre

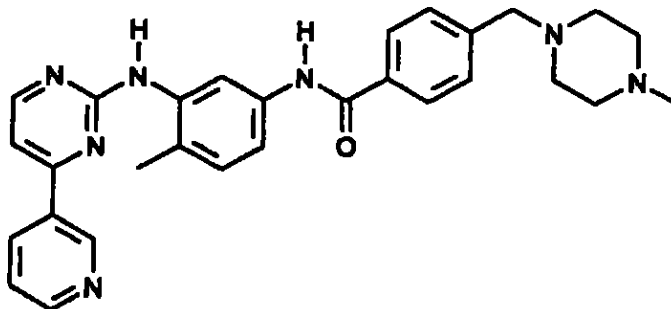
resistencia a la abrasión, son obtenidas primero por la granulación del agente activo con microcelulosa cristalina y/o HPMC (granulación húmeda), y luego comprimir el granulado junto con excipientes adicionales dentro de la tableta (núcleos dragée). La solución no es obvia a la luz de la técnica anterior, la cual no dirige el problema de proporcionar tabletas de mesilato de imatinib que poseen cargas más altas que aquellas conocidas en la técnica.

3) En cuanto a la aplicación industrial (Artículo 33(4) PCT): A fin de la evaluación de la materia objeto de la presente reivindicación 15 sobre la cuestión si es industrialmente aplicable, no existe ningún criterio en los Estados Contratantes del PCT. La patentabilidad también puede ser dependiente según la formulación de las reivindicaciones. La EPO por ejemplo, no reconoce como industrialmente aplicable la materia objeto de reivindicaciones dirigida a métodos para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia; ó al uso de un compuesto o composición en el tratamiento terapéutico/médico del cuerpo humano o animal, pero puede permitir, sin embargo, reivindicaciones para un compuesto o composición conocido para el primer uso en dicho tratamiento terapéutico/médico; y el uso de tal compuesto o composición para la fabricación de un producto o medicamento para un nuevo tratamiento terapéutico/médico.

Observaciones adicionales (Artículo 6 del PCT)

- 1) La fórmula del "Compuesto I" debe ser introducida en la reivindicación 1.
- 2) No existe justificación para la existencia de dos reivindicaciones independientes diferentes (Reivindicaciones 1 y 2) que se relacionan con la misma materia objeto, en contravención del Artículo 6 del PCT.

1. Una tableta que comprende una cantidad farmacológicamente efectiva del Compuesto I de la fórmula (1)



(1)

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de aproximadamente el 30 por ciento al 80 por ciento en peso de la fracción activa, basándose en el peso total de la tableta.

2. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el Compuesto I de la fórmula (1) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, está presente en una cantidad de aproximadamente el 50 por ciento al 80 por ciento en peso de la fracción activa, basándose en el peso total de la tableta.

3. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el Compuesto I de la fórmula (1) está en la forma de sal de monomesilato.

4. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el monosilato del Compuesto I de la fórmula (1) está en la forma del cristal beta del

mismo.

5. Una tableta de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde la tableta comprende uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables.

6. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 5, en donde el excipiente comprende cuando menos un aglutinante.

7. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 5, en donde los excipientes comprenden:

cuando menos un aglutinante en una cantidad total de aproximadamente 1 por ciento al 25 por ciento en peso basándose en el peso total de la tableta,

cuando menos un desintegrante en una cantidad total de aproximadamente el 10 por ciento al 35 por ciento en peso basándose en el peso total de la tableta

cuando menos un derrapante en una cantidad total de aproximadamente el 0.5 por ciento al 3 por ciento en peso basándose en el peso total de la tableta y/o

cuando menos un lubricante en una cantidad total de aproximadamente el 0.5 por ciento al 2% en peso basándose en el peso total de la tableta.

8. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 6 ó 7, en donde

el aglutinante comprende celulosa microcristalina o hidroxipropilmetilcelulosa o una mezcla de las mismas.

9. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el
5 desintegrante comprende polivinilpirrolidinona reticulada.

10. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el
derrapante comprende dióxido de silicio coloidal y/o sílice coloidal anhidra.

10 11. Una tableta de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el
lubricante comprende estearato de magnesio.

12. Un proceso para la preparación de una tableta de acuerdo con
cualquiera de las reivindicaciones anteriores, cuyo proceso comprende:

15 (i) mezclar el Compuesto I de la fórmula (1) o las sales
farmacéuticamente aceptables del mismo y los excipientes farmacéuticamente
aceptables;

(ii) granular en húmedo;

(iii) mezclar con los excipientes farmacéuticamente aceptables
20 para formar una mezcla; y

(iv) comprimir la mezcla obtenida en el paso (iii) para formar una

(Reivindicaciones modificadas
en vista del IPER)

30

tableta.

13. El proceso de acuerdo con la reivindicación 12, en donde la tableta se recubre.

5

14. Una tableta de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, preparada mediante un proceso de granulación húmeda.

10 15. Un método para el tratamiento de un sujeto, el cual comprende administrar una tableta de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 ó 14, la cual comprende una cantidad farmacológicamente efectiva del Compuesto I de la fórmula (1) a un sujeto que necesite dicho tratamiento.

2020
Bogotá D C

Doctor(a)
JIMENA ESCOBAR URIBE.
Apoderado(a)

REFERENCIA:	Radicación N°	04-111533
	Solicitud Internacional	PCT/EP03/04151
	Fecha límite fase nacional	23/11/2004
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio N°	1546
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486, de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la oficina de comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la Decisión 486.

Cúmplase

Dado en Bogotá D C,

06 DIC. 2005


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe División de Nuevas Creaciones

202051