



No. 08-117644-A-00007-0000

Fecha: 2013-05-30 16:22:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 21

Señor Superintendente

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 412

Referencia Expediente No. 08.117.644A
Asunto Solicitud de patente para
FORMULACIONES DE INHIBIDORES DE DPP IV
Solicitante **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**

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. **15271** del 5 de abril de 2013, interpongo en su contra el recurso de **REPOSICIÓN**, para que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para "**FORMULACIONES DE INHIBIDORES DE DPP IV**" a favor de **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**.

II. OPORTUNIDAD DE LA IMPUGNACIÓN

La Resolución No. **15271** del 5 de abril de 2013, fue notificada el veintitrés (23) de mayo de dos mil trece (2013), por lo que el término para interponer el recurso de reposición vence el treinta (30) de mayo de dos mil trece (2013). En consecuencia, me encuentro dentro de la oportunidad legal.

"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

III. LA DECISIÓN RECURRIDA

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

3.1.1 Negar el privilegio de patente para la invención **"FORMULACIONES DE INHIBIDORES DE DPP IV"**

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

3.2.1 Las composiciones reclamadas en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Una composición farmacéutica que comprende como ingrediente activo un compuesto inhibidor DPP-4"*.

3.2.2 El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque dicho documento divulga una composición que comprende como ingrediente activo un compuesto inhibidor de DPPIV que puede contener diluyentes como lactosa, glucosa, un aglutinante, un disgregante como almidón de maíz y un lubricante como estearato de magnesio. La diferencia entre la invención y el producto de D1 consiste en que la presente solicitud abarca excipientes adicionales a los divulgados en la anterioridad.

3.2.3 El documento D2 enseña los excipientes farmacéuticos como diluyentes, aglutinantes, disgregantes y lubricantes. La diferencia entre la invención y lo divulgado en D2 consiste en que la anterioridad no divulga composiciones que comprendan un inhibidor DPP IV.

3.2.4 El Problema Técnico Objetivo es cómo modificar las composiciones conocidas en D1 para conseguir formulaciones que comprendan inhibidores de DPP IV alternativas a las previamente divulgadas. Sin embargo, la utilidad del manitol y

el almidón pregelatinizado como agentes diluyentes ya se había divulgado en D2 e igualmente, D2 enseña que la crospovidona posee propiedades como agente aglutinante.

- 3.2.5 En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría otros excipientes de formulación como los descritos en D2 en reemplazo de los divulgados en las composiciones de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera que la solución propuesta en la reivindicación 1 y sus dependientes 2 a 16, es obvia y no tiene nivel inventivo.
- 3.2.6 Por otra parte, la reivindicación 17 reclama un proceso para la preparación de una composición farmacéutica.
- 3.2.7 El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque dicho documento divulga un proceso para preparar una forma farmacéutica que comprende un inhibidor DPP IV, que consiste en las etapas de: preparar una solución acuosa de aglutinante (polivinilpirrolidona), mezclar el agente activo (DPP-IV), un diluyente (lactosa) y un desintegrante (almidón), humedecer uniformemente con la solución acuosa del aglutinante, tamizar la composición húmeda (2.0 mm tamaño malla), adicionar un lubricante, comprimir la mezcla para formar tabletas y cubrir las tabletas comprimidas con una mezcla de recubrimiento (ejemplos 5 y 6). La diferencia entre la invención y el proceso de D1 consiste en que el proceso de la presente solicitud divulga excipientes adicionales a los divulgados en el estado de la técnica.
- 3.2.8 El documento D2 enseña los excipientes farmacéuticos como diluyentes, aglutinantes, disgregantes y lubricantes. La diferencia entre la invención y lo divulgado en D2 consiste en que la anterioridad no divulga el conjunto de actividades que permite lograr un producto.

- 3.2.9 El Problema Técnico Objetivo es cómo modificar los excipientes divulgados en las etapas del proceso de producción conocidas en D1 para conseguir un proceso para lograr formulaciones que comprendan inhibidores de DPP IV alternativo al previamente divulgado. Sin embargo, la utilidad de excipientes adicionales como manitol y almidón pregelatinizado como agentes diluyentes ya se había divulgado en D2 e igualmente, D2 enseña que la crospovidona posee propiedades como agente aglutinante.
- 3.2.10 En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría otros excipientes de formulación como los descritos en D2 en reemplazo de los divulgados en las etapas de fabricación de las composiciones que enseña D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 (sic) de la solicitud.
- 3.2.11 En relación con el nuevo capítulo reivindicatorio, se encuentra que a pesar del requerimiento realizado, la solicitante no ha retirado de la presente divisional la materia reclamada en la solicitud parental. Por otra parte, la presente solicitud continúa adoleciendo del requisito de consición (sic), toda vez que no se limita el alcance de la materia reclamada ya que se persiste en el uso de términos funcionales tales como "aglutinante", "disgregante", "lubricante", y como se explicó en la evaluación de nivel inventivo, dichos términos abarcan una indeterminada cantidad de agentes tanto existentes como aquellos que puedan desarrollarse en el futuro y que posean la misma función. En consecuencia, sería imposible para la persona versada en la materia identificar cuáles serían las combinaciones apropiadas entre tal número de excipientes para dar solución al problema técnico. Por otra parte, la solicitud carece de información que permita establecer que a pesar de la variabilidad propuesta dentro de la materia reclamada, todas las posibles combinaciones sean una solución al problema planteado de incompatibilidad, degradación y extracción; teniendo en cuenta que los ejemplos y resultados presentados no pueden extrapolarse a la indeterminada cantidad de composiciones reclamadas careciendo la solicitud de nivel inventivo.

Lo anterior también aplica para la reivindicación independiente 21 que además de reclamar materia superpuesta a la contenida en la solicitud parental, contempla un elevado número de combinaciones posibles; igualmente, no es clara la razón por la cual esta reivindicación es independientes si la materia reclamada está comprendida en la reivindicación 1.

3.2.12 En consecuencia, la presente reclamación es general y describe un gran número de opciones vagas que no están relacionadas de forma razonable a una solución concreta y específica del problema técnico planteado y a su vez se encuentra sugerida por las anterioridades D1 y D2 como se estableció en la evaluación del nivel inventivo.

3.2.13 En conclusión, los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada.

IV. OBJETO DEL RECURSO

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

4.1 Revocar la Resolución No. **15271** del 5 de abril de 2013.

4.2 Conceder el privilegio de patente de invención para "**FORMULACIONES DE INHIBIDORES DE DPP IV**" a favor de **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**.

V. 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 los hechos del caso no fueron

estudiados de forma adecuada, llegando a una conclusión errada respecto al nivel inventivo de la solicitud de mi representada.

5.1. Limitación al capítulo reivindicatorio

Con el fin de definir de forma más clara el alcance de la invención, presento junto con este escrito un nuevo pliego reivindicatorio en el que se limita dicho alcance, de acuerdo con lo referido por ese Despacho. Le solicito se sirva aceptar estas nuevas reivindicaciones en sustitución de las presentadas junto con mi memorial del 12 de marzo de 2013.

Ahora bien, respecto a la falta de concisión de las reivindicaciones debido al uso de términos como "aglutinante", "disgregante", "lubricante", la solicitante está en desacuerdo con dicha afirmación.

En particular, la reivindicación 22 mencionaba específicamente que "el aglutinante es seleccionado de copovidona (copolimerizados de vinil pirrolidona con otros vinilderivados), hidroxipropil metil celulosa (HPMC), hidroxipropil celulosa (HPC), poli(vinil pirrolidona) (Povidona), almidón pregelatinizado e hidroxipropil celulosa de baja sustitución (L-HPC); el disgregante es seleccionado de almidón de maíz, crospovidona, hidroxipropil celulosa de baja sustitución (L-HPC) y almidón pregelatinizado; y el lubricante es seleccionado de talco, poli(etilenglicol), behenato de calcio, estearato de calcio, aceite de ricino hidrogenado o estearato de magnesio".

Es completamente claro para la persona versada en la materia que el alcance de la reivindicación está limitado específicamente de acuerdo con el tipo de coadyuvante utilizado en la composición farmacéutica reivindicada. Estas no son indeterminadas posibilidades como lo afirma el señor Examinador ni cubre 'posibles desarrollos futuros' como lo sugiere ese Despacho.

En el nuevo pliego reivindicatorio, la reivindicación 1 se ha limitado para especificar el tipo de excipientes utilizados en la composición y apreciar de forma más clara, el alcance de la invención.

5.2 De lo establecido por la Normatividad Andina en relación al nivel inventivo

El artículo 18 de la Decisión 486 establece que *"se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica"*.

La cuestión a ser evaluada por el señor Examinador es si la invención reivindicada es o no evidente para un técnico en la materia, no sólo estableciendo las diferencias entre el estado de la técnica más cercano, sino también probando que la materia reivindicada se derivó o no de manera evidente a partir de dicho estado de la técnica. En el presente caso, la solución del problema técnico proporcionado por la presente invención no se deriva de manera evidente de los documentos D1 y D2, ni existe en su conjunto alguna indicación que lleve a la persona versada a la materia a modificar lo divulgado en los documentos D1 y D2 para llegar a lo reivindicado en la presente solicitud, sin esfuerzo intelectual y de forma directa.

Así, quisiera resaltar que el "Instructivo Examen de Solicitudes de Patentes de Invención y Modelo de Utilidad" de ese Despacho, establece además que respecto a la evaluación de la invención reivindicada, partiendo del estado de la técnica cercano y del problema técnico objetivo, se debe determinar si ésta habría sido obvia para la persona medianamente versada en la materia. Resalta que *"esta etapa consiste en responder a la pregunta de si en el estado de la técnica en su conjunto hay un segundo documento que contiene una enseñanza que indicaría (no sólo que podría indicar, sino que indicaría) a la persona medianamente versada en la materia, enfrentada al problema*

técnico, cómo modificar o adaptar el estado de la técnica más cercano para resolver el problema, de la forma reivindicada, sin realizar una actividad inventiva. (Negrilla y subrayado nuestro).

5.3 La presente solicitud sí tiene nivel inventivo

Con el fin de demostrar que la presente solicitud cumple con el requisito de nivel inventivo, se pone de presente lo siguiente:

Ninguna de las referencias citadas por ese Despacho, solas o en combinación, sugieren las composiciones reivindicadas ni el proceso reivindicado en el nuevo pliego que presento junto con este escrito. En particular no hay una enseñanza razonable en las anterioridades que llevara a seleccionar y luego modificar las composiciones divulgadas en D1 y D2 de forma tal que se llegara de forma directa a las reivindicaciones de la presente solicitud, sin ningún esfuerzo intelectual.

Por lo tanto la persona normalmente versada en la materia, que estuviera buscando una solución al problema existente, no hubiera sido guiada directamente a las composiciones y proceso de la presente invención.

El documento D2 es un texto muy general que no se relaciona específicamente con composiciones que comprenden algún inhibidor de DPP-IV, y mucho menos con alguno que tenga grupos amino libres, un compuesto del tipo xantino, y aun menos con los compuestos específicos y porcentajes mencionados en las reivindicaciones. Asimismo, D2 no habla sobre el problema existente respecto a este tipo de compuestos pues es un manual general sobre excipientes farmacéuticos. Las enseñanzas de D2 son generales y describen un vasto número de opciones vagas y generalizadas, y no existe una indicación específica que guíe al experto en la técnica para que obtenga la materia objeto particular de la presente invención.

En otras palabras, el documento D2 podría indicar una lista de coadyuvantes a ser utilizados en una composición farmacéutica pero de ninguna manera indica específicamente cuáles se deben usar y sus ventajas específicas para su utilización en una composición farmacéutica que comprende un inhibidor de DPP-IV, de acuerdo con las actuales reivindicaciones.

Lo anterior significa que una mera posibilidad o esperanza general y vaga de que algo funcione (entre una larga lista de excipientes), no puede ser un estándar válido para evaluar si una invención tiene nivel inventivo y negar que existe un esfuerzo intelectual por parte de los inventores para llegar a las composiciones y proceso que hacen parte de la presente invención.

El experto en la técnica tiene conocimiento que los compuestos con diferentes clases estructurales pueden requerir sus propias formulaciones especiales. En este contexto, quiero resaltar que las composiciones de la presente invención están limitadas a una combinación seleccionada de excipientes específicos: no hay una enseñanza específica en las referencias citadas como un todo que hubiera guiado (no que simplemente pudiera guiar) a la persona normalmente versada en la presente situación a esta combinación de excipientes específicos en una forma lógica, sencilla e inevitable sin tener un conocimiento previo de la invención (análisis *ex post facto*).

En consecuencia, se puede concluir también que el nivel inventivo no es cuestión de si se pueden 'encajar' las características de la invención reivindicada de forma aleatoria a partir de piezas divulgadas en el arte previo, sino más bien de si un experto en la técnica hubiera llegado de forma inevitable a la invención reivindicada a partir de una enseñanza técnica del arte previo.

La única fuente de cualquier sugerencia para llegar a la materia objeto de la presente invención a partir de D2 en combinación con D1 se genera a partir de un análisis *ex post facto*, el cual no es válido bajo los estándares de evaluación de solicitudes de patente de

acuerdo con lo establecido por el "Instructivo Examen de Solicitudes de Patentes de Invención y Modelo de Utilidad" de ese Despacho.

Por otra parte, la solicitud (en su conjunto) de la presente invención es completamente detallada, específica, particular y fácilmente reconocible para una persona normalmente versada en la materia en cuanto a que incluye de forma explícita y precisa los efectos, ventajas y razonamientos de la misma, de forma tal que dicho experto en la técnica puede reconocer fácilmente sus ventajas y efectos técnicos.

La presente solicitud describe los efectos beneficiosos de la invención por medio del análisis de aspectos estructurales (tales como por ejemplo un grupo amino primario o secundario, etc.), en combinación con explicaciones racionales (tales como por ejemplo la reacción con azúcares reductores y con otros grupos carbonílicos reactivos y con grupos funcionales de ácido carboxílico de excipientes principalmente en rangos de bajas dosis, etc.), y de su modo de operación (tal como por ejemplo, composiciones farmacéutica particulares de acuerdo con la invención con excipientes específicos como se indica y se enseña en la solicitud original, por medio de modalidades preferidas y ejemplos de trabajo ilustrativos para resolver problemas de incompatibilidad, degradación, extracción, etc.). Así, haber logrado encontrar la solución es evidencia plausible, convincente, y replicable para el experto en la técnica.

Por lo tanto, la persona versada en la materia no puede observar de manera obvia y evidente a partir del arte previo, las ventajas y efectos técnicos que tiene determinada combinación de excipientes en una composición farmacéutica y en el proceso de fabricación de la misma, presentes en rangos específicos, y asimismo no se puede hablar de falta de esfuerzo intelectual para encontrar las composiciones que tienen dichas ventajas sobre lo divulgado por cualquiera de las anterioridades citadas por ese Despacho.

Para finalizar, quisiera traer a colación el artículo de Nishath Fathima y otros, "*Drug excipient interaction and its importance in dosage form development*"¹, el cual pone de relieve que si bien se considera que los excipientes son farmacológicamente inertes, los mismos pueden iniciar, propagar o participar en interacciones químicas y físicas con principios activos, lo cual puede comprometer la efectividad y seguridad de un medicamento. Concluye el documento resaltando que estas interacciones pueden tomar un largo tiempo en manifestarse en programas convencionales de pruebas y no siempre se pueden predecir en estudios de pre-formulación.

Así, se puede apreciar que el haber encontrado una composición farmacéutica que comprende un inhibidor de DPP-IV, estable frente a los problemas de incompatibilidad, degradación, extracción, etc. encontrados en el arte previo, por la selección de una combinación específica de excipientes, es un indicio claro de la actividad inventiva que existe en la presente solicitud.

5.4 Conclusión

A la luz de los argumentos expuestos anteriormente, se demuestra que D1 y D2, ni solos ni en conjunto, dan una indicación clara a la persona versada en la materia para obtener la composición y proceso reivindicados por la solicitante.

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:

¹ Journal of Applied Pharmaceutical Science 01 (06); 2011: 66-71

VI. PETICIÓN

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

6.1 Que al considerar las razones precedentes se revoque la decisión contenida en la Resolución No. **15271** del 5 de abril de 2013, en cuanto resuelve negar el privilegio de patente de invención.

6.2 Que se otorgue el privilegio de patente de invención para: "**FORMULACIONES DE INHIBIDORES DE DPP IV**" a favor de **BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH**.

VII. ANEXOS

Nos permitimos anexar al presente memorial:

7.1. Nuevo capítulo reivindicatorio restringido compuesto por 21 reivindicaciones.

7.2 Formulario de modificaciones

7.3. Pago de la tasa correspondiente por valor de \$ 125 000

VIII. NOMBRE Y DIRECCIÓN

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

BOEHRINGER INGELHEIM INTERNATIONAL GMBH

Binger Strasse 173

55216 Ingelheim am Rhein

Alemania

VIII. 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 4º, de esta ciudad de Bogotá, D.C.

Señor Superintendente,


LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

C.C. 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555

 COLO-09255-0841-170-5
RBL\RBL\ID-243229\WPCL9255
No. M-2013-243229\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 _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Alemania	Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Alemania	Ingelheim am Rhein,
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
---	--	--------------------------------------

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 08.117.644 A****Aparece****Debe ser****Modificación:****Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 21 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.****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.

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-AF243294\WPCL9255

REIVINDICACIONES

1. Una composición farmacéutica que comprende como ingrediente activo un compuesto inhibidor DPP-4 con un grupo amino o una sal del mismo,

un primer diluyente, un segundo diluyente, un aglutinante, un disgregante y un lubricante;

en donde el inhibidor DPP-4 está presente en una cantidad de 0.5 mg a 10 mg, particularmente 0.5 mg, 1 mg, 2.5 mg, 5 mg o 10 mg, y

en donde los diluyentes son seleccionados de eritritol, hidroxipropil celulosa de baja sustitución, manitol, almidón pregelatinizado y xilitol;

el aglutinante se selecciona de copovidona (copolimerizados de vinilpirrolidona con otros derivados de vinilo), hidroxipropilmetilcelulosa (HPMC), hidroxipropilcelulosa (HPC), polivinilpirrolidona (povidona), almidón pregelatinizado, e hidroxipropilcelulosa de baja sustitución (L-HPC);

el disgregante se selecciona de almidón de maíz, crospovidona, hidroxipropilcelulosa de baja sustitución (L-HPC), y almidón pregelatinizado; y

el lubricante se selecciona de talco, polietilenglicol, behenato de calcio, estearato de calcio, aceite de ricino hidrogenado y estearato de magnesio.
2. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende un disgregante adicional.
3. La composición farmacéutica de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 que comprende un deslizante adicional.
4. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, donde el primer diluyente es manitol y el segundo diluyente es almidón pregelatinizado.
5. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, donde el lubricante es talco o estearato de magnesio.
6. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el aglutinante es copovidona (copolimerizados de vinil pirrolidona con otros vinilderivados), hidroxipropil metil celulosa (HPMC), hidroxipropil celulosa (HPC) o polivinil pirrolidona (Povidona).

7. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el disgregante es almidón de maíz.
8. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 2, en donde el disgregante adicional es crospovidona.
9. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 3, en la que el agente deslizante opcional es dióxido de silicio coloidal.
10. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el primer diluyente es manitol, el segundo diluyente es almidón pregelatinizado, el aglutinante es copovidona, el disgregante es almidón de maíz y el lubricante es estearato de magnesio.
11. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende
 - 0,5-20 % de ingrediente activo,
 - 40-88 % de diluyente 1,
 - 3-40 % de diluyente 2,
 - 1-5 % de aglutinante,
 - 5-15 % de disgregante, y
 - 0,1-4 % de lubricante.
12. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende
 - 0,5-7 % de ingrediente activo
 - 50-75 % de diluyente 1,
 - 5-15 % de diluyente 2,
 - 2-4 % de aglutinante,
 - 8-12 % de disgregante, y
 - 0,5-2 % de lubricante.
13. Una composición farmacéutica según la reivindicación 1, en la forma de dosificación de cápsulas, comprimidos o comprimidos revestidos por una película.

14. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 13, que comprende un 2-4% de película de revestimiento.
15. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 14, en donde la película de revestimiento comprende un agente formador de película, un plastificante, un agente deslizante y opcionalmente uno o más pigmentos.
16. La composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 15, en donde la película de revestimiento comprende hidroxipropil metil celulosa (HPMC), polietilenglicol (PEG), talco, dióxido de titanio y óxido de hierro.
17. Un proceso para la preparación de una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende
- a) disolver un aglutinante en un disolvente para producir un líquido de granulación;
 - b) mezclar un inhibidor de DPP-IV, un diluyente y un disgregante para producir una premezcla;
 - c) humedecer la premezcla con el líquido de granulación y subsiguientemente granular la premezcla humedecida;
 - d) opcionalmente, tamizar la premezcla granulada a través de un tamiz con un tamaño de malla de al menos 1,0 mm;
 - e) secar el granulado a una temperatura de aproximadamente 40-75°C hasta obtener la pérdida deseada en el valor de secado en el intervalo de 1-5%;
 - f) tamizar el granulado seco a través de un tamiz con un tamaño de malla de al menos 0,6 mm;
 - g) añadir el lubricante al granulado para el mezclado final.
18. El proceso según la reivindicación 17, que adicionalmente comprende
- h) comprimir la mezcla final para formar núcleos de comprimidos;
 - i) preparar una suspensión de revestimiento;
 - j) revestir los núcleos de los comprimidos con la suspensión de revestimiento hasta ganar un peso de aproximadamente 2-4 %, para producir comprimidos revestidos por una película.
19. El proceso según la reivindicación 17, en donde parte de los excipientes se añaden de modo extragranular, previamente al mezclado final de la etapa g).

20. El proceso según la reivindicación 17, en el que el granulado producido en las etapas a)-e) se produce en el recipiente utilizado en el proceso de granulación de alto cizallamiento y subsiguientemente se seca en el recipiente de una granuladora.

21. Una composición farmacéutica de acuerdo con la reivindicación 1 que comprende como ingrediente activo un compuesto inhibidor DDP-4 con un grupo amino 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-(3-(*R*)-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-inil)-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-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, y

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

O una sal del mismo.

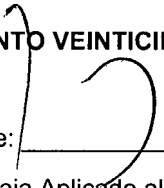
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 13 - 0049113
		Bogotá D.C., Mayo 22 de 2013 - 08:28:05

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS					NI 860.041.367	
*** Soporte del Pago ***						
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR.PAGO	
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	189813061	21/05/2013	16.260.400.00	

*** 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. 08-117644-A-00007-0000

Fecha: 2013-05-30 16:22:11 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 21

0010:09255-841-170-5.

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