

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-98041- -2	FECHA: 2015-05-16 23:14:49
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 7
ACT: 430 REQUERSOLICITA	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

Asunto: Radicación: 14-98041- -2
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 430
Oficio: 5262
Folios: 7

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/JP2012/076415				
Fecha de Presentación Internacional	12/10/2012				

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 14-098041-00000-0000	07/mayo/2014
Reivindicaciones:	Radicado 14-098041-00000-0000	07/mayo/2014
Dibujos:	Radicado 14-098041-00000-0000	07/mayo/2014
Prioridad:	JP 2011-227057	14/octubre/2011

2. Análisis de la Prioridades

Se acepta las reivindicación de la 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 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por la 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. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a

11 del capítulo reivindicatorio radicado bajo N° 14-098041-00000-0000.

Título de la solicitud: “TABLETA QUE CONTIENE 7-[4-(4-BENZO[B]TIOFEN-4-IL-PIPERAZIN-1-IL)BUTOXI]-1H-QUINOLIN-2-ONA O UNA DE SUS SALES”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar una tableta que contiene el Compuesto (I) o una de sus sales como ingrediente activo, que presente una excelente capacidad de desintegración, estabilidad de almacenamiento y alta fotoestabilidad (Pág. 7 y 8).

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una tableta de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o una de sus sales farmacéuticamente aceptables y los métodos de elaboración de las mismas.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 009/020, A61K 009/028, A61K 031/496, A61K 047/002, A61K 047/010, A61K 047/012, A61K 047/026, A61K 047/038.

4. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara puesto que una reivindicación independiente debe especificar todas las características esenciales necesarias para definir la invención y debe ser autosuficiente y el caso de la reivindicación es muy general y no menciona las características que son esenciales, se sugiere incluir las características técnicas de la reivindicación dependiente 2.

Las reivindicaciones 2, 5 y 10 no son claras ni concisas porque la utilización de las expresiones “un excipiente”, “un aglutinante”, “un desintegrante”, “un lubricante”, “azúcares”, “alcoholes de azúcar”, “almidones”, “celulosas”, “un derivado de celulosa” y “derivados de almidón” refiriéndose a los elementos constituyentes de una composición no son limitativas y son imprecisas, lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Por lo que se hace indispensable que el solicitante indique la denominación común de los excipientes que cumplen con las condiciones de “un excipiente”, “un aglutinante”, “un desintegrante”, “un lubricante”, “azúcares”, “alcoholes de azúcar”, “almidones”, “celulosas”, “un derivado de celulosa” y “derivados de almidón”.

Las reivindicaciones deben definir la materia a proteger por sus características técnicas esenciales del producto reivindicado, en el caso de la reivindicación 8 se encuentra la expresión “se obtiene dando forma de tableta a una sustancia granulada obtenida por medio de granulación húmeda” lo que corresponde a una característica técnica esencial de un procedimiento, es decir a otra categoría inventiva y no a la del producto reclamado, se sugiere al solicitante excluir este tipo de expresiones porque hacen referencia a otra categoría inventiva (procedimiento).

5. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 14 de octubre de 2011 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	Solicitud de patente nacional 13-261085-00000-0000	“Combinaciones que comprenden brexpiprazol o una sal del mismo y un segundo fármaco para uso en el	05/noviembre/2013 ^[1]

1: Fecha de presentación en fase nacional de la Solicitud de patente nacional 13-261085-00000-0000

		tratamiento de un trastorno del SNC"	
D2	US 2010/0179322	"Piperazine-substituted benzothiophenes for treatment of mental disorders"	15/Julio/2010
D3	ES 2318693	"Procedimiento de granulación en húmedo para la preparación de composiciones farmacéuticas de aripiprazol"	18/julio/2007

El documento D1 divulga tabletas del compuesto 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1*H*-quinolin-2-ona (Pág. 125, Ej. 1, tablas 3 y 4).

El documento D2^[2] divulga tabletas de un compuesto de la invención representado por el compuesto 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1*H*-quinolin-2-ona (Pág. 45, Párrs. [0556 a 0557]).

El documento D3 ^[3] divulga tabletas de aripiprazol obtenidas por granulación húmeda que comprenden como excipientes: lactosa monohidratada, almidón NF, celulosa microcristalina NF, hidroxipropilcelulosa, estearato de magnesio y colorante rojo (Pág. 5, Ejs. 1 y 2).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art16 D486)

La reivindicación 1 consiste en: *“Una tableta que contiene...”* (Radicado N°. 14-098041-00000-0000).

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

Características esenciales	D1
Fecha de presentación en fase nacional: 07 mayo de 2014	Fecha de presentación en fase nacional:05 de noviembre 2013
Fecha de Prioridad:14 de octubre de 2011	Fecha de Prioridad: 05 de abril de 2011
Fecha de publicación internacional:18 de abril de 2012	Fecha de publicación internacional: 11 de noviembre 2012
Una tableta que contiene	Un comprimido que comprende: (Pág. 125, Ej. 1, tablas 3 y 4)
7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1 <i>H</i> -quinolin-2-ona o una de sus sales como ingrediente activo	7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]- 1 <i>H</i> -quinolin-2-ona (Pág. 6); y Methocel K4M (Hidroxipropil Metilcelulosa), Avicel PH 200 (Celulosa microcristalina NF), Estearilfumarato de sodio y Povidona 30

Las características esenciales de la tableta de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual enseña tabletas de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1*H*-quinolin-2-ona.

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

La reivindicación dependiente 2 no menciona alguna característica que haga nueva a la tableta de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

2:<https://www.google.com/patents/US20100179322>

3:<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

FT=D&date=20090501&DB=EPODOC&locale=es_LP&CC=ES&NR=2318693T3&KC=T3&ND=4

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 3 consiste en: “Una tableta que contiene...” (Radicado N°. 14-098041-00000-0000).

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

Características esenciales	D2	D3
Una tableta que contiene	Un comprimido que comprende: (Pág. 45, Párrs. [0556 a 0557])	Un comprimido que comprende: (Pág. 45, Párrs. [0556 a 0557])
7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-il-piperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o una de sus sales como ingrediente activo	Un compuesto de la invención seleccionado del grupo de: 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (reivindicación , compuesto 1) Clorhidrato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 42) Sulfato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 43) Maleato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 44) Fumarato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 45) Citrato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 46) P-toluensulfonato de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) (Ejemplo 47)	Aripiprazol de tipo I
el excipiente (a) es al menos un miembro seleccionado del grupo que contiene lactosa, almidón de maíz y celulosa microcristalina	Almidón de maíz y Avicel (Celulosa microcristalina NF)	Lactosa monohidratada, almidón y celulosa microcristalina
el aglutinante (b) es hidroxipropilcelulosa	No refiere	hidroxipropilcelulosa
desintegrante (c) es al menos un miembro seleccionado del grupo que contiene hidroxipropilcelulosa de baja sustitución, croscarmelosa sódica, y carboximetilalmidón de sodio	No refiere	
el lubricante (d) es un estearato de magnesio	Estearato de magnesio	Estearato de magnesio

El documento D2 se considera el estado de la técnica más cercano a la materia reclamada en la reivindicación 3 porque divulga tabletas que comprende un compuesto seleccionado de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o una sal farmacéuticamente aceptable, almidón de maíz, celulosa microcristalina y estearato de magnesio (Pág. 45, Párrs. [0556 a 0557]).

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 3 y las composiciones divulgadas en el documento D2 consiste que la solicitud define la presencia en la composición de la tableta de hidropropilcelulosa mientras que el documento D2 no divulga que los comprimidos presenten hidropropilcelulosa.

No existe evidencia en el expediente administrativo que permita concluir que la inclusión de hidropropilcelulosa como agente aglutinante y desintegrante mejore la desintegración y/o estabilidad de almacenamiento y/o fotoestabilidad de las composiciones de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o sus sales farmacéuticamente aceptables.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en obtener composiciones de-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o de sus sales farmacéuticamente aceptables alternativas a las divulgadas en el documento D2.

Sin embargo, el documento D3 revela que composiciones que comprenden aripiprazol, lactosa monohidratada, almidón NF, celulosa microcristalina NF, hidroxipropilcelulosa, estearato de magnesio y colorante rojo (Pág. 5, Ejs. 1 y 2), que presentan un perfil de disolución del principio activo superior al 95% en los primeros 30 minutos de la disolución (Pág. 6, tabla 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir hidropropilcelulosa como agente aglutinante y desintegrante en las tabletas divulgadas en el documento D2 de la manera que lo sugiere el documento D3 para así llegar al objeto de la reivindicación 3.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 4 a 9 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 10 consiste en: “Un método para producir una tableta...” (Radicado N°. 14-098041-00000-0000).

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

Características esenciales	D3	D2
Un método para producir una tableta, método que contiene los pasos de:	Un método para producir comprimidos de aripiprazol (Pág. 5, Ejs. 1 y 2)	Un método para producir comprimidos de (Preparación de ejemplos)
granular una mezcla que contiene 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona) o una de sus sales, un excipiente (a) , un aglutinante (b) , y un desintegrante (c), y además añadiendo a dicha mezcla un lubricante (d); y	Se preparó una mezcla de aripiprazol lactosa monohidratada, almidón NF, celulosa microcristalina NF e hidroxipropilcelulosa, la mezcla se granuló en húmedo utilizando agua purificada, el granulado se clasificó por tamaño y el estearato se tamizó, se añadió al granulado seco y se mezcló	Se mezclaron 100 g de un compuesto de la invención con 40 g de celulosa microcristalina, 30 g de almidón de maíz y 2 gramos de estearato de magnesio.
formar la mezcla obtenida en una tableta, en la que el excipiente (a) es al menos uno de los miembros seleccionado de un grupo que contiene azúcares, alcoholes de azúcar, almidones, y celulosas; el aglutinante (b) es un derivado de celulosa; el desintegrante (c) es al menos un miembro seleccionado de un grupo que contiene derivados de celulosa y derivados de almidón; y el	Se comprimió la mezcla en comprimidos utilizando una prensa Kilian.	comprimir con un mortero de glicocalyx R100 mm

lubricante (d) es un estearato.		
---------------------------------	--	--

El documento D3 se considera el estado de la técnica más cercano a la materia reclamada en la reivindicación 10 porque divulga dos procedimientos para la elaboración de tabletas de aripiprazol vía granulación húmeda(Pág. 5, Ejs. 1 y 2).

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 10 y el procedimiento divulgado en el documento D3 consiste que la solicitud define en la primera etapa que el principio activo de las tabletas es 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona (Brexpiprazol) mientras que el documento D3 refiere que es aripiprazol

El efecto que logra es obtener al remplazar el aripiprazol por 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona (Brexpiprazol) es obtener un procedimiento para la elaboración de tabletas de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona (Brexpiprazol).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en obtener un procedimiento para la elaboración de tabletas de 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona (Brexpiprazol).

Sin embargo, el documento D3 revela que un procedimiento para obtener comprimidos del compuesto 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona o sus sales farmacéuticas que comprende las etapas de: mezclar 100 g de un compuesto de la invención con 40 g de celulosa microcristalina, 30 g de almidón de maíz y 2 gramos de estearato de magnesio y comprimir con un mortero de glicocalyx R100 mm.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a remplazar el aripiprazol por 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-ilpiperazin-1-il)butoxi]-1H-quinolin-2-ona (Brexpiprazol) en el procedimiento divulgado en el documento D3 de la manera que lo sugiere el documento D2 para así llegar al objeto de la reivindicación 10.

Puesto que la reivindicación dependiente 11 no menciona características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivo.

Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Solicitud de patente nacional 13-261085-00000-0000	1 y 2	Novedad
D2	US 2010/0179322	3 a 11	Nivel inventivo
D3	ES 2318693	3 a 11	Nivel inventivo

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 del día siguiente 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 2015-05-19

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero

Revisó: Dayron Alexander Ramirez Reyes