

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020  
Bogotá, D.C.,

Abogado  
CARLOS R. OLARTE  
[office@olarteraisbeck.com](mailto:office@olarteraisbeck.com)

|        |            |                |
|--------|------------|----------------|
| ASUNTO | Radicación | 09-2100        |
|        | Trámite    | 011            |
|        | Evento     | 378            |
|        | Actuación  | 519            |
|        | Oficio     | <b>11 4592</b> |
|        | Folios     | 6              |

|                         |                          |                                 |                                  |
|-------------------------|--------------------------|---------------------------------|----------------------------------|
| Patente de Invención    | <input type="checkbox"/> | Patente de Modelo de Utilidad   | <input type="checkbox"/>         |
| Via Nacional            | <input type="checkbox"/> |                                 |                                  |
| Via PCT (fase nacional) | <input type="checkbox"/> | Cap. I <input type="checkbox"/> | Cap. II <input type="checkbox"/> |

No. Solicitud Internacional PCT/US2007/013805  
Fecha de Presentación Internacional junio 12 de 2006

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:      | Folios 83-127  | 13 enero de 2009 |
| Reivindicaciones: | Folios 128-132 | 13 enero de 2009 |
| Dibujos:          | Folios 133-140 | 13 enero de 2009 |
| Prioridad:        | US 60812724    | Junio 12 de 2006 |

**2. Análisis de la Prioridad**

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

Título de la solicitud: "Formulaciones Y Composiciones Farmacéuticas De Un Antagonista Selectivo Del CXCRX2 O CXCR1 O ambos, Y Métodos De Utilización De Los Mismos Para Trastornos Inflamatorios"

El problema planteado en esta solicitud consiste en La necesidad de suministrar composiciones con base en un antagonista selectivo CXCRX2, CXCR1 o ambos. Composiciones que presenten buenas características técnicas.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona composiciones con base en un antagonista selectivo CXCRX2, CXCR1.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 9/48; A61K 9/16; A61K 47/10; A61K 47/20; A61K 47/38.

#### **4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))**

El objeto de las reivindicaciones 33-34 no es patentable de acuerdo con el literal d) del artículo citado.

#### **5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)**

El uso de las reivindicaciones 32-35 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

#### **6. De la Solicitud de Patente**

##### **Título**

El título de la presente solicitud hace referencia a un ítem patentable cuando hace uso de la expresión "Y Métodos De Utilización De Los Mismos Para Trastornos Inflamatorios", se sugiere cambiar eliminar la expresión del título.

##### **Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)**

Las reivindicaciones 1, 2, 9, 10, 30, 31 y 32 no son claras porque reclaman una composición que comprende un compuesto (I) y la caracterizan porque "proporciona liberación de...", o "exhibe una AUC media del compuesto...", o "exhibe una Cmax media entre...", o "exhibe un Tmax medio de...". Estos son resultados a alcanzar y no definen la composición farmacéutica como tal, se recuerda al solicitante que las composiciones se definen por sus características técnicas esenciales.

La reivindicación 2 refiere un valor de disolución de “por lo menos 99% del compuesto I en 15 minutos”. No deberían caracterizar el compuesto solamente por sus parámetros, si es posible definirlo de otra manera. Se sugiere definirlo por sus características esenciales, estructurales o funcionales.

La reivindicaciones 3, 11 y 26 no son concisas cuando utilizan los géneros funcionales humectantes, aglomerantes, diluyentes y desintegrantes, porque abarca todos los excipientes que contengan las propiedades mencionadas, se sugiere restringir a los excipientes preferidos que se encuentran debidamente soportados en la descripción.

La reivindicación 4 tiene la misma materia de la reivindicación 3, por lo tanto, se sugiere retirarla de la solicitud.

La reivindicación 5 no es clara porque reclama la composición por el color que se obtiene del compuesto de fórmula 1 durante su proceso de elaboración, lo cual no corresponde a una característica técnica esencial. Se sugiere eliminarlas del capítulo reivindicatorio.

La reivindicación 12 tiene la misma materia de la reivindicación 11, por lo tanto, se sugiere retirarla de la solicitud.

El rango definido en la reivindicación 6 es muy amplio, se sugiere restringirlo a un rango más estrecho, teniendo en cuenta lo soportado en el capítulo descriptivo, lo mismo aplica para las reivindicaciones 17 y 19.

El uso de expresiones tales como: “aproximadamente”, “opcionalmente” “uno o más” utilizado comúnmente el capítulo reivindicatorio es impreciso, porque no permite definir adecuadamente la materia que se desea proteger, se sugiere restringir la reivindicación a un rango preciso o valor concreto.

El uso de la expresión “al menos un excipiente” es impreciso, porque no permite distinguir la invención del estado de la técnica ni definirla de manera apropiada. Se sugiere definir concretamente los excipientes utilizados.

## **7. 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: 12 de junio de 2006

Y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Item | Documento     | Título                                                                      | Fecha de Publicación* |
|------|---------------|-----------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| D1   | US20040147559 | 3,4-Di-substituted cyclobutene-1,2-diones as CXC-chemokine receptor ligands | Julio 29 de 2004      |
| D2   | US20030143271 | Drug Mixture with enhanced dissolution rate                                 | 31 de julio de 2003   |

D1

<http://www.google.com/patents?id=kxCWAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=US20040147559&hl=en&sa=X&ei=xu4OUPH6FKuUiQfU7oHYAw&sqi=2&pj=1&ved=0CDAQ6AEwAA>

Se describen nuevos compuestos de la fórmula (I) o sales farmacéuticamente aceptables o solvatos del mismo. También se describen el tratamiento de enfermedades mediadas por quimioquinas-utilizando compuestos de la fórmula (II), 2-hidroxi- N,N-dimetil-3-((2—((1(R)-5—metil-2-furanil)propil)amino)-3,4-dioxo-1-ciclobuten-1-il)amino)benzamida (página 50, columna 1, último compuesto).

D2

<http://www.google.com/patents?id=TnudAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=us+20030143271&hl=en&sa=X&ei=Oz2oT7KCHpKW8gTvkZ3IAw&ved=0CDUQ6AEwAA>

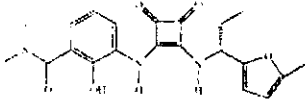
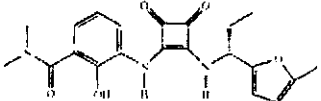
Divulga composiciones farmacéuticas que comprenden un componente ICOX poco soluble en una cantidad adecuada y por lo menos un excipiente farmacéuticamente aceptable; las cuales exhiben velocidades de disolución adecuadas

### Novedad (Art 16 D486)

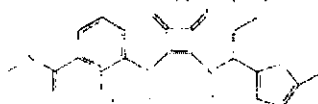
La reivindicación 1 consiste: "Una composición que comprende el compuesto I o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

| Características <b>esenciales</b> | D1                          |
|-----------------------------------|-----------------------------|
| Compuesto de fórmula I            | Un compuesto de fórmula (I) |

|                                                                                   |                                                                                                  |
|-----------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  |                |
| Al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable                                | Se menciona lactosa y estearato de magnesio, como componentes de las preparaciones farmacéuticas |

Las características técnicas esenciales de la reivindicación 1 fueron previamente divulgadas en D1 porque divulga el compuesto 2-hidroxi-N,N-dimetil-3-((2-((1(R)-5-metil-2-furanil)propil)amino)-3,4-dioxo-1-ciclobuten-1-il)amino) benzamida



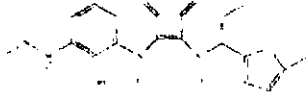
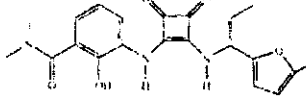
(página 50, columna 1, último compuesto); también se divulgan composiciones que incluyen excipientes farmacéuticamente aceptables (párrafo 496), una preparación farmacéutica oral que puede incluir estearato de magnesio, azúcar, lactosa talco, y otro vehículos farmacéuticamente aceptables los cuales pueden ser seleccionados de los descritos en Remington's Pharmaceutical Sciences (párrafo 514), los compuestos de fórmula (I) tienen actividad antagonista sobre los receptores CXCR2 y CXCR1 (reivindicación 104)

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

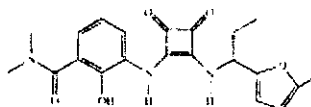
Las reivindicaciones dependientes 2-5, 9-10, 30-32 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

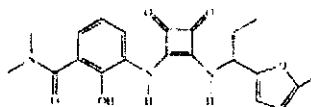
#### Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 6 consiste en una composición como la de la reivindicación 3, en donde uno o más agentes humectantes están presentes entre 0.1 y 8%

| Características esenciales                                                          | D1                                                                                  | D2                                                                                            |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------|
| Compuesto de fórmula I                                                              | Un compuesto de fórmula (I)                                                         | Divulga el uso de poloxameros y Lauril sulfato de sodio como humectantes de las formulaciones |
|  |  |                                                                                               |
| uno o más agentes humectantes están presentes entre 0.1 y 8                         | No se menciona esta característica                                                  |                                                                                               |

El documento D1 es considerado como el estado del arte más cercano a la



reivindicación 6, porque divulga el compuesto , una preparación farmacéutica oral que puede incluir estearato de magnesio, azúcar, lactosa talco, y otros vehículos farmacéuticamente aceptables los cuales pueden ser seleccionados de los descritos en Remington's Pharmaceutical Sciences (párrafo 514).

La diferencia entre D1 y la presente solicitud es que en la actual invención divulga el uso de agentes humectantes.

El efecto que logra el incluir el uso de los humectantes utilizados es que mejoran el perfil de disolución.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el formulaciones del compuesto I, conocido en D1, para obtener formas de dosificación sólidas que presentan mejores perfiles de disolución".

Sin embargo, la utilización de humectantes para aumentar la velocidad de disolución ya se había divulgado con anterioridad en D2, que se refiere a formas de dosificación oral que incluyen polaxámeros y lauril sulfato de sodio en sus componentes en cantidades en el rango de 0.25%-15% (párrafo 54), también revela el uso de povidona (párrafo 52), diluyentes como celulosa microcristalina o lactosa como diluyentes (párrafo 48), el uso de crospovidona (párrafo 49).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, se vería motivada a incluir los diluyentes conocidos en D2 en las formulaciones farmacéuticas de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 6 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

De la misma manera se encuentra que las reivindicaciones 7-29 no añaden características que hagan nueva o inventiva la actual solicitud. Por lo cual también se consideran obvias.

### Conclusión:

La reivindicación 6-29 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

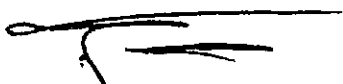
## 8. Conclusión

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

| Item | Documento     | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|---------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | US20040147559 | 1-5, 9-12, 30-32           | Novedad              |
|      |               | 5-8, 13-29                 | Nivel Inventivo      |
| D2   | US20030143271 | 1-35                       | 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 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.

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.



**JOSE LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

21 AGO. 2012

Elaborado por: Harvey Alonso Jaramillo   
Revisado Por: Jacqueline Alfonso