

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3527 de 15 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

Señor(a)
MERIAL, INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “COMPUESTOS ANTIPARASITARIOS DE ISOXAZOLINA, FORMULACIONES INYECTABLES DE ACCIÓN PROLONGADA QUE LOS COMPRENDEN, MÉTODOS Y USOS DE LOS MISMOS”

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2017/019239

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 24 de febrero de 2017.

PRIORIDAD: 25/08/2016, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/379,348
24/02/2016, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/299,333

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. 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, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 13 del radicado N° NC2018/0008829 del 15 de julio de 2020.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar composiciones veterinarias inyectables con acción prolongada que comprenda un derivado de isoxazolina.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona una composición que comprende un derivado de isoxazolina sustituido con naftaleno, PEG líquido, un solvente polar miscible en agua, un antioxidante y un aditivo o excipiente farmacéuticamente aceptable.

2. De la solicitud de patente

2.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

El solicitante ha hecho caso omiso de las observaciones presentadas por este Despacho por lo cual se mantienen las objeciones de falta de claridad y sustento en la descripción. El capítulo reivindicatorio no es claro, es muy amplio y ambiguo, se recuerda que una composición se caracteriza por sus componentes específicamente definidos y las proporciones de combinación de ellos, en este sentido una limitación negativa no es clara. Además, las expresiones “opcionalmente”, “al menos”, “aproximadamente”, “por lo menos”



Oficio N° 3527 de 15 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

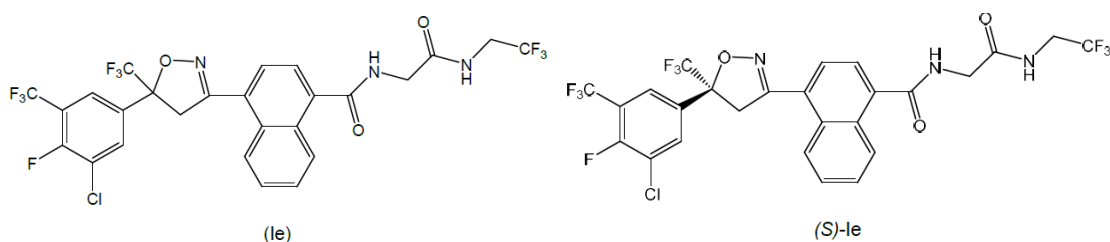
precediendo una característica no es limitativo, porque hacen opcional la característica y no limita el alcance de la reivindicación, sírvase retirar dichas expresiones y definir de forma específica la composición de interés.

Se reitera que las frases “es efectiva en contra de los parásitos durante...” y “los parásitos son pulgas o garrapatas” de las reivindicaciones 7 a 10 hacen referencia a un resultado a alcanzar por lo cual no son aceptables. Se aclara al solicitante que no es válido caracterizar una composición por su resultado puesto que la reclamación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese resultado, la plaga tratada tampoco caracteriza una composición. Sírvase retirar dichas reivindicaciones.

Asimismo, sírvase retirar las reivindicaciones 11 a 13 dado que no se encuentran sustentadas en la descripción. Nada en la descripción sustenta una composición que comprenda un ingrediente activo adicional. De igual forma no se encuentra sustento técnico en la descripción para una composición donde el compuesto de fórmula (Ic), tenga X1, X2 y X3 con significados iguales a halógeno, alquilo C1-C3 o haloalquilo C1-C3; o un compuesto de fórmula (S)-Ic; un antioxidante; opcionalmente un excipiente farmacéuticamente aceptable y que comprenda adicionalmente una lactona macrocíclica; y que sea efectiva contra parásitos durante 3 a 6 meses o 5 a 6 meses.

2.2. Descripción (Art. 28 Decisión 486 literal (c))

En el capítulo descriptivo no se divulgó la invención de manera suficientemente clara y completa para que la persona normalmente versada en la materia técnica correspondiente pueda ejecutarla o reproducirla. Particularmente porque no divulgó el desarrollo de una composición que comprenda un compuesto de fórmula (Ic), donde X1, X2 y X3 son halógeno, alquilo C1-C3 o haloalquilo C1-C3; PEG200 o PEG300; un antioxidante y opcionalmente un excipiente farmacéuticamente aceptable y que demuestre que dicha composición es efectiva en contra de los parásitos durante 3 a 6 meses o 5 a 6 meses. El capítulo descriptivo en las páginas 335 a 338 muestra que el objeto de la presente solicitud (proporcionar una composición inyectable de acción prolongada mejorada) se obtiene con una composición que comprende el compuesto de fórmula (Ie) o su enantiómero (S)-Ie;



8% de etanol y c.s.p de polietilenglicol 400, esta composición en particular tiene una eficacia contra *Rhipicephalus microplus* (garrapata) por 110 días para la formulación que comprende el compuesto de fórmula Ie y 88 días para la formulación que comprende el compuesto (S)-Ie, que equivale a aproximadamente 2.9 a 3.6 meses y no a 4, 5 o 6 meses como lo menciona el capítulo reivindicatorio.

3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 24 de febrero de 2016 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.



Oficio N° 3527 de 15 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US20110059988	“Isoxazoline compositions and their use as antiparasitics”	10 de marzo de 2011
D3	US20100254959	“Naphthalene isoxazoline invertebrate pest control agents”	7 de octubre de 2010

El documento D1¹ enseña un compuesto derivado de isoxazolina útil para controlar infestaciones parasitarias en animales y composiciones que lo comprenden (resumen; pág. 26, párr. [0255]; pág. 28, párr. [0228]; pág. 33, tab. 7; pág. 34, tab. 9 y pág. 40, comp. 5-39).

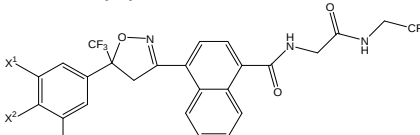
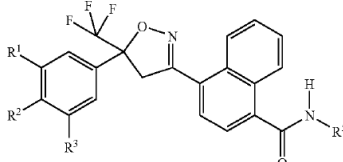
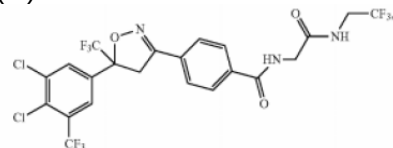
El documento D3² divulga derivados de isoxazolina sustituidos con naftaleno útiles para controlar plagas de invertebrados en animales y composiciones veterinarias de acción prolongada que lo comprenden (pág. 3, párr. [0039] y pág. 8, párr. [0236]).

4. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

4.1. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Una composición inyectable de acción prolongada...” (Radicado No NC2018/0008829 del 15 de junio de 2020).

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D3	D1
Una composición inyectable de acción prolongada que comprende:	Una composición inyectable que comprende: (pág. 74, párr. [0406])	Una composición inyectable de acción prolongada que comprende: (pág. 1, párr. [0002] y pág. 26, párr. [0226])
Un compuesto isoxazolina, caracterizado porque es de formula (Ic)  Donde X1, X2 y X3 son halógeno, alquilo C1-C3 o haloalquilo C1-C3;	Un compuesto de isoxazolina, de fórmula:  Donde R1, R2 y R3 son halógeno y haloalquilo y R5 es CH2C(O)NHCH2CF3 (pág. 23 y 24) [0158]	Un compuesto isoxazolina, caracterizado porque es de formula (Ie)  (pág. 40, comp. 5-39)
PEG líquido, seleccionado de PEG200, PEG300, PEG400, o una mezcla de los mismos;	Polietilenglicoles [0295]	Polietilenglicol ej. PEG 400 (pág. 26, párr. [0255])

D3 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga una composición de acción prolongada que comprende un derivado de isoxazolina sustituido con naftaleno-4-diglicin trifluorometilo en la posición

¹https://content2.cas.org/v1/AUTH_9a355bb5cefd4c378bde0d541c6a11ce/patentpak-cdr-full-text-123/patent/67248929_1537160410.pdf?temp_url_sig=ab37b09e22174e5e62e4304248198f48d19850da&temp_url_expires=1587421623&inline
²<https://patentimages.storage.googleapis.com/a4/8f/fd/1df9cc248d0d2d/US20100254959A1.pdf>

Oficio N° 3527 de 15 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

3 del anillo de isoxazolina y enantiómeros, donde estas composiciones se administran cada 6 meses, (pág. 3, párr. [0039] y pág. 8, párr. [0236]. Incluyen adyuvantes y solventes para su formulación (ver [0293], [0295], [0416]).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y la composición divulgada de D3 consiste en que se selecciona PEG líquido de PEG200, PEG300, PEG400.

No se observa un efecto asociado a la diferencia.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar la composición conocida en D3 con el fin de proporcionar una composición alternativa?

Sin embargo, el incluir PEG líquido, ya está divulgado en el documento 1 que se refiere a una composición inyectable de acción prolongada que comprende un derivado de isoxazolina, propilenglicol, dimetilsulfoxido (solvente polar miscible en agua) y un antioxidante, además del uso de PEG 400 (pág. 1, párr. [0002]; pág. 26, párrafos [0248], [0255] y [0226]; pág. 33, tab. 7), es importante señalar que es ampliamente conocido en el estado de la técnica el uso de PEG 400 en composiciones líquidas inyectables veterinarias³ (todo el documento).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir en una composición inyectable de acción prolongada los excipientes del documento D1 en la composición de D3, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 13 tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

5. Conclusión con respecto a nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US20110059988	1 a 13	Nivel inventivo
D3	US20100254959	1 a 13	Nivel inventivo

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

Argumentos respecto a D1

El solicitante argumenta que D1 no afecta la patentabilidad de la presente solicitud porque no enseña o sugiere una composición que comprenda un compuesto derivado de isoxazolina sustituido con naftalen-4-diglicinatrifluorometilo y PEG líquido, D1 revela composiciones que comprenden un derivado de isoxazolina sustituida con fenil-diglicina y una lista de solventes, agentes solubilizantes, agentes protectores, entre otros. Adicionalmente, no enseña el efecto técnico de la presente solicitud de proporcionar composiciones que tengan una efectividad contra las garrapatas *Rhipicephalus microplus* por 110 días.

³https://www.researchgate.net/publication/8744058_A_Study_of_the_Polyethylene_Glycols_as_Vehicles_for_Intramuscular_and_Subcutaneous_Injection



Oficio N° **3527** de **15 de marzo de 2021**

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

Se aclara al solicitante que D1 difiere de la presente solicitud en que divulga una composición con un compuesto de isoxazolina sustituido con fenildiglicina, por esta razón D1 no afecta la novedad de la presente solicitud, sin embargo, divulga una composición inyectable parasitocida de acción prolongada que comprende un derivado de isoxazolina, un cosolvente miscible en agua (dimetilsulfoxido), un antioxidante y excipientes farmacéuticamente aceptables, también sugiere el uso de PEG 400, que es un excipiente ampliamente conocido en este tipo de composiciones⁴, tal cual, como lo revela el capítulo reivindicatorio de la solicitud que menciona que la composición comprende un derivado de isoxazolina, PEG líquido, solvente miscible en agua, un antioxidante y opcionalmente excipientes farmacéuticamente aceptables. Respecto al argumento de que no enseña el efecto técnico de la presente solicitud, esta oficina aclara que como se observa en el capítulo descriptivo de la solicitud, no es el PEG400 el eventual responsable de un efecto técnico, puesto que lo que se compara en los ejemplos son composiciones con diferentes principios activos derivados de isoxazolina pero con los mismos excipientes de formulación, por lo cual se concluye que es el compuesto de fórmula Ic y su enantiómero el responsable de resultados diferenciales. Se le recomienda al solicitante que limite la materia reclamada a aquella que se encuentra sustentada en la descripción.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica el capítulo reivindicatorio, deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

⁴https://www.researchgate.net/publication/8744058_A_Study_of_the_Polyethylene_Glycols_as_Vehicles_for_Intramuscular_and_Subcutaneous_Injection



Oficio N° 3527 de 15 de marzo de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0008829		1°		2°		3°	x	Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2017/019239		24/11/2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
24/02/2016				x					
Solicitante									
MERIAL, INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 13
Palabras clave utilizadas	“polyethylene glycol” OR “PEG 400” AND “etanol” AND Isoxazoline “injection antiparasitics” AND “peg 400” AND alcohol AND isoxazoline
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A01N 43/80, C07D 261/04, A01P 7/04, A01P 7/02, A01P 3/00, A61K 9/00, A61K 47/00, A61K 31/422
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
STN	US20110059988	10/03/2011	1 a 13	Resumen; pág. 26, párr. [0255]; pág. 28, párr. [0228]; pág. 33, tab. 7; pág. 34, tab. 9 y pág. 40, comp. 5-39	Y
Googlepatent	US20100254959	7/10/2010	1 a 13	Pág. 3, párr. [0039] y pág. 8, párr. [0236].	Y
Googlepatent	EP2193124	19/12/2012	-	-	A
Patbase	WO2005074912	22/12/2011	-	-	A
Espacenet	WO2013039948	21/03/2013	-	-	A
Espacenet	WO2014039475	13/03/2014	-	-	A

(2) Categorías de documentos citados	
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre, por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O, X, O, Y o bien O, A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional, pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.

Oficio N° **3527** de **15 de marzo de 2021**

Ref. Expediente N° NC2018/0008829

Fecha del reporte de búsqueda: (27/11/2020)
Examinador: NINI JOHANA SCARPETA ROMERO

