

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

---

REF: NC2022/0008616

TÍTULO SOLICITADO: “COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA ORAL QUE  
COMPRENDE COMPUESTO DE CARBAMATO Y  
MÉTODO DE PREPARACIÓN PARA LA MISMA”

PUBLICACIÓN: Gaceta 970 2022-08-09

PRIORIDAD: KR 10-2019-0151556 22/11/2019

SOLICITANTE: SK BIOPHARMACEUTICALS CO., LTD.

APODERADO: JOSE ANDRES RINCON USCATEGUI

TRÁMITE: REMISIÓN DE INFORMACIÓN

**JUAN PABLO REYES VILLAMIZAR**, mayor de edad, identificado como aparece al pie de mi firma, abogado en ejercicio, titular de la tarjeta profesional número No. 92.189 del Consejo Superior de la Judicatura, obrando en calidad de apoderado de la sociedad **LABORATORIOS LEGRAND S.A.**, en ejercicio de lo dispuesto por el artículo 42 de la Decisión 486 de 2000, muy respetuosamente me permito formular la siguiente

I. **PETICIÓN**

Sírvase negar el beneficio patentario a la solicitud contenida en el expediente NC2022/0008616, por no cumplir con lo dispuesto en la Decisión 486 de 2000, con base en los fundamentos que se expondrán a continuación.

## **II. FUNDAMENTOS DE LA OPOSICIÓN**

La solicitud colombiana en trámite NC2022/0008616, que se refiere a *una composición farmacéutica oral que comprende un compuesto de carbamato de la fórmula química 1, un isómero del mismo, o una sal, solvato, o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo como un ingrediente activo y un método de preparación para la misma*” no cumple los requisitos materiales para otorgársele el privilegio de patente de invención, tal como puede determinarse al valorar los siguientes argumentos:

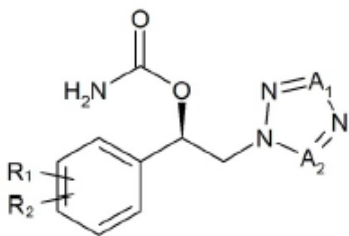
### **2.1. Las reivindicaciones 1 a 9 presentan una composición farmacéutica que se caracteriza por un ingrediente activo de fórmula I**

La reivindicación 1 se refiere a una composición farmacéutica que tiene partícula de carbamato de al menos 300  $\mu\text{m}$ :

*"1. Una composición farmacéutica para administración oral, caracterizada porque comprende partículas de un compuesto de carbamato de la siguiente Fórmula 1, un isómero del mismo, o una sal, solvato o hidrato farmacéuticamente aceptable del mismo como un ingrediente activo; y un portador farmacéuticamente aceptable;*

*en donde un diámetro de partícula  $d(0.9)$  de las partículas de ingrediente activo es menos de 300  $\mu\text{m}$ :*

[Fórmula 1]



*en donde, R1 y R2 son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, perfluoroalquilo de C1-C8, alquilo de C1-C8, tioalcoxi de C1-C8 y alcoxi de C1- C8; y uno de A1 y A2 es CH, y el otro es N."La composición farmacéutica pretendida se caracteriza mediante el compuesto de fórmula I, el cual representa varias posibles combinaciones de radicales, y por lo tanto, varios compuestos químicos.*

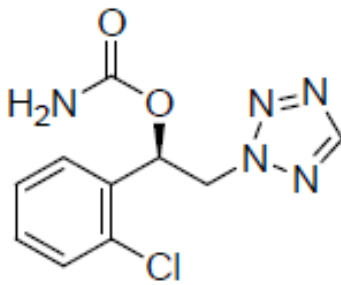
Las reivindicaciones 2, 3, 4 continúan definiendo las características preferidas del compuesto, tales como tamaño de partícula preferido y su cantidad en la composición.

Y las reivindicaciones 5 a 9 presentan un grupo bastante amplio de excipientes que conforman la composición:

*"5. La composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizada porque el portador farmacéuticamente aceptable es uno o más seleccionado del grupo que consiste de un diluyente, un desintegrante y un lubricante."*

No obstante, la descripción únicamente presenta ejemplos para la composición cuando el compuesto carbamato corresponde a la fórmula 2:

[Fórmula 2]



y, cuando el diluyente es celulosa microcristalina y lactosa hidratada; el desintegrante, almidón glicolato Na; el lubricante, dióxido de silicio coloidal y estearato Mg; y el surfactante, lauril sulfato Na.

Según el Manual Andino de Patentes: *“El requisito de concisión del Artículo 30 de la Decisión 486 se aplica tanto a cada reivindicación individual como al conjunto de reivindicaciones. La finalidad de este requisito es evitar una excesiva complejidad para el examinador a la hora de analizar las reivindicaciones y evitar que terceros no puedan ver claramente cuál es el alcance de las reivindicaciones por el excesivo número y complejidad de estas.”* (MAP, 2022, p. 62):

Se observa que la materia pretendida se relaciona con una composición farmacéutica en la cual se combinan excipientes y tres agentes activos (API) en proporciones determinadas que son presentadas repetidamente en muchas reivindicaciones.

De acuerdo a lo anterior, las reivindicaciones 1 a 9 carece de concisión pues su alcance cubre un excesivo número de composiciones

## **2.2. Las reivindicaciones 13 a 20 carecen de claridad**

Las reivindicaciones 13 a 20 se refieren a un método para preparar una composición mezclando un compuesto de fórmula I con D90 de < 300um, en una cantidad de 5 a 400 mg, que además posee excipientes como desintegrantes:

*"17. El método para preparar una composición farmacéutica para administración oral de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 13 a 16, caracterizado porque el portador farmacéuticamente aceptable es uno o más seleccionados del grupo que consiste de un diluyente, un desintegrante y un lubricante."*

Se observa que ésta reivindicación se refiere a un método que se define mediante las características estructurales de la composición de las reivindicaciones precedentes.

El Manual Andino de Patentes: *"Las reivindicaciones deben definir de manera clara el objeto para el que se solicita la protección porque de acuerdo con la claridad de las reivindicaciones será posible determinar si la invención es nueva, inventiva y susceptible de aplicación industrial."* (p. 55, 56, MAP, 2022)

Entonces, las reivindicaciones citadas no son claras ni concisas puesto que no revelan las operaciones que conducen a la persona versada en la materia a la obtención de la composición farmacéutica, y a que tampoco presentan materia adicional que permita comprender mejor el alcance de la solicitud.

### **2.3. Informe Claridad**

Los requisitos del Artículo 30 de la Decisión 486 no son cumplidos por las reivindicaciones 1 a 9 puesto que no definen claramente la composición que se desea proteger.

Además, en las reivindicaciones citadas se define la composición mediante un resultado a obtener como lo es el tamaño de partícula, el cual no debe admitirse

puesto que es posible definir la composición mediante otras características estructurales de la composición, como se observa en la tabla 1 de la solicitud.

Del mismo modo, las reivindicaciones 13 a 20 no definen el método de obtención de la composición pretendida, por lo cual deben ser rechazadas.

## **2.4. La solicitud no cumple con los requisitos de patentabilidad**

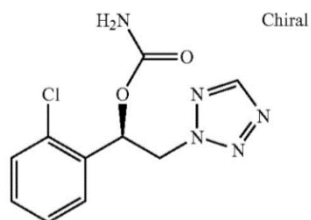
### **2.4.1. El compuesto de la solicitud en estudio carece de nivel inventivo a la luz de las enseñanzas de las anterioridades**

El documento de patente US20060258718 titulado "NEUROTHERAPEUTIC AZOLE COMPOUNDS", se refiere a compuestos del grupo carbamoil que son útiles como anticonvulsivos y específicamente presenta el éster (R)-1-(2-chlorofenil)-2-tetrazol-2-il-etílico de ácido carbámico (tabla, p. 42), veamos:

*"AZole compounds containing carbamoyl group and pharma ceutically useful salts thereof are described. The compounds are effective anticonvulsants which are used in the treatment of disorders of the central nervous system, especially as anxiety, depression, convulsion, epilepsy, migraine, bipolar disorder, drug abuse, Smoking, ADHD, obesity, sleep disorder, neuropathic pain, stroke, cognitive impairment, neuro degeneration, stroke and muscle spasm."*

(US20060258718- abstract)

20



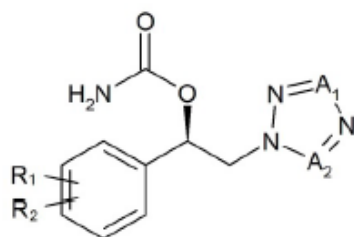
Carbamic acid (R)-1-(2-chloro-phenyl)-2-tetrazol-2-yl-ethyl ester

Así mismo, el documento US20060258718 enseña la preparación de una forma de administración oral para el carbamato que tomar la forma de tabletas o cápsulas:

*"... The compounds of formula (IX) can be formulated, using conventional inert pharmaceutical adjuvant materials, into dosage forms that are suitable for oral or parenteral administration. Such dosage forms include tablets, suspensions, solutions, and the like. Furthermore, the compounds of the invention can be administered in the form of hard or soft capsules. Examples of suitable inert adjuvant materials that can be used in formulating the compounds of formula (IX) into oral and parenteral dosage forms will be immediately apparent to persons skilled in the art. These adjuvant materials include, for example, water, gelatin, lactose, starch, magnesium stearate, talc, vegetable oils, gums polyalkylene glycols, and the like. Moreover, preservatives, stabilizers, wetting agents, emulsifying agents, salts for altering osmotic pressure, buffers, and the like, can be incorporated, if desired, into such formulations."*

Como ya se presentó anteriormente, la Fórmula Markush de la reivindicación principal posee una amplitud que excede lo justificado en el capítulo descriptivo:

[Fórmula 1]



en donde,

*R1 y R2 son cada uno independientemente seleccionados del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, perfluoroalquilo*

de C1-C8, alquilo de C1-C8, tioalcoxi de C1-C8 y alcoxi de C1-

C8; y

uno de A1 y A2 es CH, y el otro es N.

Según el Manual Andino de Patentes: *"Es necesario que todos los compuestos posibles de la fórmula Markush presenten nivel inventivo basado en el mismo efecto técnico.*

*Por ejemplo, la selección de un subgrupo de compuestos en una fórmula Markush que cumplen el requisito de novedad, tiene nivel inventivo si todos los compuestos en el subgrupo presentan un efecto o propiedad técnica no descrita en el arte anterior y que además es inesperada." (p. 197, MAP, 2022)*

Teniendo en cuenta lo presentado anteriormente, la reivindicación 1 posee un alcance injustificado, en donde la totalidad de compuestos amparados bajo la Fórmula Markush 1 no demuestra tener la misma actividad biológica que el compuesto de Fórmula 2.

Dado que el documento US20060258718 enseña compuestos azoles con efectos anticonvulsivantes, tales como el compuesto de fórmula 2 de acuerdo a la presente solicitud, y sus composiciones sólidas, se concluye que el documento US20060258718 afecta la novedad y el nivel inventivo de la presente solicitud.

Por todo lo anterior, rogamos se analicen los argumentos expuestos con el rigor y detenimiento habituales y que en consecuencia se decrete, además de la negación de la solicitud en comento, el archivo del expediente que la contiene.

### **III. PRUEBAS**

Ruego que se tenga como tal, y de aquellas que el Despacho considere oficiosamente, las siguientes:

- La publicación de patente US20060258718 titulada “Neurotherapeutic azole compounds”; inventor (es) Choi Yong Moon; Kim Choon-Gil; Yi Han-Ju; Kang Young-Sun; Lee Hyun-Seok; de la(s) compañía(s) SK Holdings Co., Ltd.; publicado 16 de noviembre de 2006

Tomado de

<https://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docPN=US20060258718>

- MANUAL ANDINO PARA EL EXAMEN DE PATENES; primera edición, 12 de agosto de 2022; autor(es) Pimentel Juan R.; Vázquez Karla F.; publicado agosto de 2022; todo

Tomado de:

[https://www.google.com/url?sa=t&rct=j&q=&esrc=s&source=web&cd=&cad=rja&uact=8&ved=2ahUKEwj1wTr\\_Zr\\_AhVksDABHZibAmEQFnoECBIQAQ&url=https%3A%2F%2Fwww.comunidadandina.org%2Fwp-content%2Fuploads%2F2022%2F08%2FManual\\_ANDINO\\_CAN\\_2022\\_fv\\_por\\_paginas.pdf&usg=AOvVaw0tIZH26z6OTrfoIxo\\_j3Zv](https://www.google.com/url?sa=t&rct=j&q=&esrc=s&source=web&cd=&cad=rja&uact=8&ved=2ahUKEwj1wTr_Zr_AhVksDABHZibAmEQFnoECBIQAQ&url=https%3A%2F%2Fwww.comunidadandina.org%2Fwp-content%2Fuploads%2F2022%2F08%2FManual_ANDINO_CAN_2022_fv_por_paginas.pdf&usg=AOvVaw0tIZH26z6OTrfoIxo_j3Zv)

#### **IV. NOTIFICACIONES**

El suscrito recibirá notificaciones en la secretaría de su Despacho o en mi oficina localizada en la Carrera 17 No. 88-23, oficina 205, fax (1) 621 25 42

Señor Superintendente,



**JUAN PABLO REYES VILLAMIZAR**

C.C. 80.419.709

T.P.A. 92.189 de C.S.J