

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 06 de enero de 2010, con el N° 10-000935-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Janssen Pharmaceutica N.V., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "NUEVOS CRISTALES Y PROCESOS PARA ELABORAR 5-({[2-AMINO-3-(4-CARBAMOIL-2,6-DIMETILFENIL)-PROPIONIL]-[1-(4-FENIL-1H-IMIDAZOL-2-IL)-ETIL]-AMINO}-METIL)-2-ACIDO METOXIBENZOICO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2008/069318 del 07 de junio de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 626 del 22 de marzo de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 16546, notificado por fijación en lista el 18 de septiembre de 2012, se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 10-000935-00008-0000 del 28 de enero de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 21 que remplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."*

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 21, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar un proceso para elaborar el zwitterion de 5-({[2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico con mejores procesos de fabricación y dos

Página 1 de 9

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

nuevos cristales con mejores propiedades. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un método para preparar el zwitterion de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico, el zwitterion cristalino y los cristales α y β del compuesto.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 09 de junio de 2007, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US2005203143	"Novel compounds as opioid receptor modulators"	15/Septiembre/2005
D2	US2006211863	"Process for the preparation of opioid modulators "	21/Septiembre/2006
D3	Libro	"Farmacia Remington"	1995

El documento D1 ¹ divulga (pág. 39, párr. [0268]) el compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico y un proceso para preparar una sal ácida del mismo.

El documento D2 ² divulga (pág. 33, párr. [0313]) el compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico y un proceso para preparar una sal ácida del mismo.

El documento D3 ³ enseña el estudio del polimorfismo como una tarea rutinaria dentro del campo farmacéutico en la preformulación de preparados farmacéuticos y que la variedad de formas cristalinas de un compuesto permiten variar propiedades como la solubilidad, estabilidad, velocidad de disolución entre otras.

1URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2005203143&KC=&FT=E&locale=en_EP.

2URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&il=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20060921&CC=US&NR=2006211863A1&KC=A1

3A.R. Genaro; "Remington Farmacia"; 19a Edición; Ed. Panamericana; 1995; págs. 1912-1920. Trasladado en el exámen de fondo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

6.3. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: *"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"*.

En el presente caso, el cristal reclamado en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Un método para preparar el zwitterion de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico; el método comprende los pasos de: combinar un ácido ionizable fuerte, que se selecciona de ácido clorhídrico, ácido trifluoroacético, ácido sulfúrico, ácido fórmico y ácido fosfórico, con 5-(((2-tert-butoxicarbonilamino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-ácido metoxibenzóico para preparar una sal de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico; y lavar la sal de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico con una base inorgánica, que se selecciona de hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, acetato de sodio y/o fosfato de sodio, para obtener el zwitterion de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico"* (Ver pág. 5 del radicado N° 10-000935-00008 -0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
método para preparar el zwitterion de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico que comprende:	método para preparar el zwitterion de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico que comprende (pág. 39, párr. [0268])	método para preparar el zwitterion de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico que comprende (pág. 33, párr. [0313])
combinar un ácido ionizable fuerte, que se selecciona de ácido clorhídrico, ácido trifluoroacético, ácido sulfúrico, ácido fórmico y ácido fosfórico, con 5-(((2-tert-butoxicarbonilamino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-ácido metoxibenzóico para preparar la sal.	combinar un ácido ionizable fuerte con 5-(((2-tert-butoxicarbonilamino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-ácido metoxibenzóico para preparar la sal.	combinar un ácido ionizable fuerte con 5-(((2-tert-butoxicarbonilamino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-ácido metoxibenzóico para preparar la sal.
lavar la sal de 5-(((2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil)-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico con una base inorgánica, que se selecciona de	No se menciona	No se menciona

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, acetato de sodio y/o fosfato de sodio, para obtener el zwitterion		
---	--	--

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan un método para preparar la sal de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic, que comprende combinar un ácido ionizable fuerte con 5-([2-tert-butoxycarbonylamino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic para obtener la sal del mismo.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el procedimiento de D1 y de D2 consiste en que la sal se lava para obtener el zwitterion de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic.

El efecto que logra el incluir este paso adicional es que proporciona el zwitterion de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic.

Por lo tanto, el problema técnico que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de un proceso para obtener el zwitterion de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic, alternativo al ya revelado en el estado del arte.

Sin embargo, es una práctica común en el sector farmacéutico la formación del zwitterion, que se puede lograr ajustando el pH al punto isoeléctrico, es decir el pH en el cual la carga neta de la molécula es cero y que la persona del oficio normalmente versada en la materia sabe a partir de sus conocimientos básico y de la bibliografía básica ⁴, ⁵. Para este caso específico, como se tiene la sal ácida, para alcanzar el pH isoeléctrico es necesaria la adición de una base.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia se vería suficientemente motivada para agregar una base, de acuerdo a sus conocimientos comunes, a la sal ácida de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl-2-acid methoxybenzoic del proceso de D1 o D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 5 y las reivindicación 6 y no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

4 **Stahl P. et al**; "Handbook of Pharmaceutical salts"; Wiley-VCH; 2002; pág. 16-17.

5 **Shayne C.**; "Pharmaceutical Manufacturing Handbook"; Wiley-Interscience; 2001; pág. 952-954.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

La reivindicación 8 consiste en el zwitterion cristalino de forma α de 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico, caracterizado además porque el cristal tiene un patrón de difracción de rayos X de polvo que tiene picos de difracción de rayos X de polvo a aproximadamente 14,0, 14,3 y 14,7 grados 2-teta.

La reivindicación 15 consiste en el zwitterion cristalino de forma β de 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico, caracterizado además porque el cristal tiene un patrón de difracción de rayos X de polvo que tiene picos de difracción de rayos X de polvo a 11,0, 12,4 y 15,2 grados 2-teta.

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 8 y 15, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2	D3
Cristal α de 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico. Cristal β de 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico.	Compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico.	Compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico.	Enseña que el fenómeno de polimorfismo (formas cristalinas) es la capacidad de cualquier elemento o compuesto para cristalizar en más de un sistema cristalino y es un trabajo habitual en el campo de preformulación farmacéutico.
Forma α : patrón de difracción de rayos X en polvo presenta picos en: 14,0, 14,3 y 14,7, entre otros. Forma β : patrón de difracción de rayos X en polvo presenta picos en: 11,0, 12,4 y 15,2, entre otros.	No se menciona	No se menciona	Enseña que la caracterización de formas cristalinas para un mismo compuesto por medio del patrón de difracción de rayos X es un método convencional.

Aproximación método problema-solución para polimorfos (formas cristalinas)

1. Determinación del estado de la técnica más cercano:

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones 8 y 15 porque divulgan el compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico. (D1:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

pág. 39, párr. [0268]; D2: pág. 33, párr. [0313]).

2. Determinación de las diferencias técnicas de la invención con respecto al estado del estado de la técnica más cercano:

La diferencia entre la invención definida en las reivindicaciones 8 y 15 y el compuesto del documento D1 y D2, consiste en que revela de manera específica las formas polimórficas α y β caracterizada por sus difractogramas de rayos X.

3. Determinación del efecto técnico obtenido por las diferencias técnicas de la invención con respecto al estado de la técnica más cercano:

Según la descripción de la solicitud, el efecto técnico que logra la diferencia es proporcionar diferentes formas cristalinas de 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico, con propiedades mejoradas.

4. Establecimiento del problema técnico objetivo a solucionar con base en el estado de la técnica más cercano:

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de obtener formas cristalinas del compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico con propiedades mejoradas.

5. Comprobación de la solución al problema técnico objetivo de la solicitud:

En ninguna parte de la descripción se encuentra soporte de las propiedades mejoradas al obtener la forma cristalina alfa o beta del compuesto o el zwitterion del compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico. Por lo anterior, la solicitud no permite comprobar la solución al problema técnico objetivo planteado en la solicitud porque no se realiza una comparación técnica de las propiedades del compuesto de la invención y del estado de la técnica más cercano que pueda ser reproducido por la persona del oficio versada en la materia que muestre un efecto técnico superior o una ventaja respecto al compuesto del estado del arte.

Por lo tanto se puede concluir que no existe un efecto técnico probado, porque no se demuestra propiedades mejoradas de las nuevas formas cristalinas del compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoil-2,6-dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino)-metil)-2-acido metoxibenzóico reclamadas en la actual solicitud, con respecto a la forma sólida del mismo compuesto divulgada en D1 y D2.

6. Evaluar si habría sido obvio solucionar el problema técnico objetivo por la invención

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

reivindicada:

De tal manera que la solución al problema técnico planteado por la invención reclamada se considera obvia porque la anterioridad D3, ya divulga que las diferentes formas cristalinas para un mismo compuesto difieren en sus propiedades fisicoquímicas tales como la solubilidad, estabilidad, velocidad de disolución, higroscopicidad, biodisponibilidad entre otras, y es además una práctica habitual en estudios de preformulación dentro de los cuales se incluyen rigurosos trabajos para determinar su presencia en los medicamentos con el fin de evitar su inestabilidad o falta de efectividad (pág. 4). Dentro de estos estudios, se investiga habitualmente (i) la cantidad de polimorfos que existen, (ii) el grado relativo de estabilidad de los diversos polimorfos, (iii) las gamas de estabilidad térmica de cada polimorfo, (iv) solubilidades, (v) método de preparación de cada forma, (vi) efecto de la micronización o tableteo e interacción con los componentes de la formulación (pág. 1913 ambas columnas), y una vez establecido que el compuesto (en este caso aplicable al compuesto 25-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acido metoxybenzoico) presenta polimorfismo, existen procedimientos con los cuales el preformulador puede preparar las diversas formas en cantidades más grandes para su evaluación adicional y adecuarlas para incorporar en las formas posológicas (D3:pág. 1915, col izquierda).

También es conocido en el campo técnico que los polimorfos son diferentes arreglos estructurales dentro de un cristal de una misma molécula o sustancia, por lo tanto una persona del oficio normalmente versada en la materia, conociendo que en D1 y en D2 ya se divulga una forma sólida de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acido metoxybenzoico, y que en D3 se conoce que el fenómeno de polimorfismo se da ampliamente en los medicamentos de uso farmacéutico, esta persona se encontraría motivada a utilizar métodos como los revelados en D3 para identificar las formas polimórficas de la molécula en cuestión, que además pueden ser analizadas por métodos de cristalografía conocidos (D3:pág. 1915-1916). De tal manera, no es posible concluir que la identificación de las formas cristalinas α y β reclamadas en la actual solicitud envuelva actividad inventiva, como quiera que la molécula misma ya era conocida con anterioridad; es decir, la identificación de las formas cristalinas reclamadas y caracterizadas mediante la técnica DRX, no representa un avance técnico real y tampoco un salto cualitativo a la regla técnica porque el efecto asociado no fue demostrado en la descripción de la solicitud, comoquiera que no se encontró alguna prueba o ensayo que permitiera determinar las ventajas reales de las formas cristalinas α y β de 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acido metoxybenzoico con respecto a la forma sólida del mismo compuesto conocido con anterioridad en D1 y en D2, que permita probar un efecto realmente inesperado asociado con las propiedades del compuesto.

En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia, encontraría la sugerencia o motivación suficiente aplicando los métodos y conocimientos que se tiene sobre el polimorfismo revelados en D3, al compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acido metoxybenzoico divulgado en D1 y D2, con el fin de determinar la existencia de la forma cristalina alfa y beta del 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

dimetilfenil)-propionil]-[1-(4-fenil-1H-imidazol-2-il)-etil]-amino}-metil)-2-acido metoxibenzóico, tales como las reivindicadas.

De acuerdo con lo expuesto, las reivindicaciones 8 y 15 y sus dependientes 9 – 14 y 16 – 21 no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La solicitante argumenta en su oficio bajo el radicado No 10-000935-00008-0000, que el nivel inventivo de la presente invención está sustentado en que a partir del arte previo la persona del oficio normalmente versada en la materia no habría llegado de manera obvia a encontrar el zwitterion del compuesto en cuestión dado que a partir de las enseñanzas de D1 y D2 no se sugiere la formación de este. Adicionalmente, señala la solicitante que en el arte previo no se señala en donde se encuentra el punto isoelectrico y que además el zwitterion reclamado sí forma cristales, lo cual no es común para este tipo de compuestos. Por último señala la solicitante que la altura inventiva está dada por el desarrollo de un proceso que permite obtener un zwitterion de un compuesto, donde dicho zwitterion tiene la capacidad de formar cristales.

Frente a estos argumentos esta Superintendencia se permite precisar a la solicitante que una invención de este tipo no puede encontrar nivel inventivo en simples modificaciones y condiciones que se deben tener en cuenta para la obtención de un zwitterion de una forma cristalina de un principio activo ya conocido, pues para cualquier persona del oficio normalmente versada en la materia una forma de obtener formas zwitteriónicas de compuestos, consiste en el empleo de técnicas tales como por ejemplo reacciones ácido – base que permiten equilibrar la cantidades de iones en determinado punto, para determinado compuesto, teniendo en cuenta factores como su polaridad, su carga eléctrica y el medio que la contiene, entre otros parámetros,⁶ lo cual no constituye nivel inventivo alguno sino que por el contrario tales métodos son tan comunes en el campo químico-farmacéutico que prácticamente constituyen los métodos de obtención más deseados por conveniencia.⁷

Ahora bien, en este punto es necesario resaltar lo que se mencionó en el método problema-solución, en cuanto a que a partir de lo divulgado en el capítulo descriptivo, en ninguna parte de la descripción se encuentra soporte de las propiedades mejoradas al obtener la forma cristalina alfa o beta del compuesto o el zwitterion del compuesto 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acid methoxybenzoic. Es más, no se evidencian otras propiedades fisicoquímicas ventajosas tales como, por ejemplo, velocidad de disolución (relacionada con la biodisponibilidad), estabilidad térmica y mecánica, higroscopicidad, entre otras, que indiquen que la forma cristalina 1 pueda tener un efecto técnico superior respecto del 5-([2-amino-3-(4-carbamoyl-2,6-dimethylphenyl)-propionyl]-[1-(4-phenyl-1H-imidazol-2-yl)-ethyl]-amino)-methyl)-2-acid methoxybenzoic, ya conocido en el estado de la técnica cercano y por lo tanto no existe evidencia suficiente para reconocer el nivel inventivo de la solicitud.

6. Mersmann, A. "Crystallization technology handbook"; second edition; Marcel Dekker, Inc.; 2001; pgs. 13, 516, 544-550

7. Govindhan D. et al, "Springer Handbook of Crystal Growth" Springer-Verlag Berlin Heidelberg 2010; pgs. 75-76, 566.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43955

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-935

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "NUEVOS CRISTALES Y PROCESOS PARA ELABORAR 5-([2-AMINO-3-(4-CARBAMOIL-2,6-DIMETILFENIL)-PROPIONIL]-[1-(4-FENIL-1H-IMIDAZOL-2-IL)-ETIL]-AMINO}-METIL)-2-ACIDO METOXIBENZOICO".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Janssen Pharmaceutica N.V., entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella(s) procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 30 Jul 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN
notificaciones@clarkemodet.com.co

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez ✓
Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓