

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43792

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-67826

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 04 de junio de 2010, con el N° 10-067826-00000-0000, por la(s) sociedad(es) RIGEL PHARMACEUTICALS, INC, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "GRANULACIÓN EN HÚMEDO QUE UTILIZA UN AGENTE SECUESTRANTE DE AGUA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2008/082618 del 06 de noviembre de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 628 del 20 de mayo de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 19158, notificado por fijación en lista el 23 de octubre 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° 10-067826-00006-0000 del 09 de enero de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 20 que remplace(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. Que de acuerdo con la modificación presentada por la solicitante, el título de la invención quedará de la siguiente manera: "FORMULACIONES GRANULADAS EN HÚMEDO QUE COMPRENDEN AGUA, SAL DE 6-(5-FLÚOR-2-(3,4,5-TRIMTOXIFENILAMINO)PIRIMIDIN-4-ILAMINO)-2,2-DIMETIL-3-OXO-2H-PIRIDO[3,2-B][1,4]OXAZIN-4(3H)-IL)METIL FOSFATO Y UN AGENTE SECUESTRANTE DE AGUA, Y MÉTODO PARA HACER DICHAS FORMULACIONES"

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 20, 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 una formulación de sal

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43792

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-67826

disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato que inhiben la degradación de este durante almacenamiento prolongado bajo condiciones ambientales. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una formulación granulada en húmedo caracterizada porque comprende agua, sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y un agente secuestrante de agua que inhibe la descomposición de la sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 07 de noviembre 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	WO2006/078846	"Prodrugs of 2,4-pyrimidinediamine compounds and their uses"	27/Julio/2006

El documento D1 ¹ divulga (pg. 68 pár. 0190 - pg. 69, pár. 0191) una tableta que comprende la sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato, sílica y trazas de agua.

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, los compuestos de fórmula I reclamados en la presente solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"una formulación granulada en húmedo caracterizada porque comprende agua, sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y un agente secuestrante de agua que inhibe la descomposición de la sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato"* (Ver pág. 7 del radicado N° 10-067826-00006-0000).

1URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2006032631&KC=&FT=E&locale=en_EP.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43792
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-67826

La reivindicación 7 consiste en “Una tableta formada a partir de un proceso de granulación en húmedo, la tableta caracterizada porque comprende agua, sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y un agente secuestrante de agua que inhibe la descomposición de la sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato” (Ver pág. 8 del radicado N° 10-067826-00006-0000).

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 que representa (n) el estado de la técnica:

Características esenciales	D1
Formulación granulada en húmedo	No menciona
Tableta caracterizada porque comprende:	Tableta caracterizada porque comprende (pg. 68, pár. 0190):
agua	agua
sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y	una cantidad eficaz de sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y
un agente secuestrante de agua	Sílica (pg. 69, pár. 0191)

Como se dijo anteriormente el documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones 1 y 7 porque divulga una tableta que comprende la sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato, sílica y trazas de agua (pg. 68 pár. 0190 - pg. 69, pár. 0191).

La diferencia entre la invención, definida en las reivindicaciones 1 y 7 y la composición farmacéutica en tableta de D1 consiste en que específicamente no menciona el método de preparación de la formulación, el cual consiste en una granulación húmeda.

Esta diferencia no concede un efecto técnico inesperado o una ventaja a las composiciones reclamadas en esta solicitud, ya que no presentan propiedades superiores en comparación con los compuestos del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “¿Cómo modificar las composiciones divulgadas en D1 para obtener formulaciones granuladas en húmedo, que comprenden sal disódica de (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato y un agente secuestrante de agua, alternativas a las ya conocidas en el estado del arte?

Sin embargo, D1 también divulga diferentes soluciones a este problema técnico, como lo son

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43792

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-67826

composiciones farmacéuticas que comprenden el principio activo (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato (pg. 68 pár. 0190 - pg. 69, pár. 0191), en además se señala que las composiciones farmacéuticas tales como tabletas pueden ser preparadas por procesos convencionales tales como por vía granulación (párr. [0182]) y que tales composiciones se encuentran formuladas junto con excipientes farmacéuticamente aceptables.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia habría podido especificar el método de preparación de la formulación farmacéutica que comprende el (6-(5-flúor-2-(3,4,5-trimtoxifenilamino)pirimidin-4-ilamino)-2,2-dimetil-3-oxo-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4(3H)-il)metil fosfato, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 6 y 8 – 11 y las reivindicaciones 12 – 20 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La solicitante argumenta en su oficio bajo el radicado No 10-067826-00006-0000, que la presente solicitud cumple con los requisitos de patentabilidad ya que el comprimido que se reivindica está formado por un proceso de granulación húmedo y esto no estaba sugerido a partir del arte previo que solamente señala el compuesto reclamado junto con sílica y trazas de agua.

Frente a estos argumentos esta Superintendencia se permite señalar, en cuanto al proceso de preparación de comprimidos por medio de granulación vía húmeda, que este tipo de procesos son de amplio conocimiento en la industria químico farmacéutica, tan es así, que desde que fue empleado por primera vez ha sido y sigue siendo de gran elección debido a las ventajas que ofrece al fabricante para producir formas farmacéuticas comprimidas (ej. simplicidad, economía, estabilidad y productos con alta calidad), aunque el mecanismo básico de que consta no ha cambiado en sus principios esenciales, se ha mejorado mucho los procesos complementarios que intervienen en su producción, así como también los equipos para su fabricación y que a su vez contribuyen a facilitar la biodisponibilidad del fármaco que está en el comprimido contenido, como es de conocimiento para la persona del oficio normalmente versada en la materia a partir de la bibliografía básica ². Técnicas como son, por ejemplo, la validación de procesos contribuyen a que se obtengan productos altamente controlados ya que se garantiza la reproducibilidad y consistencia del proceso y que por medio de la documentación que se obtiene de ellos se pueden ir mejorando al modificar algunos parámetros que contribuyen para obtener formas farmacéuticas adecuadas, seguras y eficaces. En la presente invención, la solicitante simplemente "propone" y "particulariza" los pasos de la granulación húmeda para preparar la formulación reclamada, pero como se está discutiendo, este es un proceso plenamente conocido en la industria químico-farmacéutica, que consiste en *"el proceso de mezclado de un polvo en presencia de un líquido (solución aglutinante) para formar el gránulo. Este proceso disminuye el riesgo de segregación y producción de finos relacionada con la compresión de tabletas. La granulación ocurre por la formación de enlaces tipo*

2 A. R. Gennaro. "Remington Farmacia". 19 ed. Ed. Médica Panamericana. 1995, pág 2400 - 2600.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43792

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-67826

puentes de hidrógeno entre las partículas primarias”³, y como en la presente invención no se muestran datos ni ejemplos comparativos que permitan a la persona observar la ventaja técnica de la invención frente al arte previo no se considera inventiva.

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:

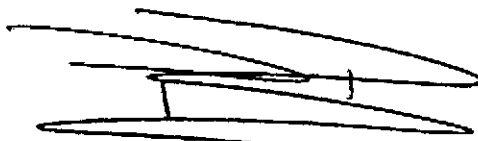
ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “FORMULACIONES GRANULADAS EN HÚMEDO QUE COMPRENDEN AGUA, SAL DE 6-(5-FLÚOR-2-(3,4,5-TRIMTOXIFENILAMINO)PIRIMIDIN-4-ILAMINO)-2,2-DIMETIL-3-OXO-2H-PIRIDO[3,2-B][1,4]OXAZIN-4(3H)-IL)METIL FOSFATO Y UN AGENTE SECUESTRANTE DE AGUA, Y MÉTODO PARA HACER DICHAS FORMULACIONES”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) RIGEL PHARMACEUTICALS, INC, 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 CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 30 Jul 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ
ip@tmtamayo.com

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

3 **URL:**http://docencia.udea.edu.co/qf/farmacotecnia/04/04_tgranulacion.html
Página 5 de 5

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 500380535

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia