

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

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 20 de diciembre de 2010, con el N° 10-159887-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Gilead Sciences, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "SALES DE COMPUESTOS INHIBIDORES DE VIH", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/049838 del 07 de julio de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 632 del 20 de septiembre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 23255, notificado por fijación en lista el 26 de diciembre 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° 10-159887-00010-0000 del 21 de marzo de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 17 que reemplaza(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 17, 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 proporcionar sales de compuestos útiles como inhibidores del VIH. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona sales del compuesto de la fórmula (I), (II) y (III) del N-[(S) (((2R,5R) – 5 - (6 – amino - 9H - purin - 9-il) - 4 - fluoro -2,5 - dihidrofuran -2-il] oxi } rnetil) fenoxifosfinoil] - L-alaninato de etilo y las composiciones que las contienen.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 08 de julio de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad.

Página 1 de 9

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1555631811

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

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:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2006015261	Antiviral Compounds	Febrero 09 de 2006
D2	Pharmaceutical Salts Pág. 214, 254, 255	Capítulo 5. Control of the Crystallization Process	2002
D3	Rémington Farmacia, 19 Ed. Panamericana tomo I páginas 371-375 y tomo II páginas 2226 a 2241	Capítulo 20. Cinética de la formación de partículas. Capítulo 83. Preformulación. Polimorfismo. Capítulo 91. Polvos Precipitación y cristalización.	1998

D1¹, menciona compuestos antivirales, composiciones que los contienen, métodos terapéuticos que incluyen la administración de tales compuestos, así como los procesos y productos intermedios útiles para la preparación de tales compuestos.

D2², divulga que la formación de sales para mejorar las propiedades de los compuestos farmacológicamente activos es de amplio conocimiento en el estado del arte, la formación de sales citrato, succinato y malonato son ampliamente utilizadas para mejorar la estabilidad de tales compuestos.

D3³, enseña el estudio del polimorfismo (formas cristalinas) 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.

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, las sales reclamadas en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que: La reivindicación 1 se refiere a: *"Una sal de citrato de fórmula (I)..."* (Ver página 6 del radicado N° 10-159887-00010-0000).

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006015261A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20060209&DB=EPODOC&locale=en_EP)

[CC=WO&NR=2006015261A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20060209&DB=EPODOC&locale=en_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006015261A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20060209&DB=EPODOC&locale=en_EP)

² Handbook of Pharmaceutical Salts pág. 214, 254, 255 (folios 135-137).

³ Remington Farmacia, 19 Ed. Editorial Panamericana tomo 1 páginas 371-375 y tomo II páginas 2226 a 2241.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

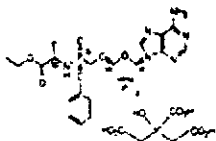
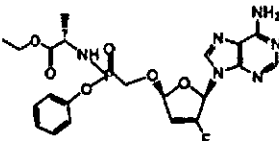
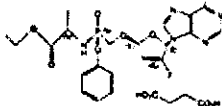
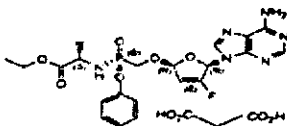
RESOLUCIÓN No: 27417
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

La reivindicación 7 se refiere a: “Una sal succinato de fórmula (II)...” (Ver página 7 del radicado N° 10-159887-00010-0000).

La reivindicación 12 se refiere a: “Una sal malonato de fórmula (II)...” (Ver página 7 del radicado N° 10-159887-00010-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 1,7 ,12 y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Una Sal de citrato de fórmula (I) 	divulga un compuesto base de formula (I) y la formación de sales de adición con ácidos orgánicos. 	Divulga que la formación de sales succinato, citrato y malónico de compuestos farmacológicamente activos son útiles para mejorar propiedades tales como estabilidad, biodisponibilidad, aceptabilidad farmacéutica, fácil manufactura
Una sal succinato de fórmula(II) 		
Una sal malonato de fórmula (III) 		

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a ia invención definida en la reivindicación 1 porque divulga el compuesto base de fórmula A específicamente los estereoisómeros A y B del compuesto N-[(S){[[[(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il 4 fluoro 2-5-dihidrofuran-2-il]oxi]metil)fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo(compuestos 57 y 59), divulga además que estos compuestos de fórmula A forman sales de adición con ácidos orgánicos tales como el ácido succínico y malónico (pág. 14, línea 23),y que se utiliza en composiciones farmacéuticas (resumen, pág. 2, líneas 30 y 31 , pág. 3, líneas 1 y 2).

La diferencia entre la invención definida en las reivindicaciones 1, 7 y 12 y el compuesto de D1 consiste en que en la actual invención se reclama específicamente las sales citrato, succinato y malonato del compuesto N-[(S) ([[(2R, 5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi} metil) fenoxi fosfinoil]-L-alaninato de etilo.

El efecto que logra se logra con las sales citrato, succinato y malonato del compuesto N-[(S) ([[(2R, 5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il 4 fluoro 2-5-dihidrofuran-2-il]oxi]metil)fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo, es que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

éstas son más estables que el compuesto en su forma base, y a su vez la sal citrato es más estable que las sales succinato y malonato (Ver páginas 30, 31 y 32 (tablas 1, 2 y 3)

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto N-[(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il) -4- fluoro -2,5- dihidrofuran -2-il]oxi) metil) fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo, conocido en D1 para que sea más estable?

Sin embargo, en D1 ya se menciona la formación de sales del compuesto N-[(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il) -4- fluoro -2,5- dihidrofuran -2-il]oxi) metil) fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo con ácidos orgánicos, tales como el ácido succínico y ácido malónico y a su vez es bien conocido en el estado del arte (D2), la utilización de sales como la citrato, succinato y malonato, entendidas en el ámbito farmacéutico como una elección de primera línea, porque son sales cristalizan fácilmente con alto grado de cristalinidad, con alto punto de fusión, buena purificación y propiedades adecuadas de estabilidad química, lo que se considera una actividad de rutina en el estado de la técnica con el fin de mejorar la propiedades de compuestos farmacológicamente activos en su forma base (pág. 214,255).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, enfrentada al problema técnico de mejorar la estabilidad del compuesto N-[(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il) -4- fluoro -2,5 - dihidrofuran-2-il]oxi) metil) fenoxifosfinoil] -L-alaninato de etilo en su forma base, combinaría las enseñanzas de los documentos D1 y D2 con el fin de desarrollar formas alternativas de dicho compuesto (sales citrato, succinato y malonato), y llegar así al objeto de las reivindicaciones 1, 7 y 12 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia y por lo tanto, sin altura inventiva.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 5 y 6,10 y 11 y 15 a 17 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Por otra parte, las formas cristalinas reclamadas en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que:

La reivindicación 2 se refiere a: *"Una sal de la reivindicación 1 caracterizada por ser una forma cristalina que presenta bandas de absorción espectral de espaciamiento d obtenidas de un patrón de difracción de rayos X en polvo iguales o esencialmente iguales a 4.48,3.12 y 6.05 angstroms". (Ver página 6 del radicado N° 10-159887-00010-0000).*

La reivindicación 8 se refiere a: *"La sal de la reivindicación 7, caracterizada por ser una forma cristalina que presenta bandas de absorción espectral de espaciamiento d obtenidas de un patrón de difracción de rayos X en polvo iguales o esencialmente iguales a 3.57, 4.80 y 4.99 angstroms". (Ver página 7 del radicado N° 10-159887-00010-0000).*

La reivindicación 13 se refiere a: *"La sal de la reivindicación 12 caracterizada por ser una forma cristalina que presenta bandas de absorción espectral de espaciamiento d obtenidas de un patrón de difracción de rayos X en polvo iguales o esencialmente iguales a 4.99,5.93 y 4.72 angstroms" (Ver página 8 del radicado N° 10-159887-00010-0000).*

La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 2,8,13, y las reveladas en los documentos D1 y D3, que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

representan el estado de la técnica:

Tabla 2

Características esenciales	D1	D3
Una sal citrato en forma cristalina del compuesto de fórmula (I) que tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo con iguales o esencialmente iguales a 4 48. 3.12 y 6 05 angstroms.	Compuesto base N-[(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil]fenoxifosfinoil]-L- alaninato de etilo de etil. y sus sales farmacéuticamente aceptables y/o solvatos	Enseña que el fenómeno polimorfismo es la capacidad de cualquier elemento o compuesto para cristalizar en más de un sistema cristalino, y que para su caracterización el patrón de difracción de rayos X es un método convencional.
La sal succinato en forma cristalina que presenta bandas de absorción espectral de espaciamiento d obtenidas de un patrón de difracción de rayos X en polvo iguales o esencialmente iguales a 3.57. 4 80 y 4.99 angstroms	No se especifica un patrón de difracción de rayos X de polvo.	
La sal malonato en forma cristalina que presenta bandas de absorción espectral de espaciamiento d obtenidas de un patrón de difracción de rayos X en polvo iguales o esencialmente iguales a 4.99.5.93 y 4.72 angstroms		

1. Determinación del estado de la técnica más cercano.

El documento del estado de la técnica más cercano es D1 el cual enseña el compuesto base de fórmula A específicamente los estereoisómeros A y B del compuesto N-[(S) ({2R, 5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il) -4-fluoro~2,5-dihidrofuran-2-il] oxi} metil] fenoxifosfinoil] -L- alaninato de etilo (compuestos 57 y 59), asimismo divulga la formación de sales de ácidos orgánicos, como las succinato y malonato (pág. 14, línea 23), además de su utilización en composiciones farmacéuticas (resumen, pág. 2, líneas 30 y 31 , pág. 3, líneas 1 y 2).

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

La solicitud se diferencia con D1 en que se reclama de manera específica las sales citrato, malonato y succinato del compuesto N-[(S)([(2R, 5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi} metil] fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo en forma cristalina.

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

El Efecto Técnico que logra la diferencia consiste en proporcionar una forma cristalina de las sales citrato, malonato y succinato del compuesto N-[(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil]fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo, que sea estable, fácilmente separable y formulable.

4. Establecer el problema técnico objetivo a solucionar con base al estado de la técnica más cercano.

El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud consiste en cómo obtener una forma cristalina de las sales citrato, malonato y succinato del compuesto N-f(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil]fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo, que sea estable y fácilmente separable y formulable.

5. Comprobar que el problema técnico objetivo de la solicitud fue solucionado.

De acuerdo con la información suministrada en la descripción, en las tablas 8A, 8B, 9A, 9B, 10A y 10B, se observa que, estos resultados corresponden simplemente a la caracterización de propiedades fisicoquímicas de las sales citrato, malonato y succinato del compuesto N-f(S)([(2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil]fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo y no es posible afirmar que se haya resuelto algún problema técnico, debido a que la solicitud carece de información comparativa que permita evidenciar que existe un efecto inesperado entre la sal citrato, la sal malonato y la sal succinato en su forma cristalina con relación a la base previamente divulgada en D1. Por otra parte, el establecimiento de las propiedades fisicoquímicas de un nuevo cristal es una labor rutinaria en formulación farmacéutica y en el presente caso las sales citrato, malonato y succinato en forma cristalina carece de un efecto técnico inesperado o sorprendente y no resuelve ningún problema técnico en particular.

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

La solución al problema técnico planteado por la invención reclamada considera obvia porque la anterioridad D3, ya divulga que las diferentes sales y 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. Dentro de estos estudios, se investiga habitualmente (i) la cantidad de polimorfos que existen (pág. 2226, col. de la derecha, último párr., pág. 2227, col. izquierda, primer párr.), (ii) el grado relativo de estabilidad de los diversos polimorfos (pág. 2228, columna derecha, último párr.), (iii) las gamas de estabilidad térmica de cada polimorfo, (IV) solubilidades (pág. 2231, col. derecha, último párr.), (v) método de preparación de cada forma (pág. 2229, col. izquierda, penúltimo párr.), (vi) efecto de la micronización o tableteado e interacción con los componentes de la formulación, y que una vez establecido que el compuesto 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 (pág. 2229 col. de la izquierda).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

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 ya se divulga de manera específica el compuesto base compuesto N- f(S) (((2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil)fenoxifosfinoil]-L-alaninato de etilo, y menciona la formación de sales orgánicas (pág. 14, líneas 16 a 29), y que en D3 se conoce que las reacciones de neutralización y la subsiguiente obtención de nuevos polimorfos se da ampliamente en los medicamentos de uso farmacéutico, esta persona se encontraría motivada a utilizar métodos como los revelados para identificar las sales de interés y las formas polimórficas de la molécula en cuestión, que además pueden ser analizadas por métodos de cristalografía conocidos.

Por lo tanto, no es posible concluir que la formación de las sales del ácido cítrico, succinato y malonato del compuesto N- [(S) (((2R,5R)- 5- (6-amino-9H-purin-9-il) -4- fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil) fenoxifosfinoil] - L- alaninato de etilo en forma cristalina, tal como se reclama en la actual solicitud envuelva actividad inventiva, como quiera que la base del compuesto y su capacidad de formar sales en forma cristalina (solvatos) ya era conocida y sugerida con anterioridad; es decir, la identificación de la forma cristalina reclamada y caracterizada mediante la técnica de 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, como quiera que no se encontró alguna prueba o ensayo que permitiera determinar las ventajas inesperadas reales de las sales citrato, succinato y malonato en forma cristalina, con relación a la base previamente divulgada en D1, por ejemplo un efecto realmente inesperado asociado a una mayor estabilidad.

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 neutralización y polimorfismo revelados en D3, al compuesto N-[(S) (((2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il]oxi)metil)fenoxifosfinoil]-L-alaninato y sus sales mencionadas en D1, con el fin de encontrar una forma cristalina más estable, tal como la sales cristalinas reivindicadas, y adicionalmente utilizaría las técnicas de neutralización, cristalización y recristalización basadas en la disolución de la molécula en diferentes solventes, tal como lo establece la bibliografía básica utilizada por el técnico medio por lo que resulta obvio diseñar una secuencia de neutralización-cristalización-recristalización en diferentes solventes o estos mismos en diferentes proporciones, con el ánimo de obtener el polimorfo de interés, más aún si se conoce el fundamento teórico para la obtención de cristales por diferencias en solubilidad y modificando parámetros adicionales como temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación etc., con la expectativa razonable de encontrar los ordenamientos cristalinos reivindicados. Por lo cual se considera obvia y por lo tanto, sin altura inventiva.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 3 a 4, 8 a 9 y 14 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Es oportuno aclarar que, contrario a lo afirmado por la solicitante, el documento D1 si muestra que el compuesto N- [(S) (((2R,5R) -5- (6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il] oxi} metil)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

fenoxifosfinoil] -L- alaninato de etilo puede formar sales de succinato y malonato (pág. 14, línea 23), y que el documento D2 muestra la posibilidad de obtener sales succinato y malonato y citrato de principios activos con el fin de lograr mejorar la estabilidad química de compuestos farmacológicamente activos, entre otras propiedades, así como que cristalicen fácilmente con alto grado de cristalinidad y que permiten obtener sales con alto punto de fusión, buena purificación, mostrando que es una actividad de rutina en el estado de la técnica (pág. 214,255).

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual "...dentro del grupo de 21 ácidos probados no se encontraba el ácido cítrico debido a su estructura potencialmente nucleofílica..." y "...en la segunda ronda de pruebas realizadas por los inventores, encontró que el compuesto químico precursor formó una sal cristalina estable con ácido cítrico..." se responde que las figuras 3 y 6 y las tablas 10A y 10B, lo que muestran es la caracterización de la sal cítrica cristalina del compuesto N- [(S) (((2R,5R) -5- (6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il] oxi} metil) fenoxifosfinoil] -L- alaninato de etilo y que no existe evidencia de un efecto sorprendente, ya que no es posible afirmar que se haya resuelto algún problema técnico, debido a que la solicitud carece de información comparativa que permita evidenciar que existe un efecto inesperado entre la sal citrato en su forma cristalina con relación a la base previamente divulgada en D1. Asimismo, el establecimiento de las propiedades fisicoquímicas de un nuevo cristal es una labor rutinaria en formulación farmacéutica y en el presente caso la sal citrato seleccionada en su forma cristalina carece de un efecto técnico inesperado o sorprendente y no resuelve ningún problema técnico en particular. Por otro lado, cabe mencionar que la sal citrato esta divulgada en el cuadro 83-2 de D3 (pág.2234) como una sal igualmente posible, así como la de succinato y malonato con un porcentaje mayor que estas dos.

Respecto a lo argumentado sobre D3, se aclara que por ser un libro de los más consultados por los químicos farmacéuticos, es un fiel reflejo de los conocimientos de un técnico medio en este campo, por tal razón, el objetivo de citar dicho documento es precisamente demostrar que una persona normalmente versada en la materia conoce perfectamente que es posible obtener polimorfos de compuestos conocidos, porque este es un fenómeno común del estado sólido de las moléculas y se produce por la modificación del solvente o de otros factores), en el proceso de cristalización/recristalización. Por lo tanto, aunque una persona en la materia solamente con lo expuesto en D1 por separado no podría llegar al objeto de la presente solicitud, sí podría hacerlo al combinar sus enseñanzas con D2 y D3 porque en D1 ya se conoce la existencia del compuesto N- [(S) (((2R,5R) -5- (6-amino-9H-purin-9-il)-4-fluoro-2,5-dihidrofuran-2-il] oxi} metil) fenoxifosfinoil]-L- alaninato de etilo, también que puede formar sales cristalinas y sus solvatos, razón por la cual encontraría la sugerencia o motivación suficiente con el fin de determinar la existencia de una forma cristalina para tal compuesto como la reivindicada, así como se explicó en numeral de análisis de patentabilidad (nivel inventivo).

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,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27417

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-159887

RESUELVE:

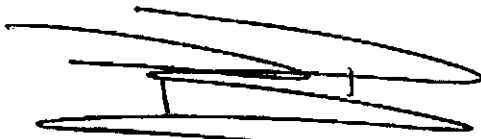
ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "SALES DE COMPUESTOS INHIBIDORES DE VIH".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Gilead Sciences, 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 10 May 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE

notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓