

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 71451

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/03-3095

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, especialmente de las conferidas en el numeral 34 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 66113 del 29 de noviembre de 2010, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó la patente de invención a la creación denominada "SUSTANCIA MEDICINAL DE ARIPIPAZOL DE BAJA HIGROSCOPICIDAD Y PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE LA MISMA", con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la materia reivindicada ya se encontraba sugerida por el arte previo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 20 de marzo de 2012, con el número 03 – 003095 – 00028 – 0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

Frente al objeto de la solicitud y la novedad de la misma, se afirma que *"[...] el objeto de este invento es ofrecer nuevas formas polimórficas cristalinas de aripiprazol. De igual modo, la propiedad física de este nuevo aripiprazol es su baja higroscopicidad. Los cristales C-F de aripiprazol anhidroso, [...] son diferentes de los cristales tipo I o tipo II de aripiprazol anhidroso convencional y de los cristales tipo III de hidrato de aripiprazol convencional divulgados en el documento D1, se diferencian en el espectro de difracción de rayos X.*

De igual manera, sostiene que *"[...] los cristales C-F de aripiprazol anhidros de este invento son cristales polimorfos nuevos. El cristal B de aripiprazol anhidroso de este invento en apariencia es similar a los cristales tipo I del aripiprazol anhidroso convencional anteriormente descrito. Sin embargo, es importante señalar que es difícil distinguir los cristales B de aripiprazol anhidroso de este invento de los cristales tipo I del aripiprazol convencional basándose en los resultados de los análisis de rayos X que se tienen en el momento".* De igual manera, menciona que *"(...) reiteramos que el cristal B del aripiprazol anhidroso es una nueva forma polimórfica cristalina de aripiprazol".*

Finalmente, menciona que el proceso de la solicitud presentada no ha sido usado para preparar aripiprazol.

De otra parte, frente a la objeción técnica realizada por este Despacho, acerca de que las reivindicaciones 2 y 9 no definen claramente la materia protegida, la recurrente menciona que *"[l]a reivindicación 2 depende de la reivindicación 1 en la que los cristales B de aripiprazol anhidroso se definen mediante los datos de la difracción de rayos X y la curva endotérmica, y el examinador reconoce estas propiedades como valores característicos que*

Página 1 de 4

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 71451

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/03-3095

definen el cristal. De igual manera, la reivindicación 9 se define mediante los datos de la difracción de rayos X y pico endotérmico, y el examinador reconoce estas propiedades como valores característicos que definen el cristal."

Ahora bien, en torno al nivel inventivo, sostiene que "[a]unque D3 describe que para la preparación de cristales polimorfos se deben definir parámetros (como el agente de disolución para la recristalización, la velocidad de cristalización, y otros parámetros adicionales como temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación, etc.), no describe ni sugiere cómo se deben definir los diversos parámetros mencionados para obtener cristales polimorfos de bajo higroscopicidad a partir de cristales polimorfos higroscópicos."

Respecto al efecto técnico, la recurrente afirma que la muestra (I) corresponde a los cristales B a F de aripiprazol anhidroso de la invención, los cuales son de baja higroscopicidad después de un tiempo prolongado de almacenamiento. Adicionalmente, sostiene que los datos presentados muestran que el hidrato de aripiprazol reduce su biodisponibilidad con el pH del estómago, en comparación con los cristales de aripiprazol anhidroso.

Finaliza la recurrente su argumentación mencionando que "[...] para la elaboración de cristales polimórficos es necesario definir parámetros como el agente de disolución para la recristalización, velocidad de cristalización y otros parámetros adicionales como temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación, etc [...]"

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto en los siguientes términos:

En relación con los argumentos la recurrente referente a la novedad y el objeto de la solicitud, este Despacho recalca que nunca objetó la novedad de los polimorfos reivindicados, por el contrario, se objetó únicamente el nivel inventivo de la invención basándose en las anterioridades D1 a D3. En efecto, se insistió que no había ninguna ventaja técnica real de la materia reivindicada, debido a que un cambio de higroscopicidad no es sorprendente de acuerdo con las enseñanzas de D3, las cuales revelan que los diferentes polimorfos de una misma sustancia difieren en propiedades como la solubilidad, la estabilidad o la higroscopicidad (pág. 1913, Fl. 800). En conclusión, las formas polimórficas reivindicadas se pueden considerar nuevas, pero no tienen nivel inventivo, de acuerdo con las enseñanzas del estado de la técnica.

Frente a la respuesta la recurrente frente a las objeciones efectuadas a la claridad de la reivindicaciones 2 y 9, esta Oficina considera que es pertinente aclarar que lo objetado en la reivindicación 2, a pesar de ser dependiente, es el hecho de caracterizar un polimorfo por su contenido de humedad, el cual es un resultado a obtener producto de la disposición espacial

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 71451

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/03-3095

de la forma cristalina. De otra parte, la reivindicación 9, aunque también es dependiente, está caracterizando un polimorfo por su proceso de preparación cuando hay otras formas posibles de caracterizarlo. En conclusión, las reivindicaciones 2 y 9 incluyen características que no son técnicamente correctas para identificar de manera adecuada un polimorfo.

Acerca de lo argumentado frente a la objeción de nivel inventivo y el documento D3, se advierte al recurrente que es la combinación de documentos lo que hace obvia a la invención reclamada, ya que D1 enseña a obtener cristales de aripiprazol tipo 1 (Fls. 569 a 576) que se obtienen de su recrystalización en etanol, los cuales se convierten en cristales de tipo 2 por calentamiento, coincidiendo con el procedimiento reclamado en las reivindicaciones 3 a 8 y 25 a 28 de la presente solicitud. De la misma forma, el documento D3 menciona que el polimorfismo es un fenómeno ampliamente difundido en los compuestos farmacéuticos y que es rutinario buscar e identificar los diferentes polimorfos de una misma sustancia con el fin de llegar a una materia prima adecuada, debido a que presentan diferentes propiedades físicas entre sí (pág. 1913, Fl. 800), por lo tanto la persona versada en la materia estaría en capacidad de buscar nuevas formas polimórficas de aripiprazol, de acuerdo con las enseñanzas de D3, y proceder a calentarlas, de acuerdo a lo enseñado en D1 y así obtener las formas no higroscópicas de la presente solicitud con la expectativa de que tuviesen propiedades físicas diferentes (higroscopicidad), tal como lo enseña D3. En conclusión, tanto los cristales de aripiprazol, como el método de obtención de los mismos por calentamiento fueron enseñados en D1 y la persona versada en la materia estaría en capacidad de obtener más formas polimórficas de aripiprazol, de acuerdo con D3, para llegar de manera obvia a la materia reivindicada.

Respecto a lo mencionado por la recurrente, se aprecia que, tal y como lo menciona, los polimorfos reclamados tienen una baja higroscopicidad durante el almacenamiento, sin embargo dicho resultado no es sorprendente a la luz de las enseñanzas de D3, las cuales mencionan de manera clara y directa que la solubilidad, la estabilidad, etc., varían de acuerdo al tipo de polimorfo en que se encuentre la sustancia, por lo tanto, la persona versada en la materia entendería que un cambio en la higroscopicidad de un polimorfo de aripiprazol no es sorprendente de acuerdo a dicha enseñanza, pues esperaría a que un nuevo polimorfo de aripiprazol tendría propiedades físicas diferentes a los polimorfos ya conocidos en D1. En conclusión, un cambio en la higroscopicidad de los polimorfos reclamados no es sorprendente para los conocimientos de la persona versada en preformulación farmacéutica y polimorfismo representados por el documento D3.

Por último, esta Oficina determina que el documento D1 ya enseñaba a obtener cristales de aripiprazol anhidro a partir de aripiprazol recrystalizado en etanol para posterior calentamiento a 130-140°C por 15 horas, si comparamos estas condiciones con lo reivindicado que es calentar el hidrato A, queda claro que las condiciones para obtener los polimorfos anhidratos de aripiprazol ya fueron revelados en D1 (Fl. 574) y sería obvio para la persona versada en la materia cambiar el tipo de cristal de aripiprazol como punto de partida para obtener formas adicionales no hidratadas del compuesto. En conclusión, D1 da las enseñanzas suficientes para llegar de manera obvia al proceso de obtención reclamado.

Página 3 de 4

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 71451

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/03-3095

En ese orden de ideas, se sostiene que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

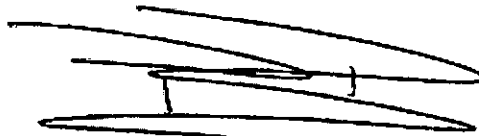
ARTÍCULO PRIMERO: CONFIRMAR la decisión contenida en la Resolución No. 66113 del 29 de noviembre de 2010, por medio de la cual se denegó la patente de invención a la creación denominada "SUSTANCIA MEDICINAL DE ARIPIPRAZOL DE BAJA HIGROSCOPICIDAD Y PROCESO PARA LA PREPARACIÓN DE LA MISMA".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente Resolución a la sociedad OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por lo cual queda agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D. C., el 26 Nov 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor
GERMÁN A. CUBILLOS MENDOZA
cubinane@gmail.com
hernandonannetti@gmail.com
cubillosgerman@yahoo.es

Elaboró: Andres Casas Santofimio ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓