

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31408

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-112338

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

En ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 60341 del 17 de octubre de 2013, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: "SALES DE ADICIÓN DE AMINAS QUE CONTIENEN GRUPOS HIDROXILO Y/O CARBOXÍlicos CON DERIVADOS DE ÁCIDO AMINONICOTÍNICO COMO INHIBIDORES DE DHODH", con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 28 de noviembre de 2013 con el No. 11-112338-00012-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad ALMIRALL S.A., interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La sociedad recurrente manifiesta que modifica la solicitud "...me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 8 reivindicaciones."

La recurrente señala respecto al nivel inventivo frente a los documentos D1 y D2 que "...la presente invención se basa en una selección de un subgrupo de compuestos concretos descritos en D1, así como en la selección de unos contraiones concretos (...) el documento D2 no contiene ninguna enseñanza que permita a una persona del oficio normalmente versada en la materia concluir con seguridad que las sales de adición de una amina que contiene uno o más grupos hidroxilo y/o carboxílicos con un compuesto de fórmula (I) pueda presentar una solubilidad mayor que la base libre (...) la Superintendencia no indica que motivaría a un experto en la materia seleccionar el subgrupo de compuestos concretos de los 62 descritos en WO2008/077639, ni qué motivaría seleccionar trometamina, meglumina y L-arginina como sal de adición."

Por otra parte, la demandante se refiere al documento O'Connor K M et al., International of Pharmaceutics 222 (2001) 163 -179, del que señala "la sal de trometamina del ácido diclofenaco es la que presenta la segunda más baja solubilidad de todas las sales ensayadas (...) no existen tendencias generales entre las propiedades del contraion, hidrofobicidad, punto de fusión y pKa y la solubilidad de la sal correspondiente. Por otro lado, también se indica que TRIS, el contraion más hidrofílico de esta serie, resultó en la sal con solubilidad más baja." Asimismo, se refiere al documento David S E et al., Drug Development and Industrial Pharmacy, 2012; 38(1): 93-103, del que resalta "... Para los cuatro medicamentos testados, flubiprofeno, ibuprofeno, etodolac y gemfibrozil, las sales de trometamina se englobarían en la zona media de solubilidades..." De lo que concluye que "...no siempre la sal de trometamina de un compuesto específico tendrá una mayor solubilidad que otra forma salina del mismo

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31408

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-112338

compuesto.”

Cita los datos contenidos en la memoria descriptiva para resaltar las propiedades de las sales de la invención indicando que *“...Sólo las sales de la invención no eran higroscópicas ni deliquescentes y tenían un punto de fusión relativamente alto, lo que ha permitido micronizarlas y que tengan estabilidad a largo plazo (...) la presente invención se refiere a una sales concretas que presentan unas mejoras específicas en solubilidad (...) se hace evidente que, a pesar de que la literatura describa sales de adición de compuestos concreto con bases concretas, no se puede generalizar que con estas bases se puedan obtener sales estables con otros compuestos...”*

Asimismo, presenta ejemplos comparativos de los cuales señala que *“...Se seleccionaron algunos compuestos de los 62 descritos en D1 (...) se llevaron a cabo ensayos de cristalización de (...) ejemplo 54 de D1 y (...) ejemplo 57 de D1 con L-arginina, meglumina y trometamina (...) Se observó que o bien no se formaba la sal o bien las sales formadas con estos ácidos eran cristalinas pero higroscópicas.”*

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

En cuanto al nuevo capítulo reivindicatorio presentado se acepta toda vez que está soportado en la descripción, no implica ampliación de materia y cuenta con el pago de la tasa correspondiente. Sin embargo, igual que el capítulo reivindicatorio denegado, no se considera inventivo por las razones que a continuación se exponen.

En lo que tiene que ver con el documento D1, divulga de manera expresa el compuesto de fórmula (I) y sus respectivos contraiones. La persona del oficio normalmente versada en la materia se vería suficientemente motivada a elegir el subgrupo de compuestos que reivindica la solicitante toda vez que todos los compuestos de la anterioridad cumplen su función como inhibidores de DHODH, sin que dicha selección implique actividad inventiva para el versado en la materia.

Respecto del documento D2, si bien no señala de manera expresa la formación de sales del compuesto de fórmula (I), da a conocer que la importancia de la formación de sales de los compuestos farmacéuticos, cuya formación se da mediante una reacción ácido-base, la cual se hace con el fin de modificar las propiedades fisicoquímicas y termodinámicas de los compuestos farmacéuticos; asimismo enseña de manera expresa que los cationes arginina, trometamina y meglumina son farmacéuticamente aceptables (Pág. 003, Tablas I, II y III). Por lo tanto, la persona del oficio normalmente versada en la materia teniendo conocimiento de que los derivados de ácido aminonicotínico de fórmula I, enseñados en el documento D1, son inhibidores de DHODH se vería suficientemente motivada a elaborar sus sales de adición con el objeto de mejorar sus propiedades fisicoquímicas, como la solubilidad, con cationes aceptables para uso farmacéutico, como trometamina y meglumina, tal como lo enseña el documento D2, y llegar así al objeto de la invención sin necesidad de emplear actividad inventiva.

Por otra parte, en cuanto a los documentos O'Connor K M *et al.*, International of

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31408

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-112338

Pharmaceutics 222 (2001) 163 -179 y David S E *et al.*, Drug Development and Industrial Pharmacy, 2012; 38(1): 93-103, se reitera que los resultados de los estudios presentados por la solicitante ratifican el hecho de que cada sal posee propiedades fisicoquímica particulares, por lo que resulta acertada su conclusión referida al hecho de que no siempre la sal de trometamina de un compuesto específico tendrá una mayor solubilidad que otra forma salina del mismo compuesto. Sin embargo, no es posible afirmar que la solicitante haya resuelto un problema técnico toda vez que es de conocimiento común para la persona del oficio normalmente versada en la materia, y la forma salina enseña el documento D2, que posterior a la elaboración de una sal corresponde su caracterización, de tal manera que la elaboración, caracterización y selección de la sal más estable y soluble hace parte de las prácticas rutinarias de la persona versada en la materia, sin que esto implique actividad inventiva.

En cuanto a los resultados de solubilidad, estabilidad y caracterización de diferentes propiedades fisicoquímicas como higroscopicidad y punto de fusión presentados por la solicitante no se pueden considerar como efectos sorprendentes o la solución a un problema técnico, ya que corresponden a una simple identificación o caracterización de diferentes propiedades fisicoquímicas como lo es la solubilidad, punto de fusión, higroscopicidad, las cuales como ya es conocido varía luego de la formación de una sal de adición cristalina. Asimismo, se reitera que el documento D2 da a conocer que diversas sales de un mismo compuesto presentan propiedades fisicoquímicas diferentes (pág. 3, col. 2). Igualmente, este documento establece que entre los cationes orgánicos usualmente utilizados para la formación de sales en medicamentos se encuentran arginina, meglumina y trometamina (tablas I, II y III), e indica que es conocido que la forma salina tiene efecto sobre las propiedades fisicoquímicas del compuesto, que incluyen la velocidad de disolución, solubilidad, estabilidad, e higroscopicidad. De manera específica, se encuentra en la Tabla III del documento D2 que la formación de sales de algunos compuestos con arginina modifica propiedades fisicoquímicas como la solubilidad y la higroscopicidad. En consecuencia, los resultados de solubilidad presentados por la solicitante no se consideran un efecto inesperado o sorprendente ya que corresponden a una propiedad intrínseca de las sales, siendo también conocido que luego de la selección del contraión las propiedades fisicoquímicas relevantes de cada sal son posteriormente caracterizadas incluyendo el grado de cristalinidad, higroscopicidad, solubilidad acuosa, hábitos cristalinos y estabilidad fisicoquímica. Por lo tanto, se concluye que el desarrollo, caracterización e identificación de las propiedades fisicoquímicas de un compuesto farmacéutico y sus sales es una tarea rutinaria en el diseño farmacotécnico.

Respecto a los estudios comparativos de sales de adición con otros compuestos del documento D1, ejemplos 54 y 57, reitera las enseñanzas del documento D2 respecto del hecho de que los compuestos que exhiben comportamiento ácido pueden participar en la formación de sales. Dichos resultados no confieren nivel inventivo a la invención, por el contrario, demuestran que la determinación del contraion que dé lugar a sales con las mejores propiedades fisicoquímicas se debe realizar para un compuesto en particular, sin que sea procedente realizar generalizaciones, como las que realiza la solicitante en el capítulo reivindicatorio, toda vez que pequeñas modificaciones estructurales en el ácido libre, que dará lugar a la formación de la sal, tiene como

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31408

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-112338

consecuencia modificaciones en las propiedades fisicoquímicas de la sal obtenida. Ahora bien, se reitera que el hecho de determinar dicho contraion es una tarea rutinaria en el diseño farmacotécnico, como se explicó anteriormente, por lo que de ninguna manera le aporta nivel inventivo a la invención.

Por lo anteriormente expuesto, se reitera que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad legalmente previstos, específicamente el de nivel inventivo y en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la 60341 del 17 de octubre de 2013, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad ALMIRALL S.A., advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 14 May 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, cavelier@cavelier.com

Doctor(a)

TITO NOE PARRA MURILLO, TPARRA@LAFRANCOL.COM

Elaboró: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo
Revisó: Carlos Daniel Lemus Giraldo
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez