

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-177476

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 ante esta Superintendencia el 23 de diciembre de 2011 con el N° 11-177476-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Sanofi, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "NUEVAS SALES DE FUMARATO DE UN ANTAGONISTA DEL RECEPTOR DE HISTAMINA H3", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US 2010/039731 del 24 de junio de 2010.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 648 del 16 de julio de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 7618, notificado por fijación en lista el 30 de abril de 2013 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° 11-177476-00005-0000 del 26 de julio de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 14 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. Asimismo, modifica el título de la solicitud el cual quedará de la siguiente manera: "SALES DE FUMARATO DE 2-(CICLOHEXILMETIL)-N- {2-[(2S)-1-METILPIRROLIDIN-2-IL]ETIL} -1,2,3,4-TETRAHIDROISOQUINOLINA-7-SULFONAMIDA".

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*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-177476

industrial."

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 14, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema técnico consiste en producir sales de un derivado de sulfonamida con mejor procesabilidad, solubilidad o vida útil en depósito, mejor biodisponibilidad, menos reacciones adversas en el tubo digestivo y mejor administración del fármaco al sitio diana objetivo. Para resolver este problema técnico se presenta sales fumarato de 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 26 de junio de 2009, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la 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	US2007/0105834	"Tetrahydroisoquinoline sulfonamide derivatives, the preparation thereof, and the use of the same in therapeutics"	10/Mayo/2007
D2	Journal of Pharmaceutical Sciences 66, N° 1, pp 2 a 19	"Pharmaceutical salts"	Enero/1977

El documento D1¹ enseña el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida y sus sales farmacéuticamente aceptables (Párrafos 0027 y 0028) y oxalatos (Ejs. 2-4).

El documento D2² divulga los efectos químicos, biológicos y físicos que pueden obtenerse al

1 URL: [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument? .](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2007105834A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070510&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)
CC=US&NR=2007105834A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20070510&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

2 URL: <http://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/jps.2600660104/abstract>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-177476

obtener las sales de un compuesto farmacéutico (Págs. 1-17).

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, la sal reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en:

Monohidrato de difumarato de 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida...” (Ver página 9 del radicado N°11-177476-00005-0000).

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:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida	2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida	No menciona
Sales de fumarato: monohidrato de difumarato, difumarato, hemifumarato, dihidrato de hemifumarato	Sales farmacéuticamente aceptables: P. Ej. succinato	La formación de sales es una reacción ácido-base que implica una transferencia de protones o una reacción de neutralización y es por lo tanto controlada por factores que influyen en tales reacciones. La tabla I categoriza todas las formas de sal aprobadas por la FDA, entre las que se encuentran las de fumarato
Forma cristalina	Forma cristalina	Procesos para la obtención de sales y sus formas cristalinas de un compuesto sólido.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-177476

Como se dijo anteriormente, D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulgan: el compuesto y sus sales. El documento D1 menciona el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida y que puede estar en forma de sales derivadas de ácidos inorgánicos y orgánicos que permitan una separación o cristalización adecuada del compuesto (Párrafo 0027). Estas sales se preparan según los métodos convencionales conocidos por la persona versada en la materia, empleando un solvente apropiado y separación mediante evaporación del solvente o filtración (Párrafo 0027). Estos compuestos pueden también existir en forma de hidratos o solvatos (Párrafo 0028).

De otro lado, el documento D2 enseña que la formación de sales consiste en una reacción ácido-base con transferencia de un protón, o puede ser una reacción de neutralización y en teoría todo compuesto que exhiba características ácidas o básicas puede formar una sal (Pág. 3).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D1, consiste en que en dicha anterioridad no se especifican sus sales fumarato.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y las enseñanzas del documento D2, consiste en que dicha anterioridad, no especifica el compuesto base de la presente solicitud.

El efecto que logra el incluir sales de fumarato, es que se logran compuestos con mejores características físico-químicas del compuesto base, aunque esto no se puede determinar ya que la solicitud carece de información que permita establecer alguna ventaja inesperada.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar el compuesto 2-(ciclohexilmetil)-N-{2-[(2S)-1-metilpirrolidin-2-il]etil}-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolina-7-sulfonamida conocido en el documento D1 para lograr una alternativa y que conserve el efecto como antagonista del receptor de histamina H3?

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D2 da a conocer la utilización de diferentes solventes y condiciones para obtener una sal que mejore las condiciones de solubilidad y otros parámetros fisicoquímicos y esto es de gran utilidad en preformulación (Pág. 3, Col. derecha), una persona del oficio normalmente versada en la materia, utilizaría sales de fumarato de los compuestos que se dan a conocer en D1, esperando el lograr mejoras en las

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-177476

características fisicoquímicas de los compuesto de la reivindicación 1 de la solicitud estudiada.

En consecuencia, es obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia referirse a las enseñanzas divulgadas en el documento D2, con el fin de mejorar o aumentar la biodisponibilidad y parámetros fisicoquímicos del fármaco descrito en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual la reivindicación 1 no tiene nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 13 y la independiente 14 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual el documento D1 presenta el compuesto de fórmula I solo en formas de oxalato o clorhidrato y no hay sugerencia en el documento D2 que habría conducido a una persona del oficio normalmente versada en la materia a escoger una forma de sal fumarato del compuesto I sobre todas las otras formas de sal; si bien el documento D1 no especifica las sales de fumarato, sí menciona la formación de sales, tipo succinato, para mejorar las propiedades fisicoquímicas del compuesto de fórmula I y el documento D2 menciona entre las posibilidades de formación de sales de los compuestos las de fumarato, por lo que la persona del oficio normalmente versada en la materia, sí acudiría a las sales de fumarato, aprobadas por la FDA por lo demás, con el fin de mejorar las propiedades fisicoquímicas del compuesto de fórmula I de la presente solicitud. Como ya se mencionó en el análisis, en la descripción no se evidencia alguna ventaja puntual de las sales de fumarato reclamadas, frente a las sales ya conocidas en el estado de la técnica.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "SALES DE FUMARATO DE 2-(CICLOHEXILMETIL)-N- {2-[(2S)-1-METILPIRROLIDIN-2-IL]ETIL} -1,2,3,4-TETRAHIDROISOQUINOLINA-7-SULFONAMIDA".

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 55438

Por la cual se deniega una patente de invención

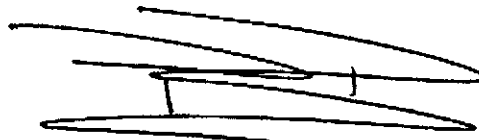
Rad. PCT/11-177476

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Sanofi, 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 18 Sep 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAÉZ
cavelier@cavelier.com
clientes@cavelier.com

Elaboró: Lina Patricia Forero Tobaría ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓