



No. 11-178631- -00009-0000

Fecha: 2014-08-28 16:25:36 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 13

Señor Superintendente
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
E. S. D.

Trámite : 002
Evento : 001
Actuación : 412

Referencia : Expediente No. **11.178.631**
Asunto : Solicitud de patente para: **"COMPUESTO HIDRATO SULFONILUREA, PROCEDIMIENTO PARA PRODUCIR EL MISMO Y FORMULACIÓN EN SUSPENSIÓN QUE CONTIENE EL MISMO"**
Solicitante : **SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED**
Fecha de solicitud : 26 de Diciembre de 2011

I. RECURSO VÍA GUBERNATIVA

Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad **SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED** solicitante de la patente de la referencia, por el presente escrito atentamente manifiesto a usted que debidamente notificada de la Resolución No. **42995** del 14 de Julio de 2014, interpongo en su contra el recurso de **REPOSICIÓN**, para que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para **"COMPUESTO HIDRATO SULFONILUREA, PROCEDIMIENTO PARA PRODUCIR EL MISMO Y FORMULACIÓN EN SUSPENSIÓN QUE CONTIENE EL MISMO"** a favor de **SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED**.

II. OPORTUNIDAD DE LA IMPUGNACIÓN

La Resolución No. **42995** del 14 de Julio de 2014, con fecha de publicación listado 22 de Julio de 2014, fecha de vencimiento 22 de Agosto, y fecha del término legal 28 de Agosto de 2014.

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

III. LA DECISIÓN RECURRIDA

3.1 Mediante la Resolución objeto de la presente impugnación, el Superintendente de Industria y Comercio decidió:

3.1.1 Denegar la patente de invención a la creación titulada: **“COMPUESTO HIDRATO SULFONILUREA, PROCEDIMIENTO PARA PRODUCIR EL MISMO Y FORMULACIÓN EN SUSPENSIÓN QUE CONTIENE EL MISMO”**.

3.2 En la parte motiva de la providencia, se mencionaron los siguientes fundamentos:

3.2.1 *“Que las reivindicaciones 1 a 3, no cumplen con el requisito de nivel inventivo”.*

3.2.2 *“De otro lado, los resultados destacados por la solicitante no se relacionan con la descomposición”.*

3.2.3 *“El documento del estado de la técnica más cercano es D1 que enseña derivados de sulfonilurea que comprenden el compuesto de formula (I), los cuales son útiles como herbicidas (Págs. 4 a 8) [...]. La solicitud se diferencia de D1 en que la anterioridad no establece que el compuesto de formula (I) pueda encontrarse en forma de hemihidrato cristalino tal como la forma B establecida en la descripción de la presente solicitud con picos característicos del patrón de difracción de rayos x en 2θ de 9.6 y 11.0. [...] El Efecto Técnico que logra la nueva configuración de hidrato consiste en una disminución en el crecimiento del tamaño de partícula del solido almacenado en suspensión [...] El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud consiste en .como obtener un derivado de sulfonilurea de formula (I) que tenga mejores propiedades farmacotecnicas que las formas conocidas? [...] De acuerdo con la información suministrada en el ejemplo de ensayo 1 (medición del tamaño de partícula) resultados de las tablas 3 y 4 la formulación en suspensión 1 que comprende el hemihidrato cristalino B conserva un tamaño de partícula entre 1.9 y 2.0, siendo mucho más constante bajo almacenamiento con respecto a la formulación 9 que comprende la forma no hidratada de dicho compuesto [...] La*

solución al problema técnico planteado por la invención reclamada se considera obvia porque la anterioridad D2 divulga que los hidratos pueden exhibir polimorfismo, y que dichos hidratos pueden ser preparados de manera simple por recristalización a partir de agua, de una mezcla de solventes que contiene agua, o por suspensión del material anhidro en agua, o simplemente exponiendo un polvo anhidro a elevadas condiciones de humedad relativa puede en algunas ocasiones dar lugar a la formación de un hidrato, este documento proporciona ejemplos de cada uno de estos procesos (Pag.121). Igualmente, la anterioridad ensena que el agua es el solvente que forma el mayor número de solidos tipo solvatomorfo y se ha estimado que aproximadamente un tercio de las sustancias con actividad biológica son capaces de formar hidratos cristalinos. El comportamiento de los hidratos se ha convertido en objeto de creciente atención en las últimas décadas, principalmente debido (directa o indirectamente) al impacto potencial de los hidratos en el proceso de desarrollo y en el desempeño de las formulaciones (Pág. 234). De lo anterior se deriva que es una actividad común en la industria el identificar los solvatomorfos de un sólido y determinar sus propiedades fisicoquímicas, también se conoce la relativamente frecuente ocurrencia de hemihidratos (0.5 moléculas de agua por cada molécula de sustancia) (Pag. 236). En consecuencia, la formación de hidratos no corresponde a un diseño racional del solicitante para lograr un compuesto que solucione un problema específico, sino a la identificación de los posibles solvatomorfos de un sólido con la posterior caracterización de sus propiedades fisicoquímicas para establecer una aplicación farmacotécnica, y aunque el producto reivindicado corresponde a una nueva configuración cristalina del hidrato del compuesto de formula I, los cristales obtenidos son producto de un estudio de recristalización efectuado sobre la molécula que se basa en la capacidad intrínseca del compuesto para cristalizar en una estructura determinada reteniendo parte del solvente formado el hemihidrato divulgado en la descripción”.

- 3.2.4** *“Igualmente, el documento D2 ensena que los hidratos representan un caso especial de solvatomorfos porque el agua no involucra aspectos relacionados con toxicidad. Por otro lado, el agua es el único disolvente que está presente en*

condiciones ambientales, y su absorción y posibles equilibrios entre las formas de hidrato representa una preocupación para el procesamiento, envasado, y almacenamiento. Para fines prácticos, por lo tanto, es importante determinar las estabilidades relativas de solvatomorfos. Los estudios de estabilidad relativa para sistemas solvatomorfo no son diferentes de aquellos para los sistemas polimórficas anhidras, excepto que la actividad del disolvente debe ser tomada en cuenta (Pág. 241)."

3.2.5 *"Adicionalmente, el documento D2 divulga métodos útiles en la determinación de la presencia de diferentes estructuras cristalinas de un hidrato entre los que se encuentran la termogravimetría para estudiar la cinética de transición de fase de los solvatomorfos, el XRD que permite obtener información fundamental sobre la estructura cristalina de la sustancia, XRD en monocristal que se considera la descripción mas fundamenta de un solvatomorfo y ayuda a explicar sus propiedades físicas, la espectroscopia de absorción de infrarrojo, la espectroscopia NIR, la espectroscopia de terahertz y la espectroscopia Raman (Pags. 318 a 321)."*

3.2.6 *"Por lo anterior, una persona del oficio normalmente versada en la materia, conociendo lo divulgado en el documento D1, el cual ensena el compuesto de formula (I), se vería motivada a utilizar métodos como los revelados en D2 para identificar otras posibles formas solvatomórficas de la molécula en cuestión, que además pueden ser caracterizados por métodos termodinámicos, cristalográficos, de espectroscopia vibracional y resonancia magnética nuclear (Pag. 318). De tal manera que no es posible concluir que la identificación de un nuevo hidrato envuelva actividad inventiva, como quiera que la molécula 2-cloro-N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-6-propilimidazo[1,2-b]piridazina-3-sulfonamida ya había sido sintetizada con anterioridad y que la capacidad de formar hidratos es una propiedad intrínseca de dicho compuesto; es decir, la identificación del solvatomorfo reclamado 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, comoquiera que no se encontró alguna prueba o*

ensayo que permitiera determinar las ventajas reales del hemihidrato del compuesto de formula (I) reclamado, que permita probar un efecto realmente inesperado asociado a una mejora en sus propiedades o actividad, más aun teniendo en cuenta que el documento D2 ensena que es conocido que las formas de hidrato la mayor parte de las veces son menos solubles en medio acuoso que su correspondiente forma anhidra (Pág. 79), lo que permite prever una menor posibilidad de formación de aglomerados y de crecimiento del tamaño de partículas, lo cual favorece la formación de suspensiones más estables.”

- 3.2.7** *“En este orden de ideas, es evidente que se pretende protección para un estado cristalino más del herbicida de formula (I), que aunque es nuevo por no encontrarse divulgada la forma de hemihidrato, se deriva de la naturaleza del estado sólido de esta molécula, propiedad alrededor de la cual se tiene amplio conocimiento, de acuerdo con la materia técnica que los documentos D1 y D2 ya enseñaban al momento de la presentación de la solicitud y que se discutió anteriormente.”*
- 3.2.8** *“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 polimorfismo y formación de hidratos revelados en D2, al compuesto de sulfonilurea de formula (I), con el fin de determinar la existencia una forma cristalina alternativa para este compuesto tal como la reivindicada. En conclusión el hidrato de la reivindicación 1 y sus dependientes al igual que la formulación en suspensión que lo contiene carecen de nivel inventivo.”*
- 3.2.9** *“En respuesta a los requerimientos realizados por esta Oficina, la solicitante argumenta que el documento D1 no ensena el efecto obtenido por el hemi-hidrato acá reivindicado. De otro lado, D2 divulga hidratos de varios compuestos y su método de producción mas sin embargo, en dicho documento no hay enseñanza o sugerencia alguna en relación con un compuesto sulfonilurea representado por la formula (1). Además, D2 no ensena o sugiere el efecto obtenido por la presente solicitud relacionada con una estabilidad superior de manera que el crecimiento de*

las partículas solidas que comprenden el presente compuesto apenas se produce en la formulación en suspensión a lo largo del tiempo durante el periodo de almacenamiento. El efecto logrado por la presente solicitud es inesperado para una persona versada en la materia, se encuentra soportado en el ejemplo de ensayo 1 de la presente solicitud, en el cual las formulaciones en suspensión (1)-(8) conteniendo el hemi-hidrato de la presente solicitud muestran una estabilidad superior en comparación con la formulación en suspensión (9) que contiene el no-hidrato. Aunque se argumente que un hidrato se puede producir con un proceso de re-cristalización a partir de agua para la persona del oficio normalmente versada en la materia el preparar un hemi-hidrato de un compuesto particular para obtener una mejor estabilidad requiere de trabajo experimental en el laboratorio y esfuerzo inventivo, toda vez que la presente invención se refiere a un hemihidrato específico que presenta unas mejoras específicas en estabilidad frente a otras formulaciones en suspensión que no contienen dicho hemi-hidrato, tal y como se ha descrito anteriormente.”

3.2.10 *“En relación con los anteriores argumentos esta Superintendencia aclara que el estado de la técnica estudiado en su conjunto si proporciona enseñanzas suficientes que direccionan a la persona versada en la materia a desarrollar las formulaciones de hidrato objeto de la presente solicitud. Tal como se estableció en el estudio de nivel inventivo el compuesto 2-cloro-N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-6-propilimidazo[1,2-b]piridazina-3-sulfonamida (compuesto de la formula (I)) había sido previamente divulgado en el documento D1 el cual indica su utilidad como agente herbicida (Pags. 4 a 8). Del mismo modo, el documento D2 da a conocer las ventajas de la preparación de hidratos y otras formas cristalinas de los agentes que exhiben alguna actividad, con la finalidad de modificar el desempeño de las formulaciones que los contienen (Pág. 234). El documento D2 establece que es una actividad común en la industria el identificar las formas solvatomorficas de un producto solido con la finalidad de determinar sus propiedades fisicoquímicas, también indica la anterioridad que es relativamente frecuente la obtención de hemihidratos mediante la aplicación de las técnica de obtención de solvatomorfos conocidas en arte previo (Pág. 236).”*

3.2.11 *“Como se indicó en el examen de patentabilidad a la luz del arte previo la identificación de solvatomorfos no se fundamenta en un diseño racional de la solicitante para lograr un compuesto que solucione un problema específico, toda vez que no es posible prever las propiedades fisicoquímicas de un solvatomorfo, en consecuencia el objeto de la presente solicitud consiste en la identificación de los posibles solvatomorfos del compuesto 2-cloro-N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-6-propilimidazo[1,2-b]piridazina-3-sulfonamida, con la finalidad de determinar las propiedades fisicoquímicas de estos y establecer posteriormente una aplicación farmacotécnica para los mismos, que en el presente caso consiste en una menor aglomeración del sólido en suspensión, lo cual es una propiedad intrínseca del sólido y no corresponde a una solución a un problema diseñada de manera racional por la solicitante. Como se explicó, la materia reivindicada carece de nivel inventivo toda vez que los cristales obtenidos son producto de un estudio de recristalización efectuado sobre la molécula que se basa en la capacidad propia del compuesto para cristalizar en una estructura determinada reteniendo parte del solvente formando el hemihidrato divulgado en la descripción, lo cual modifica las propiedades fisicoquímicas del sólido resultante.”*

3.2.12 *“En relación con los resultados del estudio presentado por la solicitante en el cual se evidencia un menor crecimiento del tamaño de partícula, se reitera a la solicitante que esto no se consideran un efecto inesperado o sorprendente ya que corresponden a una propiedad del sólido obtenido. Del mismo modo, como se indicó en el análisis de nivel inventivo el comportamiento de los hidratos se ha convertido en objeto de creciente atención en las últimas décadas, principalmente debido (directa o indirectamente) al impacto potencial de los hidratos en el proceso de desarrollo y en el desempeño de las formulaciones (Pág. 234). Por otra parte, si bien la solicitante identificó una aplicación farmacotécnica para la forma hemihidrato obtenida, esto no representa evidencia de ventajas reales de dicho sólido, toda vez que no existe ningún efecto asociado a una mejora en las propiedades herbicidas o en la actividad de dicho agente, más aun teniendo en cuenta que es conocido que las formas de hidrato la mayor parte de las veces son*

menos solubles en medio acuoso que su correspondiente forma anhidra según lo indica D2 (Pág. 79) lo que permite prever una menor posibilidad de formación de aglomerados y de crecimiento del tamaño de partículas, lo cual favorece la formación de suspensiones más estables.”

3.2.13 *“Esta Superintendencia reitera que la presente solicitud carece de altura inventiva ya que como se indicó anteriormente la formación de solvatos no corresponde a un diseño racional del solicitante para lograr un compuesto que solucione un problema específico, y aunque se trata de un nuevo estado cristalino correspondiente al hemihidrato de 2-cloro-N-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbamoil]-6-propilimidazo[1,2-b]piridazina-3-sulfonamida, los cristales obtenidos son producto de un estudio de recristalización efectuado sobre la molécula y basado en la capacidad del compuesto para cristalizar en una estructura determinada y retener parte del solvente en su estructura.”*

3.2.14 *“Finalmente, este Despacho no deja de reconocer que el polimorfismo es un problema en la industria farmacéutica como lo establece la literatura y también es cierto que solamente algunos polimorfos o solvatos presentan propiedades deseables. Sin embargo, en este caso particular el solvato reivindicado es el resultado de un trabajo rutinario o habitual, en el cual el cometido inicial del investigador, consiste en determinar si el compuesto de la solicitud, puede existir en otras formas cristalinas mediante la aplicación de técnicas conocidas como las divulgadas en D2 (Pág. 121). Una vez que el preformulador establece que la molécula presenta diferentes formas cristalinas y es capaz de formar solvatos (polimorfismo) existen procedimientos con los cuales el preformulador puede prepararlos en cantidades mayores, en donde lo que se hace es establecer las condiciones en que se pueden producir cada una de ellas; sin embargo el establecimiento de estas condiciones de obtención resultan ser destrezas básicas para cualquier persona con formación en química.”*

3.2.15 *“En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas.”*

IV. OBJETO DEL RECURSO

De acuerdo con los argumentos que expongo a continuación, solicito atentamente a su Despacho lo siguiente:

1. Revocar la Resolución No. **42995** del 14 de Julio de 2014.
2. Conceder el privilegio de patente de invención para **“COMPUESTO HIDRATO SULFONILUREA, PROCEDIMIENTO PARA PRODUCIR EL MISMO Y FORMULACIÓN EN SUSPENSIÓN QUE CONTIENE EL MISMO”** a favor de **SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED**.

V. FUNDAMENTOS DEL RECURSO

Respetuosamente me permito disentir de lo expuesto por ese Despacho en la Resolución objeto del presente recurso, toda vez que la presente solicitud sí cumple con los requerimientos de novedad y nivel inventivo exigidos en la Decisión 486, como se demostrará a continuación:

Es del conocimiento común en la técnica que un solvato o hidrato de un compuesto es diferente al compuesto como tal del cual se deriva en propiedades tales como solubilidad, punto de fusión y área superficial específica. Sin embargo, NO es obvio que un hidrato de cierto compuesto pueda prevenir que incrementen el tamaño de las partículas del compuesto en una solución.

En el ejemplo de producción comparativo 1, el cual se encuentra en la página 23 y 24 del capítulo descriptivo de la presente solicitud de patente, muestra que el tamaño de partícula del compuesto de sulfonilurea representado por la fórmula (I) fue prevenido significativamente de incrementar en las formulaciones de suspensión (1)-(8), aún en condiciones severas como lo son a 60° por dos semanas, en comparación con la formulación de suspensión comparativa (9). En las formulaciones de suspensión (1)-(8), la forma de hemihidrato del compuesto de sulfonilurea representó sólo el 0.2%-7.9% de la

cantidad total del compuesto de sulfonilurea. A saber, la forma de anhidrato del compuesto de sulfonilurea representó una porción predominante (92.1%-99.8%) de la cantidad total del compuesto de sulfonilurea.

Por lo tanto, la presencia de la forma de hemihidrato del compuesto de sulfonilurea afecta altamente las propiedades del compuesto de sulfonilurea, tales como el crecimiento de partículas del compuesto en las formulaciones de suspensión que comprenden el compuesto de sulfonilurea. En particular, el ejemplo de producción comparativo 1 muestra que la prevención significativa del crecimiento de las partículas del compuesto de sulfonilurea se obtuvo en la formulación de suspensión (8), la cual comprende la forma de hemihidrato del compuesto de sulfonilurea en una cantidad de sólo 0.2% basado en la cantidad total del compuesto de sulfonilurea.

Por lo tanto, tal como se describió previamente, la forma de hemihidrato del compuesto de sulfonilurea de acuerdo con la reivindicación 1 tiene un efecto técnico significativo que excede lo que una persona versada en la materia pudiera esperar a partir de las enseñanzas reveladas en los documentos señalados como arte previo (D1 y D2) por el Señor Examinador.

Adicionalmente, mi representada desea poner de presente lo siguiente:

Inicialmente, se aclara a su Despacho que no siempre es claro si un compuesto conocido puede formar hidratos y/o la relación estequiométrica entre el disolvente a incorporar (agua) y el compuesto no hidratado. Por tanto, debido a que es necesario realizar pruebas experimentales con el fin de conocer los posibles hidratos que puede formar un compuesto específico, es claro que a partir de D1 señalado como el documento más cercano del estado de la técnica por enseñar derivados de sulfonilurea, no era posible para un técnico medio obtener de manera obvia y/o evidente el hidrato acá reivindicado y mucho menos predecir sus propiedades inesperadas mejoradas. Concluir lo contrario solamente es posible mediante un análisis ex post facto de la invención, el cual contraria la obligación del Examinador de ubicarse a la fecha de la prioridad reivindicada al momento de efectuar dicho estudio.

Adicionalmente, se pone de presente a su Despacho que, aunque D1 divulga derivados de sulfonilurea que comprenden el compuesto de formula (I) que son útiles como herbicidas, debido a que la estructura y formula molecular de los hidratos de estos compuestos varía con respecto a la del anhidrato conforme a la relación estequiometrica existente entre las moléculas de agua y el compuesto de formula (I) conocido, claramente los hidratos de un compuesto dado y su anhidrato son diferentes entre sí.

En efecto, lo anterior se hace más evidente si se tiene en cuenta que el mismo Señor Examinador acepta que la materia reivindicada (hidratos) no se encuentra divulgada en el documento citado D1 de forma explícita, por lo cual es claro que D1 al no divulgar las características técnicas divulgadas en la presente invención, no anticipa la materia acá reivindicada y por lo tanto, se cita un segundo documento D2. Sin embargo, dicho documento a pesar de revelar enseñanzas generales sobre los hidratos, es claro que no enseña las condiciones específicas con las cuales se podría obtener el hidrato de interés el cual como se señaló previamente, presenta la ventaja de prevenir de forma significativa el crecimiento de las partículas del compuesto de sulfonilurea se obtuvo en la formulación de suspensión (8), la cual comprende la forma de hemihidrato del compuesto de sulfonilurea en una cantidad de sólo 0.2% basado en la cantidad total del compuesto de sulfonilurea.

En consecuencia, el documento D1, el documento D2, o su combinación, no resultan anterioridades válidas capaces de afectar el nivel inventivo de la invención de la presente solicitud.

Conclusión

Los documentos D1 y D2 no resultan anterioridades válidas capaces de afectar la novedad y el nivel inventivo del hidrato de compuesto de sulfonilurea de la presente solicitud.

Por todo lo anterior, consideramos que la presente solicitud cumple a cabalidad con los requerimientos de patentabilidad exigidos por la legislación actual, por lo que atentamente solicitamos en consideración lo siguiente:

VI. PETICIÓN

Por todo lo anterior, solicito a ese Despacho lo siguiente:

6.1 Que al considerar las razones precedentes se revoque la decisión contenida en la Resolución No. **42995** del 14 de Julio de 2014, en cuanto resuelve negar el privilegio de patente de invención.

6.2 Que se otorgue el privilegio de patente de invención para: que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para **“COMPUESTO HIDRATO SULFONILUREA, PROCEDIMIENTO PARA PRODUCIR EL MISMO Y FORMULACIÓN EN SUSPENSIÓN QUE CONTIENE EL MISMO”** a favor de **SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.**

VII. NOMBRE Y DIRECCIÓN

El nombre y la dirección del solicitante recurrente son los siguientes:

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED.

27-1, Shinkawa 2-chome,

Chuo-ku,

Tokio, 104-8260

Japón

CAVELIER

ABOGADOS

VIII. NOTIFICACIONES

Atentamente manifiesto a usted que recibiré notificaciones en la Secretaria de su Despacho o en mi oficina de abogada situada en la Carrera 4ª. No. 72-35, piso 4º, de esta ciudad de Bogotá, D.C.

Señor Superintendente,

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. No. 23.555

man COLO-17818-0801-001-5
DVVDVWID-270795\WPC17818
No. M-2014-270795\DVV