

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26
del artículo 3º del Decreto 4886 de 2011 y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado ante esta Superintendencia el 07 de octubre de 2005 con el N° 05-102278-B-00000-0000, por la sociedad NOVARTIS AG y MITSUBISHI PHARMA CORPORATION., a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTOS ORGANICOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2004/003656 del 06 de Abril de 2004.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma, con fundamento en el artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, en concordancia con el Tratado de Cooperación en materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a la solicitante mediante Oficio N° 19535, notificado el 16 de diciembre de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de nivel inventivo, conforme lo establece el artículo 18 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 05-102278-B-00003-0000 del 17 de abril de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 34 (Fls.84 a 88) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo, quedando como nuevo título: "PROCESO PARA LA PRODUCCIÓN DE UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE COMPRENDE UN AGONISTA DEL RECEPTOR S1P". No se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, como quiera que no se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486 ya que amplía la materia inicialmente reclamada, teniendo en cuenta que la presente solicitud se refiere a un proceso de obtención de una composición, por lo anterior se tomará en cuenta el capítulo reivindicatorio radicado inicialmente en fecha 15

Página 1 de 7

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 2087123131

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: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

de diciembre de 2011 que consta de 22 reivindicaciones, referidas a un proceso de preparación de una composición..

QUINTO: Que según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se 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 22, contenidas en los folios 63 a 66, carecen de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El objeto de la invención consiste en dar solución a la necesidad de un proceso para obtener una composición farmacéutica sólida adecuada par administración oral de un agonista del receptor S1P. Para solucionar este problema técnico, la solicitud en

estudio proporciona un proceso de obtención de una composición farmacéutica, de acuerdo a las reivindicaciones 1 a 22.

6.2. Determinación del estado de la técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la Solicitud de Prioridad: Abril 8 de 2003 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	EP1002792	2-aminopropane-1,3-diol compounds, medicinal use thereof, and intermediates in synthesizing the same.	24-05-2000
D2	Farmacia Remington	Formas orales sólidas	19ªEd 1998

D1¹, divulga un compuesto de formula (I) que muestra acción inmunosupresora y

¹<http://worldwide.espacenet.com/searchResults?>

NUM=ep1002792&DB=EPODOC&locale=en_EP&ST=number&compact=false

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

composiciones farmacéuticas que lo contienen, con vehículos farmacéuticamente aceptables, usado en la prevención o supresión de rechazo de órganos ó trasplante de médula ósea y en el tratamiento de enfermedades autoinmunes (folio 98; abstract).

D2², divulga el proceso de granulación seca y comprende etapas como: mezclar, moler y granular; mezclándose el componente activo con un diluyente y un lubricante, en donde se menciona como diluyente habitual el manitol, por sus ventajas como buena fluidez y bajo contenido de humedad y por ser un diluyente no higroscópico (folios 68-71, pág. 2472-2509).

6.3. Nivel inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma 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"*.

Visto lo anterior, se advierte que la solicitud resulta obvia y se deriva de manera evidente a partir de la información enseñada por el estado del arte, tal como a continuación se sustenta:

La reivindicación 1 consiste en un proceso para la producción de una composición farmacéutica, caracterizado porque comprende las siguientes etapas (Fl.63, pág. 38): a) Mezclar un agonista del receptor de S1P con un alcohol de azúcar, b) Moler y/o granular la mezcla obtenida en a) y c) Mezclar la mezcla molida y/o granulada en b) con un lubricante, en donde el agonista del receptor S1P es seleccionado de 2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil] propan-1,3-diol (FTY720) y una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
Etapas del Proceso (de una composición en forma sólida):	Composición en forma sólida	Etapas del Proceso (de una composición en forma sólida)
a) mezclar un agonista	mezclar un agonista del	mezclar un principio activo

2 Farmacia Remington; tomo 2, capítulo 92, formas orales sólidas, 19ªEd 1998.

Página 3 de 7

Al contestar favor indique el número de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 2087123131

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: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

del receptor de S1P (2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil] propan-1,3-diol (FTY720) y una sal farmacéuticamente aceptable del mismo) con un alcohol de azúcar	receptor de S1P con un alcohol de azúcar	(como un agonista del receptor de S1P con un alcohol de azúcar)
b) moler y/o granular la mezcla obtenida en a)	No menciona específicamente	moler y/o granular la mezcla
c) mezclar la mezcla molida y/o granulada en b) con un lubricante	mezclar con un lubricante como estearato de magnesio	mezclar con un lubricante como estearato de magnesio

El estado de la técnica cercano corresponde a los documentos D1 y D2 en donde:

El documento D1 divulga composiciones (formulaciones sólidas), en donde un agonista del receptor de S1P, del tipo 2-amino propano 1,3 diol [(al igual que el compuesto 2-amino-2-[2-(4- octilfenil) etil]propan—1,3-diol (FTY72O)] o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo (mencionado en: pág. 2, párrafo 2, documento WO94/08943 equivalente ES2126658 líneas 28-29, pág.7; líneas 39-40, pág.16; líneas 19-22 , pág. 129, y pág. 223, ej. cápsula); se mezcla con excipientes como un alcohol de azúcar (manitol, línea 55, párrafo 181, pág. 19) y un lubricante como el estearato de magnesio (línea 58, párrafo 181, pág. 19); que muestran actividad inmunosupresora.

El documento D2 divulga el proceso de granulación que comprende etapas, tales como mezclar, moler y granular, mezclándose el componente activo con un diluyente y un lubricante, en donde se divulga que el diluyente habitual es el manitol, por sus ventajas como buena fluidez y bajo contenido de humedad y por ser un diluyente no higroscópico (pág.2486 y 2487, Fl.69); en donde el secado por aspersión (rociado) también es una etapa conocida que hace parte de la granulación, para producir formas sólidas (pág.2488,Fl.70). Asimismo, se considera que estas etapas hacen parte de procedimientos convencionales, tal como se menciona en la descripción de la presente solicitud (líneas 20 a 25, pág. 23, Fl.48). Se entiende que para obtener una forma sólida como una cápsula, aunque el documento no divulgue el proceso para su obtención, es conocido que se deben mezclar los componentes para obtener el granulado (composición) para rellenar y obtener dichas capsulas.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y la composición de D1, consiste en que la primera específicamente menciona que el proceso para obtener la composición comprende las etapas de moler y/o granular.

Adicionalmente, se observa que no existe evidencia de un efecto sorprendente, porque el proceso mencione específicamente las etapas de moler y/o granular.

En consecuencia se determinó que el problema técnico objetivo era: lograr un proceso alternativo, para la producción de una composición farmacéutica sólida que

comprende un agonista del receptor de S1P con un alcohol de azúcar.

Por consiguiente, de acuerdo a las enseñanzas de D1, en cuanto a que revelaba formulaciones sólidas de un agonista del receptor de S1P, del tipo 2-amino propano 1,3 diol [(al igual que el compuesto 2-amino-2-[2-(4- octilfenil) etil]propan—1,3-diol (FTY72O)] o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo tales como cápsulas o tabletas, en donde, para obtener tales formas sólidas, están implícitamente involucradas las etapas de mezclado, molienda y/o granulado, y a que estas etapas son muy conocidas para la producción de las formas farmacéuticas sólidas, mencionadas en D2; una persona del oficio normalmente versada en la materia, pudo lograr el proceso de producción reivindicado, sin que se observe un efecto técnico sorprendente.

Por lo anterior la solución propuesta al problema técnico planteado en la reivindicación 1 es obvia y no tiene nivel inventivo. Además, dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 22, no agregan ninguna característica inventiva a la presente reivindicación; se concluye que estas tampoco son inventivas y, por ende, no cumple lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486.

Con relación a lo argumentado por la solicitante, respecto a que el documento D1 no proporciona algún detalle en cuanto a cómo preparar una formulación sólida y mucho menos que sea adecuada para la administración oral, se aclara que el solicitante tiene razón en que D1 no enseña las etapas de un proceso mediante las cuales se pueden obtener formas farmacéuticas sólidas (orales) tales como gránulos, tabletas, cápsulas, sin embargo, dado que el proceso reivindicado esta caracterizado por etapas generales como moler y/o granular y mezclar tres componentes, dicho proceso no tiene nivel inventivo, porque como ya se explico se puede obtener de manera obvia, con las enseñanzas citadas de los documentos D1 y D2.

Por otro lado, en los antecedentes de la invención de D1, sí se mencionan

Página 5 de 7

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 2087123131

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: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

compuestos 2- amino propano 1,3 diol y se cita específicamente el compuesto: 2-amino-2-[2-(4- octilfenil) etil]propan—1,3-diol que corresponde al FTY720, además se mencionan formas sólidas (orales) como tabletas píldoras, capsulas, gránulos que contienen excipientes como manitol y un lubricante como estearato de magnesio (líneas 41, 55 y 58, pág.19, Párrafo 181).

En cuanto a que “el problema técnico que subyace a la presente invención radica en la preparación de una composición farmacéutica que comprenda FTY720 en forma de una formulación sólida adecuada para la administración oral”. Se responde que (antes de la fecha de prioridad) ya se conocían formas sólidas como capsulas, que eran adecuadas para la administración oral de este principio activo.

Además se aclara, que si bien no todos los excipientes son adecuados para preparar una determinada composición, la escogencia de un (os) determinado (s) excipiente (s), hace parte de un trabajo experimental dentro de la rutina del experto en la materia, en las etapas de diseño y preformulación³ de un producto o composición farmacéutica, más cuando ya se mencionaba que con el principio activo FTY720, que es un compuesto 2- amino propano 1,3 diol, se obtenían formas solidas como las ya citadas con excipientes por ejemplo como manitol y estearato de magnesio. Cabe mencionar que la estabilidad de una composición es una condición que, estas, deben cumplir y que se debe probar durante los ensayos de

preformulación mencionados.

Por último, se observa que el solicitante argumenta (experimentos 1 y 2) sobre supuestas ventajas de una composición, que no es la materia reivindicada relacionada con esta solicitud la cual se trata es de un proceso para producción de una composición sólida.

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,

RESUELVE:

³ Pharmaceutical dosage forms: tablets; 2^aed, Herbert A. Lieberman, Leon Lachman, and Joseph B. Schwartz; Tablet Formulation and Design, Vol 1, Fls. 89 a 99, págs. 83-100.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 30274

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-102278-B

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "PROCESO PARA LA PRODUCCIÓN DE UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE COMPRENDE UN AGONISTA DEL RECEPTOR S1P".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctora Dilia María Rodríguez D'aleman, en su calidad de apoderada de la sociedad NOVARTIS AG y MITSUBISHI PHARMA CORPORATION., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella 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 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 15 May 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



JOSE MIGUEL DE LA CALLE RESTREPO

Doctora
DILIA MARIA RODRIGUEZ D`ALEMAN
Carrera 11 N° 86-53 piso 6
Bogotá D.C.

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecaj Dunoyer ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo ✓
Revisó: Andres Casas Santofimio ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓