

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 63881

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-110393A

EI 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 en esta Superintendencia el 19 octubre de 2007, con el N° 07-110393-A-00000-0000, por la sociedad Eisai R&D Management CO., LTD., a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "SALES DE MONO-LISINA DE COMPUESTOS DE AZOL", que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2006/309435 del 01 de mayo de 2006.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 593 del 27 de junio de 2008, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 10881 y notificado por fijación en lista el 22 de junio de 2012 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 visibles a folios 126 a 135 del cuaderno administrativo, 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° 07-110393-A-00002-0000 del 18 de septiembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó aclaraciones, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo.

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 industrial."*

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 6 contenidas en el folio 62, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos de azol con propiedades mejoradas de solubilidad, higroscopicidad y estabilidad, útiles para tratar infecciones fúngicas sistémicas. Para resolver este problema técnico la solicitud en

Página 1 de 5

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 63881

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-110393A

estudio proporciona una sal de monolisina de dihidrogenofosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)tiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo, composiciones que los contienen y un procedimiento para prepararlos.

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 invocada, es decir, el 03 de mayo de 2005.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO01/52852	Water soluble prodrugs of azole compounds	26-07-2001
D2	Berge, S. Journal of pharmaceutical Science, Págs. 02 - 20	Pharmaceutical Salts	01-1977

El documento D¹¹ divulga compuestos derivados de triazol utilizados en el tratamiento de infecciones sistémicas fúngicas para administración parenteral y oral (Pág. 1, renglones 7 – 9).

El documento D2 (Fls. 126 a 130) realiza una revisión sobre aspectos físicos, químicos y farmacéuticos relacionados con la utilización de compuestos con actividad terapéutica en sus formas de sales farmacéuticamente aceptables.

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, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"una sal de monolisina de dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)tiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-*

1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20010726&CC=WO&N R=0152852A1&KC=A1

Página 2 de 5

Al contestar favor indique el número de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 636809529

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

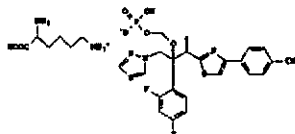
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 63881

Por la cual se deniega una patente de invención

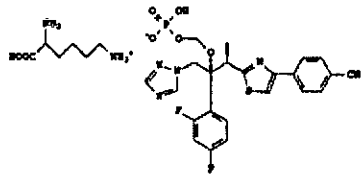
Rad. PCT/07-110393A

triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo que tiene la estructura



o un solvato farmacéuticamente aceptable de la misma" (Fl. 62).

La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2, que representan el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Sal de monolisina de estructura  de la misma o solvato	Sal de bislisina de dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)triazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo (Pág. 26, ejemplo 3)	Enseña que las propiedades de compuestos con actividad terapéutica se pueden modificar y optimizar con la utilización de sales.

Como se dijo anteriormente, los documentos D1 y D2 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D1 divulga la sal de bis-lisina de dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)triazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo (Pág. 26, ejemplo 3).

El documento D2 enseña que la formación de sales es una práctica utilizada en la industria farmacéutica con el objetivo de modificar y optimizar propiedades de compuestos con actividad terapéutica (Pág. 2, Fl. 126, ambas columnas). Asimismo, el documento enseña la lisina como un potencial agente formador de sales (Pág. 6, Fl. 130, tabla III).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que el compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)triazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo reclamado está en forma de sal monolisina. Sin embargo, se encuentra sugerido en el Pág. 10 del documento D1 en donde se menciona que se pueden obtener sales de monolisina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D2 consiste en que la sal con lisina corresponde a una sal monolisina y es específicamente del compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)triazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 63881

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-110393A

El efecto que logra el incluir la sal monolisina del compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)thiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo es que se logra estabilidad por disminución de la higroscopicidad del fármaco.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar la sal bislisina del compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)thiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo conocido en el documento D1 para lograr estabilidad por disminución de la higroscopicidad del fármaco?.

Sin embargo, la obtención de la sal monolisina de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)thiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo con buena solubilidad y estabilidad, se encuentra sugerida en el documento D1 (Pág. 10, renglones 8 - 21), así como las sales farmacéuticamente aceptables en forma solvatada (Pág. 11, renglón 1). Asimismo, el documento D2 enseña que la utilización de compuestos con actividad terapéutica en forma de sales farmacéuticamente aceptables es una práctica común en el ámbito farmacéutico, y que se lleva a la práctica con el objetivo de modificar propiedades de las sustancias, tales como solubilidad, biodisponibilidad o higroscopicidad.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia ante el problema técnico planteado, tendría una motivación razonable de incluir la sal monolisina del compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)thiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo, ya sugerida en el documento D1 (Pág. 10, renglones 8 - 21), con la expectativa de obtener un compuesto con buena solubilidad y estabilidad mejorada, llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 6 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Ante los argumentos presentados por la solicitante, es oportuno aclarar que en el análisis de patentabilidad se reconoce el efecto en la higroscopicidad tal como el solicitante lo señala en los folios 138 a 142. Sin embargo, a partir de las enseñanzas del documentos D1 y D2, el técnico medio versado en la materia tendría una motivación razonable en desarrollar la sal monolisina del compuesto dihidrógeno-fosfato de ((2R,3R)-3-(4-(4-cianofenil)thiazol-2-il)-2-(2,4-difluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-iloxi)metilo con el objetivo de encontrar buenas propiedades de estabilidad e higroscopicidad, porque que tal como lo afirma la solicitante, el control de la higroscopicidad es importante en el desarrollo de formulaciones farmacéuticas de un compuesto con actividad terapéutica.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 63881

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-110393A

manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

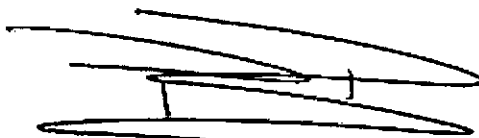
ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "SALES DE MONO-LISINA DE COMPUESTOS DE AZOL".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución al doctor Juan Pablo Cadena Sarmiento, en su calidad de apoderado de Eisai R&D Management CO., LTD., 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 cinco 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 29 Oct 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor
JUAN PABLO CADENA SARMIENTO
jcadena@bc.com.co

Elaboró: María Del Pilar Obando Patiño ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Andres Casas Santofimio ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓