Inthistria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A AVISO DE NOTIFICACION

Seæor (a) (es)
DILIA RODRIGUEZ D’ ALEMAN
CARRERA 11 NO. 86-53 PISO 6
BOGOTA D.C.

Referencia RESOLUCION:
Fecha:
Expediente:
TrÆmite:
Evento:
ActuaciOn:

CORREO CERTIFICADO

RadIcaclOn: 5-102278- -16-0 Fecha: 2012-01-02 10:25:17
TrÆmIte: 11 PATENTEIYII
Evento: 379 FASENACIONALII
ActuacIôn: 432 COMUNICACTOADM
Destinatarlo: DILIA RODRIGUEZ D’ ALEMAN Folios I

79469
30/12/2011
5-102278
11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II
379 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO II
432 COMUNICACION ACTO ADMINISTRATIVO

Comedidamente le solicito presentarse a este Despacho ubicado en la Carrera 13 No. 27 - 00 Piso Tercero (3), de la ciudad de Bogota D.C., dentro del tØrmino de cinco (5) dIas hÆbilescontados a partir del envio de la presente citaciôn, en horario de 8:00 a.m. a 4:30 p.m. jornada continua, con el fin de notificarle personalmente el contenido de la resoluciôn de la referencia proferida dentro del expediente tramitado con el nümero de radicaciôn citado en el asunto.

De no hacerse presente en el tØrmino indicado anteriormente, la providencia en mención se notificarÆ por edicto, el cual se fijarÆ por el tØrmino de diez (10) dias en el Centro de Documentación e Informaciôn.

Para su comodidad el texto completo de la resoluciôn Se encontrarâ disponible en la pÆgina web de la Entidad desde el dia hÆbil siguiente al de su notificaciôn, la cual podrÆ ser consultada desde un computador con acceso a Internet, en la pagina www.sic.gov.co, con el nUmero de resoluciôn a travØs de la opción trÆmites y servicios - de carÆcter general transversal - consulta actos administrativos y providencias.

En caso de que se haya notificado, haga caso omiso de este aviso.

Secretaria General

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 pisos 3, 5, 7y 10 PBX: 5870000
Al contestar favor indique el nUmero de EIEEllISede CAN: Av. Carrara 50 No. 26-55 mt. 2 Tel 5880070 radicación consignado an el sticker EIII11ECaII Center 5920400. Linea 018000-910165 TEEEflWeb: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
EfflIflBOgOtÆ D.C.Colombia

Xt QAT 11 39,

3

t

,-,. J;; r5

t

A ITT

5:

sic; STAVY0 -4.’f’ -:

WITT

r

MOVE V _lmyit

- L ’’A -’’-

SV

4

L R-_ --

- :

- S - -

. ft
Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPIJBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCION No 79469
Por la cual so deniega una patente do invenciOn

Rad. PCT/05-102278

EL SUPERINTENDENTE DE!NDUSTRIA Y COMERCIO en ejerciclo de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 38 del articulo3° del Decreto 1687 de 2010 y

CONSIDERANDO

PRJMERO: Que mediante escrito radicado ante esta Superintendencia el 7 de octubre de2005, con el No. 05- 102278, por la doctora Jimena Escobar Uribe, en su calidadde apoderada de las sociedades NOVARTIS AG Y MITSUBISHI PHARMA

CORPORATION, entrô a fase nacional la solicitud de patente de invenciôn titulada L "COMPOS/CIONES FARMACEUTICAS SOLIDAS QUE COMPRENDEN UN
AGONISTA DE 1?ECEPTOR SIP Y UN ALCOHOL DE AZUCAR", que corresponde a la solicitud internacional PCTIEP2004/003656 del 6 de abril de 2004.

SEGUNDO: Que una vezefectuado el examen de forma, en cuahto los requisitos que debe reunir la solicitud y cumplidas las exigencias legales establecidas en la Decision
486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperacion en materia de

patentes (PCT), el reglamento y la Circular Unica de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenO publicar el extracto sin que se,hubieran presentado oposiciones

01 parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidäd se encontrO que la invenciOn no es patentable. En consecUencia, con fundamento en Ic dispuesto en el articulo 45 de la Decision 486 de la ComisiOn de la Comunidad Andina, se requinO a Ia solicitante mediante Oficios Nos. 11663, 1389 y 00623, notificados el 12 de septiembre de 2008, el

5 de febrero de 2010 y 14 de enero de 2011, respectivamente,para que se pronunciara sobre las objeciones realizadas a la claridad y sustento de las reivindicaciones asi como

la ausencia de nivel inventivo.

CUARTO: Que Pa solicitante, mediante escritos radicados el 8 de enero de 2009, el 3 de mayo de 2010 y el 3 de mayo de 2011, atendiO de forma oportuna los requerimientos efectuados a la solicitud y presentO aclaraciones. De igual forma, con el escrito del 3 de mayo de 2010, la solicitante presentO nuevo capitulo reivindicatorio (FIs. 168 a 171), el cual se ajustO a las prescripciones establecidas en el artIculo 34 de la Decision 486.

PÆgina 1 de 15
Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Plsos 2, 5, 7y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000
Fax: 5870284. Linea 01 8000-91 01 65
Web: www.sic.pov.co e-mail: lnfo(asic.pov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
SU’ERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA V COMERCIO

RESOLUCIÔ N° 79469
Por ía cual Se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

De otro lado, con los escritos del 8 de enero de 2009 y del 3 de mayo de 2011 la solicitante presentó solicitud para dos (2) divisionales, las cuales, luego de verificar los requisitos exigidos en el artIculo 36 de Ia Decision 486, fueron aceptadas para trÆmite bajó los expedientes: 05-102278A y 05-10227813, respectivamente.

Finatmente, mediante escrito del 2 de jun10 de 2009 se presentO sustituciôn de poder a la doctora Dilia Rodriguez D’Aleman, la cual se encontrO que reunia los requisitos legates.

QUINTO: Que segün to dispuesto en el articulo 14 de la Decision 486 expedida por la . Comn de Ia Comunidad Andina se otorgarÆn patentes "(...) para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de ía tecnologfa, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicaciOn industrial".

SEXTO: Que las nuevas reivindicaciones 1 a 23, contenidas en los folios 168 a 171, 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 es la necesidad de obtener una composición farmacØutica sólida adecuada para administraciOn oral de un agonista del receptor SIP (pag. I; Fl. 7)

Para resolver este problema tØcnico la solicitud en estudio proporciona una composiciOn farmacØutica sOlida para administraciOn oral que comprende el agonista del receptor SIP 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil] propane-I,3-diol y un alcohol de azücar.

6.2. Determinación del estado de la tØcnica

6.2.1. Fecha determinantepara el anÆlisiscomparativo.

La fecha de presentaciôn de la primera solicitud db patente de la cual se reivindica prioridad es el 8 de abril del 2003, que corresponde. a la solicitud estadounidense No. 60/461,215.

La fecha de prioridad fue tenida en cuenta pare el examen de patentabilidad, segün

PÆgina 2 de15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000 Fax: 5870284. Linea 01 8000-9101 65
Web: w,w.sic.ciov.co e-mail: info(sic.gov.co

Bogota D.C. - Colombia

Im

-

t -

eo?

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUClN.N0 79469
Por là cual se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

kobra a folio 206 del expediente enestudlo.

6.2.2: Dodumentos del estàdo de la tŒcnica

Consultadas las fuentes de informaciôn con que se cuenta, se encontraron Ios, siguientes documentos, anteriores a la fecha de la prioridad invocada y relacionados con Ia materia de la solicitud en eØtudio:

No. Documento Titulo Fecha de publicación

2-aminopropane-I,3-diol

Dl ’ EP1002792 compounds, medicinal use 24-05-2000 thereof,and intermediates in
synthesizing the same.

Medicinal, compositions

containing 2-amino-2-[-2-(4- D3 EPI 050301 08-11-2000 octylphenyl)ethyll propane-I,3-

diol

6.2.3 lnformación derivada de los antecedentes

E! documento EP10027921 (en adelante Dl) divulgaun compuesto de formula (I) que muestra acción inmunosupresora y composiciones farmacØuticas que 10 contienen con vehIculos farmacØuticamente aceptables, el cual es usado en la prevencion o supresión de rechazo de ôrganos o trasplante de mØdula ôsea y en el tratamiento de enfermedades autoinmunes (resumen Dl; Fl. 98).

El documento EP10503012 (en adelapte D3) divulga una composiciOn farmacØutica, polvo liofilizado, que contiene 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil] propane-1,3-diol o una sal de Øste y ciclodextrina, opbionalmente un sacÆrido comomanitol, la cual es usada para la supresión del rechazo en Organos 0 trasplante de mØdula ósea y en tratamiento

1 httD://worldwide. espacenet.com/ searchResults?NUM=ep1002792&DB= EPODOC&Iocale= en_ EP & S T=number&compact=false
2 http://worldwide. E spacenet. óoml search Results? N U M= epi 002792 &DBEPODOC & locale =en - EP&ST=um ber&compact=falsŁ
P6gipa3de15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
iL Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000

Fax: 5870284. Lines 018000-910165 -

Web: www.slc.gov.co e-mail: lnfosic.pov.co

Bogota D.C. -Colombia

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA,DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCI6IN0, 79469
For la cual se doniega una patente de invenciOn

Rad. PCTI05-102278

inmunosupresor den enferrnedades autoinmunes (resumen 03; Fl. 148, pÆg. 3, pÆrrafo 18; Fl. 149).. .

63. Nivel inventivo.

Segün lo dispuesto, en el artIculo 18 de la Decision 486 "Se considerarÆ que una ,invención tiene fivel inventivo, si para una persona del oficio norma/monte versada en Ia materia tŁcniça correspondiente, esa invenciOn no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de ía tØcnica "

El estado de la tØcnica, al tenor de lo dispuesto en el articulo 16 de la misma DecisiOn, comprende "todo Jo que, taya sido accesible al pUbilco, por una descripciOn escrita u oral, utilizaciOn, comerciallzaciOn o cualquier otro medlo antes do Ia fecha de. presentaciOn do la solicitud de patente o, en su caso, do Is prioridad reconocida".

El Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina recientemente ha dicho sobre este

requisito, lo siguiente:

"[..j este requisito ofrece a! examinador la posibilldad de determinar si con los, conocimientos tOcnicos que exist1an al momento do Ia invención, se hubiese’
podido lIegar de manera evidente a Ia misma, 0 SI eI resultado hubiese sido obvio
para un experto media en ía materia de que so trate, es decir, para una persona.
del oficio y normalmente versada en la materia tØcnica correspondiente.

En este orden de ideas, so puede conc!uir quo una invención gaza de nivel inventivo cuando a los ojos do un experto media ei ci asunto do quo so trate, so necesita alga mÆs quoIa simple aplicación do los conocimientos tôcnicos en la

materia para iegar a ella, es decir, quo do conformidad con ci estado de la ’ tØcnica el invento no es consecuencia clara y dirocta do dicho estado.
Este Tribunal, al respecto, manifiosta quo: ’el inventor debe reunir los mOritos quo
le permitan atribuirse una patente, solo si/a invenciOn fruto de su investigaciOn y desarroio creativo constituye "un saito cualitativo en ía elaboraciOn do ía regla tØcnica", actividad intolectual, minima quo permitirÆ que su invenciôn no sea evidente (no obvia) del estado de Ia tØcnica.

Proceso 095-IP-201 0..

P6gina4de15
Sede Contrp: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN’Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 5870000
Fax: 5870284. Linea 018000-910165
Web: www.sic.pov.co e-mail: lnfotsic.ov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMRCIO

RESOLUCIOIIi N° 79 469
Por la cuaf se deniega una patente de invención

Rad. PCT/05-10227f

De acuerdo a Ic mencionado, esta Oficina determina que las composiciones farmacØuticas reivindicadas carecen de nivel inventivo, como quiera que para el tØcnico de nivel medic versado en la materia la obtenciôn de las mismas es obvia a partir del conocimiento brindado por las anterioridades Dl y D3.

En efecto, realizando una comparaciôn de las caracteristicas tØcnicas esenciales frente a las de las anterioridades DI y D3 se obtiene la siguiente tabla comparativa:

CaracterIsticas esenciales D3 Dl ComposiciOn farmacØutica, Composición farmacØutica, Composicion
sOlida,, que comprende: que comprende: farmaceutica, sôlida
como polvos, granulos,
tabletas, capsulas que
comprende:

Un agonista del receptor El agonista del receptor Un agonista del receptor SIP: 2-amino-2-[-2-(4- SIP: SIP, de formula(l). octilfeniI)etil] propane-1,3- 2-amino-2+2-(4-

diol 0 una sal octilfenil)etil] propane-1,3-
farmac6uticamente diol 0 SI.J sat clorhidratô.
aceptable del mismo.
Un alcohol de azUcar

seleccionado de: manitol, D-manitol, D- xilitol Manitol, maltitol maltitol, xilitol, inositol,
lactitol mezclas de estos.

Forma sôlida para Liofilizado en polvo para

administración parenterat Forma sôlida para

administración oral administración oral

Visto lo anterior, y teniendo en cuenta que la reivindicación I se refiere a una composiciOn farmacØutica sólida para administraciôn oral, que comprende: el agonista" del receptor SIP 2-Æmino-2-[-2-(4-octitfenil)etil] propane-I,3-diol o una sat farmacØuticamente aceptable del mismo y un alcohol de azUcar, se tiene que el estado de Ia tØcnica mÆscercano corresponde a los documentos Dl y D3.

En efecto, et documento D3 divülga una composiciOn farmacØutica en forma de polvo liofilizado, que comprende el compuesto agonista del receptor SIP: 2-amino-2-[-2-(4-

136gina 5 de 15
Sede Cenffo: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7y 10 Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 5870000 Fax: 5870284. Linea 018000-91 01 65
Web: www.sic.aov.co e-mail: lnfosic.aov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA V COMERCIO

RESOLUCIÔN No 79469
Por Ia cual se deniega una patento de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

octilfenil)etilj y Lin sacÆridocomomanitol o xilitol, (pÆg. 8ejemplos 3; Fl. 151), la cual es usada para la supresión del rechazo en organos o trasplante de mØdula ósea y en el tratamiento inmunosupresor de enfermedades autoinmunes (pag. 3, pÆrrafo 18; Fl. 149). AdemÆs, Østeindica que el principio activo puede estar entre 0.01 y 20% y que el sacÆrido, comoalcohol de, azücar, puede estar entre.1 a 100 partes por parte en peso del activo (pÆrrafo 13y 15, pags. 3 y 4; FIs. 149 y 150).

’La diferencia entre la invención, definida en la reivindicaciôn 1, y la composición de D3, consiste en que en la presente solicitud es una forma de dosificación sôlida para administraciôn oral del activo 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etiI] propano-1,3-diol.

A su vez, Dl ensena formas de dosificaciôn sólida (composiciones farmacØuticas) para administración oral en forma de: polvos, granulos, tathetas, cÆpsulas de uncompuesto, agonista del receptor SI P de formula (I), que muestran acción inmunosupresora y que incluyen vehlculos farmaôØuticamente aceptables, tales como un alcohol de azücar (manitol, maltitol) y un lubricante como el estearato de magnesio (resumen; FIs. 98 y 99). AdemÆs, en este mismo documento ya era divulgado el compuesto 2-amino-2-[-2-(4-octilfenhl)etil] propano-1,3-diol (antecedentes de la invenciôn, pÆg. 2, pÆrrafo 2, en’ el documento ES 2126658 familia del W094/08943) (pag. 7, lineas 28 a 29; FIs. 202, pÆg. 16, lineas 39 a 40; Fl. 202, pÆg.129, lineas 19-22 y pªg. 223, ej. Capsula; Fl. 203) y composiciones que lo contienen, en forma de capsulas.o tabletas, as[ como tambiØn en forma de liofihizado.

El efecto tØcnico que Iogrà la difØrencia consiste en 1a necesidad de proporcionar una composipiOn farmacØutica’ sOlida. adecuada para adpiinistraciOn oral del agonista del receptor SIP del activo 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil]propano-1,3-diol.

El problema tØcnico objetivo de esta solicitud consiste en cômo obtener una composiciOn farmacØutica sOlida adecuada para administraciOn oral del agonista del receptor SI P del activo 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil] propano-1,3-diol.

Teniendo en cuenta lo anterior, y de acuerdo con la enseæanzasde Dl, en cuanto a que ya eran conocidaslasformulaciones sOlidas para administrar via oral el compuesto: ’2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil] propano-1,3-diol (antecedentes de la invenciOn, pÆg. 2, pÆrrafo2, en el documento ES 2126658 familia del W094/08943) (pag. 7, lineas 28 a 29; FIs. 202, pag. 16, Imneas 39 a 40; Fl. 202, pag. 129, lineas 19-22 y pÆg. 223, ej. Capsula; Fl. 203) y que eI mismo documento Dl enseæacomposiciones farmacØuticas

PÆgina 6de 15
Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutadoc 5870000
. Fax: 5870284. Linea 018000-910165
Web: www.sic.pov.co e-mail: lnfosic.Qov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPCJBUCA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÔ’N No 79469
Por la cual se deniega una patente ide invenciOn

Rad. PCT/05-102278

para administrar en forma oral, tales como tabletas: cÆpsulas de otros compuestos derivados de 2-aminopropano-I,3-diol, los cuales tambiØn son agonistas del receptor SIP, que incluyen vehiculos farmacØuticamente aceptables, tales como un alcohol de .azücar (manitol, maltitol), el tØcnico de nivel medio versado en la materia estarIa motivado a desarrollar una formulaciôn de tipo sôliclo para administraciôn oral, tales como tabletas y. cÆpsulasdel compuesto 2-amino-2-[-2-(4-octilfenil)etil] con un alcohol de azücar, de acuerdo a las enseæanzas deDI, teniendo en cuenta que la combinaciOn de dicho activo cop una alcohoFde azücar como el manitol ya era conocida en DI en forma de polvo liofilizado.

DL- manera tal rnaæera, la solución propuesta en la reivindicaciôn I al problema tØcnico planteado en esta solicitüd es obvia y no tiene Nivel Inventivo. De igual forma, las reivindicaciones dependientes 2 a 23 no agregan ninguna caracteristica inventiva a la solicitud y, por tanto, se cóncluye que estas tampoco son inventivas.

6.4. Sobre la respuesta de la solicitante

Con relaciôn a los argumentos de la solicitante, allegàdos con motivo de la notificación .de fondo, se determinó que:

En cuanto a las objeciones de claridad, la solicitante menciona que "las caracteristicas descritas en las reivindicaciOn 5 a 9 permiten hacer una distinciOn entre el grado de un manitol y el grado de otros manitoles, es decir, dichos rasgos si,ven para caracterizar un manitol especIfico. Tales caracteristicas son conocidas y claras para Ia persona versada en la materia." Y agrega, 7...1 nos 1perinitimos manifestar que las caracterIsticas de las reivindicaciones independientes definen las modalidades especIficas de la invenciOn y por Jo tanto, las caracteristicas del manitol coma se describen en las reivindicaciones 5 a 9, son rasgos caracteristicos del manitol, el cual, es en sI, un rasgo caracterIstico de la composiciOn reivindicada" (pags. 3 y 4 de la respuesta al Oficio No. 00623; FIs. 185 y 186).

Finaliza mencionando que ’TeJn consecuencia las reivindicaciones 5 a 9y 19 a 20 al ser reivindicaciones que dependen finalmente de la reivindicaciOn 1, pueden hacer referenda a caracteristicas particylares de un elemento constitutivo de Ia cornposiciOn farmacØutica definida en la reivinçlicaciOn independiente 1, en este caso, caracterIsticas esenciales que deben cumplir el manitol y el ingrediente activo coma Jo son el tarnaæo de partIcula, la densidad aparente, el area superficial de Unico punto (manitol) y la

PÆgina7 de 15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5,7 y 10 Sods CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5570000 Fax: 5870284. Linea 016000-910165
Web: www.sic.aov.co e-mail: infosic.pov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio V
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPLJBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUClOiJ0 79469
Por ía cual se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

presentaciOn del ingrediente activo, como es en forma de pre-tamizado." (pÆg. 4 de la respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 186).

Al rØspecto, esta Oficina aclara a la solicitante que el tamaæode particula no es una caracteristica tØcnica esencial de la composicion sino que, por el contrarlo, es una caracteristica del manitol como excipiente. La anterior, acorde con la descripción de la presente solicitud, en donde se menciona que son adecuados manitoles comerciatmente disponibles, como el Parket M200 (pag., 21; Fl. 27) y tales caracteristicas del manitol son preferidas (Pero no esenciales) para obtener una composiciôn como la de la invención (pag. 20; Fl. 26). AsI mismo, tampoco es una caracteristica tØcnica esencial de la composicion, que el activo agonista del SIP sea pre-tamizado con una ma!Ia dada, coma quiera que 1esta es una caracteristica de un proceso mÆs no de una compoición. Igualmente, se recuerda que una composiciôn debe ser solo caracterizada por los elementos que la comprenden como son el agente activo, sus excipientes y sus proporciones.

Adicionalmente, debe tenØrse en cuenta que el manitol esta clasificado de acuerdo al tamaæo de particulasy asimismo varla su aplicabilidad en la industria farmacŁutica.

Ahora bien, en relaciOn con el nivel inventivo de la solicitud, la solicitante argumenta que no se encuentra de acuerdo con la afectaciOn hecha a la solicitud en vista del documento D3 combinado con DI. (pag. 5 de la respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 187).

Pe igual manera, afirma:?...] dado que escoger Ids posibles excipientes ofrecidos a Ia persona medianamente versada en la materia, es una acciOn bastante extensa, dicha persona no habria podido seleccionar ninguno de estos excipientes sin una fuerte motivaciOn para hacerlo. En consecuencia, tal motWaciOn no puede ser encontrada en ’las enseæanzas de las aterioridades citadas, como por ejemplo en el caso de 03." (pÆg.5 de la respuesta al Oficio No. 00623; A. 187).

AdemÆs, sostiene que "como es sabido por el Łeæorexaminador, el documento EP1050301 (D3) hace referenda Unicamente a qomposiciones liquidas, es decir, composiciones para inyecciOn, gotas oftÆlmicas,gOtàs nasa/es, gotas para los ofdos" infusiones, liquidos para administraciOn oral, liquidos para inhalaciOn, liquidos para lociones y demÆs (vºase por favor pÆrrafo 0017 de EP1050301)" (pag. 6 de la, respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 188).

PÆgina 8 de 15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10 Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador: 5870000 Fax: 5870284. Linea 01 8000-91 01 65

Web: www.slc.gov.co e-mail: infosic.ov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPIJBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIOI N0 79469
Por ía cual Se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

Respecto a D3, argumenta que dicho documento "1...1 afronta problemas relacionados con ia preparaciOn de una inyecciOn mejÆrada para las inyecciones que contienen FTY720 previamente descritas. Tales cQmposicionØs anteriormente descritas, comprenden el polietilenglicol como estabilizador, el cual es conocido para reducir Ia irritaciOn local y la hemólisis (vØase por favor el pÆçrafo 0004 de D3)" (pag. 6 de la respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 188). Finaliza mencionando que D3 Unicamente aplióa a soluciones liquidas. (pÆg.6 de!a respuesta aIOficio No. 00623; Fl. 188).

Erente a las anteriores argumentaciones, se advierte a la solicitante que aunque D3 enseæe composiciones liquidas, tales como composiciones para inyección, gotas oftÆlmicas,gotas nasales, gotas para los oldos, infusiones, liquidos para administración oral, liquidos para inhalaciôn, liquidos para lociones, tambi6n menciona composiciones sólidas del compuesto, 2amino-2-[2-(4- octilfenil)etil]propan-1,3-diol, como un polvo liofilizado, que contiene manitol, la cual se administra como soluciôn inyectable y no de manera oral como la composiciOn solicitada. Sin embargo, en la descripción de la presente solicitud se afirma que las composiciones, se pueden obtener tambiØn a travØs de procedimientos convencionales como la Iiofihización, lo cual muestra que entre las formas sôlidas de la reivindicaciôn 1, pueden estar dichos liofihizados (pag. 23, Fl. 29), indicando a una persona del oficio normalmente versada en la materia, la posibilidad de obtener otras formas sólidas del compuesto en mención.

Es decir, a partir de la informaciôn de los documentos referidos como estado de la tØcnica y de la información suministrada por la solicitante en la descripción, se concluye que se pueden desarrollar, a partir de las composiciones farmacØuticas conocidas, otras formas de presentaciOn de dichas composiciones de cuerdo a la via de administraciôn, sin que implique una altura inventiva, mÆsaün si la combinaciôn del activo 2amino-2-f2-(4- octilfenil)etil7propan-1,3461 con manitol es conocida en D3 (pag. 8, ejemplo 3; Fl. 151). Asi mismo, el tØcnico de nivel medlo versado en la materia conoce de ante mano que el manitol es ampliamente utilizado en la industria farmacØutica en el desarrollo de productos que van a ser administrados por via oraL4 Por lo tanto, contrario a lo afirmado por el solicitante, se concluye que si existe motivación suficiente en el arte previo para desarrollar Ia formulación para dministración tipo oral reclamada.

De otra parte, la solicitante sostiene que D3 no "[..j proporciona una soluciOn al problema tØcnico de Ia presente invenciOn. El alcohol de azUcar, tal como el manitol, es efectivamente mencionado en esta anterioridad, pero no es mencionado en el mismo

Handbook of pharmaceutical Excipients, pags. 424 a 427, mannitol (Fl. 144 a 147).
PÆgina9del5
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10 Sede CAN: Tr. 40A Na. 38-50 Conmutador. 5870000 Fax: 5870284. Linea 01 8000-91 01 65
Web: www.sic.ciov.co e-mail: lnfoslc.Qov.co

Bogota D.C. - Colombia

?OA
Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPCJBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCJO

RESOLUCIONN° 794 69
Por ía cual Se deniega una patentede invenciOn

Rad. PCT/05-102278

contexto, como se argumentO anteriormente, ni pala el mismo propOsito que en la presente invenciôn. En efŁcto, en D3 el alcohol de azücar se encuentra enlistado como uno de los posibles sacÆridospara ser empleados para el mejoramiento de la irritaciOn local (vØase las Ultimas lineas del pÆrrafo 0009 deD3). Mn mÆs, en D3 se muestra que una inyecciOn que contiene FTY720 ademØs comprende ciclodextrina y sacÆrido (principalmente alfa-ciclodextrina a! 0.1% y D-manitol a! 5.0 %) y tienen una propiedad hemolItica mÆs baja y no induce la irritación local (vØase por favor los Ejemplos experimentales I y2 de D3)" (pag. 7 de la respuesta al Oficlo No. 00623; Fl. 189).

En relaciôn con lo anteriormente afirmado, esta Oficina determina que el problema tØcnico de la presente invención se resuelve por la combinaciôn de D3 y Dl. Ademâs, aunque el alcohol de azücar (manitol) tenga otra funciôn, D3 si menciona que estos se pueden utilizar en proporciones entre I a 100 partes por parte en peso del activo (pªrrafo 13 y 15; Fl. 149 a 0150). AdemÆs, es del conocimiento comin5 que elmanitol se utiliza en la elaboraciôh de formas sôlidas, porque tiene el valor particular de no ser higroscôpico, es un buen diluente (10%-90%) en tabletas y liofilizados (20-90%), LademÆs de tener la propiedad de buena fluidez, la cual se imparte a los otros constituyentes en una composiciôn (pag. 427; Fl. 147).

Adicionalmente, es importante aclarar que cuando se estudian documentos del estado’ de la tØcnica no necesariamente se de-ben seleccionar los que solucionan el mismO problema tØcnico, sino aquellos que compartan el mayor nümero de caracteristicas tØcnicas esenciales. De igual manera,.y ya que las caracteristicas y propiedades fisicas y aplicaciones farmacØuticas del manitol son conocidas, es suficiente motivaciOn para una persona del oficlo normalmente versada en la materia, aplicarlas para la obtención de una composición como la reclamada, acorde con lo dicho en la descripción, respecto a que el manitol, se utiliza con el fin de ayudar a promover la distribuciôn uniforme del agonista del receptor de SIP, al mismo tiempo que mejora la capacidad de compresión y dureza de las tabletas (propiedades que ya se conocen en la ficha tØcnica del mencionado excipiente). Lo anterior, no obstante que se utilicen algunas caracteristicas (parÆmetros)definidas del manitol, las cuales no da evidencia de algün efecto tØcnico sorprendente en la composiciôn reivindicada.

Continua la solicitante su argumentÆciôn mencionando que "fijnc!uso si se combinara las enseæanzasde D3 con 10 reportado en D2 (EP1I95165) O con DI (EPI002792), la persona medianamente versada en ía materia tØdnica no habria podido llegar de

5lciem.
PÆgina10 de 15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2. 5, 7 y 10 Sede CAN: Ti. 40A No. 38.50 Conmutador 5870000 Fax: 5870284. Linea 01 8000-91 01 65
Web: www.sic.aov.co e-mail: info(sic.pov.co

Bogota D.C. -Colombia

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

It.

REPCJBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCHbN,NO 794
Por la cual so deniega una patente do invención

Rad. PCT/05-102278

manera evidente a ía presente invenciôn. En efecto, estos documentos no reportan una formulciOn que comprende un agonista del receptor SIP como el quo so define en la actual reivindicaciOn I y mucho menos, en asocio con un alcohol de azOcar. Sumado a /0 anterior, es claro qu el documento EPI 195165 (D2) hace referenda esfingosinal-fosfato (SIP) y que. DI tambiØn se refiere a un agonista del receptor SIP el cual tiene una estructura completamente distinta a! compuesto FTY720 como so muestra a continuaciö n p. r medlo de las fiechas(ver graficas pÆg. 9; Fl. 191). En ese orden de ideas, no se podrIa esperar que el SIP ylos agonistas del receptor SIP de DI, tuvieran las mismas propiedades qulmicas que el compuesto FTY720" (pags. 8 y 9 de la respuesta al Oficio No. 00623; FIs. 190 y 191).

Adiciànalmente, menciona que ’T...Jlo que estÆhacindo el seæor examinador es una selecciOri entre todos los posiblos excipientes que son citados. La persona medianamente versada en la materia no habria podido hacer tal selección, dado que no existe ninguna sugerencia para seleccionar un alcohol do azUcar, y mucho menos manitol, y escoger el estearato do magnesio entre tódos los posibles excipientes para preparnr una formulación sólida adecuada para ía administraciOn oral" (pag. 10 de la respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 192).

Sobre Ia anterior, este Despacho advierte a la solicitante que 02 no se tomô en cuenta para afectar el nivel inventivo de la presente solicitud. Adicionalmente, se reitera que los documentos citados si afectan el nivel inventivo, tal y como se explicó claramente en el numeral 6.3 de la presente Resoluciôn.

De igual manera, es del caso aclarar que los compuestos divulgados en Dl, sI guardan una relaciôn estructural con el de la presente solicitud, porque, ademÆs de ser inhibidores del SPI, son derivados del 2-aminopropano-1,3-dioles. De igual manera, ya se explicó anteriormente como Dl, junto con D3, afecta el Nivel inventivo, toda vez que Dl enseæa formas de dosificación sôlida (composiciones farmacØuticas) para jadministración oral en forma de: polvos, grÆnulos,tabletas, capsulas de un compuesto agonista del receptor S1 P, do formula(l), que muestran acción inmunosupresora, las cuales incluyen vehiculos farmacØuticamente aceptables, tales como un alcohol de azücar (manitol, maltitol) y un lubricante como el estearato de magnesio (resumen DI.. Fl. 98 y pÆg. 19, parrafo 181; Fl. 99) en donde ya era divulgado el compuesto 2-amino-2-[-2-(4-octilfenhl)etil] propano-I,3-diol y composiciones que la contienen, en forma de capsulas o tabletas. Asi mismo, se explicó coma 03, motiva al tØcnico de nivel medio versado en la materia a la obtenciön de otras formas sólidas del compuesto en

PÆgina11 de 15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10 Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000 Fax 5870284. Linea 018000-910165
Web: www.sic.aov.co e-mail: infosic.aov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria

4
y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERlNTENDENClA DE INDUSTRIA V COMERCIO

RESOLUCI$N NO 79 46 9
Por ía cual so deniega una patente de invencjOn

Rad. PCT/05-102278

menciôn.

Por lo tanto, contrario.a lo que afirma la solicitante, se concluye que Si existe motivación suficiente para desarrollar la formulaciôn para administración tipo oral reclamada a partir de las enseæanzas deDI y D3.

Respecto a DI, la solicitante Ærgumenta que dicho documento no divulga "una fomiulaciôn que comprenda FTY720 y mucho menos, el asocio de dicha sustancia con un alcohol de azUcar. EstØ documentohace referenda a un agonista del receptor SIP,"" el cual tienO una estructurà totalmente distinta a Ia estructura del FTY720. AUn mas, Dl menciona una gran lista de posibles excipientes relacionados con composiciones orales sOlidas, principalmente ’sucrosa, lactosa, azUcar de celulosa, manitol, maltitol, dextran, airnidones, agar, alginatos, quitozanos, pectinas, gprnas tragacanto, gorna arØbiga, gelatinas, colagenos, caseina, albUmina, polimeros y gliceridos sintØticos o senil-sintØticos’ (vØase el pÆrrafo 181). Por Jo tanto, en el caso de Dl, Ia persona medianarnente versada en ía materia no habrIa podido encontrar alguna motivaciOn para seleccionar el manitol entre todoslos excipientes citados" (pag. 10 de la respuesta al Oficio No. 00623; Fl. 192).

Frente a Ia anterior, se aclara a la solicitante que Dl, en la pÆgina 2 pÆrrafo2, sI menciona el compuesto 2amino-2-[2-(4- octilfenil)etil]propan-1,3-diol (F1Y720). Asi mismo, en este documento ya era divulgado el documento W094/08943 (equivalente, ES 2126658, pag. 7, lineas 28-29; Fl. 202; pÆg. 16, lineas 39-40; Fl. 202; pÆg. 129, lineas 19-22 y pag. 223; Fl. 203, ejemplo cÆpsiila) en donde ya se divulgaban composiciones que contienen el compuesto 2amino-2-[2-(4- octilfenil)etil]propan-1 13-diol, para administrar oralmente, es decir, Dl ya enseæaba composicionesen forma de polvos, granulos, tabletas, capsulas de un compuesto agonista del receptor Si de formula (I), los cuales presentan acciOn inmunØsupresora e incluyen vehiculos farmacØuticamente aceptables tales como un alcohol de aztcar (manitol, maltitol). Vale la pena mencionar que el compuesto de formula (I) en Dl, corresponde al mencionado en Ia,descripción de la presente solicitud (pag. 4; Fl. 10, nombrado come fOrmula (II), en donde se menciona que tambiØn, puede ser utilizaçlo para lograr las composiciones reclamadas. Por Ia tanto, a partir de la misma informciOn que presenta el solicitante en la descripciôn se rÆtificà quØ la cómbinaôiOn de’ D3 con Di si permite derivar el objeto reclamado en el Ultimo capitulo reivindicatorio.

En torno a la estabilidad mejorada de Ia presente invención, la solicitante sostiene que los inventores han obtenido sustento de dicha mejora y allega la tabla 1. (päg. 12 de la

PÆgina 12de 15
Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 Pleas 2, 5,7 y 10 Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000 Fax: 5870284. Linea 018000-910165

Web: www.sic.pov.co e-mail: Infosic.gov.co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÔN NO 79 46 9
Por la cual Se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

respuesta al Oflcio No. 00623; 171. 194).

Acerca del anterior argumento, esta Oficina difiere de las afirmaciones de la solicitante pot cuanto de la tabla aflegada se concluye que las composiciones del compuesto 2 amino-2-[2-(4- octilfeniIetiI]propan-1,3-diol (FTY720) con manitol y del mismo

compuesto con Avicel (celulosa microcristalina), tuvieron el mismo comportamiento, debido aque presentaron un resultado igual encuanto a la degradación del compuesto (% de degràdación de 0.2%) al ser sómetidas a las mismas condiciónes (mÆsextremas:

50°C, H.R 75% por dos semanas en hümedo). Asi mismo, el resultado de 0.5 % de degradaciôn para la mezcla del compuesto y avicel en seco, a temperatura de 50°C,

H.R 75% pot dos semanas, es mayor al que se obtuvo para la mezcla del compuesto y avibel en hUmedo, a temperatura de 50°C, H.R 75% por dos semanas, que fue de 0.2%,
lo- cual no es coherente dada que la humedad contribuye a la degradacion de los principios activos.

Adicionalmente, en la descripción tambiØn se menciona que las composiciones reclamadas pueden comprender uno o mÆsexcipientes como vehiculos aglutinantes o diluyentes, en particular celulosa microcristalina (AvicØl) (pags. 21 y 22; Fl. 27 y 28).

No obstante las inconsistencias observadas por esta Oficina en la tabla allegada, tampoco se presentó un protocolo que contemple, entre otras variables, el nümero de. datos presentados, nimero de muestras tomadas, tipo de compuesto de degradacion que se generan, entre otras., para que dicho estudlo de estabilidad tenga una validØz estadistica respecto a que las composiciones del compuesto 2amino-2-[2-(4-octilfenil)etil]propan-1,3-diol (F1Y720) con manitol y del mismo compuesto con Avicel (celulosa microcristalina) se comportaron de la misma manera ya que presentaron un resultado igual en cuanto a la degradacion del compuesto (% de degradacion de 0.2%), al ser sometidas a las mismas condiciones (mÆs extremas: 50°C, H.R 75% par dos semanas en hümedo). Asi mismo, el resultado de 0.5 % de degradaciôn para la mezcla del compuesto y avicel en seco, a temperatura de 50°C, H.R 75% par dos semanas, es mayor al que Se obtuvo para la mezcla del compuesto y avicel en hCimedo, a temperatura de 50°C, H.R 75% por dos semanas, que fue de 0.2%, lo cual no es coherente, dado que la humedad contribuye a Ia degradación de los principios activos.

En relación con el Anexo 1, la solicitante tamblØn mØnciona que se demuestra que "el agente activo (FTY720) no as compatible con Øxcipientes o mezcla de los mismos, Ia cual no habrIa sido evidente para una persona medianamente versada en la materia.

PÆgina 13de 15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Plsos 2, 5, 7 y 10
Sede CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador. 5870000
- Fax: 5870284. Linea 018000-910165
Web: www.slc.aov.co e-mail: infosic.gov.Co

Bogota D.C. - Colombia

Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÔN No 79 46 9
Por la cual se deniega una patente de invenciOn

Rad. PCT/05-102278

En efecto, en Ia tabla 2 (Fl. 212) se muestran las mediciones de impurezas para diferentes composiciones.

Como se puede apreciar de Ia tabla anterior extralda del anexo 1, la sustancia FT’(720 no as compatible con muchos excipientes, es decir, conduce a la formación do impurezas o productos do degradaciOn cuando se mezcla con estos excipientes’

Y agrega, "[...] do la tabla 2 so puede extractar que là compatibilidad de excipientes no puede ser predecible ni anticipada de manera evidente a partir do simples sugerencias do óombinaciones realizadas en las anterioridades cithdas"

Frente a lo anterior, esta Oficina acepta que el compuesto presente diferentes comportamientos don distintos excipientes o mezclas de estos, Sin embargo, las composiciones de la tabla2, Fl. 195, no incluyen un alcohol de azücar, por lo tanto no es sustento que demuestre la existencia de Nivel Inventivo, en la composición reclamada.

,Adicionalmente lo que se demuestra es que lo reivindicado corresponde a un trabajo de pre-formulaciôn rutinarlo en el campo farmacØutico en el desarrollo de formulaciones.6

En conclusion, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtüan de manera alguna las objecionesa la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: benegar la patente de invenciOn a la creación titulada "COMPOSICIONES FARMACEUTICAS SOLIDAS QUE COMPRENDEN UN AGONISTA DE RECEPTOR SIP. Y UN ALCOHOL DE AZUCAR".

IL

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resoluciOn

6 Pharmaceutical dosage forms Vol. 1, pags. 83 a 100, el enfoque experimental de desarrollo de un prototipo debe contener’ formulaciôn tableta, establecimiento dØ limites de proceso del exciplente y preliminares, estudios de biodisponibilidad, desarrollo de los datos de estabilidad para las formulaclones de tabletas, desarrollo de la validaciôn de datos para las formulaciones de tabletas. Cdmponentes del comprimido y aditivos: A. ingredientes activos, B. ingredientes no activos o excipientes tales como Mannitol USP, lactosa.
PÆgina14de15
Sede Centro: Carrara 13 No. 27-00 Pisos 2, 5, 7 y 10 Sods CAN: Tr. 40A No. 38-50 Conmutador 5870000 Fax: 5870284. Linea 01 8000-91 01 65
Web: www.sic.gov.co e-mail: info(sic.pov.co

Bogota D.C. - Colombia

U