

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 30 de mayo de 2013, con el N° 13-133022-00000-0000, por la sociedad Novartis AG., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2011/062837 del 1 de diciembre de 2011.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 680 el 29 de noviembre de 2013, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 11620, notificado por fijación en lista el 16 de septiembre de 2014, se requirió a (los) señor(es) solicitante(s) en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que (los) señor(es) solicitante(s) mediante escrito radicado bajo el N° 13-133022-00007-0000 el 10 de diciembre de 2014, respondió (respondieron) oportunamente el requerimiento formulado y presenta(n) nueva(s) reivindicación(es) 1 a 11 que reemplaza(n) la(s) originalmente presentada(s), atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486. De igual forma, la solicitante modifica el título de la solicitud a: "COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN 2-METIL-2-[4-(3-METIL-2-OXO-QUINOLIN-3-IL-2,3-DIHIDRO-IMIDAZO-[4,5-C]QUINOLIN-1-IL)-FENIL]-PROPIONITRILO"

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."

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

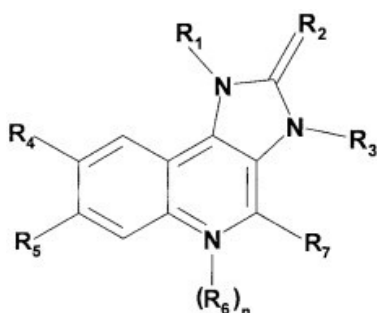
Rad. PCT/13-133022

SEXTO: Que la(s) reivindicación(es) 1 a 11, no cumple(n) 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 composiciones farmacéuticas que comprendan 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición farmacéutica, la cual comprende gránulos que comprenden: (a) un compuesto de la fórmula (I); (b) por lo menos un tensioactivo no iónico que es la Vitamina E TPGS, en una cantidad entre 15-80% en peso de la composición, y (c) por lo menos un agente mejorador de disolución seleccionado a partir de polietilenglicol, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores.



6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 3 de diciembre de 2010, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006/122806	Imidazoquinolines as lipid kinase inhibitors	23/Junio/2006
D2	WO2008/027523	Salts of benzimidazolyl pyridyl ethers and formulations thereof	06/Marzo/2008

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

D1¹ divulga (Tabla 1, ejemplos 7 y 86; págs. 36-37; reivindicaciones 2 y 5) los compuestos 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo y 8-(6-metoxi-piridin-3-il)-3-metil-1-(4-piperazin-1-il-3-trifluoro-metil-fenil)-1,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-2-ona y, composiciones farmacéuticas que lo comprenden.

D2² divulga composiciones farmacéuticas conformadas por gránulos que comprenden un principio activo, TGPS y polietilenglicol y un proceso para elaborarlas (Ejemplo 4).

6.3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: *“Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.*

En el presente caso, la composición reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la(s) reivindicación(es) 1 a 9 está(n) referida(s) a: “Una composición farmacéutica, la cual comprende gránulos granulados en fusión....” (Radicado N° 13-133022-00007-0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la(s) reivindicación(es) 1 a 9, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
Composición farmacéutica, la	Composición farmacéutica,	Composición farmacéutica,

1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2006122806A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20061123&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

2 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008103636A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20080828&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

cual comprende gránulos granulados en fusión que comprenden:	elaborada por granulación, la cual comprende (págs. 36-37):	en forma de gránulos
Un compuesto terapéutico que es 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]quinolin-1-il)-fenil]propionitrilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.	1 a 99% del activo que puede ser el compuesto terapéutico que es 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]quinolin-1-il)-fenil]propionitrilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. (Pág. 36 a 37, Pág. 46, ejemplo 7)	Un agente activo
Por lo menos un tensoactivo no iónico que es la vitamina E TPGS, en una cantidad que es del 15 al 80% en peso de la composición; y	Excipientes tales como polietilenglicol, emulsificantes y solubilizantes (Pág. 36, último párrafo a Pág. 37, primer párrafo)	TGPS
Por lo menos un agente mejorador de disolución seleccionado a partir de polietilenglicol, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores		PEG 8000 (Ejemplo 4, composición 7)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga composiciones farmacéuticas, que se pueden elaborar por granulación, que comprenden compuestos como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo (Pág. 36, último párrafo hasta la pág. 37 primer párrafo, y pág. 46, ejemplo 1). La composición puede estar en forma de una cápsula y puede comprender de 1 a 99% del agente activo. La formulación comprende excipientes incluyendo polietilenglicol, emulsificantes y solubilizantes (Pág. 36, último párrafo hasta la pág. 37 primer párrafo).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la composición del documento D1 consiste en que la anterioridad no divulga de manera explícita que la composición corresponda a granulos por fusión que tengan vitamina E TPGS y PEG.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a la composición reclamada en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades superiores en comparación con las composiciones del estado de la técnica cercano que ya resolvía la necesidad de formulaciones que permitieran la administración del agente 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo u 8-(6-metoxi-piridin-3-il)-3-metil-1-(4-piperazin-1-il-3-trifluoro-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

metil-fenil)-1,3-dihidro-imidazo- [4,5-c]-quinolin-2-ona. De igual forma, el uso de vitamina E TPGS y PEG en las formulaciones para estabilizar y solubilizar un activo ya es una metodología ampliamente conocida y aplicada en la industria farmacéutica, por lo cual los resultados presentados por la solicitante mediante los ejemplos 5, 6 y 7 no se consideran inesperados ni mucho menos sorprendentes.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar una composición farmacéutica que comprenda el agente 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo u 8-(6-metoxi-piridin-3-il)-3-metil-1-(4-piperazin-1-il-3-trifluoro-metil-fenil)-1,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-2-ona, alternativa a la conocida en el estado del arte.

Sin embargo, la utilización de vitamina E TGPS y polietilenglicol o poli óxido de etileno en formulaciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo para mejorar el perfil de disolución del principio activo está divulgada en el documento D2, que enseña que las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la mezcla de TGPS y polietilenglicol (Ejemplo 4, composición 7) y que las composiciones que comprenden gránulos que comprenden el principio activo en forma de sal, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la mezcla de TGPS y polietilenglicol y se encuentran en forma de base libre (Ejemplo 4, composición 5).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría vitamina E TGPS y polietilenglicol, tal como lo enseña el documento D2, en las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un el principio activo 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3- dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo u 8 divulgados en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual, la presente solicitud se considera una aplicación de una tecnología conocida como lo es la preparación de gránulos que provean un adecuado perfil de solubilidad la cual fue divulgada previamente en D2 y en consecuencia se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 9 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

La reivindicación 10 consiste en un proceso para la elaboración de la composición farmacéutica de la reivindicación 1, el cual comprende los pasos de:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

- (a) combinar o mezclar el compuesto terapéutico de la fórmula (I), y por lo menos un tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS, en una cantidad en el intervalo del 15 a 80% de la composición, y por lo menos un agente mejorador de la disolución seleccionado a partir del grupo que consiste en PEG, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores.
- (b) granular la mezcla utilizando una extrusora u otro equipo adecuado mientras que se calienta la mezcla hasta una temperatura del producto por debajo del punto de fusión de la vitamina E TPGS; y
- (c) enfriar los gránulos hasta temperatura ambiente.

Tabla 2

Características esenciales	D1	D2
Proceso para la elaboración de la composición farmacéutica de la reivindicación 1, el cual comprende los pasos de:	Composición farmacéutica, elaborada por granulación, la cual comprende (págs. 36-37):	Proceso para elaborar una composición farmacéutica, la cual comprende gránulos que comprenden (Ejemplo 4):
(a) combinar o mezclar el compuesto terapéutico de la fórmula (I), y por lo menos un tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS, en una cantidad en el intervalo del 15 a 80% de la composición, y por lo menos un agente mejorador de la disolución seleccionado a partir del grupo que consiste en PEG, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores.	Compuestos de fórmula (I) como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo (ejemplo 7)	Mezclar el principio activo con los demás excipientes
(b) granular la mezcla utilizando una extrusora u otro equipo adecuado mientras que se calienta la mezcla hasta una temperatura del producto por debajo del punto de fusión de la vitamina E TPGS; y	No se menciona	Granular
(c) enfriar los gránulos hasta temperatura ambiente	No se menciona	Secar los gránulos a temperatura ambiente

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 10 porque divulga composiciones farmacéuticas, que se pueden

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

elaborar por granulación, que comprenden compuestos como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y el proceso del documento D1 consiste en que la anterioridad no divulga de manera expresa que durante el proceso de fabricación se utilice vitamina E TPGS y PEG o polióxido de etileno.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja al proceso reclamado a la composición obtenida a través del mismo ya que no se divulgan propiedades superiores en comparación con las composiciones del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar una proceso para elaborar una composición farmacéutica que comprenda el compuesto 2-metil 2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo alternativo al conocido en el estado del arte.

Sin embargo, el proceso para elaborar granulados que implica la utilización de vitamina E TGPS y polietilenglicol o poli óxido de etileno para mejorar el perfil de disolución del principio activo está divulgada en el documento D2, que enseña un proceso para elaborar dichas composiciones que comprende los pasos de combinar o mezclar el principio activo y los excipientes, granular la mezcla y dejar los gránulos a temperatura ambiente (pág. 35), donde las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la mezcla de TGPS y polietilenglicol (Ejemplo 4, composición 7) y que las composiciones que comprenden gránulos que comprenden el principio activo en forma de sal, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la mezcla de TGPS y polietilenglicol y se encuentran en forma de base libre (Ejemplo 4, composición 5). Ahora bien, de lo soportado en el capítulo descriptivo no se encuentra que el hecho de calentar la vitamina E TGPS le proporciona efecto técnico alguno al proceso o a la composición, y es evidente que el proceso de mezclada genera energía por fricción que incrementa la temperatura de la mezcla, por lo que la invención ahora reclamada carece de nivel inventivo.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, aplicaría el proceso divulgado en documento D2 incluyendo vitamina E TGPS y polietilenglicol, a las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo básico como los compuestos de fórmula (I) como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo divulgadas en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 10 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 10 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 11 consiste en un proceso para la elaboración de la composición farmacéutica de la reivindicación 1, el cual comprende los pasos de: (a) dividir el tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS en una primera porción y una segunda porción

(b) combinar o mezclar el compuesto terapéutico de la fórmula (I), la primera porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS y el agente mejorador de disolución seleccionado a partir del grupo que consiste en PEG, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores.

(c) calentar la segunda porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS

(d) granular la mezcla utilizando una extrusora u otro equipo adecuado mientras que se agrega lentamente la segunda porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS a la mezcla, y mantener una temperatura del producto por debajo de 38°C, y

(e) enfriar los gránulos hasta temperatura ambiente.

Tabla 3

Características esenciales	D1	D2
Proceso para la elaboración de la composición farmacéutica de la reivindicación 1, el cual comprende los pasos de:	Composición farmacéutica, elaborada por granulación, la cual comprende (págs. 36-37):	Proceso para elaborar una composición farmacéutica, la cual comprende gránulos que comprenden (Ejemplo 4):
(a) dividir el tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS en una primera porción y una segunda porción	No se menciona	No se menciona
(b) combinar o mezclar el compuesto terapéutico de la fórmula (I), la primera porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS y el agente mejorador de disolución seleccionado a partir del grupo que consiste en PEG, poli-óxido de etileno, y cualquier combinación de los anteriores.	1 a 99% del activo que puede ser el compuesto terapéutico que es 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]quinolin-1-il)-fenil]propionitrilo; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo. (Pág. 36 a 37, Pág. 46, ejemplo 7)	Mezclar el principio activo con los demás excipientes
(c) calentar la segunda porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E	No se menciona	No se menciona

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

TPGS		
(d) granular la mezcla utilizando una extrusora u otro equipo adecuado mientras que se agrega lentamente la segunda porción del tensoactivo no iónico de Vitamina E TPGS a la mezcla, y mantener una temperatura del producto por debajo de 38°C, y	No se menciona	Granular
(e) enfriar los gránulos hasta temperatura ambiente.	No se menciona	secar los gránulos a temperatura ambiente

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 10 porque divulga composiciones farmacéuticas, que se pueden elaborar por granulación, que comprenden compuestos como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 11 y el proceso del documento D1 consiste en que la presente solicitud reclama de manera expresa el proceso para elaborar la composición que además comprende vitamina E TGPS y polietilenglicol o poli-óxido de etileno.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a la composición reclamada en esta solicitud ya que no parecen presentar propiedades superiores en comparación con las composiciones del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de suministrar una proceso para elaborar una composición farmacéutica que comprenda compuestos de la fórmula (I), como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo alternativo al conocido en el estado del arte.

Sin embargo, la utilización de vitamina E TGPS y polietilenglicol o poli óxido de etileno en formulaciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo para mejorar el perfil de disolución del principio activo está divulgada en el documento D2, asimismo, un proceso para elaborar dichas composiciones que comprende los pasos de combinar o mezclar el principio activo y los excipientes, granular la mezcla y dejar los gránulos a temperatura ambiente (pág. 35), donde las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la mezcla de TGPS y polietilenglicol (Ejemplo 4, composición 7) y que las composiciones que comprenden gránulos que comprenden el principio activo en forma de sal, TGPS y polietilenglicol tienen un mejor perfil de disolución que aquellos que no comprenden la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

mezcla de TGPS y polietilenglicol y se encuentran en forma de base libre (Ejemplo 4, composición 5). Ahora bien, de lo soportado en el capítulo descriptivo no se encuentra que el hecho de dividir la vitamina E TGPS, calentarla y agregarla en dos tiempos diferentes no le proporciona efecto técnico alguno al proceso o a la composición por lo que la invención ahora reclamada carece de nivel inventivo.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, aplicaría el proceso divulgado en documento D2 incluyendo vitamina E TGPS y polietilenglicol, a las composiciones que comprenden gránulos que comprenden un principio activo básico como los compuestos de fórmula (I) como 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo u 8-(6-metoxi-piridin-3-il)-3-metil-1-(4-piperazin-1-il-3-trifluoro-metil-fenil)- 1,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-2-ona, divulgadas en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 11 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 11 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no posee nivel inventivo (Art. 18).

Respuesta a los argumentos del solicitante

En su respuesta al requerimiento realizado, la sociedad solicitante argumenta que D1 se refiere en general a formas farmacéuticas de dosificación que comprenden los compuestos de fórmula. Solo hay un único ejemplo que ilustra capsulas de gelatina blanda y comprende un agente diferente. D1 no enseña una sola composición que comprenda particularmente el compuesto de la presente solicitud en forma de gránulos junto con vitamina E TPGS, en una cantidad que es del 15 al 80 por ciento en peso de la composición y polietilenglicol o poli-óxido de etileno o sus combinaciones.

En cuanto tiene que ver con el documento D2 la solicitante señala que este se refiere a sales de benzimidazolil piridil éteres que son diferentes de los compuestos de la presente solicitud, por lo tanto, la persona medianamente versada en la materia en busca de obtener composiciones farmacéuticas del compuesto de la invención no habría estado motivado a buscar enseñanzas y sugerencias en documentos que se refieren a compuestos estructuralmente diferentes con distinta actividad farmacológica. Indica la solicitante que D2 no comprende gránulos granulados por fusión del Compuesto A y tampoco comprende vitamina E TPGS en una cantidad que es del 15 a 80% ni un agente mejorador de disolución.

Con respecto a los anteriores argumentos, esta Oficina encuentra que contrario a lo afirmado por la solicitante el estado de la técnica en su conjunto sí provee

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

sugerencias e información suficiente para que la persona versada en la materia logre las composiciones objeto de la presente solicitud. Tal como se evidenció en el examen de patentabilidad, el documento D1 ya había divulgado el agente 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo al igual que las composiciones farmacéuticas que lo comprenden, donde el mismo es reconocido como un modulador de PI3K (Pág. 36, último párrafo hasta la pág. 37 primer párrafo, y pág. 46, ejemplo 1), la anterioridad enseña que la composición puede estar en forma de una cápsula y puede comprender de 1 a 99% del agente activo. La formulación comprende excipientes incluyendo polietilen glicol, emulsificantes y solubilizantes (Pág. 36, último párrafo hasta la pág. 37 primer párrafo). Ahora bien, estando la persona versada en la materia enfrentada a la necesidad de mejorar la solubilidad de este agente mediante formulaciones alternativas, la misma se vería motivada a estudiar el arte previo existente para determinar soluciones existentes que permitan resolver dicho problema. En consecuencia al estudiar la información contenida en D2 la cual se encontraba disponible previo a la presente solicitud, encontraría que las formulaciones que comprenden como agentes surfactantes el PEG 8000 polioxidos de etileno, proveen un perfil de liberación del fármaco mejorado como se evidencia en la tabla que resume los perfiles de disolución de los prototipos de formulación (Tabla 6, ejemplo 5). Como se puede apreciar la tecnología mediante la cual se mejora el perfil de disolución de una composición farmacéutica a través de la adición de tensoactivos y TPGS ya se había desarrollado en D2. En consecuencia, la presente solicitud corresponde a la adaptación de una tecnología existente con un fármaco adicional para obtener los resultados logrados en el arte previo y por ende la materia reivindicada no tiene altura inventiva ya que la solicitante no presenta ningún argumento que evidencie que las sutiles modificaciones realizadas en la presente solicitud agreguen un efecto inesperado o sorprendente con respecto a los desarrollos propuestos en el arte previo.

En referencia al método de las reivindicaciones 10 y 11 la solicitante argumenta que estos son diferentes a los divulgados en D1 y D2 puestos que estos no generan granulados en fusión que comprenden específicamente el compuesto A, y las etapas ilustradas en D1 y D2 para producir dichas composiciones no son siquiera similares a las etapas que se reclaman específicamente en las reivindicaciones 10 y 11.

Al respecto, esta Oficina encuentra que la solicitante no presenta ningún argumento que sustente cómo las ligeras diferencias entre el método descrito en D2 y el divulgado en la presente solicitud imprimen un efecto sustancial en el producto obtenido o solucionan un problema técnico. Como se evidenció en el examen de patentabilidad, la información contenida en D1 y D2 estudiada de manera conjunta (y

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

no mediante el erróneo análisis individual que realiza la solicitante), permiten proponer un método para la obtención de composiciones alternativas del compuesto 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo, como el ahora reivindicado. De manera específica, el documento D2 divulga el proceso para elaborar granulados que implica la utilización de vitamina E TPGS y polietilenglicol o poli óxido de etileno para mejorar el perfil de disolución del principio activo. Si bien, no se especifica que “la mezcla se caliente hasta una temperatura del producto por debajo del punto de fusión de la vitamina E TPGS”, esta expresión es totalmente ambigua, ya que no se especifica ningún rango de calentamiento, e incluso esta temperatura abarca la misma temperatura ambiental, de igual forma, como es conocido, el proceso de mezclado genera un incremento en la temperatura interna por efecto de fricción de los componentes de la mezcla lo que en consecuencia dará lugar a un calentamiento, por lo cual D2 cumple de manera implícita con esta condición.

Se reitera a la solicitante que la misma no presenta ningún argumento en relación con las ventajas técnicas de los procesos reclamados en las cláusulas 10 y 11, las cuales comprenden las mismas etapas esenciales descritas en D2, siendo la única diferencia el que se reemplace el activo de D2 por el compuesto 2-metil-2-[4-(3-metil-2-oxo-8-quinolin-3-il-2,3-dihidro-imidazo-[4,5-c]-quinolin-1-il)-fenil]-propionitrilo divulgado en D1. De igual forma la solicitante no presenta ninguna evidencia que sustente el efecto de una concentración de tensoactivo en el rango de 15 a 80%, por lo cual la misma se considera una alternativa con respecto a las divulgaciones previas.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud, el título quedará de la siguiente manera: “COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN 2-METIL-2-[4-(3-METIL-2-OXO-QUINOLIN-3-IL-2,3-DIHIDRO-IMIDAZO-[4,5-C]QUINOLIN-1-IL)-FENIL]-PROPIONITRILLO”.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN 2-METIL-2-[4-(3-METIL-2-OXO-QUINOLIN-3-IL-2,3-DIHIDRO-IMIDAZO-[4,5-C]QUINOLIN-1-IL)-FENIL]-PROPIONITRILLO”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50381

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-133022

sociedades(es) Novartis AG., advirtiéndole(s) 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 diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 18 Ago 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDÓ DEL CASTILLO

Doctor(a)

CARLOS R. OLARTE GARCIA, office@olartemoure.com

Elaboró: Emilse Cano Urrego
Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño FernÁndez