

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

En ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 54 del artículo 3 del Decreto 1687 de 2010, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 38731 del 30 de Julio de 2015 la Superintendencia de Industria y Comercio denegó la patente de invención a la creación denominada: “COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA PARA ADMINISTRACIÓN ORAL DE N-TERT-BUTIL-3-[(5-METIL-2-[(4-(2-PIRROLIDIN-1-ILETOXI)FENIL]AMINO}PIRIMIDIN-4-IL)AMINO]BENCENOSULFONAMIDA”, con fundamento en los artículos 18 y 25 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con los requisitos de nivel inventivo y de unidad de invención.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 17 de Septiembre de 2015 con el No. 13-138069-00016-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad TARGEEN INC, interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La sociedad recurrente señala que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio que reemplaza en su totalidad el aportado con antelación, el cual, está conformado por veintiun (21) reivindicaciones, en las que se eliminaron las antiguas reivindicaciones 22 y 23 referidas al kit de partes. Asimismo la recurrente manifiesta que los argumentos esgrimidos con respecto a la patentabilidad de la invención en los términos del capítulo reivindicatorio modificado, resultan predicables del capítulo reivindicatorio sobre el cual se negó la patente.

En cuanto a las objeciones frente a la unidad de invención, la recurrente manifiesta que la solicitud cuenta con un concepto común inventivo correspondiente a la cápsula para administración oral que comprende una mezcla de i) un compuesto que es N-tert-butil-3-[(5-metil-2-[(4-(2-pirrolidin-1-iletoxi)fenil]amino}pirimidin-4-il)amino]bencenosulfonamida o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o el monohidrato de dihidrocloruro del mismo, ii) una celulosa microcristalina y iii) estearil fumarato de sodio, en donde la mezcla está contenida en la cápsula y el método para preparar dicha cápsula, por lo que concluye que se debe dar por superada la objeción formulada.

Frente a las objeciones por falta de claridad, la recurrente manifiesta que estaban referidas a las antiguas reivindicaciones 22 y 23 y dado que las mismas ya no

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

hacen parte del nuevo pliego reivindicatorio, también solicita que se den por superadas.

En cuanto al examen de nivel inventivo, la recurrente manifiesta que el documento D1 no sugiere una mezcla de i) TG101348 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo o un hidrato del mismo, ii) celulosa microcristalina y iii) estearil fumarato de sodio, e indica que este documento divulga composiciones farmacéuticas en dosis únicas de pomalidomida que comprende adyuvantes, aglutinantes (tales como celulosa microcristalina), agentes de relleno, desintegrantes y lubricantes (estearil fumarato de sodio). La recurrente agrega que el compuesto formulado en el sistema que se divulga en el documento D1 es un inmunomodulador y que cuando se refiere a TG101348 lo hace como segundo ingrediente activo de la formulación para ser administrado con pomalidomida (Párrs. 0134-0315 del documento D1). Y reitera que el documento D1 no proporciona sugerencia o motivación alguna para que la persona versada en la materia elija este compuesto activo. Frente al documento D2 citado, la recurrente manifiesta que no soluciona la deficiencia del documento D1 porque no divulga un sistema tipo cápsula, la presencia del compuesto TG101348 y de celulosa microcristalina, a menos que el nivel inventivo se analice en forma retrospectiva.

La recurrente afirma que el Despacho no consideró la evidencia de efecto inesperado aportada en el presente caso y señala que se probaron varias formulaciones de di-HCl TG101348 que incluían diferentes lubricantes como estearato de magnesio y lauril-fumarato sódico (Párrs. 0193 a 0195 de WO2012061833). De acuerdo con los resultados, las formulaciones que incluyen lubricantes presentan bajo flujo y adherencia a los rodillos metálicos del compactador, mientras que en el caso de las formulaciones reivindicadas que incluyen estearil fumarato de sodio como lubricante (Pruv) se presenta un flujo constante y aceptable que genera mínima adherencia al compactador y como la mezcla de ingrediente activo y excipientes no fue divulgada por los documentos citados y por lo tanto no hay anticipación estructural, la recurrente concluye que la materia tal y como se encuentra reivindicada cumple con los requisitos de patentabilidad.

TERCERO: Que requerido a la sociedad opositora LAFRANCOL S.A.S., para que se pronunciara respecto a las pruebas allegadas con el recurso, no hizo manifestación alguna.

CUARTO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto teniendo en cuenta los argumentos de las partes en los siguientes términos:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

Revisado el contenido del capítulo reivindicatorio aportado con el radicado bajo el No. 13-0138069-00016-0000 del 17 de septiembre de 2015, conformado por 21 reivindicaciones, este Despacho encuentra que se pretende protección para los siguientes objetos:

- i) Una cápsula que comprende una mezcla de i) un compuesto *N-tert*-butil-3-[(5-metil-2-[[4-(2-pirrolidin-1-iletoxi)fenil]amino}pirimidin-4-il)amino]bencenosulfonamida o una sal o el monohidrato de dihidrocloruro del compuesto, cuya denominación común internacional es Fedratinib, ii) una celulosa microcristalina, y iii) estearil fumarato de sodio. (Reivindicaciones 1 a 16)
- ii) Un método para preparar un producto tipo cápsula que incluye el compuesto activo antes indicado y que comprende las etapas de i) mezclar el estearil fumarato de sodio con el ingrediente activo y mezclar los gránulos de i) con una celulosa microcristalina silicificada. (Reivindicaciones 17 a 21)

Bajo este respecto, se considera que la modificación aportada no implica ampliación de la divulgación contenida en la solicitud inicial, se encuentra en concordancia con lo expuesto en el radicado frente al cual se decidió sobre la patentabilidad de la invención, y se presentó el recibo de pago correspondiente, por lo que se aceptan las modificaciones, dado que se eliminó la referencia al kit de partes, consignado en las antiguas reivindicaciones 22 y 23. De lo anterior también se colige que se dan por superadas las objeciones frente a la ausencia de un concepto común e inventivo que cobije los objetos: cápsula y kit de partes.

Por otra parte, en cuanto tiene que ver con las objeciones a la claridad de la invención, este Despacho las encuentra superadas, dado que la Resolución mediante la cual se decidió negar el privilegio de patente indicó que estaban referidas exclusivamente al contenido de las reivindicaciones 22 y 23, las cuales, como se manifestó antes, fueron eliminadas del pliego reivindicatorio.

En lo concerniente al examen de patentabilidad es del caso manifestar que en la Resolución impugnada se citan los documentos US2009/0088410 (D1)¹ y Raymond C. Rowe, *et al.* 2009 (D2)², para indicar que en el estado de la técnica existía la sugerencia o motivación razonable para anticipar los elementos estructurales de la composición, específicamente porque el documento D2

¹ [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090402&CC=US&NR=2009088410A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20090402&CC=US&NR=2009088410A1&KC=A1

² <https://nurirjawati.files.wordpress.com/2012/01/handbook-of-pharmaceutical-excipients-6th-edition.pdf>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

menciona la posibilidad de usar la celulosa microcristalina como diluyente en formulaciones tipo cápsula y de aplicar agentes lubricantes como estearil fumarato de sodio (0,5 a 2% p/p), por su parte el documento D1 divulga composiciones tipo cápsula que incluyen el agente activo identificado bajo el código TG101348, que corresponde al principio activo identificado bajo el nombre IUPAC: *N-tert-butil-3-[(5-metil-2-[[4-(2-pirrolidin-1-iletoxi)fenil]amino]pirimidin-4-il)amino]bencenosulfonamida*, combinado con celulosa microcristalina y lubricantes (Párr. 0162 y 0166 del documento D1).

Sin embargo, tal y como lo manifiesta la recurrente el documento D1, considerado el documento más cercano reportado por el estado de la técnica, no divulga composiciones en las que el principio activo principal corresponda al compuesto TG101348 (Fedratinib). En contraste, se encuentra que el documento D1 divulga combinaciones del principio activo 4-(amino)-2-(2,6-dioxo(3-piperidinil))-isoindolin-1,3-diona, con actividad inmunomoduladora, con un segundo ingrediente activo, elegido de una lista en la que se encuentra el principio activo Fedratinib, identificado bajo el código TG101348 (Párr. 003 del documento D1), con actividad inhibidora de JAK quinasa para el tratamiento de enfermedades mieloproliferativas (Ejemplos, Párrs. 0185 en adelante del documento D1). Si bien, este documento menciona formas farmacéuticas sólidas que contienen la mezcla de activos, elaboradas con agentes de relleno como celulosa microcristalina (Párr. 0162 del documento D1), no menciona nada frente al problema planteado en la solicitud. De acuerdo con la descripción de la solicitud, el problema asociado a la preparación de los gránulos, que se van a administrar en un sistema de presentación farmacéutico tipo cápsula, estriba en la necesidad de conservar la estabilidad del sistema dada la naturaleza cáustica/ácida potencial de una sal di-HCl como una de las opciones en las que se presenta el principio activo y además la compatibilidad del principio activo con la carga de lubricante y relleno usado.

En la solicitud se abordan estos problemas en los ejemplos 5 en adelante (Párrs. 0168 a 0179), específicamente, en el aparte selección de excipientes (Párr. 0180, 0182 y 0186), en donde la solicitante indica que se usa celulosa microcristalina silicificada (Prosolv SMCC90HD) como excipiente de carga/vehículo primario con el lubricante estearil fumarato de sodio (Pruv) (Pág. 64, Tabla 17 de la descripción, Párr. 0179). Bajo este entendido, este documento no se puede considerar el estado de la técnica más cercano a la invención, por cuanto no aborda el problema de la selección de excipientes y aun cuando pertenece al campo técnico de la invención no motiva ni sugiere a la persona versada en la materia a combinar los excipientes que plantea la recurrente, razón por la cual este Despacho encuentra que se debe verificar en el estado de la técnica el efecto asociado a la combinación de celulosa microcristalina y esteraril-fumarato de sodio y su aplicación en el caso de agentes como Fedratinib. Ahora bien, revisado el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

contenido del segundo documento citado: *"Handbook of excipients"*, encuentra el Despacho que si bien presenta una guía de las posibilidades disponibles para el preformulador farmacéutico, no traza el camino para diseñar el sistema que plantea la recurrente y ante un capítulo reivindicatorio específico como el que se presenta en la solicitud y una divulgación en sentido general como la que se presenta en los documentos citados: D1 y D2, se concluye que los documentos no permiten derivar claramente y sin ambigüedad los elementos que caracterizan las formulaciones reivindicadas.

Por otra parte, frente a las ventajas asociadas a la selección de excipientes es del caso señalar que la Resolución no los toma en cuenta, por lo que es del caso evaluar si considerando el estado de la técnica disponible al momento de la presentación de la solicitud, dicho resultado era previsible. Por lo demás encuentra la Oficina que si bien el documento D1 no resulta relevante para afectar la patentabilidad, existen otros documentos en el estado de la técnica que eventualmente podrían llegar a afectar los requisitos de patentabilidad de la materia que ahora se reivindica como por ejemplo:

Muzikova J. *et al.*³ A Study of the properties of compacts from silicified microcrystalline celluloses. 2007. que divulga los resultados de un estudio en el que se evalúa la influencia de los lubricantes como estearil-fumarato sódico sobre la desintegración de un producto farmacéutico elaborado a partir de celulosa microcristalina silicificada, el cual divulga materia cercana a la invención de la solicitud, por lo tanto, es pertinente realizar un nuevo examen de fondo, considerando para ello el documento indicado junto a la publicación D1.

Por lo anteriormente expuesto, encuentra este Despacho procedente revocar la decisión impugnada y en su lugar, remitir el expediente a la Dirección de Nuevas Creaciones de esta Superintendencia, con el propósito de que se practique un nuevo estudio de patentabilidad.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

³ doi:10.1080/03639040601050197

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:103571

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-138069

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Revocar la decisión contenida en la Resolución No. 38731 del 30 de Julio de 2015, por medio de la cual se concedió una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Enviar el expediente a la Dirección de Nuevas Creaciones, para que se disponga lo relacionado con la práctica del examen de patentabilidad previsto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comunidad Andina y hacer el correspondiente traslado al solicitante.

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente Resolución a la sociedad TARGEEN INC y a la sociedad LAFRANCOL S.A.S., en calidad de opositora, advirtiéndoles que contra ella no procede recurso alguno.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE
Dada en Bogotá D.C., el 30 Dic 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, cavelier@cavelier.com

Doctor(a)
TITO NOE PARRA MURILLO, tparra@lafrancol.com

Elaboró: Consuelo Leguizamon Leguizamon
Revisó: Ricardo Camacho Garcia
Aprobó: José Luis Londoño Fernández