

101

151

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-063490- -00007-0000

Fecha: 2011-05-26 15:24:30 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

✓ Abogado **LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**

ASUNTO Radicación 07-63490
 Trámite 011
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 008

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Vía Nacional

☐

Vía PCT (Fase Nacional)

☐

Cap. I

☐

Cap. II

☐

No. Solicitud Internacional PCT/EP2005/013337

Fecha de Presentación Internacional 13 diciembre 2005

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios 50 a 82 como se radicó inicialmente.
Reivindicaciones: Folios 83 a 91 como se radicó inicialmente.
 Folios 148 a 149 modificado en fase nacional
Respuesta del solicitante: Folios 141 a 146
Prioridad: DE2004 1020040624755 (2004-12-24)

2. Modificaciones

Las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio fueron aceptadas ya que no exceden la materia a proteger. El nuevo capítulo reivindicatorio consta de 1 -16 reivindicaciones (Folios 165 a 167).

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Formas de dosificación farmacéutica sólida administrables por vía oral con liberación modificada"

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de formas de dosificación de liberación modificada para la profilaxis y/o el tratamiento de enfermedades tromboembólicas

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona Formas de dosificación farmacéutica sólida con liberación modificada del compuesto 5-Cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida

KLZ

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/5377; A61K9/20; A61K9/28; A61K31/5375; A61P7/02

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 hace referencia a una sal inorgánica soluble en agua, sin embargo, las posibilidades presentadas son excesivas y de diferentes características químicas lo cual no permite limitar la invención. Se sugiere limitar el objeto de la invención a una generalización razonable de las sales que son relevantes para la invención teniendo en cuenta los ejemplos presentados.

5. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de la solicitud prioritaria 24 Diciembre 2004y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	ES2237497	Substituted oxazolidinones and their use in the field of blood coagulation	04 Diciembre 2002
D2	US6294201	Osmotic medicament releasing system	25 Septiembre 2001
D3	Us4765989	Osmotic device for administering certain drugs	23 Agosto 1988

D1 – Reivindica nuevos derivados de oxazolidinona como es el 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-ticfencarboxamida, los métodos para producirlos, así como con su uso como sustancias activas para los medicamentos para la profilaxis y/o el tratamiento de enfermedades tromboembólicas.
URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0147919A1&KC=A1&FT=D&date=20010705&DB=EPODOC&locale=en_EP

D2- Describe un sistema osmótico oral de liberación de principios activos que consista en un nucleo (contiene sustancia farmacéutica activa) y una cubierta así como un proceso para su producción.
URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=6294201B1&KC=B1&FT=D&date=20010925&DB=EPODOC&locale=en_EP

D3- Un sistema osmótico que comprende dos cámara la primera que contiene un fármaco seleccionado de nifedipina, prazocin y doxazocin y una segunda cámara que están comunicadas por una pared. También contiene un material semipermeable que lo cubre.
URL:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=4765989A&KC=A&FT=D&date=19880823&DB=EPODOC&locale=en_EP

6. Análisis de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 dice: forma de dosificación farmacéutica sólida de liberación modificada administrable por vía oral, compuesta por un sistema osmótico bicameral que comprende:

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

Características esenciales	D3	D1
Forma farmacéutica sólida de liberación modificada en sistema osmótico bicameral	Sistema osmótico bicameral (ejemplos 1 a 7)	Forma farmacéutica sólida administrable por vía oral (reivindicaciones 4 y 7)
Núcleo:		
5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida (1-40%)	Principio Activo (20-30%) (ej. 1 a 4 –reivindicación 1)	5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida
Oxido de polietileno (50-95%)	Oxido de Polietileno (70-95%) (ejemplo 1 a 4)	No se menciona
Capa osmosis		
Oxido de polietileno (40-90%)	Oxido de Polietileno (50-80%) (ejemplo 1 a 4)	No se menciona
Sal inorgánica soluble en agua (10-40%)	Cloruro de Sodio (10-40%) (ejemplos 1 a 4)	
Cubierta:		
Acetato de celulosa ó mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol	Mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol (ejemplos 1)	No se menciona

Estado de la Técnica más cercano es **D3** que da a conocer un sistema de liberación bicameral de un principio activo basado en liberación osmótica (Columna 9, líneas 30 a 40; ejemplo 1-4; reivindicación1).

Este sistema de liberación osmótica comprende un **núcleo o primera capa** que contiene como componentes: un 20 a 30% de un **principio activo** como nifedipino o prazocin ejemplos 1 a 7), de 70 a 95% de **oxido de polietileno** de bajo peso molecular (ejemplos 1 a 4) y una **segunda capa osmótica** que contiene de 50 a 50% de **oxido de polietileno** de alto peso molecular (ejemplos 1 a 4) y del 10 a 40% de un agente de osmolaridad como el cloruro de sodio (ejemplos 1 a 4). De igual manera dicho núcleo esta recubierto por una **cubierta** polimérica osmóticamente activa que contiene una **mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol** (ejemplo 1 a 4).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la forma farmacéutica de liberación osmótica bicameral consiste en que el principio activo es específicamente la 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida.

El Efecto Técnico que logra la diferencia es obtener una forma de dosificación farmacéutica de liberación osmótica bicameral del principio activo 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo obtener un sistema de liberación bicameral como el dado a conocer en D3 que contenga principio activo 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida".

Por otro lado, **D1** describe composiciones una forma de dosificación farmacéutica sólida administrable por vía oral (reivindicaciones 4 y 7) que contiene el compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida (pág. 24, ejemplo 44, reivindicaciones 1 y 2). Cabe anotar que las composiciones presentadas en el capítulo descriptivo de la presente solicitud que hacen referencia a un sistema bicameral, presentan los

mismos componentes (a diferencia del principio activo) para formar el sistema osmótico bicameral divulgado en D3 para los ejemplos 1 y 4.

Es así que el estado de la técnica disponible aporta solución al problema técnico objetivo por lo cual para el experto en la materia, que tenga que obtener una forma farmacéutica de liberación modificada basada en un sistema de liberación osmótica bicameral que contenga el compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il) metil)-2-tiofencarboxamida y que conozca el estado de la técnica, sería obvio combinar la solución propuesta en **D3**, con el compuesto de **D1**, llegando de esta manera al contenido de la reivindicación 1, por lo cual el objeto reivindicado **carece de nivel inventivo**.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

La **reivindicación 9** dice: "Forma de dosificación farmacéutica sólida de liberación modificada administrable por vía oral, compuesta por un sistema osmótico monocameral que comprende:

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

Características esenciales	D2	D1
Forma farmacéutica sólida de liberación modificada en sistema osmótico monocameral	Sistema osmótico monocameral (reivindicación 1)	Forma farmacéutica sólida administrable por vía oral (reivindicaciones 4 y 7)
Núcleo:		
5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida (2-30%)	Principio Activo (20-30%) (ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13)	5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida
Xantano (25-40%)	Xantano 25 -40% (ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13)	No se menciona
Copolimero de vinilpirrolidona /acetato de vinilo (15-25%)	Copolividona 10-30% (ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13)	
Cubierta:		
Acetato de celulosa ó mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol	Mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol (ejemplos 1 a 5)	No se menciona

Estado de la Técnica más cercano es **D2** que da a conocer un sistema de liberación monocameral de un principio activo basado en liberación osmótica (Columna 1, líneas 6 a 9; reivindicaciones 1 a 16).

Este sistema de liberación osmótica comprende un **núcleo** que contiene como componentes; un 20 a 30% de un **principio activo** para enfermedades como trombosis ó enfermedades circulatorias (columna 6 línea 55 a 60; ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13), de 25 a 40% de **xantano** ((ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13) y de 10 a 30% de un **copolimero de vinilpirrolidona-acetato de vinilo** (ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13). De igual manera dicho núcleo esta recubierto por una **cubierta** polimérica osmóticamente activa que contiene una **mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol** (ejemplos 1 a 5).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 9 y la forma farmacéutica de liberación osmótica monocameral consiste en que el principio activo

para enfermedades como trombosis ó enfermedades circulatorias es específicamente la 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida.

El Efecto Técnico que logra la diferencia es obtener forma de dosificación farmacéutica de liberación osmótica del principio activo 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida para el tratamiento de enfermedades como trombosis ó enfermedades circulatorias.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo obtener un sistema de liberación monocameral de un principio activo basado en liberación osmótica donde el principio activo sea 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofen carboxamida.

Por otro lado, **D1** describe composiciones una forma de dosificación farmacéutica sólida administrable por vía oral (reivindicaciones 4 y 7) que contiene el compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida (pág. 24, ejemplo 44, reivindicaciones 1 y 2). Útiles para enfermedades relacionadas con la coagulación sanguínea como es la trombosis.

Cabe anotar que las composiciones presentadas en el capítulo descriptivo de la presente solicitud que hacen referencia a un sistema monocameral presentan los mismos componentes (a diferencia del principio activo) para formar el sistema osmótico divulgado en D2 para los ejemplos 1 a 4.

Es así que el estado de la técnica disponible aporta solución al problema técnico objetivo por lo cual para el experto en la materia, que tenga que obtener una forma de dosificación farmacéutica sólida administrable por vía oral de liberación modificada basada en un sistema de liberación osmótica que contenga el compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida y que conozca el estado de la técnica, seria obvio combinar la solución propuesta en **D2**, con el compuesto de **D1**, llegando de esta manera al contenido de la reivindicación 9, por lo cual el objeto reivindicado **carece de nivel inventivo**.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 10 -15 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	ES2237497	1 -9	Nivel Inventivo
D2	US6294201	9-16	Nivel Inventivo
D3	US4765989	1-8	Nivel Inventivo

8. Respuesta a los argumentos del solicitante

Como respuesta a los requerimientos realizados por este despacho en el concepto técnico 0491 el solicitante adjunta un nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 16 reivindicaciones (Folios 148 y 149).

Luego de las objeciones realizadas por este despacho en el concepto técnico 0491 el solicitante en folios 141 a 146 presenta respuesta a los requerimientos así:

- En cuanto a la objeción de **claridad y concisión** realizada por esta oficina, el solicitante responde:
 - *Se redacta una nueva reivindicación 1 de acuerdo a las anteriores reivindicaciones 34 a 36. De esta manera las composiciones de las capas y de la cubierta especificada en la nueva reivindicación 1 se encuentran plenamente soportadas por las especificaciones de la página 17, líneas 11 a 25 y página 15, líneas 1 a 4"*
 - *"Con respecto a las nueva reivindicación 4, se desea poner de presente que la forma hidrofílica del compuesto (I) se encuentra soportada por la líneas 22 a 25 de la página 4 y líneas 1y 2 de la página 5. En este sentido, el procedimiento de preparación de dicha forma específica del compuesto se describe detalladamente en la anterioridad DE10355461"*
 - *La nueva reivindicación 6, basada en la anterior reivindicación 35, hace referencia a un rango de viscosidad del óxido de polietileno en la capa del ingrediente activo. Dado que la nueva reivindicación 1 define que el óxido de polietileno es uno de los componentes de la forma de dosificación farmacéutica sólida, se tiene que la nueva reivindicación 6 hace referencia a un detalle adicional de la composición reclamada, por lo que no se considera un resultado a alcanzar.*
 - *La reivindicación 9 ahora especifica el compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamid (I) como principio activo y adicionalmente limita el rango de proporción del xanano y del copolímero de vinilpirrolidona- acetato de vinilo, para especificar y caracterizar apropiadamente la materia reivindicada.*

Este despacho a la luz del nuevo capítulo reivindicatorio da por superadas las objeciones de claridad y concisión realizadas en el concepto técnico 0491 en cuanto a la delimitación del objeto a reclamar.

- En cuanto a la objeción de **Novedad** realizada por este despacho, el solicitante responde:

"El examinador cita el documento D1 y manifiesta que este afecta la novedad de la reivindicación 1. Sin embargo, al tener en cuenta que el nuevo pliego reivindicatorio no incluye dicha reivindicación, se da por superada la objeción del examinador y se puede concluir que la materia revelada por el actual pliego es novedosa sobre la técnica anterior citada"

Este despacho reconoce que el documento D1 (ES2237497) a pesar que menciona composiciones farmacéuticas del compuesto 5-Cloro-N-(((5S)-2-oxo-3-

[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida (I) no afecta la novedad de la nueva reivindicación 1 en cuanto a que no se presenta de manera explícita la forma de dosificación farmacéutica sólida de liberación modificada administrable por vía oral, compuesto por un sistema osmótico bicameral reclamada en la presente solicitud.

- En cuanto a la objeción de **Nivel Inventivo** realizada por este despacho, el solicitante responde:

"El documento D1 enseña el compuesto 5-Cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida, el cual es apto para su administración oral; sin embargo dicho documento no menciona el sistema de liberación osmótica. Por el contrario, dentro de sus enseñanzas, la anterioridad citada claramente describe las ventajas de los compuestos reclamados presenten una acción rápida una vez ingeridos.

Por su parte, el documento D2 describe un sistema modificado de liberación osmótico apropiado para la liberación de fármacos durante un periodo extendido de tiempo.

Con base en lo anterior se puede observar que las enseñanzas de los documentos D1 y D2 resultan contrapuestas, y rebaten la afirmación realizado por el examinador relacionada con la motivación de un experto en la materia de combinar la solución propuesta en D2 con el compuesto descrito en D1, por lo tanto, las anterioridades no permiten derivar de manera obvia y/o evidente la presente invención a una persona medianamente versada en la materia y por ende, no pueden considerar como anterioridades válidas que afecten el nivel inventivo de la presente solicitud."

Se aclara que el documento D1 divulga un composiciones de administración oral que contienen el compuesto 5-Cloro-N-((5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida los cuales (como bien dice el solicitante) tiene una liberación y acción rápida.

Por su lado el capítulo descriptivo de la presente solicitud hace referencia a que es especialmente ventajoso para la terapia o la profilaxis a largo plazo y la profilaxis secundaria de enfermedades trombo embólicas arteriales y/o venosas poner a disposición el principio activo (I) en una forma que conduzca a una reducción de la relación pico a valle mediante una liberación modificada del principio activo y que permita una administración una vez al día (folio 52 líneas 4 a 9) por tal razón el problema que se plantea es la necesidad de composiciones de liberación modificada para un compuesto ya conocido en el estado de la técnica.

Es así, que para lograr estas formas de liberación modificada D2 revela composiciones de estas características (sistema osmótico de liberación de fármacos) los cuales son utilizados para liberación de fármacos utilizados en el tratamiento de enfermedades venosas y tromboembólicas (columna 6 línea 55 a 60: ejemplos 1 a 4 – reivindicaciones 1, 2, 5, 13) como lo es el compuesto (I). Las composiciones reveladas en D2 tienen las mismas características en cuanto a los excipientes que logran el efecto osmótico, y en cuanto al perfil de liberación deseado para el compuesto de la solicitud.

Por todo lo anterior, lo divulgado en el estado de la técnica motivaría a un experto medio en la materia a generar una forma farmacéutica de liberación modificada en

148

~~158~~

forma de sistema osmótico que permita una administración una vez al día para el compuesto 5-Cloro-N-({(5S)-2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il} metil)-2-tiofencarboxamida; por estas razones las objeciones del solicitante no son validas.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha _____

CONCEPTO TÉCNICO No.1542	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202093
------------------------------------	---