

486 205

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-063490- -00012-0000

Fecha: 2012-03-20 11:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCREA
Ira. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 372 INFORME Folios: 5

Radicación 07-063490

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Via Nacional	☐	
Via PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I ☒ Capítulo II ☐
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2005/013 337	
Fecha de Presentación Internacional	13/Diciembre/200 5	

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 50 a 82	22/Junio/2007
Reivindicaciones:	Folios 83 a 91	22/Junio/2007
	Folios 148 a 149	30/Marzo/2011
	Folios 166	23/Agosto/2011
Prioridad:	DE 10 2004 062 475.5	24/Diciembre/2004

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

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 de 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, administrables por vía oral, compuestas por un sistema osmótico bicameral.

Expediente 07 063 490 Negación

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. Determinación del estado de la técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: Diciembre 24 de 2004 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	ES2237497	Substituted oxazolidinones and their use in the field of blood coagulation	04/Diciembre/2002
D3	US4765989	Osmotic device for administering certain drugs	23/Agosto/1988

D1http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050801&CC=ES&NR=2237497T3&KC=T3 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-tiofencarboxamida, los métodos para producirlos, así como su uso como sustancias activas para los medicamentos para la profilaxis y/o el tratamiento de enfermedades tromboembólicas (pág. 24, ejemplo 44, reivindicaciones 1 y 2)

D3http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=4765989A&KC=A&FT=D&date=19880823&DB=EPODOC&locale=en_EP Un sistema osmótico que comprende dos cámaras, 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 (columna 9, líneas 30 a 40; ejemplo 1-4; reivindicación 1).

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en una 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)
Nucleo:		
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 de osmosis		
Oxido de polietileno (40-90%)	Oxido de polietileno (50-80%) (ejemplo 1 a 4)	No se menciona
10 a 40% de cloruro de sodio	Cloruro de sodio (10-40%) (ejemplos 1 a 4)	No se menciona
Cubierta:		
Acetato de celulosa ó mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol	Mezcla acetato de celulosa y polietilenglicol (ejemplo 1)	No se menciona

El documento D3, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, da a conocer un sistema de liberación osmótica (columna 9, líneas 30 a 40; ejemplo 1-4; reivindicación 1).

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 óxido de polietileno de bajo peso molecular (ejemplos 1 a 4) y una segunda capa osmótica que contiene 50 a 80% de oxido de polietileno de alto peso molecular (ejemplos 1 a 4) y del 10 al 40% de un agente de osmolaridad como el cloruro de sodio (ejemplos 1 a 4). De igual manera dicho núcleo está recubierto por una cubierta polimérica osmóticamente activa que contiene una mezcla de 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 5-cloro-N-((5S) 2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida.

El efecto 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 como 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 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.

Conclusión:
La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

6. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	ES2237497	1 – 8	Nivel inventivo
D3	US4765989	1 – 8	Nivel inventivo

7. Respuesta a los argumentos del solicitante

1. Dice el solicitante que “Cuando se toma en consideración los resultados experimentales de D3, la persona medianamente versada en la materia observa que solamente se prueban tres medicamentos. Consecuentemente, una expectativa razonable de éxito para el 5-cloro-N-((5S) 2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il}metil)-2-tiofencarboxamida (rivaroxaban) no puede ser concluida a partir de las enseñanzas de D3, el cual comprende objetivos de gran alcance soportados en pruebas experimentales llevadas a cabo con sólo 3 medicamentos. La obviedad de un objeto requiere una expectativa de éxito razonable que se extienda a medicamentos no nombrados en la anterioridad.
- D3 además no revela datos que permitan predecir el comportamiento del rivaroxaban. D3 solamente reporta resultados experimentales para tres medicamentos en donde dos de ellos –prazosin clorhidrato y doxazosin mesilato- son sales con una solubilidad significativamente mayor respecto a la solubilidad del rivaroxaban. Estos dos medicamentos revelados en D3 son aproximadamente 200 a 1000 veces más soluble en agua que el rivaroxaban.
- Es posible asumir el éxito de un sistema de liberación osmótico a partir de las características de solubilidad del medicamento. En este sentido, dado que dos de los tres medicamentos probados en D3 tienen una solubilidad mucho mayor respecto al rivaroxaban, los resultados con estos dos medicamentos no resultan razonablemente predecibles para dicho compuesto”

Se aclara que el dispositivo osmótico del documento D3 fue desarrollado
Expediente 07 063 490 Negación

204

190

precisamente con el fin de liberar agentes benéficos, que debido a sus solubilidades, son difíciles de liberar en una cantidad conocida y a una velocidad controlada de un sistema dispensador osmótico (columna 1, líneas 31-38), adicionalmente el documento D3 presenta como objeto de la invención proporcionar un dispositivo osmótico que tenga medios para cargar una cantidad elevada de fármaco insoluble en agua o ligeramente soluble en agua y medios para liberar el fármaco en cualquiera de los casos a una velocidad controlada y continuamente a lo largo del tiempo (párrafo 3, líneas 28-33), por lo tanto una persona que se enfrenta al problema de obtener un sistema de liberación osmótico, que contenga como principio activo 5-cloro-N-((5S) 2-oxo-3-[4-(3-oxo-4-morfolinil)fenil]-1,3-oxazolidin-5-il)metil)-2-tiofencarboxamida cuya solubilidad es de 7mg/L de agua, necesariamente tomaría en cuenta lo enseñado en D3, que a pesar de no sugerir específicamente al rivaroxaban, si presenta ejemplos de fármacos con diferentes solubilidades, entre los que se encuentra el nifedipino que posee una solubilidad muy similar (11mg/L de agua, folio 185) a la del rivaroxaban. El sólo hecho de que un compuesto con una solubilidad similar a la del rivaroxaban haya sido formulado en un sistema de liberación osmótico bicameral como el del documento D3, induciría a una persona versada en la materia a utilizar las formulaciones y procesos empleados en los ejemplos 1 y 1A del documento D3 para dar solución al problema técnico propuesto. Por estas razones las objeciones del solicitante no son válidas

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda negar las reivindicaciones 1 – 8 (folio 166).

Bogotá, D. C.

Realizado por: Juanita Catalina Rico *JCR*
Revisado por: Consuelo Leguizamón *CL*
Aprobado por: José Luis Salazar López