

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-168667- -13	FECHA: 2015-11-12 12:34:20
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 TRASLADOINFORME	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS R. OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 13-168667- -13
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 13546
 Folios: 5

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2012/050151				
Fecha de Presentación Internacional	05/01/2012				

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:	Radicado No. 13-168667-00000-0000	16/julio/2013
Reivindicaciones:	Radicado No. 13-168667-00000-0000	16/julio/2013
	Radicado No. 13-168667-00007-0000	5/enero/2015
	Radicado No. 13-168667-00010-0000	12/junio/2015
Prioridad:	EP 11150431.2	7/enero/2011

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta 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

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso, se tiene en

cuenta la totalidad del nuevo capítulo reivindicatorio (Radicado No. 13-168667-00010-0000) para el examen de patentabilidad.

Título de la solicitud: “COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA SÓLIDA QUE COMPRENDE AL COMPUESTO SAL HEMIFUMARATO DEL ÁCIDO 1-{4-[1-(4-CICLOHEXIL-3-TRIFLUOROMETIL-BENZILOXI-IMINO)-ETIL]-2-ETIL-BENZIL}-AZETIDIN-3-CARBOXÍLICO COM MODULDORAS DE LA ACTIVIDAD S1P”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar una composición moduladora del receptor S1P.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición que comprende el agente ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/397; A61K9/20.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 2 caracteriza la composición por cumplir los requisitos de las farmacopeas, esto no se considera una característica técnica del producto sino un resultado a alcanzar que se logra precisamente mediante la investigación de los excipientes adecuados y de la proporción de los mismos que permite obtener un producto que cumpla con el requisito de uniformidad.

Las expresiones “un desecante” y “se cubre con una barrera a la humedad” utilizadas en la reivindicación 4, son generalidades que le restan concisión a la solicitud. Adicionalmente, los ejemplos de las tablas 1 a 3 no divulgan el efecto de dicha barrera y del desecante.

La reivindicación 5 se presenta como independiente de la reivindicación 1, sin embargo, esta reivindicación corresponde a una forma preferida de la composición, por lo cual debe generarse dependencia.

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: 7 de enero de 2011 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D2	WO2010/080409	Hemifumarate salt of 1- [4- [1- (4 -cyclohexyl-3 -trifluoromethyl-benzyloxyimino) -ethyl] -2 -ethyl-benzyl] -a zetidine-3-carboxylic acid	15/julio/2010
D3	WO2009/048993	Compositions comprising sphingosine 1 phosphate (s1p) receptor modulators	6/mayo/2010

El documento D2¹ divulga una sal hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico y composiciones que las contienen que comprenden un excipiente farmacéuticamente aceptable (resumen, pág. 2, compuesto 1).

¹<https://www.google.com.co/patents/WO2010080409A1?cl=en&dq=WO2010080409&hl=es&sa=X&ved=0CB0Q6AEwAGoVChMI4fX-o7iJyQIVidkmCh0wkw7m>

El documento D3² divulga composiciones farmacéuticas sólidas en forma de cápsula que comprenden la sal hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil- benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico (Resumen y Pág. 2, líneas 9-19), donde las composiciones comprenden excipientes tales como lubricantes incluyendo el gliceril behenato (Pág. 12, línea35; Reiv. 1).

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en una composición farmacéutica e fase sólida, la cual comprende uno o más excipientes y hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2	D3
Una composición farmacéutica en fase sólida que comprende:	Composición que comprende	Composición que comprende
Uno o más excipientes	Un excipiente (Pág. 21)	Excipientes (Pág. 12)
hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico X90 de 8 micras a 300 micras.	Forma cristalina de hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico (abstract; Pág. 2, compuesto 1) No divulga el X90	Sales como la fumarato de un modulador del receptor de esfingosina 1, siendo el preferido el compuesto 1 (Pág. 1, línea 1-8; Pág. 9, líneas 1-30; Pág. 11, líneas 22-23)
Sin compuestos básicos	Las formulaciones comprenden excipientes que no son básicos (Pág. 23)	Los excipientes no son básicos como el estearato de magnesio
Uno de los excipientes es behenato de glicerilo	No lo divulga	Behenato de glicerilo (Pág. 12, línea 35; reiv. 1)

El documento D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque enseña la sal hemifumarato de del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico (compuesto 1), la cual se encuentra en forma cristalina y se utiliza para elaborar composiciones farmacéuticas que comprenden también excipientes farmacéuticamente aceptables, tales como diluyentes, o vehículos (Pág. 21). El documento D2 indica que se pueden elaborar formas farmacéuticas para administración por vía oral y los excipientes utilizados para elaborar dicha formulación no son básicos. D2 indica que la sal hemifumarato del compuesto 1 es una forma cristalina sustancialmente estable (Pág. 4, línea 10) y que el grado de cristalinidad es superior a 80% siendo la forma preferida (Pág. 4, línea 10). La forma de dosificación sólida puede prepararse con recubrimiento o película (Pág. 24, línea 2). La mayor parte de los excipientes divulgados en D2 no son básicos, como por ejemplo el manitol, lactosa, almidón, PVP, ácido algínico, estearato de magnesio o el polietilenglicol (Pág. 23).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la composición de D2 consiste en que la anterioridad no especifica que el activo posea un X90 de 8 a 300 micras. De igual forma, D2 tampoco indica que la formulación comprenda behenato de glicerol.

²<https://www.google.com.co/patents/WO2009048993A3?cl=en&dq=WO2009048993&hl=es&sa=X&ved=0CB0Q6AEwAGoVChMIrMPQna0JyQIVREomCh3iEAMv>

Estas diferencias no parecen conceder un efecto técnico inesperado ya que los resultados del ejemplo 3 indican que un amplio rango de X90 del activo da lugar a una adecuada uniformidad de dosis. Por su parte, los ensayos de estabilidad presentados por la solicitante en el ejemplos 1 evidencia que la estabilidad puede darse mediante el uso de excipientes no básicos diferentes a behenato de glicerilo. De igual forma, D2 enseña que la sal hemifumarato del compuesto de fórmula 1 es superior a la de la forma base, por lo cual, es de esperarse que las formulaciones farmacéuticas que la comprendan posean un alto porcentaje de estabilidad.

El problema técnico objetivo de esta solicitud consiste en: ¿Cómo proveer una formulación para administración oral que comprenda hemifumarato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, estable y con adecuada uniformidad de dosis, con fundamento en las enseñanzas de D2?

Por su parte, el documento D3 divulga una composición que comprende inhibidores de moduladores del receptor S1P e incluyen como agentes preferidos los agentes de la fórmula 1 y sus sales incluyendo la sal fumarato (Pág. 1, líneas 1-8; Pág. 9, líneas 1-30; Pág. 11, líneas 22-23). Los activos se pueden combinar con excipientes como lubricantes como el estearato de magnesio y el behenato de glicerol (Pág. 12, líneas 35; Reiv. 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría excipientes no alcalinos como los divulgados en las composiciones del documento D3 en la formulación propuesta en el documento D2 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y en las reivindicaciones 2 – 5 es obvia y no tiene nivel inventivo.

6. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D2	WO2010/080409	1 – 5	Nivel inventivo
D3	WO2009/048993	1 – 5	Nivel inventivo

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 del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2015-11-17

Elaboró: Emilse Cano Urrego
Revisó: Rubiela Pacanchique Vargas