

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

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 día 16 de junio de 2013 con el N° 13-168667-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Novartis AG., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "FORMULACIONES INMUNOSUPRESORAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2012/050151 del 05 de enero de 2012.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 676 del 30 de septiembre de 2013, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 12655, notificado por fijación en lista el 07 de octubre de 2014, se requirió a la solicitante 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 la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 13-168667-00007-0000 del 05 de enero de 2015, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 11 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, 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.

QUINTO: Que de acuerdo el objeto de la solicitud se modifica el título, el cual quedará de la siguiente manera: "COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA SÓLIDA QUE COMPRENDE AL COMPUESTO HEMITARTRATO DEL ÁCIDO 1-{4-[1-(4-CICLOHEXIL-3-TRIFLUOROMETIL-BENZOILOXI-IMINO)-ETIL]-2-ETIL-BENZIL}-AZETIDIN-3-CARBOXÍLICO COMO MODULADORAS DE LA ACTIVIDAD S1P".

SEXTO: 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."

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 6 no cumplen con el requisito de novedad y que las reivindicaciones 7 a 11 (Radicado N° 13-168667-00007-0000) no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

7.1. Objeto de la invención.

El problema técnico consiste en la necesidad de suministrar composiciones que comprenden compuestos moduladores S1P, útiles en el tratamiento de rechazos de trasplantes, enfermedades autoinmunes, enfermedades inflamatorias, enfermedades infecciosas, neuropatías periféricas (esclerosis múltiple) y cáncer. Para resolver este problema técnico la solicitud proporciona composiciones farmacéuticas sólidas que comprenden al hemitartrato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico.

7.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 07 de enero de 2011, 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	WO2010020610	"Compounds for the treatment of peripheral neuropathies"	25/Febrero/2010
D2	WO2010080409	"Hemifumarate salt of 1-{4-[1-(4-cyclohexyl-3-trifluoromethylbenzyloxyimino)-ethyl]-2-ethylbenzyl}-azetidine-3-carboxylic acid"	15/Julio/2010

El documento D1⁽¹⁾ divulga composiciones farmacéuticas que comprenden al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, donde el compuesto presenta una actividad inmunosupresora siendo útil en el tratamiento de neuropatías periféricas desmielizantes (Resumen; Pág. 8, líneas 8-30; Pág. 35, Rv. 21 y Pág. 36, Rv.22).

El Documento D2⁽²⁾ divulga composiciones sólidas que comprenden la sal de hemifumato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometilbenziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, útiles en el tratamiento de rechazos de órganos, enfermedades autoinmunes, alergias, inflamaciones y enfermedades musculares (Resumen y Pág. 51, Rvs. 14 y 16-17).

¹. www.google.com/patents/WO2010020610

². www.google.com/patents/WO2010080409

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

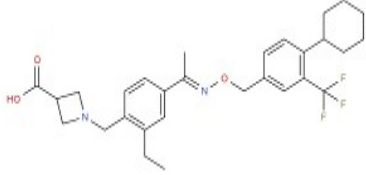
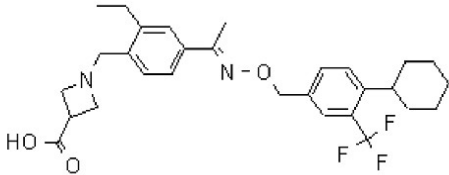
7.3. Novedad.

Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486: *“Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida”.*

En el presente caso, la composición reclamada en la solicitud no es nueva, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: *“Una composición farmacéutica en fase sólida, la cual comprende uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables, (...)”* (Pág. 16 del radicado N° 13-168667-00007-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el documento D1 que representa el estado de la técnica:

Tabla 1

Característica esencial	D1
Composición farmacéutica sólida que comprende: - Ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico -Mezclado con materiales libre de compuestos básicos	Composición farmaceutica que comprende (Pág. 36, Rv. 29) -Ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico mezclado con Carboximetilcelulosa
	 (Pág. 35, Rv. 21 y Pág. 8, líneas 8-30)
-Uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables	

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habrían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

Por su parte, las reivindicaciones dependientes 2-6 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 16 de la Decisión 486.

7.4. 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*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

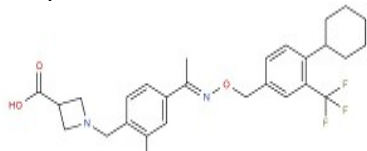
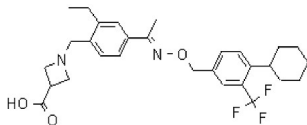
Rad. PCT/13-168667

hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

En el presente caso, la tableta reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 7 se refiere a: “Una tableta que comprende una mezcla comprimida del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, (...)”(Pág. 16 del radicado N° 13-168667-00007-0000). En el presente caso, la composición farmacéutica reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo teniendo en cuenta que la reivindicación 11 se refiere a: “Una composición farmacéutica en fase sólida, la cual comprende uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables, (...)”(Pág. 17 del radicado N° 13-168667-00007-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en las reivindicaciones 1 y 7, y las reveladas en los documentos D1 y D2 que representan el estado de la técnica:

Tabla No 2.

Características esenciales	D1	D2
Tableta que comprende:	Suspensión que comprende (Pág. 36, Rv. 29 y Figs. 1A-1B)	Tableta que comprende: (Pág, 23, línea 1)
- Ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico (tamaño de partícula 200 micras) -Mezclado con materiales libre de compuestos básicos 	-Ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico mezclado con Carboximetilcelulosa  (Pág. 35, Rv. 21 y Pág. 8, líneas 8-30)	-Sal Hemifumato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometilbenziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico mezclado con , carboximetilcelulosa (Pág, 23, línea 1 y Pág. 51, Rv. 14)
-Uno o más excipientes farmacéuticamente aceptables		

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones 7 y 11 porque divulga composiciones farmacéuticas que comprenden al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, donde el compuesto presenta una actividad inmunosupresora siendo útil en el tratamiento de neuropatías periféricas desmielizantes (Resumen; Pág. 8, líneas 8-30; Pág. 35, Rv. 21 y Pág. 36, Rv.22).

Por su parte, el documento D2 divulga composiciones sólidas que comprenden la sal de hemifumato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometilbenziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, útiles en el tratamiento de rechazos de órganos, enfermedades autoinmunes, alergias, inflamaciones y enfermedades musculares (Resumen y Pág. 51, Rvs. 14 y 16-17).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

Las diferencias entre la composiciones definidas en las reivindicaciones 7 y 11 y la composición farmacéutica revelada en el documento D1 consisten en que la composición reclamada está en forma de tableta y el tamaño de partícula del fármaco es de 200µm, mientras que la composición farmacéutica divulgada en el documento D1 está divulgada en forma de suspensión y no establece el tamaño de partícula del fármaco.

No se evidencia un efecto técnico atribuible a las diferencias expuestas.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: Cómo proporcionar composiciones sólidas alternativas que comprendan al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico a partir de las composiciones farmacéuticas reveladas en el documento D1, útiles en el tratamiento de rechazos de trasplantes, enfermedades autoinmunes, enfermedades inflamatorias, enfermedades infecciosas, neuropatías periféricas (Esclerosis múltiple) y cáncer.

Sin embargo, tabletas que comprendan al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico útiles en el tratamiento de neuropatías periféricas, rechazos de órganos e inflamaciones, está divulgada en el documento D2 que enseña composiciones sólidas (Tabletas) que comprenden la sal de hemifumato del ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluoro metilbenzil oxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico, útiles en el tratamiento de rechazos de órganos, enfermedades autoinmunes, alergias, inflamaciones y enfermedades musculares (Resumen y Pág. 51, Rvs. 14 y 16-17).

Además, es parte del conocimiento de la persona normalmente versada en la materia que la micronización es una técnica conocida en la tecnología farmacéutica y que favorece el efecto del fármaco al aumentar la superficie del sólido, agrega, que la reducción del tamaño de partícula de las materias primas garantiza la calidad, la acción terapéutica, y propiedades biofarmacéuticas⁽³⁾.

El documento D1 revela que el compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico reduce los efectos de la neuritis autoinmune luego de 14 días de administración con una recuperación total al día 19 de tratamiento (Pág. 28, líneas 1-5). Por su parte, la solicitud no sustenta el efecto técnico del compuesto como inmunosupresor.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada en presentar la composición revelada en el documento D1 en forma de tableta de acuerdo con lo divulgado en el documento D2, para llegar así al objeto de las reivindicaciones 7 y 11 de la solicitud. Por lo cual, la materia reclamada se considera obvia.

³. Micronización. Su aplicación tecnológica en la elaboración de formas farmacéuticas terminadas
Revista Cubana de Farmacia: 2001;35(3):159-164. http://bvs.sld.cu/revistas/far/vol35_3_01/far01301.pdf

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

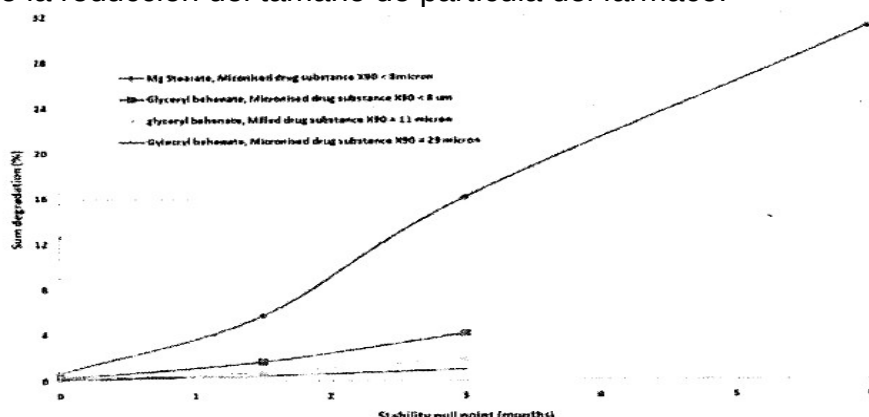
RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

Puesto que las reivindicaciones dependientes 8-10 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La solicitante argumenta que el salto cualitativo dado por la presente invención consiste en proveer tabletas más estables como consecuencia del uso de excipientes no básicos y de la reducción del tamaño de partícula del fármaco.



(Gráfico suministrado por la solicitante).

Al respecto, este Despacho manifiesta que las composiciones inmunosupresoras reclamadas incluyen al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico con un tamaño de partícula de 200 micras y en donde éste último se incorpora en una matriz conformada por excipientes no básicos como la carboximetilcelulosa, materia que es anticipada por el documento D1 que revela composiciones farmacéuticas que comprenden al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico incorporado en una matriz conformada por carboximetilcelulosa. Por su lado, el documento D2 sugiere tabletas que comprenden al compuesto ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-trifluorometil-benziloxi-imino)-etil]-2-etil-benzil}-azetidin-3-carboxílico. Es importante aclarar que, la micronización es una técnica conocida en la tecnología farmacéutica y que favorece el efecto del fármaco al aumentar la superficie del sólido y la reducción del tamaño de partícula de las materias primas garantiza la calidad, la acción terapéutica, y propiedades biofarmacéuticas. Por lo anterior, una persona normalmente versada en la materia tendría suficiente motivación para cambiar la presentación de la composición revelada en el documento D1 de suspensión a tabletas, reduciendo el tamaño de partícula del fármaco, con la razonable expectativa de encontrar los mismos resultados de estabilidad presentados por la solicitud.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA SÓLIDA QUE COMPRENDE AL COMPUESTO

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20258

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-168667

HEMITARTRATO DEL ÁCIDO 1 -{4-[1-(4-CICLOHEXIL-3-TRIFLUOROMETIL-BENZOLOXI-IMINO)-ETIL]-2-ETIL-BENZIL}-AZETIDIN-3-CARBOXÍLICO COMO MODULADORAS DE LA ACTIVIDAD S1P”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(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 24 Abr 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

CARLOS R. OLARTE GARCIA, office@olartemoure.com

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Aprobó: JosÉ Luis Londoño FernÁndez