

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

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 20 de diciembre de 2007, con el N° 07-134575-0000-0000, por la(s) sociedad(es) Novartis AG, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "FORMAS CRISTALINAS Y OTRAS FORMAS DE LAS SALES DE ÁCIDO LÁCTICO DE 4-AMINO-5-FLUORO-3-[6-(4-METILPIPERAZIN-1-IL)-1H-BENCIMIDAZOL-2-IL]- 1H-QUINOLIN-2-ONA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2006/020296 del 23 de mayo de 2006.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 600 del 30 de enero de 2009, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 20851, notificado por fijación en lista el 05 de noviembre de 2013, 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° 07-134575-00016-00000 del 13 de marzo de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 13 que reemplaza(n) las originalmente presentadas. 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 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."

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 13, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de nuevas formas polimórficas más puras de la sal de ácido láctico de 4-amino-5 fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-1-il)-1H-bencimidazol-2-il]- 1H-quinolin-2-ona. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un monohidrato cristalino de una sal de ácido láctico de un compuesto de Fórmula I que tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende los siguientes picos característicos según radicado N° 07-134575-00016-00000.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el mayo 23 de 2005, 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	WO2004043389	Methods of treating cancer and related methods	Mayo 27 de 2004
D2	*artículo	High-throughput crystallization: polymorphs, salts, co-crystals and solvates of pharmaceutical solids	Octubre 6 de 2003
D3	Farmacia Practica Remington Vol.2. 17* Edición Editorial Médica Panamericana. Capítulo VIII preparados farmacéuticos y su elaboración (pág. 1912-1920)	76. Preformulación polimorfismo	1987

D1¹ divulga la sal de ácido láctico del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona (Pág. 52, ejemplo 7), sus composiciones farmacéuticas en forma sólida como tableta.

D2² divulga nuevas estrategias para acelerar el desarrollo farmacéutico y capturar la diversidad sólida forma de sustancias farmacéuticas, han dado lugar a la aparición de las tecnologías de cristalización HT. Esto se refiere a polimorfos, que son diferentes formas cristalinas de la misma composición química.

D3³ Enseña que el fenómeno de polimorfismo consiste en la capacidad de cualquier compuesto para permanecer en el estado sólido en más de una forma cristalina, y que la caracterización de formas cristalinas por el patrón de difracción de rayos X es un método convencional.

1 http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=WO2004043389&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC

2 Anexo al concepto

3 Farmacia práctica de Remington 76. Preformulación polimorfismo pág. 1912-1920 1987

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

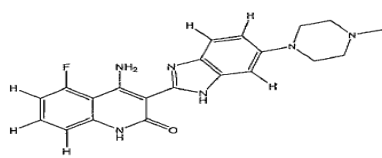
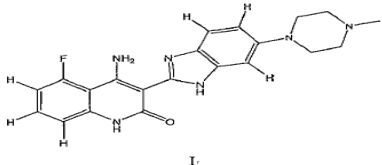
6.3. Nivel Inventivo.

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

En el presente caso, el hidrato cristalino de una sal de de ácido láctico de un compuesto de la fórmula (I) o un tautómero del mismo reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un monohidrato cristalino de una sal de ácido láctico de un compuesto de Fórmula (I)...” (Ver pág 10 del radicado N°07-134575-00016-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y sus dependientes 2- las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
 I. Un monohidratado de una sal de ácido láctico de un compuesto de (fórmula (I).	 I. Lactato de 4 amino -5- fluoro-3-[6-(4- metilpiperazin-il)-1H-bencimidazol-2-il]-1H- quinolin-2- ona (fórmula (1))	Preparación de un sólido cristalino de compuestos por tecnologías de cristalización de alto rendimiento (HT).
que tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende los siguientes picos característicos, en términos de 2 theta grados: 17.6°, 19.3°, 26.0°, 23.3°, 23.5°, 28.2°, 11.9°,16.1°, 18.5°, 10.2°, 12.9°, 11.3°, 11.6°, 15.3°,15.6°, 22.3°, 23.9°, 26.0°,28.2°, 29.3°, 29.8°, 30.7°, 32.2°, 32.6°, 33.1°, 34.3°	No menciona	Se refiere a polimorfos, que son diferentes formas cristalinas del mismo compuesto químico. Sin embargo, las diversas formas de sal, co-cristal, hidratos, solvatos también son susceptibles a estudiar en los sistemas de cristalización HT, esta diversidad impacta en la estabilidad y biodisponibilidad, así como consideraciones de desarrollo, tales como definición de proceso, diseño de la formulación.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

El análisis de nivel inventivo del monohidrato cristalino de una sal de ácido láctico de un compuesto de la fórmula (I) reclamado, se realizó mediante la aproximación problema-solución en polimorfos (Patenting Polymorphs at the European Patent Office⁴) posición que ha adoptado la Superintendencia de Industria y Comercio para efectos del análisis de la patentabilidad de las formas polimórficas.

Hechas las anteriores precisiones, procede esta Oficina a realizar el estudio de nivel inventivo bajo los criterios ya mencionados:

1. Identificación del estado de la técnica más cercano:

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga la sal de ácido láctico del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona (Pág. 52, ejemplo 7,). También enseña composiciones farmacéuticas en forma sólida como tabletas para administración por vía oral que comprenden excipientes comunes, entre otros, como azúcares, diluentes, lubricantes, preservantes antioxidantes, desintegrantes; las formulaciones pueden ser diseñadas para acción corta, liberación rápida, acción prolongada, y liberación sostenida (párr. 69,77 y 78)

2. Identificación de las diferencias técnicas:

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el sólido revelado en D1 consiste en que el polimorfo cristalino reivindicado en la presente solicitud se encuentra en estado hidratado y presenta un patrón de difracción de rayos X como el definido en la reivindicación 1 por los ángulos theta según radicado N°07-134575-000016-0000.

3. Efecto técnico derivado de la diferencia:

El efecto que logra el incluir estas diferencias, según lo menciona el capítulo descriptivo de la presente solicitud, es que la forma cristalina de la reivindicación 1 presenta mejores propiedades de higroscopicidad.

4. Establecimiento del problema técnico objetivo:

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "¿Cómo obtener una forma cristalina alternativa de la sal de ácido láctico del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona con mejores propiedades de higroscopicidad?".

5. Verificación de que el problema técnico fue resuelto:

El solicitante anexa en la figura 6 el diagrama de difracción de rayos X para la forma B del lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona y adicionalmente un análisis de sorción dinámica de vapor (DVS) aplicado a la forma B pero no presenta datos y el estadístico de prueba que le permitan concluir que la forma B no absorbe agua para formar un hidrato superior, que el hidrato fue eliminado por completo bajo nitrógeno (0% de humedad relativa) y que al 50% de humedad relativa muestra que la pérdida de agua previa fue

4 <http://medical.wesrch.com/page-summary-pdf-ME1XXFXMHJWLR-patenting-polymorphs-in-europe-2>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

reabsorbida, para concluir que la forma B refleje las propiedades de un hidrato de canal típico (Ejemplo 10, numeral E. de la memoria descriptiva).

Además, el diagrama de difracción de rayos X en polvo para la forma B de la sal de ácido láctico del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1-H-bencimidazol-2-il]-IH-quinolin-2-ona, no permite concluir que el comportamiento higroscópico, según el solicitante, represente el efecto técnico asociado al polimorfo. Por lo anterior, no es posible concluir que la nueva forma cristalina B, muestre un mejor desempeño en la obtención de una forma farmacéutica sólida.

6. Verificación de si es obvia o no la manera de resolver el problema técnico:

Por otra parte, el documento D2 enseña que nuevas estrategias para acelerar el desarrollo farmacéutico y capturar la diversidad de formas sólidas de sustancias farmacéuticas, han dado lugar a la aparición de las tecnologías de cristalización HT. Esto se refiere a polimorfos, que son diferentes formas cristalinas de la misma composición química. Sin embargo, las diversas formas de sal, co-cristal, hidratos, solvatos también son susceptibles a estudiar en los sistemas de cristalización de alto rendimiento (HT), el impacto de la diversidad de forma abarca cuestiones de estabilidad y biodisponibilidad, así como consideraciones de desarrollo, tales como definición de proceso, diseño de la formulación, la protección de patentes y los controles reglamentarios. Esta revisión destaca la oportunidad y desafíos de tecnologías de cristalización HT y son aplicadas en la investigación y el desarrollo farmacéutico.

Adicionalmente, el técnico medio versado en la materia conoce que, el polimorfismo es una tarea rutinaria, dentro del campo farmacéutico, ya que de no realizarse esta labor podrían presentarse casos de inestabilidad o falta de efectividad de los medicamentos preparados con dichos polimorfos, debido a que la transformación de un polimorfo en otro se presenta por procesos como compresión, pulverización, o por la mezcla con algunos excipientes. Debido a lo anterior, dentro de los estudios de preformulación se suelen incluir rigurosos trabajos para determinar la presencia de polimorfos en los medicamentos y que entre los parámetros que se investigan como rutina figuran: i) La cantidad de polimorfos que pueden llegar a configurarse, ii) el grado relativo de estabilidad de los diversos polimorfos, iii) las gamas de estabilidad térmica de cada polimorfo, solubilidades, método de preparación de cada forma, efecto de la micronización o tableteado e interacción con los componentes de la formulación, considerando que las propiedades de desempeño de cada polimorfo son diferentes (pág. 1913 ambas columnas)⁵.

El documento D1 enseña el sólido del compuesto lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6- (4-metilpiperazin-il)-IH-bencimidazol-2-il]-IH-quinolin-2-ona, y que dicho sólido es adecuado en la preparación de medicamentos orales (Pág. 4, párrafo 0012, pág.22, párr.55). De esta manera, para una persona versada en la materia sería obvio que una molécula que ya es conocida pueda presentar una nueva forma cristalina con propiedades de higroscopicidad diferentes, como es el caso d la presente solicitud.

Por lo tanto, conociendo ampliamente las consideraciones teóricas y aplicaciones análogas próximas (documentos D1 y D2) se observa que la identificación de otra forma cristalina caracterizada mediante la técnica de DRX, no presenta un avance técnico real y no representa un salto cualitativo a la regla técnica porque el efecto

5. Idem 3.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

técnico asociado fue previsto por los documentos D1 y D2, por los cuales se tendría una motivación razonable de encontrar formas cristalinas alternativas.

De otro lado, cabe indicar que al revisar en detalle la descripción presentada no se encontró algún ensayo que permitiera determinar ventajas reales de la forma B de la solicitud, en comparación con el sólido conocido con anterioridad, ya que no se presentan los resultados de los estudios que demuestran la mayor efectividad de medicamentos preparados con la forma B reclamada frente a los ya conocidos y por tanto un efecto inesperado asociado al mismo; teniendo en cuenta que en D1 se revelaban diversos tipos de composiciones farmacéuticas (párr.68-79).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, tomaría en cuenta lo divulgado en el documento D1 respecto al compuesto lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-IH-bencimidazol-2-il]-IH-quinolin-2-ona y utilizaría los métodos revelados en D2 y los conocidos por el técnico versado en la materia3 para determinar la existencia de la forma B reivindicada en la presente solicitud, con la expectativa razonable de encontrar un ordenamiento cristalino con características de higroscopicidad diferentes.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-10 y 13 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

La(s) reivindicación(es) 11-12 consiste(n) en un método para preparar el hidrato de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7, que comprende suspender una forma anhidra, cristalina de la sal de ácido láctico del compuesto de Fórmula I y dicha forma tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende picos característicos, en términos de grados 2θ, en 5.7° y 25.9°.

Tabla 2

Características esenciales	D1
Un método para preparar el hidrato de cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7, que comprende:	Método de preparación del compuesto lactato de 4 amino -5- íluoro-3-[6-(4-metilpiperazin -Hil)IH-bencimidazol-2-il]-IH-quinolin-2-ona
Suspender una forma anhidra cristalina de la sal de ácido láctico del compuesto de fórmula(I) en una solución que comprende agua y un solvente orgánico, a una temperatura de 20°C a 60°C, donde dicha agua está presente en dicha solución en una cantidad del 5% hasta 20% en volumen y dicho solvente orgánico comprende alcohol, una cetona, un nitrilo orgánico o una mezcla de los mismos.	Se hace reaccionar la molécula base con un ácido láctico en solución agua/etanol (agua en una proporción del 22%), y después de la reacción, se cristaliza el sólido utilizando un esquema de temperaturas entre 60°C y 80°C
Donde dicha forma cristalina de sal de ácido láctico del compuesto de fórmula 1 o un tautómero del mismo que tiene un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende los siguientes picos característicos en términos de grados 2 theta en 5.7° y 25.9°	No se menciona

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano porque divulga un proceso de obtención del compuesto lactato de 4- amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-1-il)1H-bencimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona (Págs. 52 y 53, Ejemplo 7).

La diferencia entre la invención definida por la reivindicación 14 y el proceso divulgado por D1 consiste en que en la invención la forma de partida es una forma anhidra cristalina de la sal de ácido láctico del compuesto de fórmula (I) un patrón de difracción de rayos X en polvo que comprende picos característicos, en términos de grados 2 θ , en 5.1° y 25.9°.

El efecto logrado por el hecho de especificar como material de partida una forma anhidra cristalina de la sal de ácido láctico del compuesto de fórmula (I) que comprende picos característicos, en términos de grados theta, en 5.7° y 25.9°, consiste en la obtención de la forma B del lactato de 4 amino -5- fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin -1-il)-1H-bencimidazol-2-il]- 1H-quinolin-2-ona.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver es: "¿cómo modificar el proceso conocido en D1 para obtener la forma B del lactato de 4-amino-5-fluoro-3- [6-(4-metilpiperazin-il) 1-H-bencimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona?"

Sin embargo, el documento D3 enseña que habiéndose determinado que una molécula puede existir en más de una forma cristalina, se establecen las condiciones para producir cada una de ellas, y de este modo, mantener las condiciones de cristalización apropiadas para asegurar una materia prima uniforme.

El documento D3 también agrega que en los estudios de preformulación se suelen incluir rigurosos trabajos para determinar la presencia de polimorfos en los medicamentos y que entre los parámetros que se investigan como rutina, figuran la cantidad de polimorfos que existen, el grado relativo de estabilidad de los diversos polimorfos, las gamas de estabilidad térmica de cada polimorfo, solubilidades, método de preparación de cada forma, efecto de la micronización o tableteo, e interacción con los componentes de la formulación, que las propiedades de desempeño del material cambian con cada polimorfo (pág. 1913 ambas columnas), y que una vez establecido que el compuesto presenta polimorfismo, existen procedimientos con los cuales el preformulador puede preparar las diversas formas en cantidades más grandes, en donde, lo que se hace es establecer las condiciones en que se puede preparar cada una de ellas, para su posterior evaluación y adecuación con el fin de incorporarlas en formas posológicas (pág. 1915 cl. iz. y pág. 1916, cl. der).

Por tal motivo, la persona del oficio normalmente versada en la materia en vista del estado de la técnica, habría inferido sin mucho esfuerzo de su parte la aplicación de conocimientos básicos sobre el polimorfismo al lactato de 4-amino-5- fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-1-il) 1-H-bencimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona, con la expectativa razonable de encontrar una forma cristalina hidratada con propiedades de higroscopicidad diferente.

Adicionalmente, aplicando las técnicas de preparación de diferentes formas cristalinas, tal como lo establece la bibliografía básica del campo técnico², resulta obvio para la persona de nivel medio versada en la materia técnica diseñar un procedimiento de preparación de dichas formas, más aún con conocimiento del fundamento teórico para la obtención de cristales por diferencias en solubilidad y por

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

modificación de parámetros adicionales como la temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación, etc., con el fin de obtener la forma cristalina reivindicada.

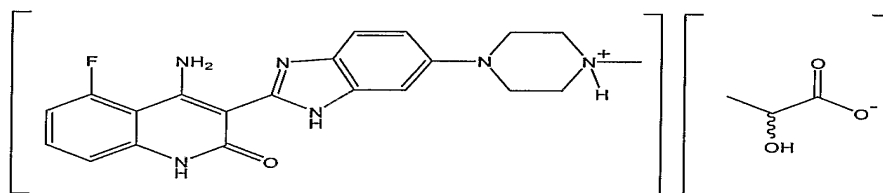
De acuerdo a lo anterior, el procedimiento reclamado en la reivindicación 11 se considera obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia y en consecuencia, carece de nivel inventivo.

Puesto que la reivindicaciones dependiente 12 no menciona ninguna característica inventiva adicional tampoco se puede considerar inventiva.

En referencia a la respuesta al examen de fondo identificado con el oficio N° 20851, se observa que el solicitante declara que adjunta un nuevo capítulo reivindicatorio modificado de manera voluntaria reemplazando en su totalidad al de fecha diciembre 14 de 2011 el cual no amplía la materia correspondiente a la divulgación inicial sino que limita la materia reivindicada.

Esta Oficina encuentra que la reivindicación 4 del nuevo capítulo se menciona un pico en términos de grados de 5,3° que no hace parte del patrón de difracción de rayos X del producto reivindicado (cristal)

En cuanto a los argumentos del solicitante frente a la falta de nivel inventivo, esta Oficina encuentra que respecto a D1 y contrario a lo afirmado por el solicitante este documento sí divulga la preparación de una sal de ácido láctico del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona (pág. 52).



También menciona que dicho compuesto lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona, es adecuado en la preparación de medicamentos orales (Pág. 4, párrafo 0012, pág.22, párr.55).

Respecto a la comparación entre la forma B del compuesto de la solicitud y la A divulgada en D1, esta Oficina reitera que para una persona versada en la materia sería obvio que una molécula que ya es conocida pueda presentar otra forma cristalina con propiedades de higroscopicidad diferentes, correspondiendo estos resultados simplemente a la evaluación de una propiedad fisicoquímica de una nueva forma cristalina del compuesto 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona y no es posible afirmar que se haya resuelto algún problema técnico, debido a que el compuesto lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6-(4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2-ona, su actividad terapéutica y su utilidad en la preparación de formulaciones farmacéuticas que comprendan la sal del ácido láctico del compuesto de fórmula I, ya se habían dado a conocer, de manera que no era inesperado. Por otra parte, el establecimiento o la determinación de ciertas propiedades fisicoquímicas de un nuevo cristal es una labor rutinaria en formulación farmacéutica, por lo tanto, en el presente caso, la forma cristalina B del

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

lactato de 4-amino-5-fluoro-3-[6- (4-metilpiperazin-il)-1H-benzimidazol-2-il]-1H-quinolin-2ona carece de un efecto técnico inesperado o sorprendente.

En cuanto a que D2 y D3 asegura que dan a conocer generalidades acerca de los polimorfos en el campo farmacéutico, así como ciertas técnicas de síntesis de polimorfos, dichos documentos no sugieren ni ilustran de manera explícita cómo obtener el polimorfo reclamado por la presente invención, ni motivarían a una persona medianamente versada en la materia a obtener el compuesto reclamado por la presente solicitud (particularmente la forma B).

A la afirmación que la investigación de las diferentes formas sólidas de un medicamento puede conducir al desarrollo de nuevos productos con propiedades mejoradas, tales como mayor estabilidad, que resultan ventajosos y deseables en operaciones de procesamiento farmacéutico a gran escala, involucrando un esfuerzo en el desarrollo de estas mejoras, esta Oficina responde que la posibilidad de obtener polimorfos de un determinado compuesto es plenamente del conocimiento común de la persona del oficio medianamente versada en la materia que no se requiere ningún tipo de literatura especializada en fenómenos de cristalización para llevar a cabo la invención aquí reclamada.

Según el argumento que el análisis de nivel inventivo no puede estar basado en si es o no posible obtener la invención reclamada, pues claramente era posible, toda vez que las formas polimórficas reivindicadas existen, esta Oficina responde que el análisis de Nivel inventivo no se realizó basándose en si es o no posible obtener la invención reclamada sino mediante un análisis de la materia reclamada a través de la metodología se realizó mediante la aproximación problema-solución en polimorfos (Patenting Polymorphs at the European Patent Office) la cual da como resultado la obviedad según los documentos que constituyen el arte previo y el conocimiento común.

Por lo tanto, conociendo ampliamente las consideraciones teóricas y aplicaciones análogas próximas (documentos D1 y D2) se observa que la identificación de otra forma cristalina caracterizada mediante la técnica de DRX, no presenta un avance técnico real y no representa un salto cualitativo a la regla técnica porque el efecto técnico asociado fue previsto por los documentos D1 y D2, por los cuales se tendría una motivación razonable de encontrar formas cristalinas alternativas.

De otro lado, es de indicar que al revisar en detalle la descripción presentada no se encontró algún ensayo que permitiera determinar ventajas reales de la forma B de la solicitud, en comparación con el sólido conocido con anterioridad, ya que no se presentan los resultados de los estudios que demuestran la mayor efectividad de medicamentos preparados con la forma B reclamada y por tanto un efecto inesperado asociado al mismo.

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,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:38936

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-134575

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “FORMAS CRISTALINAS Y OTRAS FORMAS DE LAS SALES DE ÁCIDO LÁCTICO DE 4-AMINO-5-FLUORO-3-[6-(4-METILPIPERAZIN-1-IL)-1H-BENCIMIDAZOL-2-IL]-1H-QUINOLIN-2-ONA”.

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 cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 24 Jun 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA, office@olartemoure.com

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño Fernández