



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3º del Decreto 4886 de 2011 y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado ante esta Superintendencia el 08 de febrero de 2008 con el N° 08-012824-00000-0000, por la sociedad Novartis AG, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "FORMULACIONES LÍQUIDAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2006/030836 del 08 de agosto de 2006.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma, con fundamento en el artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, en concordancia con el Tratado de Cooperación en materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a la solicitante mediante Oficio N°00564, notificado el 19 de enero de 2012, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de novedad, conforme lo establece el artículo 16 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 08-012824-00006-0000 del 28 de mayo de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 6 (Fl. 89) que reemplazan 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 según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se 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 6, contenidas en el Fl. 89, carecen de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

El objeto de la invención consiste en dar solución a la necesidad de proporcionar composiciones farmacéuticas líquidas estables que comprenden un modulador o agonista del receptor S1P, útiles para el tratamiento de enfermedades relacionadas con inmunosupresión. Para solucionar este problema, la solicitud estudiada proporciona una composición farmacéutica líquida que comprende un agonista del receptor S1P o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y propilenglicol.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 9 de agosto de 2005, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos anteriores a la fecha de reivindicación de prioridad, relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

No.	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US20040058894	SELECTIVE S1P/EDG1 RECEPTOR AGONISTS.	03/ 25 /2004
D2	EP1050301	MEDICINAL COMPOSITIONS	08/11/2000

D1¹ enseña una composición farmacéutica líquida que comprende un agonista del receptor S1P o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y propilenglicol.

D2² divulga una composición farmacéutica, polvo liofilizado, que contiene 2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil] propane-1,3-diol o una sal de éste y ciclodextrina, opcionalmente un sacárido como manitol, la cual es usada en tratamiento inmunosupresor de enfermedades autoinmunes(folio 148; abstract, folio 149 párrafo 18).

6.3. Nivel inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma Decisión 486 "Se considerará que una

1<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

CC=US&NR=2004058894A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20040325&DB=EPODOC&locale=en_EP

2<http://worldwide.espacenet.com/searchResults?>

NUM=ep1002792&DB=EPODOC&locale=en_EP&ST=number&compact=false

Página 2 de 6

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1926504956

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

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".

Visto lo anterior, se advierte que la solicitud resulta obvia y se deriva de manera evidente a partir de la información enseñada por el estado del arte, tal como a continuación se sustenta:

La reivindicación 1 consiste en una composición farmacéutica para dilución antes de su administración, que comprende un modulador o agonista del receptor S1P seleccionado a partir de 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol, 2-amino-2-[4-benciloxifeniltio)-2-clorofenil]etil-1,3-propano-diol o un fosfato correspondiente del mismo, y ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-triflurometil-benciloxiimino)-etil-2-etil-bencil]-azetidín-3-carboxílico, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y 65 a 99% en peso de propilenglicol, basado en el peso total de la composición.

De acuerdo con lo anterior, en el siguiente cuadro comparativo se muestran las características técnicas esenciales de la invención y aquellas reveladas en el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Composición que comprende	Composición que comprende	Composición que comprende
agonista del receptor S1P seleccionado a partir de: 1) 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol (FTY720); 2) 2-amino-2-[4-benciloxifeniltio)-2-clorofenil]etil-1,3-propano-diol o un fosfato y 3) ácido 1-{4-[1-(4-ciclohexil-3-triflurometil-benciloxiimino)-etil-2-etil-bencil]-azetidín-3-carboxílico o una sal del mismo.	agonista del receptor S1P: 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol una sal del mismo (FTY720) al 1,5%	agonista del receptor S1P: 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol una sal del mismo (FTY720)
Propilenglicol del 65 al 99% en peso total de la composición.	Propilenglicol al 10%	ciclodextrina 1 al 50%

El estado de la técnica cercano corresponde a los documentos D1 y D2 en donde: D1 divulga una composición farmacéutica en forma líquida del compuesto 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol una sal del mismo (FTY720, párrafo 79, Pág.25 y párrafo 14 , Pág.2) y propilenglicol al 10% (párrafo 95, Pág.26).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y la composición de D1, consiste en que la composición reivindicada con el principio activo 2-amino-2-[2-(4-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

octilfenil)etil]propano-1,3-diol, tiene una mayor proporción de propilenglicol 65 al 99%.

No se evidencia un efecto técnico porque la composición tenga una mayor proporción de propilenglicol (65 al 99%).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo de esta solicitud consiste en cómo obtener una composición farmacéutica líquida con una mayor proporción de propilenglicol, de un principio activo como el 2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil] propano-1,3-diol.

Adicionalmente D2, enseña formas de dosificación líquidas, para administración oral (párrafo 17, Pág.3) del compuesto 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol o una sal del mismo que al estar en solución acuosa menor al 0.05% se disuelven sin formar micelas pero a concentraciones mayores que 0.1%, se disuelven con la formación de micelas (párrafo 16, Pág.3); asimismo se enseña que a una concentración entre 0.05% y 0.1% en agua, se presenta formación de cristales del compuesto y que al agregar ciclodextrina se evitaba la formación de dichos cristales.

Por otra parte, no se realizó ningún ensayo comparativo de estabilidad, con el estado de la técnica, que permita evidenciar algún efecto técnico como lo menciona el solicitante al afirmar que la composición es estable durante más de seis meses a temperatura ambiente (líneas 13 a 16, Pág.21, Fl.58) y por el contrario obtener composiciones de componentes conocidos como el compuesto 2-amino-2-[2-(4-octilfeniletil)]propano-1,3-diol una sal del mismo y el propilenglicol, a diferentes concentraciones es una tarea de rutina del experto en la materia. Por otro lado, se observa que las formulaciones de la solicitud en estudio en los ejemplos 1,2 y 3 (Pág. 26, Fl.63) tienen una concentración del principio activo de 1.1% y 0,56% y que el propilenglicol está en una proporción de más del 80%, lo cual muestra que no son composiciones concentradas como lo afirma el solicitante sino por el contrario son diluidas.

Cabe mencionar que el propilenglicol junto con la glicerina (Fl.93, Pág.296) son solventes muy comunes utilizados en la obtención de preparaciones farmacéuticas líquidas, por lo tanto es tarea de rutina para el experto en la materia durante los desarrollos de dichas formulaciones determinar la solubilidad del principio activo de interés, en el mejor solvente, de acuerdo a ciertas condiciones, entre otras la temperatura (Fls.90 a 96)³; adicionalmente, ya en D2 se revelaba a qué concentraciones no era soluble en agua este principio activo, lo cual motiva a la persona medianamente versada en la materia para ensayar la solubilidad de este principio activo en un solvente como el propilenglicol, el cual tiene grupos hidroxilos

3 Farmacia Remington, Alfonso R. Gennaro, Ed 19ª Tomos 1 y 2, Págs. 2291 a 2293, 296,281 y 288 a 289.

Página 4 de 6

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1926504956

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

como la ciclodextrina, que permiten la unión del soluto (2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil]propano-1,3-diol una sal del mismo) al solvente (propilenglicol) y su solubilización a diferentes concentraciones evitando así la formación de cristales.

Por consiguiente, de acuerdo a las enseñanzas de D1, en cuanto a que ya eran conocidas las formulaciones líquidas para administrar vía oral el compuesto: 2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil]propano-1,3-diol una sal del mismo y a como fue resuelto en D2 el problema de formación de cristales de este principio activo, la persona del oficio medianamente versada en la materia estaría motivada a desarrollar una formulación líquida para administración oral del compuesto 2-amino-2-[2-(4-octilfenil)etil] o una sal del mismo con un alto contenido del solvente propilenglicol.

De manera que la solución propuesta al problema técnico planteado en esta solicitud en la reivindicación 1 es obvia y no tiene Nivel Inventivo. Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 6, no agregan ninguna característica inventiva a la presente reivindicación, se concluye que estas tampoco son inventivas.

En consecuencia, la materia reclamada en la presente solicitud carece de nivel inventivo y, por ende, no cumple lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486.

Con relación a los argumentos presentados por el solicitante esta oficina se permite aclarar que frente al documento D1 la composición reivindicada es nueva, pero en cuanto a que la composición que comprenda un agonista del receptor S1P o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, propilenglicol y opcionalmente glicerina es inventiva, porque sorprendentemente sea físicamente estable por largos períodos de tiempo (lo cual no es un parámetro de un diseño para un estudio de estabilidad); se aclara que mediante lo observado en la descripción esta afirmación no se puede evidenciar y se concluye que no existe un efecto técnico que sea logrado mediante la composición que se reclama y que el problema se resolvió de manera obvia utilizando el propilenglicol en diferentes proporciones.

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 "FORMULACIONES LÍQUIDAS".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Carlos R. Olarte, en su calidad de apoderado de la sociedad Novartis AG, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el

Página 5 de 6

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36455

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-12824

cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE
Dada en Bogotá D.C., el 15 Jun 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),


CARMEN LÚCIA VALDERRAMA ROJÁS

Doctor:
CARLOS R. OLARTE
Diagonal 34 N° 5-38
Bogotá D.C.

Elaboró: Lina Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo ✓
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓