

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60321

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad.PCT/09-025191

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

En ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 27327 del 10 de mayo de 2013, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: "4-[4-([(4-CLORO-3-TRIFLUOROMETIL)FENIL]CARBAMOIL)AMINO)-3-FLUOROFENOXI]-N-METILPIRIDINA-2-CARBOXAMIDA MONOHIDRATO", con fundamento en los artículos 16 y 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con los requisitos de novedad y nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 28 de junio de 2013 con el No. 09-025191-00012-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Bayer Schering Pharma Aktiengesellschaft interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La recurrente manifiesta que contrario a lo expresado por esta Oficina el documento D1 no destruye la novedad de la reivindicación 1, aunque "... describe el compuesto de fórmula (I) y de manera genérica 'sus solvatos, hidratos, sales farmacéuticamente aceptables o una combinación de estos'.

Afirma además que "En la respuesta al examen de patentabilidad, ya habíamos mencionado que el documento D1 solo hacía referencia de manera genérica a los hidratos pero que no describía específicamente el monohidrato reivindicado en la presente invención y por ello la reivindicación 1 era nueva. Es una regla bien conocida en la práctica de patentes, y así lo atestiguan por ejemplo las guidelines de la EPO (ver GL G.VI-5), que lo genérico (hidrato) no anticipa lo específico (monohidrato). En este caso, el objeto reivindicado en forma de monohidrato se trata de una selección novedosa de lo descrito en el documento D1." Agrega que ha "...ha modificado la reivindicación 1 (ver anexo) para especificar que el monohidrato de fórmula (II) reivindicado está en forma cristalina." Agrega que desiste de las reivindicaciones 2 a 4 que se refieren al procedimiento.

Señala a continuación que "El documento D1 describe el compuesto base libre de agua que es el compuesto de fórmula (I) de la presente invención donde se ha descubierto que el monohidrato tiene una estabilidad muy alta y se forma durante el aumento de escala del procedimiento de fabricación con una preferencia muy alta respecto al compuesto libre de agua. Esto significa que, en presencia de agua en el procedimiento de fabricación, el monohidrato se forma directamente, y es muy difícil obtener el producto libre de agua en tal procedimiento. Este aspecto es muy importante en la síntesis de compuestos

Página 1 de 5

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60321

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad.PCT/09-025191

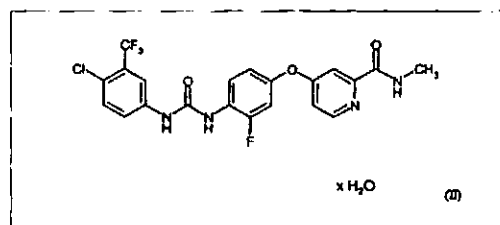
farmacéuticos a escala industrial, porque cuando se aumenta de escala el procedimiento es mucho más fácil de usar disolventes convencionales que pueden contener agua y usar procedimientos de tratamiento acuosos. Es mucho más caro y complejo producir una sustancia libre de agua porque todos los disolventes usados en el procedimiento deben mantenerse y manipularse bajo exclusión de agua. El monohidrato permite ahora el uso de disolventes convencionales que contienen trazas de agua. Adicionalmente, las etapas de extracción con agua pueden realizarse fácilmente. Esto no es posible en la síntesis del producto libre de agua; aparte de ello, es necesaria una etapa de secado final costosa. No hay nada en la técnica anterior que enseñe o sugiera que el monohidrato puede obtenerse en un procedimiento de fabricación en condiciones convencionales más fáciles y mejor que las del producto libre de agua. Sorprendentemente, el monohidrato se prefiere sobre el producto libre de agua y, sorprendentemente, tiene un mejor comportamiento de cristalización que el polimorfo I. Esto es importante, por ejemplo, en el procedimiento de fabricación."

En cuanto se refiere a la estabilidad, afirma que se hicieron dos ensayos que presentaron los siguientes resultados: (1) transformó el clorhidrato en monohidrato y (2) recrystalizó el polimorfo I en (a) solvente con agua y (b) solvente sin agua. Después analizó los productos y encontró que (1) el monohidrato contenía menos de 50 ppm del producto secundario indeseado, metilamida y (2) el polimorfo I contenía 2000 - 5000 ppm del producto secundario indeseado, metilamida. De otro lado, después de almacenar los productos a 60 °C durante 6 meses, observó que (1) el monohidrato aumentó en 12 ppm la cantidad de producto secundario indeseado, metilamida y (2) el polimorfo I aumentó en 23 ppm la cantidad de producto secundario indeseado, metilamida.

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto en los siguientes términos:

Con relación al argumento según el cual el documento D1 no destruye la novedad de la reivindicación 1, aunque describe el compuesto de fórmula (I) y de manera genérica 'sus solvatos, hidratos, sales farmacéuticamente aceptables o una combinación de estos', esta Oficina considera que tal como lo presenta la única reivindicación 1 en el nuevo capítulo reivindicatorio, esto es:

"Un compuesto de la fórmula (II):



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60321

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad.PCT/09-025191

en forma cristalina.", este cristal puede considerarse nuevo.

De otro lado, asiste razón a la recurrente en su afirmación según la cual dado que el documento D1 menciona de forma genérica los hidratos, mas no el monohidrato específicamente y lo genérico (hidrato) del estado de la técnica no anula la novedad de lo particular (monohidrato) que se reivindica, este cristal, en sentido estricto, es nuevo.

Esta Oficina aclara que se acepta el desistimiento de las reivindicaciones 2 a 4 que se refieren al procedimiento.

En cuanto tiene que ver con la afirmación de que el documento D1 describe el compuesto base libre de agua, esta Oficina considera que es una contradicción respecto a lo que la recurrente había afirmado antes, dado que el documento divulga, aunque de manera genérica, los solvatos, dentro de los cuales se encuentra el monohidrato reivindicado.

De otro lado, el hecho de que el monohidrato tenga mayor estabilidad que el cristal del estado de la técnica, esta Oficina aclara que la persona versada esperaría que el compuesto tienda a configurarse en la forma cristalina más estable posible, que es lo que en realidad se confirmó mediante las pruebas presentadas por la recurrente, según las cuales el cristal monohidrato (II) es más estable que el cristal anhidro del estado de la técnica, de manera que estos resultados no son evidencia relevante de que se haya logrado algún efecto técnico sorprendente para la persona versada, que haya sido causado, ni pueda ser directamente atribuido, al cristal reivindicado en esta solicitud. De otro lado, el formulador debe elegir, como se sabe bien en el medio y lo presentan los manuales de uso común (ver por ejemplo el libro de Aulton¹, Pág. 144, Col. 2, Párr. 1) el cristal del compuesto que sea más estable durante la vida del producto. Es claro, entonces, que para escoger el cristal más apropiado para preparar las composiciones farmacéuticas es necesario realizar ensayos rutinarios de prueba y error y no pretender elegir un cristal u otro al azar, sino que el formulador debe utilizar la forma cristalina que haya mostrado ser más estable. Por lo tanto, en este caso particular esta Oficina considera que el elegir un cristal más estable que el cristal mencionado en el documento D1 no es un hecho que sea sorprendente para la persona versada en la materia, por lo cual se considera obvio y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Con respecto al procedimiento de fabricación en el cual "... en presencia de agua ... el monohidrato se forma directamente, y es muy difícil obtener el producto libre de agua en tal procedimiento ..." esta Oficina considera que este argumento es contradictorio porque ya no se reivindica el proceso. Y porque si es más fácil producir el monohidrato, significa que es obvio para la persona versada y por lo tanto no tiene nivel inventivo.

Se advierte además, con respecto los resultados presentados que el hecho de que el monohidrato contenía menos de 50 ppm del producto secundario indeseado, metilamida y el polimorfo I contenía 2000 - 5000 ppm no es resultado relevante, dado que este contenido depende directamente de la cantidad de impureza que contenía el polimorfo de partida y en este caso particular no se informa cuál era el contenido de impureza del clorhidrato ni del polimorfo I, que son las 'materias primas' de

¹Pharmaceutics: the science of dosage form design. Aulton, Michael E., 2da. Ed. Elsevier Ltd, Philadelphia, 2002. Pág. 337.
Página 3 de 5

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60321

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad.PCT/09-025191

partida.

De la misma manera, en lo que se refiere al resultado según el cual el cristal monohidrato es más estable que el polimorfo I por su bajo contenido de impureza cuando se expone a a 60 °C durante 6 meses.

De otro lado, de acuerdo con los conocimientos del estado de la técnica era de preverse que uno de los cristales tuviese mayor estabilidad, por lo cual esta no es evidencia de nivel inventivo, porque la persona versada sabe que todo compuesto tiende a configurarse en la forma cristalina más estable posible, es decir, en aquella que tiene una estructura cuya energía es mínima ("Una introducción sobre las imperfecciones cristalinas"²).

De manera que, siendo estos resultados de esperarse, el cristal reivindicado se considera obvio y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

En cuanto tiene que ver con las pruebas presentadas por la recurrente, esta Oficina reitera que la persona versada esperaría que el compuesto tienda a configurarse en la forma cristalina más estable posible, que es lo que en realidad se confirmó mediante las pruebas presentadas por la recurrente, según las cuales el cristal monohidrato es más estable que el cristal I, de manera que estos resultados no son evidencia relevante de que se haya logrado algún efecto técnico sorprendente para la persona versada, que haya sido causado, ni pueda ser directamente atribuido, al cristal reivindicado en esta solicitud y, en consecuencia, puede concluirse que el cristal reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo, por lo tanto puede concluirse que el objeto reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo.

Por lo anteriormente expuesto, se reitera que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad legalmente previstos, específicamente el de nivel inventivo; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución No. 27327 del 10 de mayo de 2013, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

²<http://www.spanishminerals.com/Article;%20Imperfecciones%20cristalinas.htm>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60321

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad.PCT/09-025191

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Bayer Schering Pharma Aktiengesellschaft, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D. C., el 17 Oct 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor

JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS

mde@mdelaw.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Carlos Daniel Lemus Giraldo ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓