

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

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 2 de diciembre de 2013, con el N° 13-282303-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Kempharm Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PROFÁRMACOS DE METILFENIDATO, PROCESOS DE ELABORACIÓN Y UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2012/048641 del 27 de julio de 2012.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 690 del 20 de marzo de 2014, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 14965, notificado por fijación en lista el 09 de diciembre de 2014, se requirió a (las) solicitante(s) 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 (las) solicitante(s) mediante escrito radicado bajo el N° 13-282303-00007-0000 el 4 de marzo de 2015, respondió (respondieron) oportunamente el requerimiento formulado y presenta(n) nueva(s) reivindicación(es) 1 a 8 que reemplaza(n) la(s) originalmente presentada(s), 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 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 la(s) reivindicación(es) 1 a 8, no cumple(n) con el requisito de nivel inventivo, Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

6.1. Objeto de la invención.

El problema técnico consiste en la necesidad de formas solubles en agua y biodisponibles de metilfenidato que mantengan el beneficio farmacológico cuando se administra, en particular a través de la ruta oral.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una conjugación mediante un enlace amida de metilfenidato con un aminoácido estándar, aminoácidos no estándar y aminoácidos sintéticos.

6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 28 de julio 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	US20070123468	"Produgs of active agents"	31/mayo/2007
D2	US20110021564	"Method of treating binge eating disorder and obesity resulting from binge eating behavior"	27/enero/2011

El documento D1¹ divulga enseña profármacos de agentes activos que contienen por lo menos una amina, donde dicho agente puede ser metilfenidato (resumen).

El documento D2² divulga composiciones para tratar desórdenes alimenticios que incluye la administración de una composición que comprende un profármaco de metilfenidato (Resumen).

6.3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo.

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

1[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20070531&CC=US&NR=2007123468A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20070531&CC=US&NR=2007123468A1&KC=A1

2[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20110127&CC=US&NR=2011021564A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20110127&CC=US&NR=2011021564A1&KC=A1

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

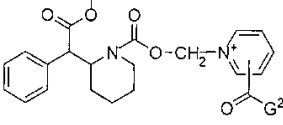
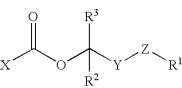
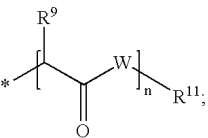
Rad. PCT/13-282303

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 profármaco reclamado(a) en la solicitud tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la(s) reivindicación(es) 1 a 8 está(n) referida(s) a: “Una composición de profármaco que comprende por lo menos un conjugado de metilfenidato...” (Ver radicado N° 13-282303-00007-0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la(s) reivindicación(es) 1 a 8, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
Una composición de profármaco que comprende por lo menos un conjugado de metilfenidato donde el conjugado tiene la siguiente estructura: 	Composiciones que comprenden profármacos de metilfenidato de fórmula:  En donde X es metilfenidato (Párrs. [0103] y [0106]) CR ² R ³ R ² y R ³ son hidrógeno (Párr. [0084]) Y es heteroaril	Enseña las ventajas del grupo amino del metilfenidato para la formación de profármacos mediante la formación de enlaces covalentes con aminoácidos, di o tripéptidos, o profármacos tipo carboxamida y carbamato por reacción con un ácido orgánico alifático o un aldehído alifático. (Párrs. [0054] y [0055]) La anterioridad enseña composiciones y métodos de tratamiento que incluyen profármacos de metilfenidato.
en donde G2 se selecciona del grupo que consiste de aminoácidos estándar, aminoácidos no estándar y aminoácidos sintéticos; y en donde el aminoácido está unido al resto de la molécula por un enlace amida.	Z es -N(R ⁸)- Donde R ⁸ es  (Párr. [0113])	

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 enseña composiciones farmacéuticas que comprenden profármacos de metilfenidato y métodos para producirlos

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

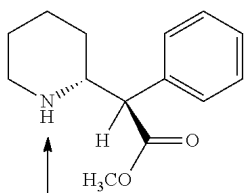
(reivindicaciones).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los profármacos de D1 consiste en que la solicitante selecciona como sustituyente G1 un derivado de ácido carboxílico de piridina.

Estas diferencias no parecen conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja los compuestos reivindicados debido a que el arte previo enseña que los agentes activos que poseen por lo menos un grupo amino, fenol, ácido carboxílico o tiol, pueden ser funcionalizados para formar un profármaco, el cual incluye un grupo espaciador y un resto escindible. Los resultados de ensayo presentados por la solicitante no evidencian alguna ventaja ya que el documento D1 enseña que la formación de profármacos de los agentes activos potencialmente incrementa la biodisponibilidad y provee propiedades fisicoquímicas superiores, al igual que resistencia al abuso por parte de los pacientes (Párrs. [0005] y [0006]).

El problema técnico objetivo de esta solicitud consiste en la necesidad de profármacos de metilfenidato alternativos a los divulgados en D1.

Por su parte, el documento D2 ya divulgaba el sitio químicamente accesible al cual los grupos lábiles pueden ser adicionados para crear los profármacos de metilfenidato :



El documento D2 igualmente enseña que los profármacos de metilfenidato tipo aminoácido pueden ser preparados mediante los mismos métodos generales como descritos en US 7.105.486 para la preparación de profármacos de amina de la anfetamina. Los profármacos de aminoácidos de metilfenidato pueden comprender enlaces covalentes a un único aminoácido con el nitrógeno de la piperidina o la unión de un di o tri péptido a esta posición. También es una síntesis orgánica rutinaria el preparar profármacos de metilfenidato tipo carboxamida y carbamato mediante la reacción del metilfenidato con aldehídos alifáticos o un ácido orgánico alifático.

La anterioridad D2 también indica que el metilfenidato contiene una amina secundaria la cual puede reaccionar para formar profármacos mediante la formación de un enlace covalente. Los profármacos de compuestos que contienen un grupo amino se discuten en US 2007/0123468.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, motivada

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

por las enseñanzas del documento D2 establecería profármacos alternativos a los discutidos D1 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 dependientes 2 – 8 es obvia y no tiene nivel inventivo.

Con referencia a la afectación por falta de nivel inventivo la sociedad solicitante indica en su respuesta que los documentos D1 y D2 son completamente silenciosos, cuando se toman solos o en combinación, con respecto a una composición que comprende un conjugado de profármaco de metilfenidato unido a un aminoácido en el que el aminoácido está unido al resto de la molécula mediante un enlace amida a través del radical carboxipiridina. Agrega la solicitante que los conjugados reclamados no podrían haber sido derivados en forma obvia de las divulgaciones de D1 y D2, debido a que el experto en la materia no habría estado motivado para utilizar las características descritas en las referencias y llegar a los conjugados reclamados en las nuevas reivindicaciones de manera obvia.

Esta Superintendencia encuentra que contrario a lo afirmado por la solicitante, el arte previo en su conjunto representado por los documentos D1 y D2 los cuales fueron oportunamente trasladados a la solicitante, sí proveen información suficiente que direcciona a la persona versada en la materia a seleccionar una formulación que comprenda un profármaco unido a un aminoácido. Como se evidenció en el examen de nivel inventivo y en la tabla comparativa, el documento D1 comprende los profármacos de metilfenidato con un aminoácido unido mediante un radical carboxipiridina (Párrs. [0084, 0103, 0106, 0113]) . Por su parte, el documento D2 ya divulgaba el sitio químicamente accesible al cual los grupos lábiles pueden ser adicionados para crear los profármacos de metilfenidato, e indica que los profármacos de metilfenidato tipo aminoácido pueden ser preparados mediante los mismos métodos generales como descritos en US 7.105.486 para la preparación de profármacos de amina de la anfetamina.

Como se puede observar, el arte previo sí reúne enseñanzas suficientes para que la persona versada en la materia seleccione los profármacos de aminoácido de metilfenidato que si bien no están divulgados de manera expresa en el documento D1 se encuentran comprendidos dentro del alcance de la definición de la Markush. Por otra parte, la descripción no evidencia ningún efecto técnico inesperado o sorprendente relacionado con los profármacos reivindicados, conforme lo divulgado en las tablas 2 a 5 de la presentes solicitud, debido a que el documento D1 enseña que la formación de profármacos de los agentes activos potencialmente incrementa la biodisponibilidad y provee propiedades fisicoquímicas superiores, al igual que resistencia al abuso por parte de los pacientes (Párrs. [0005] y [0006]).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

En consecuencia, esta Superintendencia considera que el objeto reivindicado corresponde a una selección obvia y no inventiva de la materia que se encuentra divulgada de manera implícita en D1 y que a su vez el documento D2 sugiere cómo seleccionar los presentes compuestos debido a que enseña el sitio químicamente accesible para la formación de profármacos de metilfenidato y divulga que los profármacos de aminoácidos de metilfenidato pueden comprender enlaces covalentes a un único aminoácido con el nitrógeno de la piperidina o la unión de un di o tri péptido a esta posición (Párrs. [0054] y [0055]).

Indica la solicitante que el señor examinador no enfoca su análisis en el momento en el que el solicitante plantea un problema con el fin de solucionar fallas técnicas existentes en los productos convencionales de un campo técnico específico, sino que se enfoca en la solución dada al problema planteado y en la búsqueda de documentos con conceptos análogos.

En relación con los anteriores argumentos esta Oficina considera que las afirmaciones realizadas por la solicitante están equivocadas debido a que el análisis realizado se fundamenta en la metodología del problema solución en donde como se puede apreciar se identificó el problema a solucionar por parte de la solicitante y la solución propuesta por la misma y a su vez se evaluó si dicha solución era nueva e inventiva frente al arte previo publicado a la fecha de prioridad. Sin embargo, como se concluyó en el examen de nivel inventivo la solicitud carece de una ventaja o efecto técnico inesperado o sorprendente y se fundamenta en una selección de profármacos de aminoácido del metilfenidato realizada a partir de la divulgación contenida en el documento D1 junto con las enseñanzas de la anterioridad D2, los cuales son documentos pertinentes para analizar la patentabilidad de la presente solicitud ya que resolvían de manera previa el problema técnico planteado en la presente solicitud mediante el mismo tipo de compuestos.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud, el título quedará de la siguiente manera: “COMPOSICIONES DE PROFÁRMACO QUE COMPRENDE POR LO MENOS UN CONJUGADO DE METILFENIDATO Y UN AMINOÁCIDO ESTÁNDAR, AMINOÁCIDOS NO ESTÁNDAR O AMINOÁCIDOS SINTÉTICOS UNIDOS MEDIANTE UN ENLACE AMIDA”.

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:20103

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-282303

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPOSICIONES DE PROFÁRMACO QUE COMPRENDE POR LO MENOS UN CONJUGADO DE METILFENIDATO Y UN AMINOÁCIDO ESTÁNDAR, AMINOÁCIDOS NO ESTÁNDAR O AMINOÁCIDOS SINTÉTICOS UNIDOS MEDIANTE UN ENLACE AMIDA”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Kempharm Inc., 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)

SILVANA MARÍA LÓPEZ DÍAZ, notificaciones@clarkemodet.com.co

Elaboró: Emilse Cano Urrego
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño FernÁndez