

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogada
 LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
 clientes@cavelier.com; cavelier@cavelier.com

ASUNTO	Radicación	09 082 396
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	6 - 15104

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Vía PC! (Fase Nacional)	☒	☒ Capítulo I ☒ Capítulo II
No Solicitud Internacional		PCT/EP2008/000975
Fecha de Presentación Internacional		08/Febrero/2008

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 35 a 51	06/Agosto/2009
Reivindicaciones:	Folios 52 a 55	06/Agosto/2009
Dibujos:	Folios 57 a 59	06/Agosto/2009
Oposiciones:	Folios 79 a 99	Lafranco! 15/Marzo/2011
Respuesta del solicitante:	Folios 103 a 143	28/Diciembre/2011
Prioridad:	ES P200700362	09/Febrero/2007

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Sal de napadisilato de 5-(2-{{6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino}-1-hidroxietil)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona como agonista del receptor adrenérgico $\beta 2$ ".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad sales de 5-(2-{{6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino}-1-hidroxietil)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona estables, no deliquescentes, con baja higroscopicidad y puntos de fusión que permitan su micronización.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una sal cristalina de mononapadisilato y/o heminapadisilato de 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietil)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona y sus solvatos farmacéuticamente aceptables.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D215/26.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal (d))

El objeto de las reivindicaciones 15 - 17 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 7 y 18 - 19 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara porque emplea el término "sal cristalina", pero esta no se caracterizan apropiadamente debido a que no presenta el patrón de difracción de rayos X en mono cristal, el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP) con por lo menos los 20 picos correspondientes a las intensidades de los haces difractados o a los espacios interplanares d_{hkl} según los índices de Miller (hkl) medidos de acuerdo con el ángulo de difracción de Bragg 2θ en el intervalo más representativo comprendido entre 5° hasta 90° , las espectroscopías Raman e IR, la espectroscopía RMN- C^{13} , o, los métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC. Se solicita eliminar el término del pliego reivindicatorio o caracterizar la forma cristalinas de acuerdo a lo que se encuentre debidamente soportado en la descripción.

Las reivindicaciones 1, 2, 4 y 5, no son claras cuando emplean los término "solvato" del cual en la descripción señala "se refiere a un complejo agregado formado por una o más moléculas de un soluto, es decir, una sal de la invención o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma, y uno o más disolventes", sin embargo, en ninguna parte de la descripción se encuentra soporte de los solvatos que hayan sido obtenidos o probados. Se sugiere eliminar el término del pliego reivindicatorio.

Las reivindicaciones 6 y 8 no son claras porque emplea el término "una cantidad terapéuticamente eficaz", el cual es un resultado a alcanzar no definen la composición farmacéutica porque la invención no queda definida por el resultado a alcanzar, puesto que la reivindicación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese resultado. Se sugiere reemplazarlo por las características esenciales, estructurales o funcionales, que contribuyen a la obtención de ese efecto.

Las reivindicaciones 7 y 19 no son claras porque indica el uso que puede darse al compuesto reivindicado, lo cual no es una característica técnica que defina la invención o aporte algo adicional al compuesto ya reclamado. Se sugiere eliminar esta reivindicación del alcance del pliego reivindicatorio.

Las reivindicaciones 8 y 12 - 14 no son claras, ni concisas cuando emplean los términos "uno o más ingredientes activos adicionales", "sales que se reivindican en las solicitudes de patente...", "compuestos reivindicados en las solicitudes de patente...", porque son imprecisos, no definen la cantidad, ni los ingredientes activos que acompañan a la sal de la invención en la composición farmacéutica, dando lugar a que se obtengan un número indefinido de composiciones de las cuales no se encuentra soporte en la descripción. Se sugiere al solicitante eliminar estas reivindicaciones.

La reivindicación 9 no es clara cuando emplea los términos "corticosteroide", "agente anticolinérgico", "inhibidor de PDE4", entre otros porque se definen los componentes de la composición por su función pero no por un compuesto como tal, lo que hace que se obtengan un número indefinido de composiciones, de las cuales no se encuentra soporte en la descripción. Se sugiere al solicitante eliminar esta reivindicación.

Las reivindicaciones 8 - 14 no están soportadas en la descripción porque no hay ejemplos que demuestren que se han obtenido o probado las composiciones farmacéuticas que contengan las combinaciones mencionadas. Sólo se encuentra soporte para composiciones farmacéuticas que comprenden mononapadisilato y/o heminapadisilato de 5-(2-{{6-(2,2-difluoro-2-feniletotoxi)hexil}amino}-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona con bromuro de (R)-[2-hidroxi-2,2-bis(2-tienil)acetotoxi]-1-(3-fenoxiproyl)-1-azaniabicyclo[2.2.2]octano, furoato de mometasona o 1,1,1,2,3,3,3-heptanofluoro-n-propano.

7. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Lafranco

Afirma el oponente que esta solicitud incumple con los requisitos de patentabilidad porque las composiciones y combinaciones farmacéuticas correspondientes a una sal cristalina de 5-(2-{{6-(2,2-difluoro-2-feniletotoxi)hexil}amino}-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona y sus solvatos son prácticas y eventos totalmente conocidos en la industria farmacéutica. Agrega que "composiciones farmacéuticas de las cuales se hace referencia, donde se involucran agentes terapéuticos tales como dexametasona, budenosida, ciclesonida, betametasona [...] [...] comprenden moléculas que se encuentran descubiertas y plenamente identificadas en el sector químico farmacéutico". El opositor aporta el documento "The Merck Index" donde se observa que las moléculas dexametasona, budenosida, ciclesonida y betametasona cuentan con beneficios patentarios concedidos por oficinas de patentes de diversos países

Respuestas del Solicitante

Afirma el solicitante que el opositor no señala los hechos que da manera clara y contundente permiten demostrar que la invención carece de los requisitos de patentabilidad. Señala que "todos los documentos citados en el escrito de la oposición se refieren a compuestos que son: dexametasona, budenosida, ciclesonida y betametasona, que pertenecen al grupo de los corticosteroides; por su parte, la invención solicitada se refiere a la sal napadisilato de 5-(2-{{6-(2,2-difluoro-2-feniletotoxi)hexil}amino}-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona; está claro que este compuesto es diferente de los compuestos citados por la oposición y por lo tanto la presente invención presenta novedad frente a los compuestos arriba mencionados".

Agrega también que “dichos documentos no presentan enseñanza o sugerencia alguna que lleve de manera obvia y evidente obtener como resultado la invención aquí solicitada”. Además, “es evidente que la presente invención tiene aplicación industrial ya que se trata de un compuesto útil en el tratamiento de enfermedades respiratorias”.

Respuesta del Examinador Técnico

Si bien es cierto el opositor tiene razón al afirmar que los compuestos dexametasona, budenosida, ciclesonida y betametasona son conocidos en el estado del arte, esta invención se refiere a la sal napadisilato de 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietil)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona, un compuesto diferente a los mencionados, tal como lo recalca el solicitante, razón por la cual el documento aportado en la oposición no afecta la novedad, ni el nivel inventivo del objeto de esta solicitud, por lo cual no se considerará dentro del examen de patentabilidad.

8. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad 09 de febrero de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006122788	Derivatives of 4-(2-amino-1-hydroxyethyl)phenol as agonists of the ss2 adrenergic receptor	23/Noviembre/2006
D2	US 2006/0205949	Crystalline forms of a biphenyl compound	14/Septiembre/2006

D1
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2006122788&KC=&FT=E&locale=en_EP, divulga (pg. 51, ejemplo 5; pg. 70, ejemplo 14; pg. 4, ln 25 –pg. 5, ln 13; pg. 78, ln 9 - 87) sales farmacéuticamente aceptables de 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietil)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona y composiciones farmacéuticas que las contienen.

D2
http://www.google.com/patents?id=dpuYAAAAEBAJ&pg=PA14&lpg=PA14&dq=us+2006/0205949&source=bl&ots=6W7Y05UC4_&sig=Nq1018qFFuX21iPg8Yifhh1pQdc&hl=en&sa=X&ei=y-EaUKVvx_jSAa6fgPAN&ved=0CDAQ6AEwAA#v=onepage&q=us%202006%2F0205949&f=false, divulga (abstract, reivindicaciones, pg. 9, pár. 0094 – pg. 10, pár. 0102) la sal cristalina mononapadisilato y/o heminapadisilato del compuesto éster 1-{2[5-(4-hidroxibencilamino)pentilcarbamoil]etil}piperidin-4-ilico del ácido bifenil-2-ilcarbámico útil en el tratamiento de enfermedades pulmonares, y composiciones farmacéuticas que las contienen.

9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en una sal cristalina de mononapadisilato y/o heminapadisilato de 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietil)-8-

hidroxiquinolin-2(1H)-ona y sus solvatos farmacéuticamente aceptables.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del Estado de la Técnica:		
Características esenciales	D1	D2
Sal cristalina mononapadisilato y/o heminapadisilato de	Sales farmacéuticamente aceptables de: (pg. 51, ejemplo 5; pg. 70, ejemplo 14, pg. 4, ln 25 –pg. 5, ln 13)	Sal cristalina mononapadisilato y/o heminapadisilato de (abstract, reivindicaciones)
5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona	5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona	éster 1-{2[5-(4-hidroxibencilamino)pentilcarbamoil]etil}piperidin-4-ilico del ácido bifenil-2-ilcarbamico

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga sales farmacéuticamente aceptables del compuesto 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y las sales de D1 consiste en que divulga específicamente que la sal corresponde a la sal cristalina mononapadisilato y/o heminapadisilato.

El efecto que logra el incluir esta característica es que la sal es estable, no es delicuescente, tiene baja higroscopicidad y un punto de fusión más elevado.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad sales de 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona más estables, no delicuescentes, con menor higroscopicidad y puntos de fusión más elevados que las del estado del arte.

Sin embargo, la formación de sales cristalinas mononapadisilato y/o heminapadisilato estables para eliminar la delicuescencia, disminuir la higroscopicidad y elevar el punto de fusión de principios activos ya está divulgada en el documento D2, el cual enseña sales mononapadisilato y/o heminapadisilato de éster 1-{2[5-(4-hidroxibencilamino)pentilcarbamoil]etil}piperidin-4-ilico del ácido bifenil-2-ilcarbamico, útil en el tratamiento de enfermedades pulmonares, las cuales han demostrado que no son delicuescentes, tienen un nivel de higroscopicidad aceptable y un alto punto de fusión (pg. 1, pár. 0010)

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, se vería suficientemente motivada para formar sales cristalinas mononapadisilato y/o heminapadisilato de acuerdo a lo divulgado en D2 con el compuesto 5-(2-([6-(2,2-difluoro-2-feniletoksi)hexil]amino)-1-hidroxietyl)-8-hidroxiquinolin-2(1H)-ona de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión: la reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 14 y 19 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

10. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006122788	1 – 14 y 19	Nivel Inventivo
D2	US 2006/0205949	1 – 14 y 19	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
29 AGO. 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisado por: Jacqueline Alfonso Roza

