

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

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 28 de octubre de 2010, con el N° 10-134187-00000-0000, por la sociedad Gilead Sciences, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "USO DE PARTÍCULAS PORTADORAS SÓLIDAS PARA MEJORAR LA PROCESABILIDAD DE UN AGENTE FARMACÉUTICO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/042607 del 01 de mayo de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 632 del 20 de septiembre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 20099 y notificado por fijación en lista el 06 de noviembre de 2012 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 visibles a folios 193 a 198 del cuaderno administrativo, 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° 10-134187-00007-0000 del 01 de febrero de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 33 (Fls. 215 a 219) 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. Asimismo, modifica el título de la invención durante el trámite, el cual quedará de la siguiente manera: PARTÍCULAS PORTADORAS SÓLIDAS PARA MEJORAR LA PROCESABILIDAD DE UN AGENTE FARMACÉUTICO

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 33 contenidas en los Fls. 215 a 219, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

6.1. Objeto de la invención

El objeto de la invención consiste en la necesidad de suministrar formulaciones mejoradas del compuesto de fórmula (I) (Fl.215). Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición que comprende a una pluralidad de partículas sólidas portadoras de dióxido de silicio con un diámetro de partícula promedio aprox. de 10 a 120 μm y un área superficial de BET de 40 a 400 m^2/g ., y un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en los poros o en la superficie de las partículas sólidas portadoras.

6.2. 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 invocada, es decir, el 02 de mayo de 2008.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO200810921	Modulators of pharmacokinetic properties of therapeutics	Enero 24 de 2008
D2	WO0337379	Use of granular materials base don pyrogenically produced silicon dioxide in pharmaceutical compositions	Mayo 8 de 2003
D3	WO04/73689	Use of a silica or silica derivative as a sorption material	Septiembre 2 de 2004

D1¹ divulga el compuesto Cobocistat de fórmula (I), sales, solvatos, estereoisómeros y sus composiciones en forma de tabletas que pueden contener excipientes como celulosa microcristalina, hidroxipropilcelulosa, croscarmelosa de sodio y estearato de magnesio, además de otros principios activos como son fumarato de disopropilo de tenofovir, emtricitabina, elvitegravir.

D2² divulga un excipiente sólido como el dióxido de silicio, con un diámetro de partícula promedio entre 10 y 120 μm y un área de superficial BET de a 400 m^2/g , además menciona que con este material se obtienen ventajas como son mayor densidad aparente y mayor densidad compactada, mayor estabilidad, como consecuencia presentando mejor desempeño en la desintegración.

1 http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=wo2008010921&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC

2 http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=wo03037379&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC

Página 2 de 8

Al contestar favor indique el número de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 390569683

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: 5039
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

D3³ divulga el uso de la silica o sus derivados como el Aeroperl ®, como material de sorción, en formulaciones farmacéuticas que presenten problemas con la biodisponibilidad y la solubilidad.

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, la composición reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Una composición que comprende, una pluralidad de partículas sólidas portadoras que cada una comprende dióxido de silicio..."*(Fl. 215)

La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el documento D1, D2 y D3, que representan el estado de la técnica:

Tabla 1

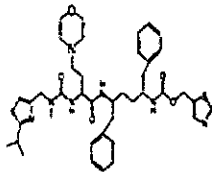
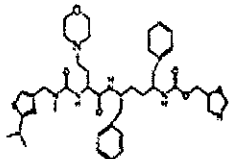
Características esenciales	D1	D2	D3
composición que comprende:	composición que comprende:	composición que comprende:	composición que comprende:
Una pluralidad de partículas sólidas portadoras que cada una comprende dióxido de silicio y que tienen, cada una superficie y poros y que tienen un diámetro de partícula promedio de aprox.10 a 120 µm y un área superficial BET de aprox. 40 a 400m2/g.; y un	No menciona	Un excipiente como partículas sólidas de dióxido de silicio, con un diámetro de partícula promedio entre 10 y 120 µm y un área de superficial (BET) de 40 a 400m²/g.	una pluralidad de partículas sólidas de sílice ahumado hidrofílico, que tienen un diámetro de partícula promedio de entre 20 y 30 µm y un área de superficial (BET) de por lo menos 150m²/g para proveer una mezcla.

3http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=wo2004073689&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC
Página 3 de 8

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

Compuesto de fórmula(I)  O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en los poros o en la superficie de las partículas sólidas.	Compuesto (Cobicistat, antiviral) de fórmula  O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, o su estereoisómero de fórmula S (pág. 212)	Menciona principios activos, entre otros, como antivirales.	Menciona principios activos, entre otros, como antivirales.
--	--	--	--

Como se dijo anteriormente, los documentos D1, D2 y D3 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque D1 divulga el compuesto cobicistat (corresponde a la fórmula I de la invención), sus sales, solvatos (pág.5, líneas 17 a 23, pág. 30 1er compuesto), estereoisómeros (pág.212, ejemplo S) y sus composiciones en forma de tabletas que pueden contener excipientes seleccionados de acuerdo a la práctica diaria del experto los cuales deben ser compatibles con los compuestos e inocuos (pág.159, línea 17; pág.160, líneas 1 a 6) como la celulosa microcristalina, hidroxipropilcelulosa, croscarmelosa de sodio y estearato de magnesio (pág.159, líneas 15 a 25; pág. 162, líneas 17 a pág.163, líneas 1 a 12), además de otros principios activos como son fumarato de disopropilo de tenofovir, emtricitabina, elvitegravir (pág.170, líneas 21, 23;pág.174, líneas 7 a 28).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la divulgada en D1, es que esta menciona que comprende partículas sólidas de dióxido de silicio que tienen un diámetro de 10 a 120 µm y un área superficial BET de aprox. 40 a 400m2/g.

Sin embargo, no se logra evidenciar algún efecto sorprendente por esta diferencia.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar la composición de D1, para obtener otra como alternativa a las ya conocidas”.

Por otro lado, un excipiente como el dióxido de silicio, utilizado para elaborar formas sólidas como tabletas, con un diámetro de partícula promedio entre 10 y 120 µm y un área de superficial (BET) de 40 a 400m2/g, ya estaba divulgado en el documento D2 (pág. 4,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

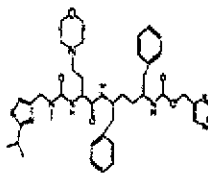
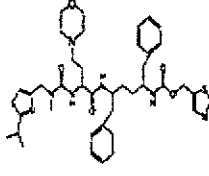
líneas 30 a 34), que además menciona que con este material se obtienen ventajas en las composiciones como mayor densidad aparente, mayor densidad de compactación, mayor estabilidad las cuales presentan mejor desempeño en la desintegración (pág.22, líneas 25 a 32); asimismo otro tipo de sílice (ahumado hidrofílico), para la elaboración de tabletas se divulga en D3 (abstract, pág.35 y 36), con un área superficial (BET) de por lo menos 150m²/g (pág.9, línea 28) y un diámetro de partícula promedio entre 20 y 30 µm. Igualmente, se menciona que dichas composiciones contienen principios activos entre otros como los antivirales (D2, pág.13, línea 13 y reivindicación 8, págs.36 a 39 y D3, pág.19, líneas 25).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el dióxido de silicio, utilizado para elaborar formas sólidas como tabletas, de las composiciones de D2 o de D3 en la composición de D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 9 y 18 a 33 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Las reivindicaciones 10 – 16 consisten en un método de preparación de la composición en la tabla siguiente:

Tabla 2

Características esenciales	D1	D2	D3
Método que comprende:	Método que comprende:	Método que comprende:	Método que comprende:
1)combinar el compuesto de fórmula (I) 		No menciona este compuesto específicamente pero si menciona principios activos como antivirales, entre otros.	No menciona este compuesto específicamente pero si menciona principios activos como antivirales, entre otros.
2)Solvente adecuado	Solvente adecuado	Solvente adecuado	Solvente adecuado
3)una pluralidad de partículas de sílice que tienen, cada una	No menciona	Un excipiente como partículas sólidas de dióxido de silicio, con un	una pluralidad de partículas sólidas de sílice ahumado

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

superficie y poros y que tienen un diámetro de partícula promedio de aprox.10 a 120 μm y un área superficial BET de aprox. 40 a 400m ² /g.		diámetro de partícula promedio entre 10 y 120 μm y un área de superficial (BET) de 40 a 400m ² /g.	hidrofílico, que tienen un diámetro de partícula promedio de entre 20 y 30 μm y un área de superficial (BET) de por lo menos 150m ² /g para proveer una mezcla.
--	--	--	---

Los documentos D1, D2 y D3 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 10, porque D1 divulga que las composiciones en forma de tabletas, que contienen el compuesto cobicistat (corresponde a la fórmula I de la invención), sus sales, solvatos, estereoisómeros (pág.5, líneas 17 a 23, pág. 30 1er compuesto, pág. 40), se pueden obtener por medio de los métodos conocidos en la Farmacia Práctica de Remington (formas sólidas, pág. 160, líneas 8 a 28 y pág. 161, líneas 1 a 3)⁴, en donde se utiliza también el óxido de silicio en preparaciones de tabletas⁵.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 10 y la divulgada en D1, es que esta menciona que el excipiente que comprende partículas sólidas de dióxido de silicio, tienen un diámetro de 10 a 120 μm y un área superficial BET de aprox. 40 a 400m²/g.

Sin embargo, no se logra evidenciar algún efecto sorprendente por esta diferencia.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el método de D1, para obtener otro como alternativa a los ya conocidos".

De otro lado, un excipiente sólido como el dióxido de silicio, que es utilizado para elaborar formas sólidas como tabletas con un diámetro de partícula promedio entre 10 y 120 μm y un área de superficial (BET) de 40 a 400m²/g, ya estaba divulgado en el documento D2 (pág. 4, líneas 30 a 34; pág.13, líneas 5 a 11; pág. 21, líneas 4 a 19), así como el sílice ahumado es divulgado en D3 (abstract, pág.35 y 36), con un área superficial (BET) de por lo menos 150m²/g (pág.9, línea 28) y un diámetro de partícula promedio entre 20 y 30 μm .

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el dióxido de silicio, utilizado para elaborar formas sólidas como tabletas, de las composiciones de D2 o de D3 en el método de elaboración de la composición de D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 10 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

4Farmacia Práctica de Remington tomo 2,19a Edición 1995, págs. 2478 a 2485 (Fls.199 a 202)

5 Handbook of pharmaceuticals excipients fifth edition, colloidal silicon dioxide (págs 188-190)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

Puesto que las reivindicaciones dependientes 11 a 16 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

En primer lugar, se aclara que el documento D1, de acuerdo a la forma como se presenta el nuevo capítulo reivindicatorio, no afecta la novedad del método de obtención de la composición ni de la composición reclamada y en segundo lugar el D1 sí divulga que las composiciones que se elaboran con los compuestos de fórmulas (I) y (Ia), pueden incluir excipientes farmacéuticos conocidos e inocuos para obtener una tableta⁵, por métodos muy conocidos en el campo farmacéutico⁴.

De otro lado, como se explica en el análisis de nivel inventivo, la presencia de excipientes como las partículas de sílice que tienen, cada una superficie y poros con un diámetro de partícula promedio de aprox.10 a 120 μm y un área superficial BET de aprox. 40 a 400m²/g., y el sílice ahumado con un área superficial (BET) de por lo menos 150m²/g (pág.9, línea 28) y un diámetro de partícula promedio entre 20 y 30 μm , en la composición que se reclama, son utilizados para obtener composiciones en forma de tabletas con propiedades mejoradas, ya era conocido en los documentos D2 y D3, con el fin de mejorar las propiedades de las tabletas, entre otras, la estabilidad y la dureza. Además, se aclara que utilizar excipientes de los cuales ya se conocen sus propiedades y su uso en el campo farmacéutico para luego caracterizar las propiedades de una composición en forma de tableta, como es el presente caso, no tiene nivel inventivo⁵.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual los ejemplos 2-3 y las figuras 2 y 3 muestran el nivel inventivo de la presente solicitud, se aclara que en cuanto a la disminución de la higroscopicidad, esa es precisamente la función de un adsorbente en una composición, disminuir su capacidad de adsorber humedad del ambiente, por lo tanto cuando el compuesto que tiene la función de adsorbente, como las sílices, está parcialmente saturado en la composición, se disminuye la higroscopicidad de dicha mezcla o composición; en cuanto al aumento de la compresibilidad ya se conoce de D2 y D3.

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,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "PARTÍCULAS PORTADORAS SÓLIDAS PARA MEJORAR LA PROCESABILIDAD DE UN AGENTE FARMACÉUTICO".

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 5039

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Gilead Sciences, Inc., entregándole copia de la misma y advirtiéndole 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 19 Feb 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctora

ALICIA LLOREDA RICAURTE

notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓