

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 38
del artículo 3º del Decreto 1687 de 2010, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 14 de febrero de 2003, con el No. 03 12650, por la doctora Jimena Escobar Uribe, en su calidad de apoderada de NOVARTIS AG., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIONES FARMACEUTICAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP01/10448 del 10 de septiembre de 2001.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma, en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad se encontró que la invención no es patentable. En consecuencia, 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 en dos oportunidades para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud.

CUARTO: Que la solicitante, mediante escritos radicados el 29 de enero de 2008 y el 10 de febrero de 2009, atendió oportunamente los requerimientos formulados y presentó aclaraciones. Así mismo, allegó un nuevo capítulo reivindicatorio el cual cumple con los requisitos exigidos por el artículo 34 de la Decisión 486. Adicionalmente, modificó el título de la solicitud bajo estudio a: "COMPOSICIONES FARMACEUTICAS DE LIBERACION INMEDIATA QUE COMPRENDEN ACIDO 5-METIL-2-(2'-CLORO-6'-FLUOROANILINO) FENILACÉTICO"

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 nuevas reivindicaciones 1 a 4, contenidas en el folio 259, no cumplen con los requisitos de novedad y nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

49319

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 493191
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

6.1. Objeto de la invención

La solicitud bajo estudio está relacionada con la necesidad de obtener una formulación oral para tabletas de liberación inmediata del Lumirabacoxib: ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino) fenilacético (inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2), como una mejor opción a formulaciones de otros AINES convencionales que generan efectos colaterales, principalmente cuando éstos están contraindicados por sus efectos colaterales. (Fls. 56-57 y 61)

Lumiracoxib: Ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético

Para solucionar el anterior problema técnico, la solicitud en estudio proporciona una composición farmacéutica de liberación inmediata que comprende el ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en una cantidad de (60-90)% en peso y conteniendo de (50-400)mg de tal activo, donde la composición está en forma de tableta.

6.2. Determinación del estado de la técnica

6.2.1. Fecha determinante para el análisis comparativo

Las fechas para determinar el estado de la técnica son el 11 de septiembre de 2000 y el 14 de septiembre de 2000, que corresponde a las fechas de las prioridades invocadas respecto de las solicitudes US 60/231655 y US 60/232261.

Las fechas de las prioridades fueron tenidas en cuenta para el estudio de patentabilidad, según obra a folio 277 del expediente en estudio.

6.2.2. Documentos del estado de la técnica

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

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1 (Folios 161 a 169)	WO9911605	Certain 5-alkil-2-arylaminophenylacetic acids and derivates.	11-03-1999

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

6.3. Novedad

Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486, "una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica."

Y el estado de la técnica, al tenor del mismo artículo, comprende *"todo lo que haya sido accesible al público, por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida."*

A su vez, sobre este requisito el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina recientemente ha dicho:

"(...) para que una invención sea novedosa se requiere que no esté comprendida en el estado de la técnica, es decir, que antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o de la prioridad reconocida, ni la innovación ni los conocimientos técnicos que de ella se desprenden hayan sido accesibles al público, entendiendo que la difusión de la información que se menciona debe ser detallada y suficiente para que una persona versada en la materia pueda utilizar esa información a fin de explotar la invención."

En el presente caso, la invención reclamada no es nueva, porque está integralmente revelada en el estado de la técnica, tal como a continuación se explicará.

Como ya se dijo, las reivindicaciones 1 a 4 reclaman una composición farmacéutica de liberación inmediata que comprende ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo en una cantidad de (60-90)% en peso y conteniendo entre (50-400) mg de tal activo, donde la composición está en forma de tableta.

Ahora bien, al comparar elemento por elemento del objeto de la presente solicitud con el estado de la técnica existente, esto es con la anterioridad WO9911605 (llamada D1 de aquí en adelante), se observa que:

SOLICITUD BAJO ESTUDIO	ANTERIORIDAD D1
Una composición farmacéutica	Una composición farmacéutica
Ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético (<i>lumiracoxib</i>) o una sal farmacéuticamente aceptable de éste entre (60-90)%.	Un compuesto de fórmula I del ácido 5-alkil-2-arilaminofenilacético o sus derivados (como el <i>lumiracoxib</i>) (Folios 162-163; pág. 1-2) entre (0,1-75)% (folio 166; pág. 19).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

Conteniendo entre (50-400) mg por dosis	Dosis unitaria entre (5-500)mg (folio 167; pág. 20).
En forma de tableta	Puede estar en forma de tableta (folio 166; pág. 19).

De acuerdo con el cuadro comparativo anterior, la anterioridad D1 divulga formulaciones farmacéuticas para tabletas convencionales que comprenden entre (0,1-75)% de un compuesto inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2 de formula I -incluido el de la solicitud-, conteniendo entre (5-500)mg del activo en la dosis unitaria para administración oral.

De tal manera que las composiciones farmacéuticas de las reivindicaciones 1 a 4 de la solicitud bajo estudio que comprenden del (60-75)% en peso de ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6' fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y que contienen entre (50-400)mg de tal activo, se encuentran integralmente divulgadas por D1.

En consecuencia, la materia reivindicada en la solicitud bajo estudio no cumple con el requisito de novedad, requerido para otorgar el privilegio solicitado, según lo previsto en el artículo 16 de la normatividad andina.

6.4. Nivel inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma 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."*

El estado de la técnica, al tenor de lo dispuesto en el artículo 16 de la misma Decisión, comprende *"todo lo que haya sido accesible al público, por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida."*

El Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha dicho sobre este requisito, lo siguiente:

"...se exige que la invención tenga nivel inventivo, esto es, que implique un salto cualitativo en relación con la técnica existente. Este requerimiento es desarrollado por el artículo 4 de la Decisión 344 que presupone el requisito de nivel inventivo al establecer que la invención goza de dicho nivel al no derivar de manera evidente del estado de la técnica, ni resultar obvia para una persona entendida o"

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

versada en la materia.

Este requisito ofrece al examinador la posibilidad de determinar si con los conocimientos técnicos que existían al momento de la invención, se hubiese podido llegar de manera evidente a la misma, o si el resultado hubiese sido obvio para un experto medio en la materia de que se trate, es decir, para una persona del oficio y normalmente versada en la materia técnica correspondiente.

Con respecto a lo anterior, el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha manifestado lo siguiente:

"Con el requisito del nivel inventivo, lo que se pretende es dotar al examinador técnico de un elemento que le permita afirmar o no si a la invención objeto de estudio no se habría podido llegar a partir de los conocimientos técnicos que existían en ese momento dentro del estado de la técnica... En este punto conviene advertir que uno es el examen que realiza el técnico medio respecto de la novedad y otro el que se efectúa con respecto al nivel inventivo; si bien en uno y otro se utiliza como parámetro de referencia el 'estado de la técnica', en el primero, se coteja la invención con las 'anterioridades' existentes dentro de aquella, cada uno (sic) por separado, mientras que en el segundo (nivel inventivo) se exige que el técnico medio que realiza el examen debe partir del conocimiento general que él tiene sobre el estado de la técnica y realizar el cotejo comparativo con su apreciación de conjunto, determinando si con tales conocimientos técnicos existentes ha podido o no producirse tal invención".

Resulta pertinente, a los efectos del artículo 4 de la Decisión 344, definir qué se entiende por "obvio" y por "evidente" a fin de determinar qué se debe entender por nivel inventivo.

Lo obvio es aquello que salta a la vista de manera clara y directa; lo "que se encuentra o pone delante de los ojos, muy claro o que no tiene dificultad". Lo evidente consiste en la "certeza clara y manifiesta de la que no se puede dudar; cierto, claro, patente y sin la menor duda"

En este orden de ideas, se puede concluir que una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no es consecuencia clara y directa de dicho estado.

Este Tribunal, al respecto, manifiesta que "Tal y como lo establece Gómez Segade (...) el inventor debe reunir los méritos que le permitan atribuirse una patente, sólo si la invención fruto de su investigación y desarrollo creativo constituye 'un salto cualitativo en la elaboración de la regla técnica', actividad intelectual mínima que le permitirá que su invención no sea evidente (no obvia) del estado de la técnica. Es decir, que con el requisito del nivel inventivo, lo que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

se pretende es dotar al examinador técnico de un elemento que le permita afirmar o no si a la invención objeto de estudio no se habría podido llegar a partir de los conocimientos técnicos que existían en ese momento dentro del estado de la técnica (...)"2

Ahora bien, en el presente caso carecen de nivel inventivo las composiciones que comprenden del 76 al 90% en peso del ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6' fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y que contienen entre (50-400)mg de tal activo, toda vez que, a los ojos del experto medio en el asunto, la invención se trata de la simple aplicación de conocimientos en la materia.

El estado de la técnica más cercano es la anterioridad D1, que divulga composiciones farmacéuticas para tabletas convencionales (no de liberación prolongada o extendida) que comprenden entre 0,1-75% de un compuesto de fórmula I -incluyendo el de la solicitud-, junto con excipientes comúnmente conocidos y conteniendo entre 5-500 mg del activo en la dosis unitaria para administración oral, tal como se observa en la tabla comparativa de novedad.

Así mismo, D1 indica que el compuesto de fórmula I -incluido el de la solicitud- es un inhibidor selectivo de ciclooxygenasa-2 que no presenta los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (Fls. 162-163, 168; pág. 1-2, 21).

De esta manera, la diferencia entre la solicitud bajo estudio y la anterioridad D1 es que el *Lumiracoxib* puede estar entre 76-90% en una composición para tabletas que contiene entre 50-400mg de tal activo. El efecto técnico que logra tal diferencia, es obtener una composición para tabletas con alta proporción del compuesto activo *Lumiracoxib* entre 76-90% conteniendo dosis entre 50-400 mg de tal activo.

No obstante, dado lo divulgado por D1 y teniendo en cuenta que para un técnico medio en la materia es un ejercicio común tratar de adecuar las proporciones o porcentajes (disminuir o aumentar) del activo y excipientes en una composición, acorde a las necesidades de la forma farmacéutica (p. ej. tamaño de tableta fácil de tragar) y de administración (dosis del fármaco), así como la información dada en la solicitud, que enseña sólo composiciones que comprenden 42%, 50% y 65% del compuesto activo conteniendo 50mg, 200mg y 400mg del compuesto activo, respectivamente (folios 74, 78 y 95; pág. 19, 23 y 40, tabla 1, 2 y 11) y, que señala que al evaluar tres niveles de carga del fármaco (85%, 75% y 65%) se encontró que la posibilidad de compresión no es satisfactoria para cargas de 85% y de 75%, hallando que una carga de 65% del

2 Proceso N° 12-IP-98. Doc. Cit. TRIBUNAL DE JUSTICIA DE LA COMUNIDAD ANDINA.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

fármaco puede producir tabletas con propiedades de compresión satisfactoria y seleccionando así esta carga para el desarrollo de la formulación (folios 87-88; pág. 32-33), se puede concluir que, acorde con la anterior información de la solicitud, las composiciones con porcentajes de carga entre (76-90)% del activo no tienen propiedades satisfactorias de compresión y no logran entonces resolver el problema técnico objetivo.

En consecuencia, la composición reclamada que comprende entre (76-90)% del activo y que contiene entre (50-400)mg de tal activo carece de nivel inventivo y, por ende no puede acceder al privilegio solicitado.

6.5. Respuesta a los argumentos del solicitante

Con relación a los argumentos de la solicitante, allegados con motivo de la notificación de fondo, se determinó que:

La solicitante a favor del requisito de novedad cita el manual Andino de Patentes, para afirmar lo siguiente: *"[e]n este sentido, es claro que la invención en estudio es nueva sobre lo mencionado en D1, toda vez que en D1 no se hace mención clara o se deriva directamente que se produzcan composiciones de liberación inmediata para administración de una vez al día como sí lo hace la presente solicitud. Es más, las composiciones reclamadas en la presente invención se encuentran en un rango limitado entre el 60% y 90%."*(Fl. 267)

Al respecto, se aclara que el Manual Andino de Patentes no es un marco normativo de referencia para el estudio y análisis de patentabilidad de una solicitud en trámite, como quiera que se trata de una guía práctica para la realización del examen de las solicitudes de patentes, dirigida principalmente a los examinadores de las oficinas nacionales de los Países miembros de la Comunidad Andina. Por lo demás la regulación vigente en materia de propiedad industrial en Colombia es la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina.

No obstante lo anterior, dado que la solicitante cita el Manual se hace necesario aclarar que lo que se compara con el estado de la técnica son las características técnicas esenciales o elementos que conforman la composición (compuesto activo, excipientes y sus proporciones) y no la observación específica *"que la composición sea de liberación inmediata para administración una vez al día"*, puesto que el que *"sea de liberación inmediata"* será un resultado a alcanzar que depende de los elementos (activo y excipientes) y proporciones de éstos en la composición; además, *"que se pueda administrar una vez al día"* es una forma de utilizar el producto en un método de tratamiento.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

Por lo tanto, la observación específica señalada por la solicitante no es un elemento que deba ser comparado con el estado de la técnica para evaluar la patentabilidad de la materia reclamada.

Adicionalmente, la característica de la proporción del activo entre (60-90)% en la composición, no es una característica que genere una composición de liberación inmediata, ya que la liberación inmediata dependerá también de los demás elementos que conforman la composición (los excipientes y sus proporciones). Por ende, dado que en las reivindicaciones 1 a 4 no se definen cuáles son los excipientes y sus proporciones que permitan que la tableta sea de liberación inmediata, la composición reclamada (reivindicaciones 1 a 4) que comprende entre (60-75)% del activo y que contiene de (50-400)mg de tal activo, es una formulación farmacéutica para tabletas convencionales, como la que divulga D1, por lo que la solicitud bajo estudio carece del requisito de novedad.

Por otro lado, la materia involucrada en las reivindicaciones 1 a 4 que comprenden entre el 76 al 90% del activo (diferencia técnica con D1) y que contiene de (50-400)mg de tal activo, resulta ser nueva al ser comparada con D1 (el estado de la técnica más cercano), por lo que se evalúa el nivel inventivo para tal materia.

Afirma la solicitante que: *"...para desvirtuar el requisito de novedad de una invención será necesario que lo reivindicado por la invención bajo estudio corresponda de forma total con lo revelado en un documento o anterioridad señalada, conclusión a la que se llega después de un análisis exhaustivo mediante una comparación entre el capítulo reivindicatorio de la invención en estudio y la divulgación citada por ese despacho como anterioridad."* (Fl. 268)

Frente a lo anterior, es preciso señalar que en la evaluación de novedad no es necesario que la materia incluida en el capítulo reivindicatorio de la invención corresponda de forma idéntica con lo revelado en la anterioridad señalada, ya que al realizar la comparación de la materia reclamada con el estado de la técnica existente, el paso inicial es comparar los elementos técnicos esenciales que conforman y delimitan tal materia en la reivindicación independiente: materia que en este caso resulta ser una composición caracterizada sólo por el compuesto activo y su porcentaje (entre 60-90%), sin definir los excipientes y sus proporciones en la composición. Lo anterior, significa que esta materia comprende todas las composiciones que contengan tal activo en una proporción del (60-90)%, encontrando que las composiciones que contienen del (60-75)% del activo resultan no ser nuevas frente a D1, al igual que las reivindicaciones 2- 4 que se encuentran en esta misma proporción y conteniendo de (50-400)mg de tal activo, como ya se explicó en el aparte de novedad.



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

De tal suerte, la materia reclamada en las reivindicaciones 1 a 4, es nueva sólo en lo referente a las composiciones que comprenden del (76-90)% en peso de ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6' fluoroanilino)fenilacético (Lumiracoxib) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y que contienen entre (50-400)mg de tal activo, razón por la que se evaluó el nivel inventivo de dicha materia.

Manifiesta la solicitante que:

"El intervalo reivindicado en la solicitud en estudio no escogido de manera arbitraria a partir del documento d1 sino que es el resultado de una selección deliberada que representa otra invención.

En ese orden de ideas, atentamente nos permitimos dirigir la atención de ese despacho a la página 19, tercer párrafo de D1, donde se expone que el intervalo preferido del ingrediente activo se encuentra entre 1 y 50%, lo cual es el punto central de D1, es decir, en el extremo más bajo del rango de concentración generalmente revelado de entre 1 y 75%. Esto es debido al conocimiento de problemas de compresibilidad de estos compuestos y a los efectos colaterales producidos cuando se aplican dichos compuestos en altas concentraciones.

En contraste con las enseñanzas de d1, el solicitante de la invención en estudio hizo caso omiso a estos problemas y de manera sorprendente encontró que una forma de dosificación en tableta con cantidades entre 60% y 90% de carga del fármaco se podía alcanzar y que el ingrediente activo puede ser aplicado en tales concentraciones tan altas sin la producción de efectos laterales no deseados..."
(FI.269)

Respecto a las anteriores observaciones, se reitera que la característica de la proporción del activo (Lumiracoxib) entre (60-90)% en la composición, por sí sola no es una característica que genere una composición de liberación inmediata, ya que tal liberación dependerá también de los demás elementos que conforman la composición (los excipientes y sus proporciones). Por lo tanto, la composición (reivindicaciones 1-4) que se caracteriza porque el fármaco (Lumiracoxib) comprende entre (60-75)% y porque contiene de (50-400)mg de tal activo, es una formulación farmacéutica para tabletas convencionales como la que divulga D1, careciendo por ello del requisito de novedad.

Ahora bien, frente a la anterioridad D1 ya es conocido que los compuestos de fórmula I -incluido el de la solicitud- son inhibidores selectivos de ciclooxigenasa-2, que no presentan los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (folios 162-163, 168; pág. 1-2, 21); es decir, que el compuesto por sí mismo tiene la propiedad de no generar tales efectos colaterales y, por tanto, las composiciones que lo contengan tendrán tal propiedad (folio 166; pág. 19).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

independientemente de la concentración del fármaco. Por consiguiente, no procede que la solicitante señale que era conocido que tales efectos colaterales eran producidos por una alta concentración de dicho fármaco ni que atribuya la ausencia de tales efectos colaterales sólo a una composición que tiene entre (60-90)% del fármaco.

Frente al nivel inventivo, el solicitante señala que: *"En ningún momento es acertado concluir que la presente invención no tiene un efecto técnico inesperado partiendo de la simple comparación de lo revelado en D1, sin entrar a evaluar las ventajas técnicas y los prejuicios superados por la invención en estudio y sí las características de alta carga del ingrediente activo en la composición reclamada habría sido evidente para una persona medianamente versada en la materia."* (Fl.271)

Es necesario aclarar a la solicitante, que en la evaluación del nivel inventivo para la materia que se consideró nueva: composiciones que comprenden del (76-90)% del fármaco y que contienen entre (50-400)mg de tal activo, se tuvo en cuenta que la diferencia técnica entre la solicitud y D1 es la mayor proporción (76-90)% del fármaco.

Acorde a lo anterior, se concluye al respecto que composiciones con (76-90)% del activo no tienen propiedades satisfactorias de compresión y no logran entonces resolver el problema técnico objetivo; por lo que la composición reclamada que comprende entre (76-90)% del activo y que contiene entre (50-400)mg de tal activo no tiene una ventaja técnica y no tiene nivel inventivo.

Manifiesta la solicitante que: *"...se puede afirmar que la persona medianamente versada en la materia no encontraría motivación alguna para aumentar las cantidades del ingrediente activo, principalmente del compuesto ácido 5-metil-2-(2-cloro-6-fluoroanilino)fenilacético, pues sabría y predeciría que dicho aumento causaría problemas en la comprensibilidad de la tableta y problemas de efecto colaterales a causa de la alta administración del ingrediente activo, debido a que D1 enfatiza que la concentración debe ser menor a 50% ya que dicho intervalo coincide con los problemas asociados con el uso de estos compuestos en términos de efectos no deseados y deficiencias en la comprensión de la tableta."* (Fl.272)

Al respecto, se reitera que en la anterioridad D1 ya era conocido que los compuestos de formula I -incluido el de la solicitud- son inhibidores selectivos de ciclooxigenasa-2, que no presentan los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (folios 162-163, 168); es decir, que el compuesto por si mismo tiene la propiedad de no generar tales efectos colaterales y, por tanto, las composiciones que lo contengan tendrán tal propiedad (folio 166), independientemente de la concentración del fármaco. Por consiguiente, no es correcto que el solicitante establezca que la composición reivindicada es la que logra suministrar una dosis alta y efectiva de tal activo sin que se presenten los efectos colaterales mencionados en el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

arte previo.

Adicionalmente, se encuentra que composiciones con porcentajes de carga alta entre (76-90)% del fármaco no tuvieron propiedades satisfactorias de compresión, es decir, tabletas con tales composiciones no se lograron obtener adecuadamente, por lo que no es correcta la afirmación del solicitante según la cual la solicitud permite que compuestos de características escasas de compresibilidad puedan ser suministrados en cantidades relativamente altas sin afectar la compresibilidad de la tableta.

Señala la solicitante que: *"...Así las cosas resulta ventajoso y sorprendente una carga de este compuesto de 60% a 90% en una formulación de liberación inmediata, que presentará una desintegración o disolución de la tableta en un lapso de una hora de administración y por lo tanto, la liberación inmediata de la totalidad de la carga del fármaco".* (Fl. 272)

Frente a lo anterior, es preciso señalar que la solicitud bajo estudio no indica que el ingrediente activo (*Lumiracoxib*) presente efectos secundarios a una alta carga, pues lo que se indica es que *"las dosis relativamente grandes necesarias para obtener un tratamiento de una vez al día con los AINES clásicos o convencionales darían por resultado efectos colaterales en una formulación de liberación inmediata"* (folio 56-57), en razón a que tales efectos secundarios son debidos a que los AINES clásicos no son inhibidores selectivos de ciclooxigenasa-2 e inhiben también la ciclooxigenasa-1, siendo esta última la causante de tales efectos colaterales, tal como se explica en D1 (folios 162-163 y 168; pág. 1-2 y 21).

Adicionalmente, se reitera que ya D1 indica que un compuesto de formula I -incluido el de la solicitud- es un inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2 que es libre de causar los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (folios 162-163 y 168); es decir, que el compuesto por si mismo tiene la propiedad de no generar tales efectos colaterales y, por lo tanto, las composiciones (folio 166) que lo contengan tendrán tal propiedad independientemente de su concentración o carga.

Afirma la solicitante que: *"También se sabía, como se expone en la memoria descriptiva, que la mayoría de los agentes anti-inflamatorios no esteroideos normalmente se administran de 2 a 4 veces al día y que la vida media de estos es relativamente corta, lo cual hace que no sea posible ni deseable su administración una vez por día."* (Folio 272)

Al respecto, se reitera que el agente activo en la composición de la solicitud acorde con lo que divulga D1 es un inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2, que es libre de efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (folios 74-75, 81), por tanto tales efectos colaterales no son el problema técnico de la solicitud.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. Nº 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

Ahora bien, se aclara que la solicitud señala que se identificó un fármaco (Lumiracoxib) que podía ser empleado una vez por día, dado que se descubrió que este activo tiene atributos que permiten proveer un tratamiento antiinflamatorio efectivo por 24 horas con una dosis diaria de entrega inmediata, entre (200-1200)mg, preferiblemente 400mg (folio 57; pág. 2); también se indica que los datos clínicos sugieren que tal efecto o acción del fármaco (Lumiracoxib) no está relacionado con su concentración en plasma, sino que más bien está regido por las concentraciones del fármaco en un compartimiento de efecto (folio 69; pág. 14); esto último, significa para un experto en la materia que no es necesaria una composición de liberación prolongada que mantenga la concentración del fármaco en el plasma, para mantener el efecto del fármaco.

Así mismo, se aclara que la solicitud bajo estudio señala que el efecto (reducción del dolor) es relativamente constante con una sola dosis diaria del fármaco (Lumiracoxib) e indica que la respuesta no está influenciada por la frecuencia de dosificación -p. ej. una dosificación dos veces al día con 200mg contra una dosificación una vez al día con 400 mg- (folio 69). Es decir, que dada la información de D1, y al descubrimiento e identificación de los atributos o características del fármaco, el técnico medio en la materia se enfrenta al problema técnico objetivo de cómo lograr una composición para tabletas de liberación inmediata que tenga una alta proporción (entre 76-90%) de un fármaco con característica de baja compresibilidad y que contenga entre (50-400)mg de tal activo; sin embargo, en la descripción se encuentra que la posibilidad de compresión no es satisfactoria para cargas de 85% y de 75% del fármaco (folios 87-88), de donde es posible concluir que composiciones con porcentajes de carga alta, como (76-90)%, no tienen propiedades satisfactorias de compresión y no logran entonces resolver el problema técnico.

Manifiesta la solicitante que:

"De otra parte, el examinador también hubiera podido juzgar la actividad inventiva de la invención mediante el planteamiento y la respuesta a las siguientes preguntas, de acuerdo con lo planteado en el Manual Andino:

- 1) Estaba un técnico de conocimientos medios en la materia en condiciones de plantearse el problema?*
- 2) de resolverlo en la forma en que se reivindica? Y*
- 3) de prever el resultado?"*

Frente a lo anterior, es preciso señalar que de acuerdo con D1 un compuesto de formula I -incluido el de la solicitud- es un inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2, que es libre de los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos; es decir, que el problema técnico no debe encaminarse a resolver problemas colaterales, porque el compuesto por si solo es libre de los mismos así como las composiciones que lo contengan, independientemente de su concentración.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

Adicionalmente a que el fármaco sea libre de tales efectos colaterales, el técnico medio en la materia tiene en cuenta otras características del fármaco (*Lumiracoxib*) que han sido descubiertas e identificadas como: tener baja compresibilidad; generar una duración de acción por 24 horas con una dosis diaria de entrega inmediata entre (200-1200)mg, preferiblemente 400mg (folio 57; pág. 2); conocer que los datos clínicos sugieren que tal efecto o acción del fármaco (*Lumiracoxib*), no está relacionado con su concentración en plasma, sino que más bien está regido por las concentraciones del fármaco en un compartimiento de efecto (folios 69; pág. 14); esto último significa, para un experto en la materia, que no es necesaria una composición de liberación prolongada que mantenga la concentración del fármaco en el plasma para mantener el efecto del fármaco.

Así mismo, el efecto (reducción del dolor) es relativamente constante con una sola dosis diaria del fármaco (*Lumiracoxib*) y conocer que la respuesta no está influenciada por la frecuencia de dosificación -p. ej. una dosificación dos veces al día con 200mg contra una dosificación una vez al día con 400 mg- (folio 69); lo que significa, para un experto en la materia, que se puede administrar al día una o más composiciones farmacéuticas para lograr el mismo efecto en 24 horas, tal como se reconoce en la solicitud al señalar que la cantidad de fármaco en una forma de dosificación variará de acuerdo al receptor (*paciente*) y al modo particular de administración, siendo posible que la formulación contenga de (50-1200)mg, preferiblemente (50-400)mg del activo (folio 60, 70-71; pág. 5, 15-16).

Por consiguiente, el técnico medio en la materia conociendo los antecedentes de D1 y demás características propias del fármaco estará en la capacidad de plantearse el problema técnico objetivo de: cómo obtener una composición para tabletas de liberación inmediata de *Lumiracoxib* (inhibidor selectivo de ciclooxygenasa-2), un fármaco con baja compresibilidad, que pueda ser formulado en altas proporciones (como 76-90%) y que contenga entre (50-400)mg de tal activo. Por lo tanto, la respuesta a la primera pregunta es positiva.

Por otra parte, es necesario resaltar que el descubrimiento de características de un fármaco ya conocido, así como la definición de un problema técnico no le conceden nivel inventivo a la materia reclamada, sino la solución que se da a dicho problema (el cómo se resuelve), aunque tales características descubiertas del fármaco o el problema definido no se encuentren señalados en el estado de la técnica.

Frente al segundo interrogante propuesto por la solicitante referente a: *¿Estaba un técnico de conocimientos medios en la materia en condiciones de resolverlo en la forma en que se reivindica?*. Establece la solicitante que la respuesta a esta pregunta es negativa, pues una persona versada en la materia que no hubiera planteado el problema obviamente tampoco hubiera pensado en solucionarlo de la manera como se

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

realiza en la invención, es decir mediante tabletas de formulación oral del ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) de liberación inmediata (folio 273-274; pág. 8-9 de respuesta).

Al respecto, y de acuerdo con lo aclarado anteriormente, el técnico medio en la materia al conocer la anterioridad D1 y demás características propias del fármaco está en la capacidad de plantearse el problema técnico objetivo arriba señalado.

De esta forma, el técnico medio en la materia intentaría solucionar tal problema teniendo en cuenta lo divulgado por D1 y su conocimiento en el ejercicio común de adecuar las proporciones o porcentajes (disminuir o aumentar) del activo y excipientes en una composición, acorde a las necesidades de la forma farmacéutica (p. ej. tamaño de tableta fácil de tragar) y de administración (dosis del fármaco).

No obstante, se aclara que la materia reclamada y nueva: composiciones que comprenden del (76-90)% del fármaco (*Lumiracoxib*) y que contienen de (50-400)mg de tal activo, no logran solucionar el problema técnico objetivo, puesto que en la descripción se indica que la posibilidad de compresión no es satisfactoria para cargas de 85% y de 75% del fármaco (folios 87-88; pág. 32-33).

Frente al tercer interrogante de la solicitante, es preciso señalar que no es sorprendente que las composiciones reclamadas no presenten efectos colaterales, ya que D1 indica que un compuesto de formula I -incluido el de la solicitud- es un inhibidor selectivo de ciclooxigenasa-2 que es libre de causar los efectos colaterales indeseables (gastrointestinales y renales) de los AINES clásicos (folios 74-75, 81); es decir, que el compuesto por sí mismo tiene la propiedad de no generar tales efectos colaterales y, por tanto, las composiciones que lo contengan tendrán tal propiedad (folio 166; pág. 19), independientemente de su concentración o carga.

Se reitera que de acuerdo con el resultado obtenido de compresibilidad no satisfactoria para cargas del 85% y de 75% del fármaco (folios 87-88; pág. 32-33), las composiciones reclamadas que comprenden del 76-90% del fármaco no resuelven el problema técnico y no tienen nivel inventivo.

Finalmente, señala la solicitante que de la técnica anterior se conocía que la vida media de los compuestos de D1 es muy corta, pero lo que resulta sorprendente es que mediante una tableta de liberación inmediata del ácido 5-metil-2-(2'-cloro-6'-fluoroanilino)fenilacético (*Lumiracoxib*) que presenta características desfavorables para realizar tabletas de esta naturaleza, se logre mantener niveles aceptables del fármaco en plasma por más tiempo a través de una sola dosis al día y no de varias tomas sucesivas en el mismo día (folio 274).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/03-12650

Al respecto, se aclara que en la solicitud se indica que los datos clínicos sugieren que el efecto del fármaco (*Lumiracoxib*) no está directamente relacionado con la concentración en plasma, sino mas bien está regido por las concentraciones del fármaco en un compartimento de efecto (folios 69; pág. 14), lo cual significa, para un experto en la materia, que no es necesaria una composición de liberación prolongada que mantenga la concentración del fármaco en el plasma para mantener el efecto del fármaco.

Así mismo, se aclara que en la solicitud se señala que el efecto (reducción del dolor) es relativamente constante con una sola dosis diaria del fármaco (*lumiracoxib*) y se indica que la respuesta no está influenciada por la frecuencia de dosificación, p. ej. una dosificación dos veces al día con 200mg contra una dosificación una vez al día con 400 mg, (folio 69; pág. 14); lo que significa, para un experto en la materia, que se puede administrar al día una o más composiciones farmacéuticas para lograr el mismo efecto en 24 horas, tal como se reconoce en la solicitud al señalar que la cantidad de fármaco en una forma de dosificación variará de acuerdo al receptor (*paciente*) y al modo particular de administración, siendo posible que la formulación contenga de (50-1200)mg, preferiblemente (50-400)mg del activo (folio 60, 70-71; pág. 5, 15-16).

Por las anteriores aclaraciones, no es correcta la afirmación de la solicitante según la cual con la tableta de la invención se *"logra mantener niveles aceptables del fármaco en plasma por más tiempo a través de una sola dosis al día y no de varias tomas sucesivas en el mismo día"*.

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:

ARTICULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "COMPOSICIONES FARMACEUTICAS DE LIBERACION INMEDIATA QUE COMPRENDEN ACIDO 5-METIL-2-(2'-CLORO-6'-FLUOROANILINO) FENILACÉTICO".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Jimena Escobar Uribe, en su calidad de apoderado de NOVARTIS AG., o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No. 49319
Por la cual se deniega una patente de invención

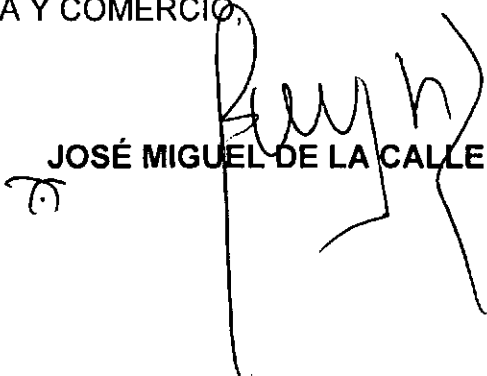
Rad. PCT/03-12650

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 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los **17 SET. 2010**

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


JOSÉ MIGUEL DE LA CALLE RESTREPO

Doctora.
Jimena Escobar Uribe
Carrera 11 A No. 86-53, piso 6
Bogotá, D.C.
202069
