

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31533

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-063891

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

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

CONSIDERANDO:

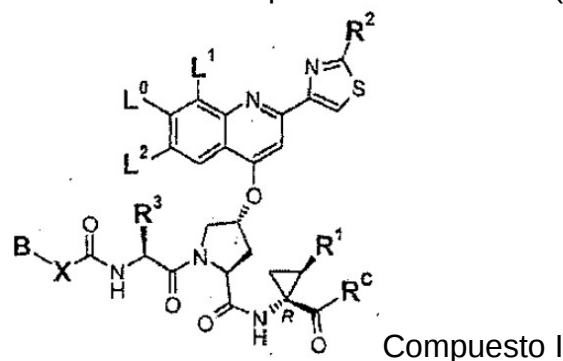
PRIMERO: Que mediante Resolución No. 56781 del 27 de septiembre de 2013, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada “COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS LÍQUIDAS DEL ÁCIDO 1-(4-((8-BROMO-2-(2-ISOBUTIRAMIDOTIAZOL-4-IL)-7-METOXIQUNOLIN-4-IL)OXI)-1-(3-(((CICLOHEXILOXI)CARBONIL)AMINO)-4,4-DIMETILPENT-1-EN-2-IL)PIRROLIDIN-3-CARBOXAMIDO)-2-VINILCICLOPROPANO CARBOXÍLICO LIBRES DE LÍPIDOS”, con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito del 12 de noviembre de 2013 radicado con el No. 11-063891-00011-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Boehringer Ingelheim International GmbH interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

En primer lugar la recurrente allega un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 16 reivindicaciones y señala sobre este que no hay ampliación de materia.

En relación con el examen de patentabilidad la recurrente afirma que la totalidad de los argumentos de la resolución recurrida son el resultado de análisis retrospectivo (hindsight o a posteriori) del arte previo.

En relación con el documento D1 la recurrente manifiesta que este hace referencia a un compuesto útil para el tratamiento de la Hepatitis C de fórmula (I),



que el ejemplo 1055 (compuesto de interés) es uno de los 258 ejemplos revelados por el antecedente y que “*tal como lo reconoce la SIC, D1 no presenta resultados de biodisponibilidad alguno*” por lo que concluye que no existe ninguna motivación para su selección del ejemplo 1055 como compuesto base de las composiciones reclamadas.

Adicional a ello en relación con el antecedente afirma que “*D1 no hace ninguna*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31533

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-063891

referencia explícita a la ausencia o presencia de aminos en las composiciones farmacéuticas y las dificultades que este grupo representa para la formulación en composiciones farmacéuticas del compuesto de interés en la presente invención” ni tampoco “sugiere que las composiciones farmacéuticas líquidas contengan precisamente una cantidad menor o igual 4.6% en peso del Compuesto (1) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, de 10% a 30% en peso de un tensioactivo, de 60% a 90% en peso de un solvente farmacéuticamente aceptable, y una relación en peso de surfactante al compuesto (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo es mayor o igual a 2.7” por lo que concluye que el documento no proporciona información suficiente para desarrollar la materia reclamada.

Con respecto al documento D2 manifiesta que son evidentes las diferencias estructurales entre los principios activos, además que las composiciones divulgadas en el antecedente están basadas en lípidos y son sólidas, lo que considera contrario con las características de la solicitud por lo que concluye que aunque en general los excipientes coinciden, el documento no provee enseñanzas para el desarrollo de las composiciones y orienta en algunos aspectos de manera contraria a la persona del oficio.

Por otra parte manifiesta que el documento D2 no revela que las composiciones farmacéuticas líquidas deban estar libres de lípidos, que formen una dispersión clara con un tamaño de partícula promedio de menos de 1µm después de la dilución en fluido gástrico simulado ni deban contener precisamente cantidades del compuesto, tensoactivo y solvente, por lo que concluye una vez más que el antecedente no proporciona información suficiente para desarrollar la materia reclamada.

Por último afirma que *“la biodisponibilidad de los compuestos presentes en las formulaciones reclamadas se mejora gracias a una reducción en el tamaño de partícula obtenido después de la dilución de la forma farmacéutica”* después de la administración del fármaco, y esto es contrario a lo conocido en el arte previo.

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

Esta Oficina aclara, en primera instancia, en relación con los efectos técnicos atribuidos a la materia reclamada y en especial a la afirmación de la recurrente según la cual *“la biodisponibilidad de los compuestos presentes en las formulaciones reclamadas se mejora gracias a una reducción en el tamaño de partícula obtenido”*, que tal y como se manifestó en el examen de patentabilidad de la solicitud no existe ninguna prueba, dato o evidencia que permita concluir que las composiciones obtenidas presentan una mayor biodisponibilidad o estabilidad que aquellas divulgadas en el documento D1, es decir, no existe un efecto técnico probado en la solicitud en relación a la biodisponibilidad o estabilidad de las composiciones, por lo que los argumentos de la recurrente sobre el particular carecen de validez. Se aclara a la recurrente que es conocido en el campo técnico que una microemulsión (como la materia reclamada) presenta una mayor biodisponibilidad que una emulsión elaborada a partir de los mismos excipientes y activos debido a la mayor proporción del agente tensoactivo presente en la microemulsión, lo que conlleva a formulaciones con un tamaño de gota menor, que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31533

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-063891

presentan mayor solubilidad acuosa que las emulsiones elaboradas con los mismos componentes.

En relación con el argumento de la recurrente según el cual el documento D1 no hace referencia específica a la presencia de una amina y que su inclusión es contraria a las enseñanzas de la solicitud, esta Oficina aclara que aunque la recurrente en su capítulo descriptivo indicó que las composiciones *“están también preferiblemente sustancialmente libres de aminas”* (pág. 66, líneas 3 a 9) de acuerdo con la tabla IX del mismo capítulo descriptivo la incorporación de una amina (Tris) en las formulaciones F383 y F382 no tiene un efecto técnico sobre la materia reclamada, es decir que su inclusión no es contraria a las enseñanzas de la solicitud.

Por otra parte con respecto a los argumentos presentados frente al documento D2 según los cuales el sistema divulgado en este es basado en lípidos y en algunos casos el producto es un sólido, este Despacho aclara que el documento D2 revela que los compuesto inhibidores de la proteasa de HCV son lipófilos, presentan una baja solubilidad acuosa y son de carácter zwitteriónico (pág. 5, líneas 1 a 10), por lo que indica que los sistemas generales para mejorar la solubilización aplicados a estos compuestos no han sido efectivos, sin embargo revela el uso de sistemas co-disolventes para mejorar la solubilización y con ello la biodisponibilidad de un agente zwitteriónico como el principio activo de las formulaciones reclamadas, es decir, que el sistema basado en lípidos es tan solo una de las dos alternativas presentadas por el documento D2.

Adicionalmente, era conocido en el arte previo que un menor tamaño de gota en una emulsión conduce a una disminución en la capacidad de la emulsión de reflejar la luz, hasta el punto de que una emulsión que presente un tamaño de gota en el rango nanométrico, es decir, una microemulsión, no refleja la luz y en consecuencia es translúcida^{[1][2]}, tal y como se describe en la solicitud donde el incremento de la proporción del agente tensioactivo entre 1 al 8.1% en formulaciones que presentan una cantidad de activo equiparable conlleva a que la emulsión pase de turbia a clara, lo anterior independientemente de las proporciones de los restantes excipientes de la formulación (pág. 62, tabla 2) y esta característica es solo dependiente de la proporción del activo y tensioactivo como se evidencia de la comparación de los ejemplos F180 y F363, puesto que composiciones con igual proporción del agente tensioactivo, en donde se presenta un incremento de la proporción del activo se produce un enturbiamiento o apariencia lechosa en la formulación, producto del incremento del tamaño de gota, es decir pasa de ser una microemulsión a una emulsión.

Por lo anterior, contrario a lo manifestado por la recurrente, no es posible atribuir un efecto técnico sorprendente al reemplazo de un agente tensioactivo y la selección de un solvente en las formulaciones divulgadas en el documento D1 dado que el aporte técnico del documento D2 es proveer la motivación a la persona del oficio tanto para la utilización de un sistema co-disolvente basado en propilenglicol como para sustituir un

¹ Alok K. Kulshreshtha, Onkar N. Singh y G. Michael Wall Pharmaceutical Suspensions Pág. 28 Tabla 1.3 Diferencias entre microemulsiones y emulsiones.2010

² Drugs and the Pharmaceutical Sciences, Microencapsulation. Pág. 350. Tabla 1. Resumen de la principales diferencias entre microemulsiones, nanoemulsiones y emulsiones. 2006

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31533

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-063891

tensoactivo por otro alternativo y de manera preferente el succinato de polietilenglicol de la vitamina E por su capacidad de producir formulaciones autoemulsificantes como mecanismos para mejorar la solubilidad de un agente zwitteriónico como el principio activo de la materia reclamada.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución 56781 del 27 de septiembre de 2013, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Boehringer Ingelheim International GmbH, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 14 May 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA, office@olartemoure.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez