

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

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 ante esta Superintendencia el 11 de julio de 2011 con el N° 11-086183-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Siegfried Rhein S.A. DE C.V., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIÓN DE LIBERACIÓN PULSÁTIL DE SILDENAFIL Y PROCESO PARA PREPARARLA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB 2008/003466 del 12 de diciembre de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 639 del 29 de febrero de 2012, habiéndose presentado oposición por parte de la(s) sociedad(es) Procaps S.A., Laboratorio Franco Colombiano, Lafrancol S.A. y Tecnoquímicas S.A., la(s) cual(es) una vez fue(ron) estudiada(s) por el Despacho, las presentadas por las sociedades Procaps S.A. y Tecnoquímicas S.A. sí desvirtuaron la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará mas adelante.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 8314, notificado por fijación en lista el 14 de mayo de 2013 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, 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° 11-086183-00017-0000 del 23 de septiembre de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 9 que reemplaza(n) 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.

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 9, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Oposición presentada

Página 1 de 12

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

Argumentaciones de la sociedad opositora Procaps S.A.

La oponente señala que el objeto de la solicitud está afectado por el documento D1 US6964780 que divulga una formulación de liberación dual de sildenafil que comprende una porción de liberación inmediata y una fracción de liberación controlada. En el ejemplo 3 de dicho documento D1 se prepara una forma farmacéutica que comprende un núcleo formado por sildenafil, celulosa microcristalina, lactosa y ácido succínico. Estos núcleos se recubren posteriormente con una composición que incluye un copolímero de amonio metacrilato tipo B (Eudragit RS 300), un copolímero de amonio metacrilato tipo A (Eudragit 30D) y trietil citrato. Así las cosas, el uso de dichos compuestos y sus combinaciones para conformar una formulación de liberación dual son ampliamente conocidos por lo cual las formulaciones no son nuevas.

De igual manera, la oponente cita el documento D2 US2008069878 que revela el uso y una composición farmacéutica para la preparación de un medicamento que comprenden la combinación de una dispersión sólida de un principio activo y un polímero mejorador de la solubilidad, con un recubrimiento de liberación pulsátil controlada (TPR) que comprende un polímero insoluble en agua y un polímero entérico. Estas formas de dosificación según D2 pueden comprender mezclas de partículas de liberación inmediata (IR) y partículas recubiertas TPR. Entre los polímeros insolubles en agua empleados se encuentran etilcelulosa, polivinilacetato y copolímeros neutros basados en etilacrilato y metilmetacrilato. Entre los polímeros entéricos, figuran: acetato ftalato de celulosa, hidroxipropilmetilcelulosa ftalato, hidroxipropilmetilcelulosa acetato succinato, polivinilacetato ftalato y copolímeros de ácido metacrílico sensibles al pH. Las composiciones pueden incluir disgregantes, como croscarmelosa sódica, crospovidona, almidón glicolato de sodio y celulosa microcristalina. La oponente concluye que la invención carece de nivel inventivo según las enseñanzas de D1 y D2.

Argumentaciones de la sociedad opositora Laboratorio Franco Colombiano, Lafrancol S.A.

Afirma el oponente que la solicitud en estudio incumple los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial. Señala que las composiciones, combinaciones y formulaciones farmacéuticas que se refieren una composición pulsátil de sildenafil, son conocidas en la industria. Por lo tanto, no cumplen con los requisitos de novedad y de nivel inventivo. De igual manera, el oponente se refiere a composiciones de sildenafil cuya molécula está totalmente descubierta e identificada y cita el libro "The Merck Index" así como las patentes EP 463756 y US 5250534.

Argumentaciones de la sociedad opositora Tecnoquímicas S.A.

Afirma el oponente que ante la reivindicación textual de concentraciones (dosis) de sildenafil, específicamente en la reivindicación 1, es importante indicar que esto contraviene lo dispuesto

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

en la Decisión 486 porque la mención de dosificaciones tiene el mismo efecto que las reivindicaciones sobre métodos de tratamiento médico explícitos, dado que la concentración, en este caso directamente referido a la dosificación de la formulación farmacéutica, no pertenece a la categoría de producto o proceso, sino que hace referencia la forma en la que un producto se utiliza terapéuticamente, y por lo tanto no hace parte de las actividades industriales sino de las actividades médicas.

Las reivindicaciones referidas a las características de disolución no tienen nivel inventivo y que conseguir dichos perfiles de disolución hace parte de los conocimientos propios de una persona versada en la formulación de productos farmacéuticos. Del mismo modo carecen de nivel inventivo los procedimientos de obtención de las composiciones, puesto que comprenden procedimientos convencionales para la obtención de formulaciones sólidas a través de un lecho fluidizado o por granulación y compresión (en el caso de la fracción de liberación controlada) y cita el documento "Tecnología Farmacéutica" Vol. II, Pág. 107-112 para apoyar su afirmación.

De igual manera, la oponente señala que la utilización de dichos soportes o "seeds" también es una estrategia tecnológica ampliamente reconocida en el estado de la técnica, en especial para obtener dispersiones sólidas, en donde dichos soportes o "seeds" son el núcleo al cual se adhieren soluciones compuestas por principios activos y otros excipientes, para formar dichas dispersiones sólidas y cita el documento WO 2008/027993 en donde se revelan procedimientos para elaborar a partir de soportes sólidos o núcleos, a los cuales se les adiciona el principio activo junto con excipientes farmacéuticamente aceptables y que finalmente pueden ser recubiertos. Si bien es cierto que en esta anterioridad no se menciona sildenafil, también es cierto que lo anterior deja en evidencia la versatilidad de dicha técnica de granulación y la carencia de nivel inventivo que tiene el involucrar cualquier principio activo a través de esta técnica.

Finalmente, concluye que la solicitud en estudio carece de nivel inventivo porque las formulaciones reivindicadas y los procedimientos para obtenerlas son pequeñas variaciones resultantes de combinar estrategias tecnológicas ampliamente reconocidas y utilizadas en la industria farmacéutica (granulación por spray-dried, utilización de "seeds" y técnicas de recubrimiento).

Respuesta del solicitante

La solicitante en respuesta a los argumentos de la firma opositora Laboratorios Procaps S.A., señaló que las reivindicaciones 1 a 10 de la presente invención están claramente dirigidas a una composición farmacéutica y las reivindicaciones 11 a 15 están dirigidas al proceso de obtención de las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud y no a un uso o a un método de tratamiento como lo afirmó en su momento la oponente.

Frente al documento D1 que citó la oponente Procaps S.A., la solicitante afirma que aunque este documento describe la posibilidad de tener el sildenafil (principio activo) en partículas que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

tuvieran dos tipos de sistemas de liberación, es decir, que una parte del principio activo fuera de liberación inmediata y otra parte de liberación controlada, de ninguna manera D1 anticipa la presente invención. D1 describe en sus ejemplos dos tipos de formulaciones de sildenafil. Las primeras donde se utiliza una matriz de lactosa e hidroxipropilmetil celulosa, obteniéndose tabletas. Por otro lado, se describe una formulación donde se fabrican núcleos de sildenafil con celulosa microcristalina, lactosa, ácido succínico y agua, recubiertos con una cobertura que tiene dos polímeros Eudragit TM RS 30 D y Eudragit TM RL 30 D. El Opositor establece que esta última preparación es comparable a la presente invención. Sin embargo, el Opositor no tiene en cuenta que la presente invención necesita una cobertura de los núcleos de sildenafil que contenga una mezcla de polímeros pH dependientes con polímeros pH independientes. Y los dos polímeros usados en D1 son pH independientes, es decir, su acción depende de la permeabilidad que tienen estos polímeros. Los diferentes perfiles de permeabilidad de Eudragit TM RS 30 D (polímero de baja permeabilidad) y Eudragit TM RL 30 D (polímero de alta permeabilidad), son los que permiten obtener perfiles de disolución variables. Sin embargo, D1 no establece ni sugiere el uso de mezcla de polímeros pH dependientes con pH independientes para producir un mejor perfil de disolución.

Con respecto al documento D2 citado por la opositora Procaps S.A., la solicitante argumenta que aunque D2 describe composiciones farmacéuticas que comprenden la combinación de partículas de liberación inmediata (IR) y partículas con un recubrimiento de liberación pulsátil controlada (TPR), en ninguna parte de D2 se ejemplifica que el principio activo pueda ser sildenafil y solo lo menciona como una posibilidad remota. Adicionalmente, las composiciones de D2 no se comparan con las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud, debido a que D2 no describe ni sugiere composiciones de liberación pulsátil de sildenafil de la presente solicitud.

La presente solicitud resuelve un problema técnico que no había sido resuelto por el estado de la técnica. Dicho problema consiste en proporcionar composiciones de sildenafil de liberación pulsátil que proporcionen un prolongado efecto con pulsos de liberación, así como proveer un proceso de preparación de dichas composiciones. La solución al problema técnico planteado se tiene mediante la provisión de una composición farmacéutica de sildenafil de liberación pulsátil de las reivindicaciones de la presente solicitud.

En cuanto a la oposición presentada por Lafranco S.A., la solicitante señala que la invención de la presente solicitud está dirigida a una composición farmacéutica que contiene dicho principio activo y en ningún momento pretende la protección únicamente del principio activo sildenafil o como sustancia químicamente pura. Las Reivindicaciones 1 a 10 de la presente invención están claramente dirigidas a una composición farmacéutica y las Reivindicaciones 11 a 15 están dirigidas al proceso de obtención de las composiciones farmacéuticas de la presente solicitud.

En cuanto a la oposición presentada por Tecnoquímicas S.A., específicamente en relación con los argumentos frente a la reivindicación 10 de la presente solicitud, la solicitante señala

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

que aunque las técnicas para establecer perfiles de disolución en la fabricación de medicamentos son claramente conocidas, de ninguna manera se está reivindicando dicha técnica como tal. Ahora bien, los resultados específicos para una composición, es decir, los perfiles de disolución particulares para las composiciones reclamadas, son características que, además de los elementos estructurales ya establecidos en la reivindicación 1, permiten caracterizar aún más las composiciones que se pretenden proteger. Adicionalmente, el procedimiento para establecer los resultados de los perfiles de disolución está claramente divulgado dentro del Capítulo Descriptivo, por lo que reproducir e identificar dichos perfiles de disolución será perfectamente viable para cualquier persona medianamente versada en el arte.

Con respecto a los argumentos frente a las reivindicaciones 11 a 15, la solicitante destaca que para evaluar la patentabilidad de un proceso se debe tomar en cuenta la combinación y utilización específica de todos los elementos que integran dicho proceso, lo cual le retribuirá al proceso el carácter de novedoso e inventivo. De esta manera, y toda vez que las composiciones reclamadas en la presente solicitud son novedosas e inventivas, puesto que la presente solicitud no pretende obtener protección para todos los procesos de preparación de cualquier composición farmacéutica sino obtener protección específicamente para el proceso de preparación de las composiciones de las reivindicaciones 1 a 10.

Respuesta del examinador técnico

Si bien los documentos D1 y D2, citados por la opositora Procaps S.A., no tienen todas las características esenciales del objeto reclamado en la presente solicitud, estos documentos ya mencionaban composiciones de liberación controlada de sildenafil así como varios de los excipientes empleados en la presente solicitud. No obstante, se tendrá en cuenta el documento D1 para efectos del presente estudio debido a que guarda más relación con el objeto reivindicado.

En cuanto a los argumentos de la firma opositora Laboratorio Franco Colombiano S.A. Lafrancol S.A., se encontró que los documentos citados no son relevantes para afectar la patentabilidad de la presente solicitud.

Con respecto a los documentos y argumentos presentados por la opositora Tecnoquímicas S.A., se observó que, en efecto, las composiciones pulsátiles son ampliamente conocidas en la industria farmacéutica y que resulta obvio para una persona del oficio normalmente versada en la materia emplear este tipo de forma de entrega para solucionar problemas de liberación del activo especialmente a nivel intestinal y así mejorar su perfil de disolución y biodisponibilidad. Sin embargo, la opositora no menciona documentos que sean cercanos a la invención que se reclama en la presente solicitud.

El documento WO 2008/027993 en donde se revelan procedimientos para elaborar a partir de soportes sólidos o núcleos, a los cuales se les adiciona el principio activo junto con excipientes farmacéuticamente aceptables y que finalmente pueden ser recubiertos, puede

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

afectar el procedimiento de las reivindicaciones 8 y 9 de la presente solicitud.

Por lo anterior, el documento presentado en la(s) oposición(es) de Tecnoquímicas S.A. desvirtúa el nivel inventivo del objeto de las reivindicaciones 8 y 9 de esta solicitud; por lo tanto, se consideró dentro del examen de patentabilidad. Igualmente, el documento US6964780 presentado en la oposición de Procaps S.A. desvirtúa el nivel inventivo del objeto de las reivindicaciones 1 a 9 de esta solicitud; por lo tanto, se consideró dentro del examen de patentabilidad. De otro lado, los documentos presentados en la oposición de Laboratorio Franco Colombiano S.A. Lafrancol S.A. no desvirtúan ni la novedad ni el nivel inventivo del objeto de la presente solicitud, por lo cual los argumentos presentados no prosperan como elementos que permitan desvirtuar la patentabilidad de la solicitud que aquí se analiza.

6.2. Objeto de la invención

El problema técnico consiste en proveer una composición de sildenafil con una liberación mejorada a nivel intestinal, con un perfil de disolución más rápido en medio alcalino que en medio ácido y por ende, una biodisponibilidad mejorada. Para resolver este problema técnico se presenta una composición de liberación pulsátil de sildenafil que provee un adecuado nivel de disolución in vivo.

6.3. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 12 de diciembre de 2008, que corresponde a la fecha de presentación internacional de la solicitud .

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:

Item	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US6964780	"Sustained-release pharmaceutical formulations containing a cGMP pde-5 inhibitor"	15/Noviembre/2005
D2	US6627223	"Timed pulsatile drug delivery systems"	30/Septiembre/2003
D3	US20050276853	"Chronotherapeutic dosage forms and methods of treatment using chronotherapy"	15/Diciembre/2005
D4	WO2008/027993	"Drug delivery systems comprising solid solutions of weakly basic drugs"	6/Marzo/2008

El documento D1¹ enseña formulaciones de liberación controlada de inhibidores de PDE-5

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20051115&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=6964780B1&KC=B1&ND=4)

FT=D&date=20051115&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=6964780B1&KC=B1&ND=4

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

GMPC cuyo propósito es modificar la velocidad de liberación del fármaco en el tracto gastrointestinal o retardar su liberación (Col. 1, líneas 1-11). Específicamente el inhibidor de PDE-5 GMPC incluye sildenafil (Col. 2, líneas 25-26) o citrato de sildenafil (Col. 4, línea 24).

El documento D2² divulga una forma de dosificación que utiliza un sistema de liberación pulsátil (Col. 1, líneas 54 a 59). Estos sistemas proveen la liberación simultánea de un fármaco o combinación de fármacos a tiempos controlados mediante una serie de pulsos para un tratamiento eficaz con efectos secundarios mínimos (Col. 1 línea 67 a Col. 2 línea 4). También menciona la preparación de las mismas (Col. 2 líneas 40 a 54).

El documento D3³ divulga una composición cronoterapéutica que comprende un núcleo que contiene un fármaco y una cubierta para liberación retardada que comprende una goma sintética. En el núcleo se incorpora un superdesintegrante como por ejemplo croscarmelosa sódica, crospovidona y almidón glicolato de sodio (Resumen, Párrafos 0027 y 0056).

El documento D4⁴ divulga procedimientos para hacer soportes sólidos o núcleos que contienen fármaco junto con excipientes farmacéuticamente aceptables y menciona la que estos núcleos se pueden emplear para formas de liberación pulsátil (Fig. 1).

6.4. 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 farmacéutica de sildenafil de liberación pulsátil caracterizada porque comprende una fracción de liberación inmediata que contiene 5 a 100 mg de sildenafil y una fracción de liberación controlada que contiene 25 a 150 mg de sildenafil, estando la fracción de liberación controlada compuesta por partículas recubiertas que contienen (a) un agente superdesintegrante..., (b) un recubrimiento formado por... un polímero de solubilidad pH-dependiente... y... un polímero pH-independiente... y (c)... otros excipientes..."* (Ver página 10 del radicado N° 11-086183-00017-0000).

2[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20030930&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP&CC=US&NR=662722382&KC=B2&ND=4)

FT=D&date=20030930&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP&CC=US&NR=662722382&KC=B2&ND=4

3[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2005276853A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20051215&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

CC=US&NR=2005276853A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20051215&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

4[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008027993A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080306&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2008027993A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080306&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

Página 7 de 12

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1, D2, D3 y D4, que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2	D3
Composición de sildenafil de liberación pulsátil	Composición de liberación controlada de sildenafil	Composición de liberación pulsátil	Composición de liberación
Fracción de liberación inmediata que contiene 5-100 mg sildenafil	Liberación inmediata de sildenafil	Liberación inmediata de fármaco	Capa de liberación
Fracción de liberación controlada que contiene 25-150 mg de sildenafil, tiene partículas recubiertas (gránulos o microtabletas) de:	Liberación controlada de sildenafil: en forma de perlas	Liberación controlada: partículas recubiertas como gránulos:	Núcleo que contiene el fármaco
Polímero pH dependiente: acetato ftalato de celulosa, hidroxipropilmetilcelulosa ftalato, hidroxipropilmetilcelulosa acetato succinato, polivinil acetato ftalato y copolímeros del ácido metacrílico: Eudragit L100-55, RS100	Celulosa microcristalina, lactosa, ácido succínico	Polímeros: acetato ftalato de celulosa, hidroxipropilmetilcelulosa ftalato, hidroxipropilmetilcelulosa acetato succinato, polivinil acetato ftalato y copolímeros del ácido metacrílico: Eudragit	Ésteres de celulosa, ésteres de ác. Metacrílico
Polímero pH independiente: copolímeros de amonio metacrilato, etilcelulosa, polivinilacetato y copolímeros neutrales basados en etilacrilato y metilmetacrilato	Copolímero de amonio Eudragit RS300, Eudragit 30D	No menciona	Etilcelulosa
Superdesintegrante: croscarmelosa sódica, almidón glicolato de sodio y crospovidona	Desintegrante: celulosa microcristalina	No especifica	Superdesintegrante: croscarmelosa sódica Almidón glicolato de sodio, crospovidona Desintegrante: celulosa microcristalina

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

Como se dijo anteriormente, D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulgan: la composición de sildenafil de liberación pulsátil. El documento D1 menciona composiciones de liberación controlada de sildenafil que comprende una porción de liberación inmediata y una fracción de liberación controlada. En el ejemplo 3 se puede observar una forma de preparación de una tableta de liberación dual de sildenafil. El documento D2 una composición de liberación pulsátil que comprende la fracción de liberación inmediata y la de liberación controlada (Párrafo 003).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y la composición del documento D1, consiste en que dicha anterioridad no especifica que la composición tenga superdesintegrantes.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y la composición del documento D2, consiste en que dicha anterioridad no menciona el sildenafil como principio activo.

El efecto que logra el incluir la diferencia es que se logra una composición con una disolución completa mayor de 80% luego de 5 horas.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar la composición conocida en el documento D1 para lograr una disolución completa mayor del 80% luego de 5 horas?

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D2 da a conocer una composición pulsátil para liberación a diferentes tiempos y velocidades (Col. 4, líneas 21-27, Col. 5, tabla 2), que emplea partículas recubiertas como gránulos teniendo un núcleo con el activo y una primera membrana de un polímero entérico y una segunda membrana de una mezcla de polímeros insolubles y entéricos (Col. 2, Líneas 5-8). Entre los polímeros entéricos incluidos están: celulosa y sus derivados (acetato ftalato de celulosa, ftalato de hidroxipropilmetilcelulosa y succinato de hidroxipropilmetilcelulosa acetato), ftalato acetato de polivinilo y copolímeros del ácido metacrílico como Eudragit (Col. 3, líneas 14-23).

Estos polímeros son pH-dependientes. Entre los polímeros pH-independientes están acetato de polivinilo, copolímeros de ácido acrílico y metacrílico con grupos de amonio cuaternario y copolímeros neutros basados en acrilato de etilo y metilmetacrilato (Col. 3, líneas 29-35). La composición de la capa más externa de la membrana polimérica así como los pesos de las capas interna, intermedia y externa son optimizadas para lograr perfiles de liberación pulsátil para un agente terapéutico dado, que se predijo sobre la base de correlaciones in vitro/ in vivo (Col. 3, Líneas 8-13); una persona del oficio normalmente versada en la materia, emplearía una composición pulsátil para lograr una disolución completa mayor del 80% luego de 5 horas,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

para preparar composiciones de sildenafil que se dan a conocer en D1, esperando el lograr composiciones de la reivindicación 1 de la solicitud estudiada.

Aunque los documentos D1 y D2 no mencionan los superdesintegrantes de la reivindicación 1, vale la pena decir que el documento D1 menciona la celulosa microcristalina, el cual es bien conocido en el medio, como un agente desintegrante.

El documento D3 menciona una formulación que comprende un núcleo que contiene el fármaco y un recubrimiento por compresión de liberación retardada que comprende una goma natural o sintética aplicada sobre la superficie o el núcleo. Se incorpora un superdesintegrante en el núcleo en una cantidad eficaz para provocar la liberación de al menos el 50 por ciento del activo en la solución acuosa dentro de una hora tras la finalización del período de liberación retardada. Entre los superdesintegrantes mencionados en este documento D3 se encuentran croscarmelosa sódica, crospovidona, almidón glicolato de sodio (Párrafo 0056) que corresponden a los mencionados en la reivindicación 4 de la presente solicitud y que son ampliamente utilizados en la industria con el fin de facilitar la liberación del principio activo.

En consecuencia, era obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia referirse a las enseñanzas divulgadas en el documento D2 con el fin de lograr una disolución completa mayor al 80% luego de 5 horas en composiciones farmacéuticas orales de sildenafil descritas en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. De igual modo, era obvio incorporar superdesintegrantes del documento D3 en formulaciones orales de liberación controlada de sildenafil del documento D1 con el fin de mejorar la disolución del fármaco.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 7 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

En cuanto a las reivindicaciones de proceso para preparar la composición de la reivindicación 1 (reivindicaciones 8 y 9), el documento WO2008/027993 (D4) así como el documento D1 ya mencionaban las etapas contempladas en las reivindicaciones de la presente solicitud, que son las comúnmente llevadas a cabo en este tipo de procesos. Por lo cual, estas reivindicaciones no cumplen con el requisito de nivel inventivo.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual ni el documento D1 ni el documento D2 afectan la patentabilidad de la composición de la presente solicitud, puesto que no describen el uso necesario de agentes superdesintegrantes en las composiciones, ni que dichos agentes sean seleccionados de croscarmelosa sódica, almidón glicolato de sodio y crospovidona, además, que estos documentos no mencionan las cantidades de sildenafil en cada una de las fracciones que integran la composición reclamada ni la mezcla de polímeros pH dependientes con polímeros pH independientes que logren resolver el problema de la baja solubilidad en medio alcalino y así obtener un perfil adecuado.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT11/086183

Por lo anterior, es necesario anotar que si bien el documento D1 no menciona una composición pulsátil de sildenafil, sí menciona una composición con la mayoría de componentes que pueda tener la composición de la presente solicitud, incluso, menciona la presencia de un superdesintegrante; de igual manera, el documento D2 se refiere a composiciones del tipo pulsátil que emplea los excipientes de uso habitual en la industria y que también se emplean en la composición de la presente solicitud.

Aunque este documento D2 no menciona la presencia de superdesintegrantes, el documento D3 menciona una formulación que comprende un núcleo que contiene el fármaco y un recubrimiento por compresión de liberación retardada que comprende una goma natural o sintética aplicada sobre la superficie o el núcleo y que puede tener superdesintegrantes tales como croscarmelosa sódica, crospovidona, almidón glicolato de sodio (Párrafo 0056).

Es sabido por una persona del oficio normalmente versada en la materia que una composición farmacéutica puede tener superdesintegrantes para mejorar las propiedades farmacocinéticas del activo, y así lograr un buen perfil de disolución. Por lo tanto, el efecto técnico de la presente solicitud era el esperado y resulta obvio y derivado del estado de la técnica.

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: Declarar fundada la oposición presentada por la(s) sociedad(es) Procaps S.A. y Tecnoquímicas S.A. y no fundada la oposición presentada por la(s) sociedad(es) Laboratorio Franco Colombiano, Lafrancol S.A., de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente Resolución.

ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "COMPOSICIÓN DE LIBERACIÓN PULSÁTIL DE SILDENAFIL Y PROCESO PARA PREPARARLA".

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Siegfried Rhein S.A. DE C.V., y a las sociedad(es) opositora(s) Procaps S.A., Laboratorio

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 60078

Por la cual se deniega una patente de invención

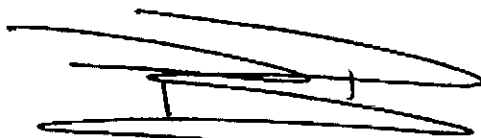
Rad. PCT11/086183

Franco Colombiano, Lafrancol S.A. y Tecnoquímicas S.A., entregándoles copia de la misma y advirtiéndoles 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 17 Oct 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

J. IAN RAISBECK

notificaciones.patentes@roclaw.co

Doctor(a)

ELIANA ISAURA MORENO BOHÓRQUEZ

negocios@optimum-co.com

Doctor(a)

TITO NOÉ PARRA MURILLO

tparra@lafrancol.com; msalazar@lafrancol.com

Doctor(a)

JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR

info@reyes-abogados.com

Elaboró: Lina Patricia Forero Tobaría ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓