

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 26, del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 09 de agosto de 2011, con el N°. 11-100847-00000-0000, por la sociedad Reata Pharmaceuticals Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIONES DE DOSIS ORALES DE LIBERACIÓN RETARDADA QUE CONTIENEN BARDOLOXONA-METILO (CDDO-ME) AMORFO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2010/024127 del 12 de febrero de 2010.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 636 del 20 de enero de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N°. 23242 y notificado por fijación en lista el 18 de diciembre 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, 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°. 11-100847-00005-0000 del 08 de mayo de 2013, presentó el nuevo título: "COMPOSICIONES DE DOSIS ORALES DE LIBERACIÓN RETARDADA QUE CONTIENEN BARDOLOXONA-METILO (CDDO-ME) AMORFO Y UN AGLUTINANTE HIDRÓFILO, TAL COMO UN EXCIPIENTE BASADO EN CELULOSA". Se aceptó el nuevo título presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en la Decisión 486.

QUINTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N°. 11-100847-00005-0000 del 08 de mayo de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 18 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.

SEXTO: 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,*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial".

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 18 contenidas en el radicado 11-100847-00005-0000, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención

El problema técnico se refiere a la necesidad de proporcionar composiciones de liberación modificada de bardoloxona-metilo (cddo-me). Para solucionar este problema la solicitud presenta composiciones que contienen bardoloxona-metilo (cddo-me) amorfo y un aglutinante hidrófilo, tal como un excipiente basado en celulosa.

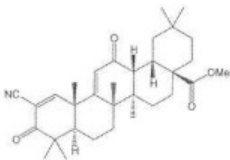
7.2. Determinación del estado de la técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad invocada, es decir el 13 de febrero de 2009.

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

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	JP2008110962	"Preventing or treating agent of keratoconjunctival trouble, containing nrf2-activating substance as active ingredient"	15/Mayo/2008
D2	Raymond C. Rue. Pharmaceutical Press. 5a. ed., Págs. 346 a 348.	"Handbook of pharmaceutical excipients"	2006

El documento D1¹ divulga un compuesto para la prevención y tratamiento de problemas keratoconjuntivales, de fórmula:



¹http://worldwide.espacenet.com/searchResults?bookmarkedResults=true&submitted=true&DB=EPODOC&locale=en_gb&sf=n&FIRST=1&F=0&CY=gb&LG=en&&PN=CA2519208&Submit=SEARCH&=&=&=&=

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

El documento D2² enseña que la HPMC o hipromelosa se utiliza en concentraciones de 2 a 5% en procesos de granulación y en tabletas de liberación prolongada se utiliza en proporciones del 10 al 80% (Págs. 346 a 348).

7.3. 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"*.

En el presente caso, la forma de dosis sólida reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Una forma de dosis sólida que comprende (A) partículas comprendidas de bardoloxona-metilo amorfo, mezcladas con (B) partículas comprendidas de al menos un aglutinante hidrófilo seleccionado del grupo que consiste de excipientes a base de a base de celulosa, polímeros de carbohidratos que ocurren naturalmente, polímeros aniónicos, polímeros de ácido láctico o copolímeros de ácido láctico y glutámico, gelatina o gelatinas modificadas, y polímeros de carbohidratos sustituidos con amina."* (Pág. 5 del radicado 11-100847-00005-0000).

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

Tabla 1		
Características esenciales	D1	D2
Reiv 1		
Forma de dosis sólida	Forma de dosis sólida	Forma de dosis sólida
A = Bardoxolona-metilo amorfo	A = Bardoxolona-metilo	A = diversos compuestos activos
B = Aglutinante hidrófilo:	B = Aglutinante hidrófilo:	B = Aglutinante hidrófilo:
a base de celulosa	a base de celulosa	a base de celulosa
carbohidratos naturales	carbohidratos naturales	carbohidratos naturales
polímeros aniónicos	polímeros aniónicos	polímeros aniónicos
polímeros de ácido láctico	HPMC	HPMC
copolímeros de ácido láctico y glutá		2 a 5 % para granular
gelatinas		10 a 80 % para liberación retardada
gelatinas modificadas		
polímeros de carbohidratos sustituidos con amina		
	Párrs. [0017] y [0027]	Págs. 346 a 348

²Raymond C. Rwe. Handbook of pharmaceutical excipients. Pharmaceutical Press. 5a. ed., Págs. 346 a 348

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga una forma de dosis sólida que contiene bardoxolona-metilo y un aglutinante hidrófilo aniónico a base de celulosa natural tal como HPMC (Párrs. [0017] y [0027]).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1, y la composición divulgada en el documento D1, es que el compuesto activo bardoxolona-metilo es amorfo.

Los efectos técnicos observados no se consideran sorprendentes, dado que estos son:

- (a) la forma de dosis sólida que contiene el compuesto activo bardoxolona-metilo amorfo logra mayor biodisponibilidad (expresada por su alta Cmax y el corto tiempo para lograr dicha concentración) que la que lo contiene en forma cristalina, y
- (b) de entre las diversas formas de dosis sólida que contienen el compuesto amorfo, se observa que la biodisponibilidad depende de diversos factores tales como la cantidad de celulosa microcristalina, de lactosa mono hidrato y de HPMC.

Según se observa en la tabla siguiente:

	AMORFO	AMORFO	AMORFO	AMORFO	AMORFO	CRISTALINO
	1	2	3	4	5	OTRA
BARDOXOLONA	12,5	12,5	12,5	12,5	12,5	18,18
CELULOSA MICROC	20	29	24	29,2	22,5	18,55
LACTOSA MONO H2O	53,5	53,5	53,5	33,3	20	-
ALMIDÓN PREGELAT	-	-	-	-	-	53,45
COPOVIDONA XL	9	-	-	-	-	8,72
LS de Na	3	3	3	3	3	-
SIO2	1	1	1	1	1	0,55
ESTEARATO Mg	1	1	1	1	1	0,55
HPMC	- - -	-	5	20	40	-
C max	34,8	27,6	22,4	11,4	16	10,2
Tmax	4,0	5,6	6,4	10,0	4,0	12,0

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar la forma de dosis sólida conocida en el documento D1 para lograr una forma de dosis alternativa.

El documento D2 enseña la forma de retardar la liberación del ingrediente activo, mediante la adición de aglutinantes tales como HPMC. Además, da a conocer que una concentración de 2 a 5 % de HPMC es apropiada para granular y una de 10 a 80 % es apropiada para lograr la liberación retardada (Págs. 346 a 348).

En consecuencia, la persona versada en la materia incluiría un aglutinante tal como el HPMC en concentración de 10 a 80% según enseña el documento D2 (Págs. 346 a 348) en la forma de dosis del documento D1, logrando así que la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

forma de dosis que contiene el compuesto activo amorfo se libere de forma más lenta (la fórmula No. 4, que contiene 20% de HPMC, tarda 10 horas para lograr la Cmax, dato que es muy cercano a la forma de dosis que contiene el compuesto activo cristalino).

De otro lado, el formulador normalmente versado en la materia sabe, como se conoce bien en el medio y lo presentan los manuales de uso común, que la forma amorfa usualmente se disuelve más rápidamente que las formas cristalinas (Aulton³, Pág. 239, Col. 2, Párr. 1), por lo cual el hecho de que la forma de dosis sólida que contiene el compuesto activo bardoxolona-metilo amorfo logre mayor biodisponibilidad (expresada por su alta Cmax y el corto tiempo para lograr dicha concentración) que la que lo contiene en forma cristalina, no es sorprendente y, en consecuencia no es indicativo de que se haya logrado algún efecto técnico inesperado. Por lo tanto, la solicitud se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 18 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

Se reitera a la solicitante que se aceptó para examen el nuevo capítulo reivindicatorio del radicado 11-100847-00005-0000 y el examen confirmó la falta de nivel inventivo, según se había comunicado previamente mediante el requerimiento presentado de acuerdo con el Artículo 45.

Es oportuno aclarar que, tal como afirma la solicitante, el documento D1 no da a conocer la forma amorfa del compuesto bardoxolona-metilo, por lo cual la composición reivindicada es nueva frente a este documento, pero, como se explicó, no tiene nivel inventivo.

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 "COMPOSICIONES DE DOSIS ORALES DE LIBERACIÓN RETARDADA QUE CONTIENEN BARDOLOXONA-METILO (CDDO-ME) AMORFO Y UN AGLUTINANTE HIDRÓFILO, TAL COMO UN EXCIPIENTE BASADO EN CELULOSA".

³Pharmaceutics: the science of dosage form design. Aulton, Michael E., 2da. Ed. Elsevier Ltd, Philadelphia, 2002. Pág. 239.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:31531

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-100847

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Reata Pharmaceuticals Inc., 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 5 días hábiles siguientes a ella.

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)

SILVANA MARIA LÓPEZ DÍAZ, NOTIFICACIONES@CLARKEMODET.COM.CO

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca

Revisó: Sandra Carolina Crespo

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez