

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 236.00

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 30 del artículo 3° del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 23 de diciembre de 2005, bajo el número 05 129656, se presentó la solicitud de patente de invención titulada: "COMPOSICION FARMACEUTICA QUE CONTIENE (S)-I-(2S, 3S)-3-HEXIL-4-OXO-OXETAN-2-ILMETIL DODECIL N-FORMIL-L-LEUCINATO".

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.

TERCERO: Que el doctor José Luis Reyes Villamizar en su calidad de apoderado de las sociedades Lafranco S.A. y Tecnoquímicas S.A., mediante escrito radicado el 27 de septiembre de 2007, presentó oposición fundamentada, la cual cumplió los requisitos formales previstos por la normativa andina. (Folio 182)

CUARTO: Que el solicitante no dio respuesta a las oposiciones referenciadas en el considerando precedente.

QUINTO: Que realizado el examen de patentabilidad se encontró que la invención no cumple con los requisitos establecidos. En consecuencia, con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió al peticionario para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud.

SEXTO: Que el solicitante mediante escrito radicado el 24 de septiembre de 2009 atendió oportunamente al requerimiento formulado presentando aclaraciones.

SEPTIMO: 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."

OCTAVO: Que las reivindicaciones 1 a 11, contenidas en los folios 15 a 17 del expediente en estudio, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N°  236 00

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

de acuerdo con las siguientes consideraciones:

1. Objeto de la invención

El objeto de la presente solicitud de patente de invención, se refiere a una composición farmacéutica que contiene como principio activo (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, conjuntamente con auxiliares de formulación apropiados para formar gránulos irregulares de tamaño de partícula en el rango de 0,1 mm a 0,25 mm, utilizados en la fabricación de formas farmacéuticas orales.

Según la descripción, el principio activo presenta un punto de fusión de aproximadamente 43°C, por lo que se requiere establecer formulaciones estables que protejan el (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, de los efectos térmicos causados por la acción del aumento de la temperatura generada por los equipos de producción utilizados en los procesos técnicos típicos de encapsulación y compresión, así como, por la temperatura y humedad relativa ambiental.

Estas formulaciones permiten superar alteraciones en las características de flujo de adherencia que pueden afectar los procesos productivos de las formas sólidas en las que se empleen (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, mediante el uso de auxiliares de formulación con puntos de fusión superiores que puedan estabilizar el principio activo.

Ahora bien, el (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato adecuadamente combinado con los auxiliares, permite obtener partículas irregulares con características fisicoquímicas tales que produzcan un sistema estable desde el punto de vista físico y químico, con buenas características de flujo y sin presentar adherencia, para ser utilizado en varias composiciones farmacéuticas.

El problema planteado en esta solicitud, es obtener un sistema estable desde el punto de vista físico y químico, con buenas características de flujo y sin presentar adherencia, para ser utilizado en varias composiciones farmacéuticas de (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato.

La solución propuesta por la invención bajo estudio, consiste en una composición farmacéutica que contiene como principio activo (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato conjuntamente con auxiliares de formulación apropiados para formar gránulos irregulares de tamaño de partícula en el rango de 0,1 mm a 0,25 mm.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 236 00
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

2. Análisis de las oposiciones presentadas

De acuerdo con lo establecido en el artículo 42 de la Decisión 486, “dentro del plazo de sesenta días siguientes a la fecha de la publicación, quien tenga legítimo interés, podrá presentar por una sola vez, oposición fundamentada que pueda desvirtuar la patentabilidad de la invención.”

Ahora bien, argumentando legítimo interés, las sociedades Tecnoquímicas S.A. y Lafrancol S.A., presentaron oposición a la solicitud de la patente en estudio, para demostrar la ausencia de nivel inventivo de la presente solicitud, citando y adjuntando para ello los documentos WO 98/34607, US 6734314 y US 4598089.

Posteriormente, con fecha 26 de diciembre de 2007 los opositores adjuntan otros documentos para desvirtuar el nivel inventivo (folios 127 a 175).

De esta forma, la oposición presentada por las sociedades antedichas, se encuentra fundada, ya que los documentos WO 98/34607 y US 4598089 se tuvieron en cuenta para analizar el nivel inventivo de la solicitud y, por lo tanto, se tendrán en cuenta para efectos de la presente decisión.

3. Determinación del Estado de la Técnica

3.1. Fecha determinante para el análisis comparativo

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 23 de diciembre de 2005, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud bajo estudio. La fecha de presentación fue tomada en cuenta para el estudio de patentabilidad, según obra a folio 191 del expediente en estudio, como quiera que no se invocó prioridad alguna (ver folio 1 del expediente).

3.2. Documentos del estado de la técnica

Consultadas las bases de datos y los archivos con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de presentación y relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 98/34607	Tetrahydrolipstatin containing compositions	13 de agosto de 1998
D2	US 4598089	Leucine derivatives	1 de julio de 1986

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 236 00
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

D3	US 6734314	Preparation of orlistat and orlistat crystalline forms	11 de mayo de 2004
-----------	-------------------	--	--------------------

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."

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."

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

"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, determinado si con tales conocimientos técnicos existentes ha podido o no producirse tal invención."¹

Para el caso en estudio, el nivel inventivo se evaluó por comparación entre los compuestos solicitados y los encontrados en el estado de la técnica que se relacionan con el objeto reivindicado.

Es así como se observa que la presente solicitud de patente de invención, reivindica una composición farmacéutica que contiene como principio activo (S)-l-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, conjuntamente con auxiliares de formulación apropiados para formar gránulos irregulares de

¹ Proceso 192 IP 2005.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 236 00
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

tamaño de partícula en el rango de 0,1 mm a 0,25 mm, utilizados en la fabricación de formas farmacéuticas orales.

Ahora bien, la anterioridad citada por los opositores WO 98/34607 (llamada D1 de aquí en adelante), menciona composiciones de tetrahidrolipstatina, THL (orlistat) como principio activo y como excipientes tiene estabilizantes tales como: hidroxipropilmetil celulosa, hidroxipropil celulosa, polivinilpirrolidona (PVP) y lactosa. (Folios 59 a 68).

Argumentan los opositores, que el diámetro de las partículas está entre 0,25 mm y 2 mm y, D1 revela formulaciones que contienen el mismo principio activo de las composiciones de la presente solicitud, los mismos excipientes y se encuentran en un determinado rango de tamaño de partícula.

Como se explicó en el requerimiento realizado al solicitante, los opositores afirman que en la página 3 de D1 se describen composiciones preferidas y comparan con las composiciones de las reivindicaciones 3 y 6 de la presente solicitud, en donde se encuentran el THL, laurilsulfato de sodio, talco, almidón glicolato de sodio, PVP y que pueden estar en las mismas proporciones tanto en la presente solicitud como en la anterioridad. Además, hacen una comparación entre la composición de la reivindicación 11 de la solicitud en estudio y la composición de la reivindicación 14 y ejemplos 4 y 5 del documento WO 98/34607, en donde se aprecia con toda claridad que emplean los mismos excipientes y las cantidades dadas en mg son bastante cercanas (ver FL 55).

Otro de los documentos citados por los opositores, US 4598089, (llamado D2 de aquí en adelante) menciona derivados de leucina, entre los cuales se encuentra THL u orlistat (es el mismo principio activo de las composiciones de la presente solicitud) y que pueden ser administrados en preparaciones farmacéuticas por vía oral como tabletas, tabletas cubiertas, grageas, cápsulas duras y de gelatina blanda, soluciones, emulsiones o suspensiones. Los excipientes que se pueden emplear son lactosa, almidón de maíz o derivados, talco, ácido esteárico y pueden contener agentes preservantes, solubilizantes, agentes endulzantes, agentes colorantes, agentes saborizantes, antioxidantes, entre otros. (FL 73 a 80).

Ahora bien, la anterioridad US 6734314 (llamada D3 de aquí en adelante) – también citada por los opositores-, describe una preparación de orlistat y formas cristalinas de orlistat. Las composiciones pueden contener uno o más excipientes como, por ejemplo, celulosa microcristalina, celulosa microfina, lactosa, almidón, almidón pregelatinizado, carbonato de calcio, azúcar, dextranos, dextrina, dextrosa, caolín, carbonato de magnesio, óxido de magnesio, maltodextrina, manitol, talco, sorbitol, entre otros. (FL 69 a 72).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 236 00
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

Tal como se explicó, estas anterioridades señaladas por los opositores resultan relevantes para desvirtuar el nivel inventivo de la presente solicitud, toda vez que revelan los componentes de la composición farmacéutica de la presente solicitud, es decir, (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato (orlistat) y auxiliares de formulación apropiados para formar gránulos irregulares de tamaño de partícula en el rango de 0,1 mm a 0,25 mm. Teniendo en cuenta que los auxiliares de formulación, que menciona la presente solicitud son ampliamente utilizados en la industria farmacéutica y, como lo afirman los opositores: "... son componentes ampliamente utilizados y reconocidos en la formulación de gránulos que posteriormente van a ser encapsulados, la selección, inclusión y formulación de los mismos, se reduce a la aplicación de los ensayos de preformulación y formulación que deben realizarse, como es de conocimiento de cualquier persona medianamente versada en la materia, en el momento de escoger y formular los componentes de la formulación que aseguren la calidad, seguridad y eficacia del medicamento a producirse, en este caso gránulos para encapsular en cápsulas de gelatina dura..." (folio 131).

El problema técnico planteado en esta solicitud, es como obtener un sistema estable desde el punto de vista físico y químico, con buenas características de flujo y sin presentar adherencia, para ser utilizado en varias composiciones farmacéuticas de (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, este problema ya había sido resuelto mediante la formulación de composiciones farmacéuticas de orlistat ya conocidos(as).

Por esta razón, se considera que los componentes de las composiciones farmacéuticas reivindicadas son evidentes para una persona medianamente versada en la materia.

La(s) reivindicación(es) 1 a 11 de esta solicitud no menciona(n) una característica que conceda un efecto inesperado o especial a las composiciones farmacéuticas, que pueda considerarse como un aporte a la técnica, por lo tanto se consideran obvios(as) para una persona medianamente versada en la materia.

Adicionalmente, las anterioridades D1, D2 y D3 divulgaban previamente composiciones farmacéuticas de orlistat (folios 59 a 80) y, consecuentemente una persona medianamente conocedora de la materia, motivada por tal sugerencia, lograría el objeto de esta solicitud, esto es, composiciones farmacéuticas de (S)-I-(2S,3S)-3-hexil-4-oxo-oxetan-2-ilmetil dodecil N-formil-L-leucinato, por lo cual el objeto reivindicado carece de nivel inventivo.

En consecuencia, al observar las consideraciones expuestas junto con el contenido del artículo 18 de la Decisión 486, queda claro que el objeto de solicitud

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 23600

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

no es patentable.

5. Respuesta a los argumentos del solicitante

Señala el solicitante que: "En primer lugar hay que señalar que el nivel inventivo está enfocado básicamente en el tamaño de los gránulos. De acuerdo con ello, el grado de innovación está en que a diferencia de los productos en el mercado, esta invención usa un tamaño de partícula inferior a cualquiera comúnmente usada en esta producción farmacéutica, pues como se estipula en la parte técnica, se debe hacer el granulado y luego pasarlo por un tamiz mas fino, cuya apertura de malla es más pequeña y se obtiene gránulos de un tamaño entre 01.mm y 0.25 mm."

Frente a lo anterior, es preciso señalar que las reivindicaciones de composición se deben caracterizar por sus componentes, más no se deben caracterizar por el tamaño de partícula.

En la presente solicitud de patente de invención, en la reivindicación 1 se reclama una composición de orlistat junto con excipientes apropiados, sin mencionar cuales, y el solicitante basa su invención en el hecho que orlistat se encuentra junto con excipientes para formar gránulos de tamaño de partícula de 0,1 mm a 0,25 mm, lo que corresponde a una de las propiedades fisico-químicas que se deben evaluar en el proceso de fabricación de medicamentos y este hecho resulta obvio para una persona medianamente versada en la materia.

Visto lo anterior, se ratifica que la invención en estudio no cumple con el requisito de nivel inventivo, requerido por la normatividad andina para acceder al privilegio solicitado

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención a la creación denominada: "COMPOSICION FARMACEUTICA QUE CONTIENE (S)-I-(2S, 3S)-3-HEXIL-4-OXO-OXETAN-2-ILMETIL DODECIL N-FORMIL-L-LEUCINATO".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente al doctor Enrique Aranguren Laurens, en su calidad de apoderado de la sociedad GRUPO INTERNACIONAL FARMACEUTICO GRUFARMA S.A., y al doctor Jorge Luis Reyes Villamizar en su calidad de apoderado de las sociedades Lafrancol S.A. y Tecnoquímicas S.A., o a quien haga sus veces, el contenido de la presente resolución, entregándole copia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° ^{NU} 236 00
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° 05-129656

de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición ante el Superintendente Delegado para la Propiedad Industrial al momento de notificarse o dentro de los 5 días hábiles siguientes.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE
Dada en Bogotá D.C., a los **30 ABR. 2010**

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),


GIANCARLO MARCENARO JIMENEZ

Doctor.
Enrique Aranguren Laurens
Carrera 13 No. 93-19, oficina 202
Bogotá D. C.

Doctor.
José Luis Reyes Villamizar
Carrera 17 No. 88-23, oficina 205
Bogotá D.C.

202069