



No. 06-001295- -00016-0000

Fecha: 2011-09-06 16:26:37 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 329 CTOINFORMACION Folios: 14

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E.

S.

D.

REF:

Expediente No. 06-001-295

TÍTULO SOLICITADO:

"FORMA DE DOSIFICACION ORAL DE MESILATO DE SAQUINAVIR"

PUBLICACIÓN:

Gaceta 564 de 31/05/2006. N° de publicación: 69

PRIORIDAD:

US 60/486,600 de 11/07/2003; US 60/568,204 de 05/05/2004

SOLICITANTE:

F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

APODERADO:

ALICIA LLORED A RICAURTE

TRÁMITE:

REMISION DE INFORMACION

Pronunciamiento sobre Recurso de Reposición.

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, mayor de edad, identificado como aparece al pie de mi firma, reconocido apoderado de la sociedad **TECNOQUÍMICAS S.A.** en el asunto de la referencia, de manera respetuosa, me permito pronunciarme sobre el Recurso de Reposición presentado por el solicitante contra la Resolución 68389 de Diciembre 9 de 2010 por la cual se niega la solicitud 06-001-295 el privilegio de patente de invención.

I. PETICIÓN

Sírvase ratificar la negación del beneficio patentario a la solicitud contenida en el expediente 06-001-295, por incumplir los requisitos materiales de patentabilidad establecidos por el Título II, Capítulo I de la Decisión 486 de 2000. Lo anterior, con base en los fundamentos y pruebas que dentro de los términos legales he presentado a ese Despacho, y los argumentos que planteo en este memorial.

II. ARGUMENTOS SOBRE LOS FUNDAMENTOS DEL RECURSO Y MOTIVOS DE INCONFORMIDAD

El recurso en contra de la Resolución 68389 de Diciembre 9 de 2010, por la cual se niega a la solicitud 06-001-295 el privilegio de patente de invención solicitado para el capítulo reivindicatorio de la invención titulada “**FORMA DE DOSIFICACION ORAL DE MESILATO DE SAQUINAVIR**”, afirma que:

1. LA SOLICITUD DENEGADA BRINDA UN APORTE SIGNIFICATIVO AL ESTADO DE LA TÉCNICA QUE NO ES EVIDENTE A PARTIR DEL ARTE PREVIO,

El recurrente afirma que: “...*la solicitud denegada proporciona una forma de dosificación farmacéutica que comprende de 60% a 80% de mesilato de saquinavir (como base libre), la cual facilita el tratamiento al paciente toda vez que disminuye el número de unidades de dosificación diaria que deben ser ingeridas, presentando además un patrón de disolución uniforme y rápido...*”. Menciona que “...**contrario a lo afirmado por la Resolución impugnada, la presente solicitud no solo busca obtener una forma de dosificación que permita una muy buena biodisponibilidad del principio activo y un rápido perfil de disolución a pesar de tener dicho algo contenido de saquinavir...**”; (negrita y cursiva, fuera del texto).

El recurrente adiciona que “...*la presente invención no solo pretende aumentar la concentración del principio activo en la forma de dosificación, sino que busca hacer que este principio activo sea realmente absorbido en la cantidad necesaria...*” y que “...*es un gran aporte dentro del campo técnico de la invención toda vez que el saquinavir es una molécula muy hidrofóbica,...* la cual tiene baja solubilidad y baja permeabilidad... resuelve este reto de la formulación en altas cantidades de un compuesto con baja solubilidad y biodisponibilidad como es el saquinavir, a través de una forma que emplea el medicamento micronizado con un alta carga por tableta y mantiene simultáneamente buenas propiedades de disolución, permitiendo al medicamento alcanzar niveles eficientes en los pacientes, en una sola administración, donde dicha forma de dosificación comprende de 60% a 80% de saquinavir mesilato, de 4 % a 8 % de

polivinilpirrolidona, 4% a 10% de un desintegrante seleccionado de croscarmelosa sódica..., el subrayado es nuestro.

El recurrente concluye para este aparte que “...*de ninguna manera podría predecir que si se tiene específicamente una formulación de mesilato de saquinavir como la que hace a partir de la forma de dosificación farmacéutica oral de la invención se tendría una alta biodisponibilidad del principio activo, lo que permite brindar en una sola ingestión la cantidad diaria requerida...*”, el subrayado es nuestro.

De esta forma, y grosso modo, la solicitud denegada presenta dos estrategias conocidas en el estado de la técnica para obtener una mejora en la solubilidad acuosa de compuestos difícilmente solubles, las cuales consisten en: la utilización de una sal del compuesto insoluble (mesilato de saquinavir) y la disminución del tamaño de partícula (micronizado) del mismo.

Como ya se había sustentado ante ese Despacho, es ampliamente conocido que en términos generales si se tiene una sustancia cuya solubilidad en agua es inferior a 1 mg/ml en el intervalo de pH fisiológico, presenta problemas de biodisponibilidad. Por esta razón existen varios métodos para incrementar la solubilidad; algunos emplean modificaciones químicas y otros se basan en modificaciones físicas o de la formulación. El uso de sales formadas a partir de procedimientos químicos, es quizás el método más comúnmente utilizado para aumentar la solubilidad y la velocidad de disolución de principios activos poco solubles en agua. Este es el caso claro de la solicitud colombiana en trámite cuando incluye dentro de su formulación al mesilato de saquinavir.

De la misma forma, se sabe que entre las características fisicoquímicas implicadas en la solubilidad de cualquier compuesto se encuentra el tamaño de partícula, al disminuir el tamaño de partícula (por ejemplo, al micronizar un principio activo), aumenta la superficie específica en contacto con el medio y por lo tanto la velocidad de disolución. Este es también el caso claro de la formulación de la solicitud denegada, cuando utiliza mesilato de saquinavir micronizado.

La persona versada sabe que las características inherentes del principio activo influyen en su solubilidad, y que existen factores de la formulación que influyen en la solubilidad del mismo.

Es así como la formulación de la solicitud denegada presentaba un agente desintegrante como polivinilpirrolidona (PVP), sustentando un efecto inesperado y beneficioso en la misma, a lo que hay que decir que dichos efectos no son más que el resultado de la aplicación y combinación de diversas estrategias de solubilización reconocidas en el estado de la técnica, que a través de los respectivos ensayos de preformulación y formulación que se deben llevar a cabo para este tipo de formulaciones farmacéuticas, dan, obviamente como resultado, una mejora en la biodisponibilidad del saquinavir.

En conclusión, se ratifica que el capítulo reivindicatorio carece por completo de nivel inventivo considerando que se le adjudica el efecto sorprendente de biodisponibilidad mejorada de la sal mesilato de saquinavir a la formulación de la composición reivindicada, cosa que, repito, no es más que el resultado de utilizar estrategias de solubilización ampliamente conocidas y estudiadas en el estado de la técnica sobre principios activos poco solubles en medios acuosos, como las empleadas en este caso: estrategias tanto a nivel molecular del compuesto activo (utilizar una sal mas soluble, micronizar, etc.) como a nivel de la formulación (inclusión de desintegrantes y PVP).

Por otra parte, el proceso a través del cual se obtienen las formulaciones sólidas de la presente solicitud denegada corresponde simplemente a una granulación por vía húmeda convencional, con variaciones menores reconocidas por cualquier persona medianamente versada en la materia.

2. EL DOCUMENTO D1 NO BUSCA RESOLVER EL MISMO PROBLEMA QUE LA INVENCION DENEGADA Y NO SE REFIERE DE NINGUNA MANERA A LOS PROBLEMAS DE SOLUBILIDAD Y BIODISPONIBILIDAD DEL SAQUINAVIR.

D1 (correspondiente a la patente americana US 6,039,975 con fecha de patente de 21/03/2000) revela un sistema de liberación para marcar medicamentos basado en una tableta que comprende en su núcleo un ingrediente activo como inhibidor de la proteasa viral, una membrana interna semipermeable de polímero y una cubierta entérica exterior fabricada a través de granulación, posterior compresión y recubrimiento.

REYES & REYES

A B O G A D O S

Frente a D1 el recurrente argumenta: "... está dirigido a resolver un problema totalmente diferente al que es solucionado por la presente invención... **busca obtener formas de dosificación que mantengan su integridad hasta llegar al colon y sólo allí liberen el principio activo, buscando una mejor absorción sistémica del principio activo y evitar el rompimiento o degradación de este al estar en contacto con los jugos gástricos... no está encaminado de ninguna manera a buscar una forma de dosificación que permita aumentar la cantidad de principio activo administrado en una sola toma, brindando un alta biodisponibilidad de este, sino que se enfoca en buscar una forma de dosificación que permita liberar el medicamento únicamente cuando este llegue al colon...** no señala de ninguna manera el saquinavir como medicamento preferido, ni se refiere o sugiere de modo alguno una posible problemática con respecto a la solubilidad de este principio activo... emplea en el ejemplo 5 saquinavir, en forma de base libre, pero de ninguna manera muestra la solubilidad del núcleo allí obtenido y mucho menos resalta su comportamiento en un pH ácido, lo que no permitiría que la persona versada en la materia identificara ni el problema de solubilidad de este principio activo, ni una posible solución a este problema..."

En la columna 4 se describen los componentes de cada una de las partes que conforman dicha tableta y en especial, el núcleo está compuesto de un ingrediente activo en un vehículo farmacéuticamente aceptable, con un agente desintegrante y varios otros excipientes como enlazantes, lubricantes o diluyentes.

Como se observa en D1, el núcleo de dicha tableta comprende los mismos componentes o excipientes reclamados por la solicitud denegada, con lubricantes como el estearato de magnesio, diluentes como la celulosa microcristalina, desintegrantes como la croscarmelosa sódica, aglutinantes como la polivinilpirrolidona y el agente activo corresponde a un inhibidor de la proteasa viral (columna 4 líneas 1 a 15 y ejemplo 5).

D1 revela además, una formulación en forma de tabletas recubiertas en este caso específico para liberación colónica de saquinavir que aunque no se encuentra en forma micronizada, permite demostrar anticipadamente la existencia de composiciones como las que se pretenden revelar ahora en la solicitud

colombiana debido a que contienen el mismo principio activo, sus excipientes son en su gran mayoría los mismos y resuelven el mismo problema: liberar gradualmente el principio activo.

Así entonces, la anterioridad D1 enseña compuestos activos en núcleos y tabletas recubiertas mediante procesos de granulación, seguidos de compresión y recubrimiento, tal como son divulgados para las composiciones reivindicadas y así mismo son adecuadas para la liberación de inhibidores de proteasa tales como el saquinavir.

De esta forma, se establece que la única diferencia entre la solicitud y D1 se refiere al proceso físico que sufre el compuesto al estar micronizado y a las proporciones establecidas de 60 a 80% del ingrediente activo, las cuales no conceden ningún efecto sorprendente.

3. LA FORMA DE DOSIFICACIÓN REVELADA EN D1 DIFIERE SIGNIFICATIVAMENTE DE AQUELLA RECLAMADA POR LA SOLICITUD DENEGADA TANTO EN SU ESTRUCTURA COMO EN SU FORMA DE LIBERACIÓN DEL PRINCIPIO ACTIVO.

Argumenta el recurrente que: ***“...La capa más externa del sistema de liberación de D1 se constituye en una membrana entérica resistente al ácido (columna 5 línea 35, D1), la cual no se disuelve en el jugo gástrico estomacal y por lo tanto se mantiene intacta en el estómago y no permite que ninguno de los componentes interiores (como el principio activo) sean liberados en ese lugar del organismo...”*** adicionalmente dice: ***“...en el colon, como consecuencia del hinchamiento del núcleo la membrana se revienta y expone al núcleo al ambiente del colon..”***. Luego, argumenta que: ***“La forma de dosificación de la invención está diseñada para permitir la rápida disolución del principio activo una vez entra en contacto con los jugos gástricos...”*** ***“...es decir que contrario al sistema revelado en D1 la forma de dosificación de la presente invención se disuelve en pH ácido.”***

El recurrente además menciona sobre las gráficas figura 3 de la solicitud y figura 3 de D1 que ***“las condiciones y perfiles de disolución de ambas formas de***

dosificación son completamente distintas. Así, la forma de dosificación de la invención luego de 30 minutos en un pH ácido se ha disuelto casi en un 90% (en contraposición a lo que ocurre con la forma comercial en este mismo tiempo, puntos negros en la gráfica, que apenas se ha disuelto aproximadamente un 70%)”.

“Contrario a esto, la forma de dosificación de D1 no libera ninguna cantidad medicamento en pH ácido (Zona A, HCl 0,1N, pH =1) aún después de 4 horas. Así mismo luego de 4 horas en un medio con un pH superior (Zona B, buffer fosfato, pH 7,5, de tiempo 4 a 8 horas) no se produce liberación del principio activo, pero pasado este tiempo empieza a liberarse y en aproximadamente 4 horas más casi el 100% del medicamento ha sido liberado”.

Sobre lo señalado por la SIC respecto al análisis de nivel inventivo, el recurrente indica que se realizó una “*incorrecta interpretación*” debido a que las diferencias de los dos documentos radican en que D1 “(A) está diseñado para empezar la disolución a pH superiores a 5, contrario a la presente invención que busca la rápida y reproducible disolución a pH menor, por ejemplo pH=3; (B) posee una membrana semipermeable que permite la entrada de líquido y evita la salida de sustancias como el principio activo, la cual no está de ninguna manera presente en la forma de dosificación de la presente invención; (C) libera el medicamento 4 a 6 horas después de haber entrado en contacto con el fluido intestinal, y tarda 1 a 2 horas en liberar todo el principio activo, mientras que la presente invención se disuelve en un 90% en menos de 1 hora en pH ácido...”

De lo anterior se puede entender que el problema a solucionar con relación al estado de la técnica es precisamente la formulación de un medicamento ya conocido para que se libere de forma controlada en el estómago a unas condiciones determinadas. Por tal razón, las diferencias señaladas por el recurrente como A y C corresponden a la misma desde dos puntos de vista como causa y efecto respectivamente, queriendo decir con esto que corresponden al mismo rasgo pero C depende de manera obvia de cómo se diseñe la formulación en A. De otra forma se entiende además, que C es un resultado a alcanzar y no una característica técnica esencial que permita comparar la materia de la solicitud denegada y D1.

Por otra parte, la característica B citada por el recurrente se refiere a una membrana semipermeable que si bien esta dirigida a solucionar el efecto técnico planteado por el recurrente, su carencia o disminución obedece a una alternativa evidente en procesos de formulación y liberación, además de ser ampliamente conocido el hecho de que la celulosa y sus derivados modifican propiedades de solubilidad del compuesto.

De esta forma, se establece que únicamente se modifican las propiedades de solubilidad para obtener el efecto deseado según el conocimiento científico divulgado. Dicho efecto es evidente para cualquier persona versada en la materia técnica de la presente solicitud, dado que es ampliamente conocida la solubilidad de compuestos y su liberación en el cuerpo humano dependiendo el pH y la composición del medicamento en pastillas recubiertas.

4. LA FORMA DE DOSIFICACIÓN ENSEÑADA D1 NO COMPRENDE UN NÚCLEO CON EXACTAMENTE LOS MISMOS COMPONENTES PRESENTES EN EL NÚCLEO DE LA FORMA DE DOSIFICACIÓN DE LA PRESENTE INVENCION.

Dice el recurrente: ***“... la referencia que hace la Resolución impugnada de la composición de los núcleos revelados en D1 implica que la persona versada en la materia debería escoger de forma arbitraria no emplear dos de las 3 capas presentes en la forma de dosificación allí revelada...”***. Menciona entonces que ***“...a pesar de que la persona versada en la materia ignorara todos estos hechos y se concentrara únicamente en el núcleo revelado en D1, los contenidos de los componentes de dicho núcleo no lo conducirían de forma evidente a las proporciones presentes en la forma de dosificación de la invención...”***. Adiciona que ***“...si bien muchos de los componentes incluidos en el núcleo revelado en D1 son los mismos que están presentes dentro de la forma de dosificación de la solicitud denegada, dicho núcleo de D1 comprende elementos adicionales y proporciones distintas con respecto a dicha forma de dosificación de la invención...”***. ***“...De lo anterior, es evidente que el manitol es un componente preferido dentro de la formulación de D1 y que siempre estaría incluido en una proporción importante en la formulación. Contrario a esto dicho componente no está de ninguna manera presente en la formulación de la forma de***

dosificación que es objeto de la presente invención...". "D1 no brinda ninguna indicación que motive a la persona versada en la materia a modificar lo revelado en dicho documento, toda vez que este es completamente silencioso con respecto a una posible utilidad de cualquier modificación de lo allí revelado en la solubilidad y biodisponibilidad de principios activos de difícil formulación, como lo son principios activos clase 4, y específicamente el mesilato de saquinavir..." "...D1 no sugiere de ninguna manera que una modificación particular en la composición del núcleo allí revelada podría mejorar la biodisponibilidad del mesilato de saquinavir en pH ácido, este documento no puede de ninguna manera afectar el nivel inventivo de la solicitud denegada".

Se refiere entonces que todos los componentes de la solicitud se encuentran anticipados por D1 lo cual no hace pertinente que para el análisis se examinen elementos particulares de dicha anterioridad en la medida en que no es dicho documento el que se encuentra bajo análisis sino la composición reivindicada de la solicitud denegada.

Entonces, para que el argumento fuera válido, la carencia de un compuesto como el manitol debería haber sido incluida como una limitación negativa o disclaimer- en caso de que fuera este hecho el que diera el efecto sorprendente a la composición -, pero de acuerdo a las demás reivindicaciones, en las cuales otros compuestos pueden estar presentes en la composición de la reivindicación 1 (como la celulosa microcristalina que es opcionalmente añadida como se observa en la reivindicación 15), se comprueba que los compuestos no se limitan únicamente a los señalados.

Por estas razones no hay motivos para seleccionar los compuestos activos, determinar la funcionalidad de los excipientes de D1 y seleccionar las alternativas evidentes para lograr una formulación más soluble, resultado que se alcanza seleccionando los compuestos determinados en la solicitud y obviando la membrana semipermeable, hecho que no solo motiva, sino que obliga al técnico medio versado en la materia a emplear proporciones como las reivindicadas mediante técnicas universalmente conocidas de estandarización.

5. AÚN SI PARTIERA DE LAS ENSEÑANZAS DE D1, LA PERSONA VERSADA EN LA MATERIA NO PODRÍA TENER CERTEZA DE QUE UN AUMENTO

SIGNIFICATIVO EN LA CONCENTRACIÓN DEL PRINCIPIO ACTIVO CONSERVARÍA UNA BUENA BIODISPONIBILIDAD DE ESTE.

Dice el recurrente: *"... dado que el núcleo del sistema de liberación de D1 está encaminado a disolverse en el pH intestinal (7,5), de ninguna manera la persona versada en la materia podría deducir cuál sería el comportamiento de la solubilidad de una composición con una alta cantidad de principio activo, en un pH mucho menor como lo es el pH estomacal..."*

En el estado de la técnica es conocida la dependencia de la solubilidad con el pH para lo cual la persona encargada de estandarizar técnicas emplea por defecto una tabla de solubilidad de cada compuesto cuando requiere conocer la solubilidad a determinado pH. De aquí que no existe ningún criterio inventivo para formular una composición que presente una ventaja sorprendente en cuanto a su solubilidad en determinado pH, sobre todo cuando se sabe que el saquinavir presenta una mejor solubilidad y estabilidad a pH bajo y dependiendo de los excipientes (como en el caso de D1) se puede modificar su solubilidad a diferentes condiciones. Por lo tanto, no existe merito inventivo en emplear excipientes comúnmente usada en química para conceder diferentes propiedades de solubilidad a un compuesto como el reivindicado a un pH bajo.

6. EL DOCUMENTO D2 NO SUBSANA LAS DEFICIENCIAS DE D1 PARA OBTENER LA SOLICITUD DENEGADA TODA VEZ QUE ESTÁ DIRIGIDO A FORMAS DE DOSIFICACIÓN DISTINTAS Y NO SE REFIERE ESPECÍFICAMENTE A SAQUINAVIR NI A LOS INCONVENIENTES DE LA SOLUBILIDAD Y BIODISPONIBILIDAD DE ESTE PRINCIPIO ACTIVO.

El recurrente afirma que *"...la persona versada en la materia no combinaría de forma evidente las revelaciones de D1 con las de D2, y aún si lo hiciera no obtendría inequívocamente la forma de dosificación objeto de la presente solicitud (...) D2 se refiere a los problemas que se presentan en los sistemas de liberación existentes en el estado del arte, los cuales no liberan toda la dosis de medicamento requerida, por lo que en muchos casos se emplea en sobre dosis para cubrir la deficiencia de liberación; dicho documento además resalta que dichas sobre dosis pueden acarrear una descarga súbita del principio activo que conlleve a una sobre medicación y efectos colaterales indeseados (páginas 2 y 3*

de D2)."

El recurrente menciona aludiendo a la figura 2 de D2 que dicho documento *"...emplea una membrana semipermeable, que posee una salida y que rodea la formulación del principio activo, la cual a su vez comprende un portador osmopolimérico y un aglutinante cohesivo, lo que brinda una liberación controlada del medicamento (...) D2 no se dirige específicamente la formulación de saquinavir sino que se refiere a este de forma general dentro de un gran número de posibles principios activos..."* aparte menciona que ***"...ninguno de los ejemplos específicos revelados en las páginas 24 A 35 de D2 incluye dentro de la formulación saquinavir, ni dicho documento menciona en particular cómo podría formularse este principio activo o posibles inconvenientes de dicha formulación debidas a la solubilidad o biodisponibilidad del saquinavir."***

"...la cantidad de principio activo contenida en la forma de dosificación revelada en D2 es muy inferior a aquella que hace parte de la forma de dosificación de la presente invención...". El recurrente argumenta además que *"la composición de D2 comprenden componentes que no son de ninguna manera incluidos ni en la forma de dosificación de D1 ni en la de la presente invención, como son el polióxido de etileno y la hidroxipropil celulosa; tomando en consideración este hecho ¿qué llevaría a la persona versada en la materia a no incluir ninguno de estos componentes dentro de la forma de dosificación?"*.

Sobre este punto concluye el recurrente que *"para que la persona versada en la materia pudiera obtener la forma de dosificación objeto de la presente invención a partir de las enseñanzas de D1 y D2 tendría que:*

- (A) *ignorar las capas exteriores de las formas de dosificación allí reveladas y emplear únicamente la composición central;*
- (B) *tomar los componentes de D1 y ninguno de los de D2, modificando la cantidad de celulosa microcristalina, eliminando el manitol e introduciendo lactosa;*
- (C) *ignorar que D1 muestra claramente que la composición allí revelada está diseñada para disolverse luego de aproximadamente 4 horas en pH de 7,5;*
- (D) *tomar de D2 la idea de micronizar el principio activo;*
- (E) *aumentar significativamente la cantidad de principio activo contenido para que esta corresponda a del 60% al 80% del peso de la forma de dosificación;*

(F) *esperar que la composición así obtenida tenga una buena biodisponibilidad y rápida disolución en pH ácido.*

*(...) resaltar que **ninguno sería evidente a partir de las enseñanzas de D1 y D2**, toda vez que en dichos documentos no se indican de ninguna manera que pueda existir un problema de solubilidad y biodisponibilidad de saquinavir, y mucho menos se sugiere que la manera de tener una composición con altos contenidos de este principio activo que tenga buenas biodisponibilidad y rápida disolución en un pH ácido sería por medio de una forma de dosificación farmacéutica que contenga específicamente los componentes en las cantidades particulares que define la presente invención."*

Es necesario tener en cuenta que D2 divulga núcleos que contienen un rango amplio de concentración de principio activo (ver página 13) en donde se encuentra saquinavir (pág 13, línea 10) en dosis que pueden variar de 0.5mg a 650mg (pág 13, líneas 11 y 12) de forma micronizada y demás auxiliares farmacéuticos como almidón, PVP y estearato de magnesio.

Así entonces es de reconocer que las proporciones presentes de compuesto activo estaban anticipadas por el documento D2 y su forma de presentación para su solubilidad a determinadas condiciones. De esta forma y en vista de que no se presentó ningún efecto sorprendente por la solicitud denegada, era evidente para un técnico medio en la materia emplear altas concentraciones de saquinavir logrando los resultados deseados, problema que no se aclaraba en D1 pero si en D2.

Por otra parte, es claro que el documento D2 trata de forma precisa y contundente medicamentos tales como el saquinavir, debido a que lo menciona entre la lista (no generalidad) de la página 13 columnas 1 a 11, definiendo exactamente los productos sobre los que se extiende la composición de la invención. Por esta razón no es lógico considerar que el documento no se refiere específicamente a una formulación de saquinavir como lo plantea el recurrente, ya que los ejemplos se remiten a la lista indicada de forma puntual y no como una generalización.

Adicionalmente, es de tener en cuenta que las proporciones y concentraciones de saquinavir en D2 y la solicitud denegada son la misma si se revisan las modalidades particulares de la invención en las reivindicaciones 2 a 5 en las

REYES & REYES

A B O G A D O S

cuales se habla de intervalos de mesilato de saquinavir de 200mg a 700 mg, 250mg a 700mg y 500 mg respectivamente mientras que D2 habla de dosis de 05 a 650 mg, así entonces solo se encuentra un pequeño intervalo de 651mg a 700mg de margen de ingrediente activo que no comprende D2, pero sobre el que la solicitud denegada no demuestra un efecto sorprendente.

De esta forma bastaría con analizar correctamente el documento D1 y con el fin de lograr un medicamento de liberación controlada más soluble y que se disuelva en el estomago y no en el colon, el experto medio se vería no solo motivado sino forzado a emplear únicamente el núcleo en una nueva formulación, y bajo la premisa de emplear una concentración micronizada como la de D2 en las concentraciones sugeridas, se determinaría de manera evidente la formulación de la invención. Los parámetros involucrados por el recurrente, tales como mecanismos de acción, propiedades de solubilidad con relación al pH y tiempo de acción, son evidentes para cualquier técnico medio y dependen únicamente de las características estructurales antes mencionadas y son medibles de forma elemental.

Adicionalmente a esto, la solicitud denegada no demostró ningún efecto sorprendente o mejorado de las composiciones reivindicadas en comparación con lo conocido en el estado de la técnica, sino una medida de sus propiedades y su espectro de acción, lo cual es una simple caracterización farmacéutica.

7. DADO QUE NINGUNO DE LOS DOCUMENTOS CITADOS CONDUCE DE FORMA EVIDENTE LA INVENCION DENEGADA, ESTÁ SE AJUSTA TOTALMENTE A LO PRECEPTUADO POR EL ARTÍCULO 18 DE LA DECISIÓN ANDINA 486 DE 2000.

Por último el recurrente argumenta que es *“... pertinente resaltar que al tener conocimiento de la invención y de la solución que esta proporciona es de esperarse que dichas selección, agrupación y modificaciones particulares de las enseñanzas de D1 y D2 parezcan obvias, toda vez que ya se sabe de antemano que efectivamente estos elementos en combinación resuelven el problema planteado; sin embargo, esta información no era conocida por el inventor en el momento de desarrollar la invención, por lo que no podría tener certeza de la utilidad de realizar estos pasos... la única motivación que tendría la persona*

REYES & REYES

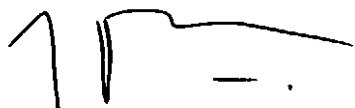
A B O G A D O S

versada en la materia de reunir estas características particulares reveladas en D1 y D2 sería la misma invención como ha sido revelada, es evidente el nivel Inventivo que conlleva dicha solicitud...”

Sin embargo, es útil mencionar que a diferencia de lo expresado por el recurrente, los argumentos anteriormente expresados dejan claro que el objeto de la presente invención obedece a una selección de compuestos y excipientes ya conocidos para obtener una formulación con una estructura que le permita funcionar a unas condiciones determinadas y con unos parámetros determinados, lo cual en materia de medicamentos sería evidente a partir de los conocimientos básicos de cualquier técnico medio y/o a partir de las enseñanzas divulgadas en los documentos del estado de la técnica D1 y D2.

Por todo lo anterior, ruego se analicen los argumentos expuestos con el rigor y detenimiento habituales, y que en consecuencia el Despacho decrete, además de la negación de la solicitud en comento, el archivo del expediente que lo contiene.

Señor Superintendente,



JOSE LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. 79.152.473 de Usaquén

T.P. 44655 del C. S de la J.