

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

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

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución N° 9981 del 28 de febrero de 2012, la Superintendencia de Industria y Comercio negó patente de invención a la creación denominada: "UN PROCESO PARA LA ELABORACIÓN DE COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS DE LIBERACIÓN RÁPIDA DE FÁRMACOS INSOLUBLES EN AGUA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS OBTENIDAS POR DICHO PROCESO", con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 12 de abril de 2012 con el N° 07-007599-00025-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Nicomed Danmark APS, por intermedio de apoderado interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La recurrente argumenta no estar de acuerdo con las afirmaciones del examen según las cuales (a) la persona versada enfrentada a la tarea de elaborar tabletas de tiazincaboxamida sin humectación y por co-molienda, puede darse cuenta que a partir de D1 y D2 las composiciones que contienen una tiazincaboxamida se pueden elaborar mediante un proceso de mezclado como es la molienda conjunta y en condiciones secas; (b) que era obvio para la persona versada recurrir a las enseñanzas del documento D2 y luego utilizar la co-molienda para mezclar unatiazincaboxamida con una sustancia alcalina para preparar tabletas y (c) en ausencia de un efecto inesperado mostrado por las composiciones y por el procedimiento, en comparación con los del estado de la técnica, la solución al problema técnico parece ser obvia a la luz de los documentos D1y D2.

Considera que el examen hizo una lectura equivocada de la descripción, porque asegura que la descripción señala que la tableta se elaboró sin líquidos, que tenía un contenido de agua similar a la tableta producida por granulación húmeda y tenía estabilidad mejorada, y concluye que el proceso de la solicitud sí puede incluir líquidos.

Señala a continuación que el contenido de agua al que se refiere, es al contenido final de agua de la tableta y que la tableta de la solicitud tiene una vida en estante equivalente a la de la tableta obtenida agregando agua durante el proceso. Agrega que la estabilidad de las tabletas obtenidas por molienda conjunta, era mejor que

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

la de las tabletas producidas convencionalmente, aunque ambas contenían agua al mismo nivel (Pág. 47, líneas 10 a 17 de la descripción).

Menciona la recurrente que el documento D1 no describe la importancia de la relación molar tiazincarcboxamida/agente alcalino de 1:100 a 1:1 en la co-molienda (es decir una mayor cantidad de agente alcalino que de compuesto activo). Afirma que el documento D1 no revela que la co-molienda deba aplicarse sólo a la tiazincarcboxamida y el agente alcalino. Asevera que, contrario a lo afirmado por la Entidad, la relación molar de tiazincarcboxamida/agente alcalino si es una característica técnica esencial que logra una mayor disolución.

La recurrente sostiene que *"el efecto técnico inesperado conferido por la co-molienda bajo condiciones secas de una proporción específica de la sustancia alcalina con respecto al compuesto detiazincarcboxamida, es la generación de un incremento local en el pH debido al estrecho contacto físico entre el compuesto de tiazincarcboxamida y el agente alcalino, lo que resulta en una disolución mejorada del fármaco administrado por vía oral bajo las condiciones ácidas reinantes en el estómago y en una vida útil mejorada para el producto en comparación con composiciones de la técnica anterior"*.

Señala que *"El problema técnico objetivo que subyace a la presente invención es proporcionar una composición para administración oral con un fármaco que tiene baja solubilidad en condiciones ácidas (por ejemplo, un compuesto de tiazincarcboxamida), de modo que dicha composición exhiba buenas propiedades de disolución bajo condiciones ácidas, así como una vida útil en estante mejorada"*.

Frente a las enseñanzas del documento D2, menciona que no enseña una relación molar relativamente elevada entre la sustancia alcalina y la tiazincarcboxamida y que las enseñanzas del documento D2 que se indican por ejemplo, en el Ejemplo IV/12 citado por el Despacho, se utiliza una relación molar muy baja de más de 20:1, la que está muy lejos de las altas cantidades de sustancia alcalina que son requeridas por la presente invención.

Sostiene que en el documento D2 no hay ninguna indicación clara en absoluto en relación con la presencia de la sustancia alcalina en la etapa de co-molienda. Agrega que en el "Ejemplo V/2, que se refiere a una "tableta de liberación inmediata..." el meloxicam no es co-molido con alguna de las sustancias alcalinas que se indican en la reivindicación 1 del documento D2, por el contrario el meloxicam es co- molido con un oligosacárido o polisacárido y si alguna sustancia alcalina se agrega posteriormente, ésta se agrega después de la etapa de co-molienda.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

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

En cuanto a los argumentos referidos a la co-molienda, es pertinente aclarar que los documentos D1 y D2 indican a la persona del oficio normalmente versada en la materia, enfrentada con la tarea de elaborar tabletas de una tiazincarboxamida sin la etapa de humectación y por co-molienda, la manera de obtener las tabletas, mediante el conocido proceso de mezclado en seco, tal como lo es la molienda conjunta. Lo anterior, dado que el documento D1 enseña en la col. 3, líneas 50 y siguientes y col. 4, líneas 60 y siguientes, que es necesario que haya una mezcla completa del activo con el compuesto alcalino de manera que cada pequeñísima partícula de compuesto activo esté rodeada de otras del compuesto alcalino.

De otro lado, el documento D2 enseña en la Pág. 20, Ej. IV/12 la co-molienda intensiva, en un molino de bolas, con alta energía, de meloxicam sólido y carbonato. Por tanto es cierto que "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 utilizar un paso de co-molienda para mezclar un compuesto de tiazincarboxamida con una sustancia alcalina para preparar composiciones farmacéuticas orales tipo tableta descritas en el documento D1".

Ahora bien, no hay efecto inesperado en esta solicitud porque si bien los Ejs. 2 a 7 son procesos de co-molienda, la mezcla del Ej. 8 (en el cual no se siguió la indicación del documento D1, en donde es necesario que haya una mezcla completa del activo con el compuesto alcalino) se hizo de forma manual y no se hizo co-molienda intensiva, ni en molino de bolas, ni con alta energía, por lo cual no se garantizó que cada pequeñísima partícula de compuesto activo estuviese rodeada de otras del compuesto alcalino, por lo tanto el porcentaje de disolución fue más bajo que en los Ej. 2 a 7 en los que la mezcla sí se hizo bien.

Un hecho similar sucedió en el Ej. 9, porque en éste no se hizo tampoco previamente la mezcla completa del activo con el compuesto alcalino, sino que se mezcló el activo con todos los excipientes, lo cual, como se entiende, no aseguró que cada pequeñísima partícula de compuesto activo estuviese rodeada de otras del compuesto alcalino y por lo tanto el porcentaje de disolución fue más bajo que en los Ejs. 2 a 7 en los que la mezcla sí se hizo bien.

En relación con el ejemplo Ej. 10, los resultados (porcentaje de activo degradado) eran de esperarse por parte de la persona versada en la materia técnica, dado que las tabletas obtenidas por proceso de granulación en húmedo tienen menos estabilidad que las que se obtienen por compresión directa, esta es la razón por la cual el formulador tratará de optimizar el proceso, como parte de su labor de rutina, ensayando la compresión directa. Por tanto, es cierta la afirmación del examinador según la cual dado que la solicitud estudiada no presenta que el

Página 3 de 6

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

procedimiento reivindicado haya logrado algún efecto técnico que sea inesperado para la persona versada, la solución al problema técnico se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Frente a los argumentos referidos a lectura equivocada de la descripción, este Despacho considera que aunque la tableta se elabore sin emplear líquidos, se entiende que cada componente tiene un grado de humedad aceptable farmacéuticamente, por lo tanto la tableta también lo tendrá, sin embargo, como se explicó anteriormente, la estabilidad observada se debe a un efecto esperado por la persona versada en la materia técnica correspondiente.

Lo anterior justamente porque el documento D1 no describe exactamente la proporción 1:100 y 1:1 para la co-molienda del compuesto de tiazincaboxamida y el agente alcalino, por tal razón no anula la novedad de esta solicitud, pero sí el nivel inventivo como se ha indicado.

Es cierto que el concepto de molienda conjunta se refiere a un mezclado mecánico muy intensivo de dos o más sustancias, que pone dichas dos o más sustancias en contacto físico íntimo entre sí, más cerca que empleando un procedimiento de mezclado convencional, tal como un procedimiento de mezclado en tambor giratorio, la falta de esa mezcla completa (que se indicaba en los documentos D1 y D2), es la causa de que las composiciones no tuviesen el comportamiento esperado. Se aclara que la relación molar de tiazincaboxamida a la sustancia alcalina, tal como se define en la reivindicación 1, aunque sea una "característica esencial" de la invención, no parece ser la causa de un perfil de disolución mejorada, y por tanto no parece ser la causa de un efecto técnico que sea sorprendente para la persona versada. Contrario a esto, lo que logra el proceso tal como se reivindica, es una mezcla como se lograba en los procesos que se habían dado a conocer en los documentos D1 y D2. De lo cual se infiere que el proceso reivindicado no tiene nivel inventivo.

En cuanto a los argumentos relacionados con el efecto técnico inesperado atribuido a las diferencias técnicas, se reitera que el efecto técnico observado por la co-molienda de un compuesto activo con un agente alcalino, en proporción específica y bajo condiciones secas, ya había sido indicado en los documentos D1 y D2. Este efecto se debe al estrecho contacto físico entre el compuesto activo y el agente alcalino; por tanto, la persona versada, con el fin de lograr que la mezcla del activo con el agente alcalino sea completa, haría la co-molienda intensiva, en molino de bolas y con alta energía, como enseña el documento D1. Además, dado que el estado de la técnica da a conocer a la persona versada que una alta proporción de agente alcalino aumenta el pH, es claro que el proceso reivindicado no tiene nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

La recurrente sostiene que *"El problema técnico objetivo que subyace a la presente invención es proporcionar una composición para administración oral con un fármaco que tiene baja solubilidad en condiciones ácidas, de modo que dicha composición exhiba buenas propiedades de disolución bajo condiciones ácidas, así como una vida útil en estante mejorada"*, respecto de lo cual se aclara que el problema técnico objetivo que era la necesidad de proporcionar una composición para administración oral de un fármaco que tiene baja solubilidad en condiciones ácidas (por ejemplo, un compuesto de tiazincarboxamida) que presente buena disolución en medio ácido y una vida útil en estante mejorada, se solucionó de una forma obvia, es decir, de la misma manera como se había solucionado en los documentos D1 (que enseña, en la Col. 3, línea 51, una composición que contiene un agente alcalino) y D2 (que enseña una composición que contiene un agente alcalino, en las reivindicaciones 1 y 6, composición que mejora la solubilidad en las condiciones ácidas del estómago en 5 veces). Por lo cual el proceso reivindicado no tiene nivel inventivo.

En relación con las enseñanzas del documento D2, igualmente este Despacho considera oportuno aclarar que justamente porque el documento D2 no describe exactamente la proporción 1:100 y 1:1 del compuesto de tiazincarboxamida y el agente alcalino en la co-molienda, por tal razón no anula la novedad de esta solicitud, pero sí el nivel inventivo, dado que este documento enseña que la adición de agentes alcalinos mejora la solubilidad y la biodisponibilidad (documento D2, Pág. 20, segundo Párr.).

Por lo tanto, considerando además que la proporción reivindicada no logró algún otro efecto técnico que sea inesperado para la persona versada en la materia, es claro que el proceso de esta solicitud, que también incluye la co-molienda del compuesto de tiazincarboxamida y el agente alcalino, no tiene nivel inventivo.

Lo anterior en razón a que con la co-molienda y con las diversas proporciones que se incluyeron en el proceso del documento D2, ya se había logrado mejorar la solubilidad. Se observa que el documento D2 enseña que con menor cantidad de agente alcalino se alcanza el mismo efecto técnico presentado por el proceso de esta solicitud, el cual es la mayor disolución del activo. Por tanto, el efecto presentado en esta solicitud no supera el efecto que ya se presentaba en el estado de la técnica, representado por el documento D2, el cual además de presentar muy buena solubilidad en medio ácido (gástrico), requería la adición de menor cantidad de agente alcalino.

El recurrente sostiene que en el documento D2 no hay ninguna indicación clara en absoluto en relación con la presencia de la sustancia alcalina en la etapa de co-molienda, afirmación que no es cierta, dado que el documento D2 enseña, en la Pág. 20, ejemplo IV/12, la comolienda intensiva de meloxicam sólido y carbonato,

Página 5 de 6

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 23946

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/07-7599

en un molino de bolas, con alta energía. Por tal razón, el documento D2 anula el nivel inventivo del proceso reivindicado en esta solicitud.

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

RESUELVE:

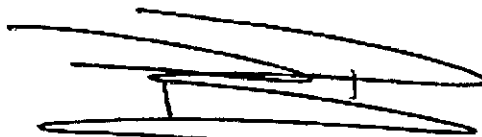
ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución N° 9981 del 28 de febrero de 2012, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Nicomed Danmark APS, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los 29 Abr 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor
MAURICIO PATIÑO BONNET
patmarks@prietocarrizosa.com

Elaboró: Carlos Daniel Lemus Giraldo ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓