

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

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 ante esta Superintendencia el 29 de enero de 2007 con el N°07-008212-00000-0000, por la sociedad Zambon Group S.P.A., a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE CONTIENE GABAPENTINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2005/053473 del 19 de julio de 2005.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma, con fundamento en el artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, en concordancia con el Tratado de Cooperación en materia de patentes (PCT), el reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenó publicar el extracto presentándose oposiciones por parte de la doctora Eliana Isaura Moreno, en calidad de apoderada de la sociedad Procaps S.A y el doctor José Luis Reyes Villamizar, en su calidad de apoderado de la sociedad Tecnoquímicas S.A. (Fls.93 a 175 y Fls.176 a 235), respectivamente.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a la solicitante mediante Oficio N° 13188, notificado el 26 de agosto de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de nivel inventivo, conforme lo establecen el artículo 18 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N°07-008212-00014-0000 del 04 de noviembre de 2011, respondió oportunamente el requerimiento formulado, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo.

QUINTO: 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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

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 14 contenidas en los folios 326 a 328, no cumplen con los requisitos de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Oposiciones presentadas.

Como se anunció en el segundo considerando, se presentó un escrito de oposición por parte de la doctora Eliana Isaura Moreno, en calidad de apoderada de la sociedad Procaps S.A y el doctor José Luis Reyes Villamizar, en su calidad de apoderado de la sociedad Tecnoquímicas S.A.

La opositora menciona que el documento *W02004014356*, se relaciona con composiciones farmacéuticas que comprenden gabapentina de estabilidad mejorada en adición con un compuesto básico tal como un hidróxido; el documento *US2004010035* se refiere a composiciones de gabapentina con tricalcio fosfato en forma de polvo de relleno de cápsulas y la anterioridad *US2004092522* trata de formulaciones de gabapentina sólidas, con excipientes tales como calcio carbonato y calcio fosfato dibásico y lubricantes como el gliceril behenato. Por lo tanto, en vista de las indicaciones reveladas en las anterioridades citadas, cualquier persona versada en la materia puede llegar de manera evidente y obvia a la materia aquí propuesta. Por lo tanto la presente solicitud carece de altura inventiva.

Con respecto a la oposición presentada por la sociedad Procaps S.A., la solicitante menciona que no existe indicación alguna en el documento *W02004014356* que lleve al uso de una sal de calcio de un ácido débil (agente deslizante) y en particular, a una sal de calcio, en combinación con un lubricante específico seleccionado de aceite de ricino hidrogenado y behenato de glicerilo para estabilizar composiciones de gabapentina. Además, la información del documento *W02004014356* no le enseñaba al técnico con habilidad en la materia a seleccionar una sal de calcio específica con propiedades deslizantes ya que, como regla, no tiene ningún sentido agregar un agente deslizante en un proceso de granulación. También afirma que el documento *US2004010035* y la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

anterioridad *US2004092522* no tienen nada que ver con el problema de estabilidad y se refieren a análogos GABA genéricos en combinación con uno o más ingredientes en el tratamiento de desórdenes gastrointestinales o el dolor, respectivamente. D2, en el ejemplo 1, divulga una composición de cápsula que consiste de gabapentina, trimebutina, lactosa y fosfato de calcio tribásico como un portador inerte oral genérico no tóxico farmacéuticamente aceptable. En la anterioridad *US2004092522* el carbonato de calcio y el fosfato de calcio dibásico por un lado y el behenato de glicerilo por el otro, son indicados como excipientes/lubricante genéricos en una larga lista de posibles alternativas; y que por lo anteriormente explicado respecto de la irrelevancia de las anterioridades *US2004010035* y *US2004092522*, estas no deben ser tenidas en cuenta porque su objeto no es el mismo de la presente solicitud y se relacionan con ella únicamente por mencionar compuestos químicos semejantes.

Por su parte el opositor Tecnoquímicas S.A., afirma que en la publicación internacional WO 2004/014356 se puede apreciar, que la inclusión de sales de ácidos débiles en formulaciones que contienen gabapentina, previene de manera significativa la formación del derivado lactámico -impureza- de gabapentina, en formulaciones sólidas para administración oral tipo tableta. Así mismo en la publicación internacional WO 02/26263 se revela que la presencia de cierta cantidad de aniones en el contexto donde se encuentra la pregabalina, favorece la estabilidad de la misma y previene la formación del derivado lactámico, por tanto el problema técnico ya se había resuelto. Posteriormente el opositor ratifica los argumentos ya citados, respecto a las anterioridades WO 2004/014356 y WO 02/26263.

Frente a la oposición presentada por la sociedad Tecnoquímicas S.A., la solicitante menciona que el documento *W02004014356* hace una referencia general a composiciones de gabapentina sólida con estabilidad mejorada y un "compuesto básico" que puede ser la sal de un ácido débil, además afirma que las composiciones preferidas del documento *W02004014356* son tabletas obtenidas por la compresión de un granulado, donde el "compuesto básico", que es supuesto estabilizante, se agrega a la solución aglutinante, como un ingrediente empleado en el proceso de granulación en húmedo. Por el contrario, la composición preferida del solicitante comprende cápsulas en donde el uso de las sales de calcio se relaciona tanto con la estabilidad de la gabapentina como con sus propiedades deslizantes. Además, el documento *US2004010035* esta relacionado con la estabilidad de formulaciones de aminoácidos, por lo que su carácter es muy

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

amplio y un técnico con habilidad ordinaria en la materia no encontraría en dicho documento ninguna enseñanza o sugerencia que lo lleve a seleccionar de manera particular una sal que no es enseñada ni sugerida por la anterioridad W02004014356 y que se conoce en el campo de las formulaciones farmacéuticas por tener propiedades completamente diferentes. Asimismo, la anterioridad US2004092522, se limita a citar las composiciones sólidas de gabapentina, sin hacer referencia alguna a procesos de estabilización de las mismas.

En consideración a los documentos y argumentos presentados tanto por las sociedades opositoras como por la solicitante, esta Superintendencia declara infundada las oposiciones porque los documentos citados por las partes citadas antes, no son relevantes para anular el Nivel inventivo del capítulo reivindicatorio estudiado y, por lo tanto, selecciona otros documentos para realizar el presente análisis de patentabilidad.

6.2. Objeto de la invención.

El objeto de la invención consiste en la necesidad de identificar condiciones que sean capaces de controlar la integridad estructural de la Gabapentina sin incrementar su susceptibilidad a la degradación a la correspondiente forma láctamica. Para solucionar este problema, la solicitud estudiada proporciona una composición que comprende Gabapentina, un agente de deslizamiento (sal de calcio de un ácido débil, un agente de lubricación seleccionado de aceite de castor hidrogenado y de behenato de glicerilo, un agente de dilución (reivindicación 1).

6.3. Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 20 de julio de 2004, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos anteriores a la fecha de reivindicación de prioridad relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2002037926	Sodium CHannel Blocker Compositions and the use thereof	28-03-02

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

D2	US6294198	Pharmaceutical tablet formulation containing Gabapentin with improved physical and chemical Characteristics and methods making the same	25-09-01
----	-----------	---	----------

D1¹, divulga composiciones estables en forma de capsulas de gabapentina con 75% del activo y excipientes farmacéuticamente aceptables.

D2², divulga composiciones estables, con menos de 0.2% de lactama, en forma de tabletas gabapentina con 89% del activo y excipientes farmacéuticamente aceptables.

6.5. 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".

La reivindicación 1 consiste en: Una composición farmacéutica que comprende gabapentina como ingrediente activo, caracterizada en que esta también comprende una mezcla de excipientes capaces de no promover la conversión de gabapentina en la impureza láctamica correspondiente, que comprende: (i) Un agente de deslizamiento seleccionado a partir de sal de calcio de un ácido débil. (ii) Un agente de lubricación seleccionado de aceite de Castor hidrogenado y de behenato de glicerilo; y opcionalmente (iii) Un agente de dilución, solo o mezclado con uno o más de otros agentes de dilución, seleccionados a partir de azúcar monosacárido tal como sorbitol, xilitol, manitol, fructosa, dextrosa, y eritritol, y derivados de polisacáridos como sacarosa, manitol, isomalt, maltitol, un galactomanan, ácido alginico o una de sus sales, una pectina, un carragenano y maltodextrina.

1, <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

CC=US&NR=2002037926A1&KC=A1&FT=D&ND=3date=20020328&DB=EPODOC&locale=en_gb.

2, <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

CC=US&NR=20010925&DB=EPODOC&locale=en_gb.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

Ahora bien, en el siguiente cuadro comparativo se muestran las características técnicas esenciales de la invención definida en la reivindicación 1 y aquellas reveladas en el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Composición	Capsulas	tabletas
Gabapentina	Gabapentina 75%	Gabapentina 88%
Sal de calcio de ácido débil	Sal de calcio de un ácido débil ej: fosfato tricalcico	no menciona
Aceite de castor o behenato de glicerilo (lubricantes)	No menciona estos (pero sí otros lubricantes)	No específicamente (pero sí aceites vegetales hidrogenado, como lubricantes)
Opcionalmente: un agente de dilución solo o mezclado con uno o más de otros agentes de dilución, seleccionados a partir de azúcar monosacárido tal como sorbitol,xilitol, manitol, fructosa, dextrosa, y eritritol, y derivados de polisacáridos como sacarosa, manitol, isomalt, maltitol, un galactomanan, ácido algínico o una de sus sales, una pectina, un carragenano y maltodextrina.	Sorbitol, manitol Sucrosa Derivados de polisacárido: alginato de sodio	No menciona específicamente, pero sí azúcares monosacáridos

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan una forma de dosis farmacéutica de Gabapentina.

El documento D1 da a conocer una composición estable en forma de capsulas que comprende: 75% de Gabapentina (párrafo 186) y excipientes farmacéuticamente aceptables (párrafo 21) como: fosfato tricalcico, sucrosa, manitol, sorbitol, alginato de sodio, goma tragacanto; (párrafo 192) y aceites (párrafo 193).

La composición, objeto de esta solicitud se diferencia de las composiciones de D1, en que menciona específicamente, como agentes de lubricación, el aceite de

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

castor hidrogenado o el behenato de glicerilo. Aunque exista esta diferencia, no se evidencia un efecto logrado por el hecho de incluir el aceite de castor hidrogenado o el behenato de glicerilo en la composición reivindicada.

Por tanto, el problema técnico objetivo es: "cómo modificar la composición de D1, para obtener composiciones, estables, alternativas a las ya conocidas".

Adicionalmente D2 ya divulgaba una composición en forma de tabletas que contiene 88% de gabapentina (columna 5, línea 2) y excipientes como aceites vegetales hidrogenados, utilizados como lubricantes (columna 6, líneas, 14-15); la cual mostró una estabilidad almacenada en recipientes, a una temperatura de 45°C y 75% de humedad relativa, por tres meses, con una impureza láctamica de menos del 0.2% (columna 4), al igual que la presentada por la composición reclamada tal como se menciona en la presente solicitud (pág. 7, descripción).

De acuerdo a lo anterior, es importante mencionar que el aceite de castor³ y el behenato de glicerilo⁴, son lubricantes bien conocidos en el estado de la técnica, en la fabricación de capsulas y tabletas, con poca solubilidad en agua y muy baja humedad, lo cual garantiza la estabilidad de una formulación sólida como la reivindicada.

En consecuencia, la persona medianamente versada en la materia que tenga que resolver el problema de: "cómo modificar las composiciones de D1, para obtener composiciones, estables, alternativas a las ya conocidas", lo lograría incluyendo un aceite vegetal (castor hidrogenado o el behenato de glicerilo, ya conocidos en el estado de la técnica) de acuerdo con lo divulgado en D1 y D2, con la expectativa de que la composición reivindicada, forme una impureza láctamica de menos del 0.2%, al igual que las conocidas (D2).

Por lo cual la composición, de la reivindicación 1 carece de nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 14 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

3 Handbook of Pharmaceutical excipients. (1) págs. 95 y 412 y (2), pág. 229(2000)

4 Handbook of Pharmaceutical excipients. (1) págs. 95 y 412 y (2), pág. 229(2000)
Página 7 de 9

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

En relación a los comentarios de la solicitante en cuanto a que los documentos D1 y D2, no anulan el nivel inventivo de la composición reivindicada, esta oficina señala que tal y como se pudo apreciar en el análisis de nivel inventivo, estos documentos se refieren a composiciones estables de Gabapentina, en donde particularmente D2 ya mencionaba que sus composiciones con un contenido de gabapentina del 88% y excipientes como aceites vegetales hidrogenados, utilizados como lubricantes, tienen una vida útil de dos años como consecuencia de un estudio de estabilidad acelerado (a una temperatura de 45°C y 75% de humedad relativa, por tres meses). Asimismo, fue calculado el contenido de la impureza láctamica y se obtuvo un valor de menos del 0.2% (columna 4), igual que el presentado por la composición reclamada tal como se menciona en la presente solicitud (pág. 7, descripción).

Por lo tanto se observa que el problema planteado por el solicitante, es decir, de la necesidad de identificar condiciones que sean capaces de controlar la integridad estructural de la Gabapentina sin incrementar su susceptibilidad a la degradación a la correspondiente forma láctamica ya se había resuelto.

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 infundada las oposiciones presentadas por las apoderadas de las sociedades Procaps S.A. y Tecnoquímicas 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 "UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE CONTIENE GABAPENTINA".

ARTÍCULO TERCERO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Dilia Rodríguez D'Aleman, en su calidad de apoderada de Zambon Group S.P.A., a la doctora Eliana Isaura Moreno Bohórquez, en su calidad de apoderada de la sociedad opositora Procaps S.A. y al doctor José Luis Reyes Villamizar, en su calidad de apoderado de la sociedad opositora Tecnoquímicas S.A. o a quienes hagan sus veces, entregándoles copia de la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19117

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-008212

misma y 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 29 Mar 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



JOSE MIGUEL DE LA CALLE RESTREPO

Doctora

DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

Cr 11 N° 86-53 piso 6

Bogotá D.C.

Doctora

ELIANA ISAURA MORENO BOHÓRQUEZ

Carrera 13 N° 119-95, Of. 104.

Bogotá D.C.

Doctor:

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

Cr 17 N° 88.23 of 205

Bogotá D.C.

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓

Revisó: Andres Casas Santofimio ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓