

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-94376- -1	FECHA: 2013-05-06 14:39:08
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

Asunto: Radicación: 13-94376- -1
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 8355
 Folios: 5

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/JP2009/054983				
Fecha de Presentación Internacional	10/03/2009				

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Radicado No. 13-094376-00000-0000 que equivale a la divisional radicada con el número 10-125889-00014-0000	11/04/2013
Reivindicaciones:	Radicado No. 13-094376-00000-0000	11/04/2013
Oposiciones:	Radicado No. 10-125889-00004-0000	Procaps 16/12/2011
	Radicado No. 10-125889-00005-0000	Tecnoquímicas 19/12/2011
	Radicado No. 10-125889-00008-0000	Sustentación 08/03/2012
Respuesta del solicitante:	Radicado No. 10-125889-00009-0000	23/05/2012
Prioridad:	JP 2008-061673 JP 2008-334920	11/03/2008 26/12/2008

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. Para el caso de la presente solicitud se estudiarán las reivindicaciones 1 a 39 (Radicado No. 13-094376-00000-0000) debido al pago de la tasa correspondiente a las reivindicaciones adicionales.

Título de la solicitud: "PREPARACION SOLIDA DE DESINTEGRACION ORAL QUE CONTIENE GRANULOS FINOS QUE MUESTRAN UNA LIBERACION CONTROLADA DE UN PRINCIPIO ACTIVO PARA USO FARMACEUTICO".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar una preparación sólida oral que contiene gránulos finos y que provea una liberación controlada de un agente activo.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una preparación sólida de desintegración oral caracterizada porque comprende los gránulos finos que muestran una liberación controlada de un principio activo que tiene una capa de recubrimiento que comprende un polímero que produce una película de recubrimiento.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K9/20; A61K9/50.

4. De la solicitud de patente

Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque se refiere al uso de las composiciones, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las expresiones "gránulos finos que muestran una liberación controlada", "produce una película de recubrimiento que tiene una elongación en la ruptura de alrededor de 100% - alrededor de 700%", "es capaz de lograr un pH promedio en el estómago de no menos de 4 a 0.5 hr después de la administración oral y mantener dicho pH o pH superior durante 14 hora o más",

"alcanza la concentración del fármaco máxima en sangre en alrededor de 5hr y mantiene la concentración del fármaco máxima en sangre de no menos de 100 ng/ml durante alrededor de 4hr o más, cuando 30 mg del principio activo desde el punto de vista farmacéutico se administra por vía oral", corresponden a resultados a alcanzar con la preparación reclamada por lo cual no son considerados como características técnicas ya que abarcan todas las preparaciones presentes o futuras que logren dichos resultados.

La reivindicación 1 carece de concisión ya que no limita el alcance de la materia reclamada debido a que no se establecen los componentes de la preparación. Una composición debe caracterizarse por su compuesto activo, excipientes, proporciones y cualidades de los excipientes.

Las expresiones “aproximadamente” y “al rededor” son ambiguas y no limitan el alcance de la solicitud.

La reivindicación 39 reclama un método para suprimir ruptura de gránulos, sin embargo el aparte caracterizante no describe las etapas o secuencia de actividades que comprenden dicho método y se refiere a características técnicas de producto, lo cual no está acorde con el tipo de reclamación.

Las reivindicaciones 20 y 21 utilizan la expresión “inestable al ácido”, se sugiere cambiarla por “inestable en ácido”.

Las reivindicaciones 26 y 27 indican que los gránulos se disuelven a un pH no inferior a 5,0 y un pH no superior a 6,0. Sin embargo los polímeros entéricos pH-dependientes que inician su disolución a un pH de 5.5 o más, serán necesariamente solubles a pH de 7,5^[1] y la presente solicitud describe solo polímeros pH dependientes convencionales, por lo tanto no es claro como la solicitud logra que los gránulos se disuelvan a un pH no superior a 6.0 cuando los polímeros requieren un pH superior.

5. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Procaps

La sociedad opositora presenta el documento US 2005053660 publicado el 10 de marzo de 2005 que se refiere a una forma farmacéutica adecuada para la liberación uniforme de múltiples partículas de un ingrediente farmacéutico activo en el intestino delgado y en el intestino grueso, que comprende al menos dos formas de pastillas A y B, que comprenden un ingrediente farmacéutico activo en el núcleo y tienen diferentes polímeros de recubrimiento que determinan la liberación del principio activo en diferentes valores de pH, que se caracteriza en que la forma de granular A está provista de un recubrimiento de polímero interior que permite la liberación continua del principio activo, y tiene un recubrimiento exterior entérico que se disuelve rápidamente por encima de pH 5,5 y el granulado B cuenta con un recubrimiento de polímero, que en el test de liberación de la USP, libera menos del 20% del ingrediente activo a pH 6.8 en 6 horas y libera más del 50% del ingrediente activo a pH 7.2 en 6 horas; la invención se refiere además a un proceso para producir la forma.

Concluye la opositora que la presente solicitud carece de novedad frente a US 2005053660 que divulga preparaciones sólidas de desintegración oral que contienen gránulos finos que muestran una liberación controlada de un principio activo para uso farmacéutico, que comprenden gránulos con un núcleo activo, una capa interna que comprende por ejemplo un copolímero de acrilato o metacrilato, y un recubrimiento entérico exterior; y/o los gránulos que comprenden un núcleo activo que puede ser el mismo principio activo y un recubrimiento entérico. Igualmente, afirma la sociedad opositora que la presente solicitud carece de nivel inventivo frente a la divulgación US 2005053660.

Argumentaciones de Tecnoquímicas S.A.

Argumenta el opositor que la solicitud hace mención a la capacidad de la preparación reivindicada para “lograr un pH promedio en el estómago de no menos de 4 a 0.5 horas después de la administración oral y mantener dicho pH o pH superior durante 14 horas o más” corresponde a un método terapéutico por lo cual no es patentable. Por otra parte, en relación con la mención de rangos de tamaño de partículas, afirma la opositora que dicha caracterización por consistir en la simple aplicación de estrategias

¹Journal of Controlled Release, 58:215–222 (1999), p. 221. (numeral 5. Discusión)

tecnológicas obvias para una persona medianamente versada en procesos de formulación farmacéutica, y hacer parte de las valoraciones fisicoquímicas de rutina requeridas para determinar las características de seguridad, eficiencia, eficacia y estabilidad requeridas en todo medicamento terminado, no resultan aceptables para fundamentar el Nivel inventivo de las formulaciones reivindicadas. Indica el opositor que es una actividad cotidiana de todo formulador evaluar todas las ventajas y desventajas de modificar el tamaño de partícula de la materia prima de la cual se parta (incluidos los excipientes) a fin de establecer si es necesario el tratamiento de reducción, siendo una estrategia altamente reconocida y aplicada en la industria farmacéutica para obtener características deseadas e indispensables de una formulación.

El opositor presenta los documentos WO 2007/078271 publicado el 12 de julio de 2007 y US 2005/053660 publicado el 10 de marzo de 2005 y afirma que en estas dos anterioridades se evidencian características como el principio activo lansoprazol, la desintegración oral de comprimidos que comprenden a su vez gránulos recubiertos, cuyos gránulos sustentan una liberación controlada debido específicamente a un recubrimiento entérico, la distribución del tamaño de partícula de dichos gránulos, la inclusión de un agente alcalino estabilizante en la formulación, una diferenciación entre dos poblaciones de gránulos, y en donde finalmente dichos gránulos recubiertos obtenidos pueden comprimirse.

En la ratificación de la oposición la sociedad opositora reitera los argumentos anteriormente presentados y presenta los mismos documentos WO 2007/078271 publicado el 12 de julio de 2007 y US 2005/053660 publicado el 10 de marzo de 2005 junto con "Copression of enteric-coated pellets todisintegratingtablets", indicando que estos afectan la patentabilidad de la presente reclamación.

Respuestas del Solicitante

En respuesta a las oposiciones, la sociedad solicitante presenta un nuevo capítulo reivindicatorio, e indica que el argumento del apoderado de la sociedad opositora Tecnoquímicas S.A., no resulta válido porque la reiv. 37 ha sido eliminada. Por otra parte, la solicitud puede producir una acción particular y efecto al fijar el promedio del tamaño de partícula de los gránulos finos a no más de 500 μm . Sin embargo, el promedio del tamaño de partícula del gránulo fino es un medio para resolver el problema de la presente invención y es la característica inventiva.

La presente preparación logra la liberación del ingrediente activo en la presencia de ácido logrando un perfil de elución deseado. En razón a que la preparación de sólidos de desintegración por vía oral de la presente invención muestra ruptura suprimida de gránulos finos se puede controlar la liberación de los ingredientes farmacéuticamente activos según se desea durante bastante tiempo.

Indica el solicitante que US 2005/053660 no indica que el diámetro del núcleo sea menor a 800 μm , y la preparación muestra un comportamiento de disolución de liberación lenta del fármaco. Este documento describe una forma de fármaco que comprende dos clases de forma de glóbulos, este no describe ni sugiere la constitución ni una preparación que muestre un comportamiento de disolución de un ingrediente farmacéuticamente activo. Tampoco se sugiere el control superior de un ingrediente activo en la sangre durante largo tiempo como se muestra en la preparación de la presente solicitud.

Con respecto a WO 2007/078271, el solicitante indica que la anterioridad no describe ni sugiere un comportamiento de disolución de un ingrediente farmacéuticamente activo que se define en las reivindicaciones 1, 22 y 37.

En relación con US2005/287211 la sociedad solicitante argumenta que no se describe un polímero como el de la presente solicitud y no sugiere un comportamiento de disolución de un ingrediente farmacéuticamente activo y un tamaño de partícula promedio de gránulos finos que se define en la reclamación.

Respuesta del Examinador Técnico

Los documentos presentados en las oposiciones desvirtúan el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; por lo cual podrían ser considerados dentro del examen de patentabilidad.

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 11 de marzo de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	Chemical & pharmaceutical bulletin 51(10) 1121-1127(2003)	"Formulation Study for Lansoprazole Fast-disintegrating Tablet. III. Design of Rapidly Disintegrating Tablets"	2003
D2	US 2005/053660	"Multi-particulate form of medicament, comprising at least two differently coated forms of pellet"	10/03/2005

D1^[2] divulga tabletas de desintegración rápida de lansoprazol que consisten en microgránulos con recubrimiento entérico donde el tamaño promedio de partículas es de aproximadamente 300 µm (resumen). Los gránulos tienen un recubrimiento que comprende un polímero con un elongación de ruptura de 100% a 700% (tabla 2).

D2^[3] enseña una preparación sólida que comprende gránulos finos que provee una liberación controlada del agente activo.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en una preparación sólida de desintegración oral caracterizada porque comprende los gránulos finos que muestran una liberación controlada de un principio activo para uso farmacéutico, que tiene una capa de recubrimiento que comprende un polímero que produce una película de recubrimiento.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Preparación de desintegración oral caracterizada por:	Preparación sólida para desintegración oral que comprende:	Preparación sólida que comprende:
Comprende los gránulos finos con un principio activo para uso farmacéutico.	Gránulos finos que proveen un agente activo (ejemplos 1 a 4)	Gránulos finos que proveen una liberación controlada de un agente farmacéuticamente activo (ejemplos 1 a 4)
La sustancia polimérica comprende una mezcla de una o más clase seleccionadas	Los gránulos finos tienen una película de recubrimiento	Los gránulos poseen una película de recubrimiento que

2[] URL: <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/14519914>
 3[] URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=2&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050310&CC=US&NR=2005053660A1&KC=A1

del grupo que consiste en hipromelosa ftalato, acetato de celulosa ftalato, copolímero de metacrílico-metilacrilato, metil -metacrilato.	compuesta de un copolímero de etil acrilato-metil metacrilato (Tabla 2 y Tabla 4)	comprende un polímero entérico como eudragit RL30D, eudragit L30D-55 y eudragit FS30D. (Párrafos [0026] a [0033], ejemplos 1-4)
--	---	---

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga preparación sólida para desintegración oral que comprende gránulos finos que proveen liberación controlada de un agente farmacéuticamente activo (ejemplos 1 a 4). Los gránulos finos tienen una película de recubrimiento que comprende un polímero que produce una película de recubrimiento (Tablas 2 y 4). La composición también comprende un agente plastificante (trietil citrato) y el polímero es un polímero entérico de metil metacrilato-ácido metacrílico (Tabla 2).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la preparación de D1 consiste en que la materia reclamada en la presente solicitud es que la anterioridad no divulga que el recubrimiento posea una elongación de ruptura entre 100% y 700%. Sin embargo se reitera que la elongación de ruptura es un resultado a alcanzar y no una característica técnica de una preparación.

El documento D2 enseña una preparación sólida que comprende gránulos finos que proveen liberación controlada de un agente farmacéuticamente activo (ejemplos 1 a 4). Los gránulos poseen una película polimérica de recubrimiento entérico compuesta por copolímeros de metacrilato (Párrafos [0026] a [0033], ejemplos 1-4).

El efecto que logra el incluir los rangos de elongación de ruptura entre 100% y 700% no se puede determinar, toda vez que la composición del recubrimiento entérico de los gránulos divulgados en D1 es igual a la composición de la presente solicitud, por lo cual es de esperar que las películas poliméricas de D1 posean el mismo patrón de elongación de ruptura ya que están compuestas de un copolímero de etil acrilato-metil metacrilato.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo seleccionar las características técnicas de las composiciones de D1 para conseguir un sistema de liberación controlada de un agente activo.

Sin embargo, la utilización de una película de recubrimiento compuesta por polímero de ácido metacrílico-metilmetacrilato para proveer un sistema de liberación controlado de un agente activo también está divulgada en el documento D2 que enseña composiciones específicas que contienen eudragit RL30D, eudragit L30D-55 y eudragit FS30D (ejemplos 1 a 4).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, determinaría los valores de elongación de ruptura de las composiciones previamente divulgadas en D1 y D2 los cual se considera un resultado a alcanzar y no una característica técnica. Por lo cual la presente solicitud se considera obvia y carece de nivel inventivo.

8. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Chemical & pharmaceutical bulletin 51(10) 1121-1127(2003)	1-39	Nivel inventivo
D2	US 2005/053660	1-39	Nivel inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-05-14

Elaboró: Emilse Cano Urrego

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo