

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

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 30 de agosto de 2007 con el N° 07-089251-00000-0000, por la sociedad Bayer Schering Pharma AG, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "FORMAS FARMACÉUTICAS CON PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS MEJORADAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2006/001393 del 16 de febrero de 2006.

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 sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

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° 04027, notificado el 04 de marzo de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de novedad, conforme lo establece el artículo 16 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 07-089251-00008-0000 del 11 de julio de 2011, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 8 (Fl. 108) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

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 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 8 contenidas en el folio 108, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención.

El objeto de la invención consiste en dar solución a la necesidad de suministrar una composición de vardenafilo que tenga alta biodisponibilidad y que mantenga

Página 1 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

su concentración en plasma. Para solucionar este problema, la solicitud estudiada proporciona una composición que se caracteriza porque la solubilidad de la forma usada de vardenafilo es suficientemente alta en una pequeña cantidad de líquido acuoso y la velocidad de disolución de la formulación que se disgrega en la boca es suficientemente rápida.

6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 01 de marzo de 2005, 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:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	CA2492747	Medicaments containing vardenafil hidochloride trihydrate	22/Enero/2004
D2	US6465010	Means for creating a mass having structural integrity	15/Octubre/2002

El documento D1 enseña una composición de clorhidrato de vardenafilo trihidrato en forma sólida, tal como tabletas que contienen desintegrantes, lubricantes, un vehículo y otros excipientes, para administración oral, sublingual, bucal y nasal entre otras (Pág. 1, párr. 0016, 0019 y 0020; Páginas 3, 4 y 7, ejemplos 2 a 9)

El documento D2 da a conocer una forma de dosificación sólida de rápida disolución o desintegración que libera el ingrediente activo con la exposición a un ambiente acuoso, que se desintegra rápidamente en la boca entre 3 y 60 segundos, preferiblemente entre 10 a 30 segundos; esta composición también puede ser útil para la liberación controlada y sostenida del ingrediente activo. (Col. 4, líneas 10 a 13; Col. 5, líneas 4 a 11; Col. 6, líneas 18 a 21) Entre los agentes de relleno se enseña que el sorbitol y el manitol son de uso común (Col. 12, líneas 32 a 35)

6.3. 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 comprenderá 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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

patente o, en su caso, de la prioridad reconocida”.

En el presente caso, la composición reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que, la reivindicación 1 está referida a: *“Una composición farmacéutica de vardenafilo que se disgrega rápidamente en la boca, caracterizada porque comprende clorhidrato de vardenafilo trihidrato y un alcohol de azúcar, en donde al menos el 80% de la dosis de vardenafilo de la forma de sustancia usada se disuelve a 25°C en 10 mL de disolución fisiológica de cloruro de sodio y la velocidad de liberación de la composición farmacéutica en 900 mL de disolución fisiológica de cloruro de sodio dentro de los primeros 5 minutos en el equipo agitador de palas planas USP a 50 revoluciones por minuto a 37°C es al menos del 70%.”* (Fl. 108).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en D1 y D2 que representan el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Composición	Composición	Composición de rápida disolución o desintegración
de clorhidrato de vardenafilo trihidrato	de clorhidrato de vardenafilo trihidrato	no se menciona
alcohol de azúcar	No se menciona	sorbitol y manitol

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan composiciones sólidas donde en D1 se da a conocer una composición de clorhidrato de vardenafilo trihidrato (Páginas 3, 4 y 7, ejemplos 2 a 9) y el documento D2 da a conocer una forma de dosificación sólida de rápida disolución o desintegración que libera el ingrediente activo con la exposición a un ambiente acuoso (Col. 4, líneas 10 a 13; Col. 5, líneas 4 a 11), en el documento D2 se enseña que el sorbitol y el manitol son usados comúnmente como agentes de relleno en estas composiciones (Col. 12, líneas 32 a 35).

El documento D1 también enseña que la composición de clorhidrato de vardenafilo trihidrato presenta un tiempo de desintegración de 0,5 minutos (Pág. 3, ejemplo 2, párr. 0054) y que libera el 100% del ingrediente activo en 5 minutos (Pág. 3, ejemplo 4, tabla 1).

El documento D2 también enseña que la composición se disuelve rápidamente en la boca entre 3 y 60 segundos, preferiblemente entre 10 a 30 segundos (Col. 6, líneas 18 a 21).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la composición del documento D1 es la presencia de alcoholes de azúcar en la composición.

El efecto que logra el incluir los alcoholes de azúcar es la obtención de una

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

composición de clorhidrato de vardenafilo trihidrato que tenga alta biodisponibilidad y mantenga su concentración en plasma.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar la composición conocida en D1 para obtener una composición de clorhidrato de vardenafilo trihidrato que tenga alta biodisponibilidad y mantenga su concentración en plasma".

Sin embargo, el documento D2 da a conocer que los alcoholes de azúcar como el sorbitol y el manitol son comúnmente usados como agentes de relleno en tabletas de rápida disolución o desintegración que liberan el ingrediente activo con la exposición a un ambiente acuoso (Col. 4, líneas 10 a 13; Col. 5, líneas 4 a 10; Col. 6, líneas 18 a 21; Col. 12, líneas 32 a 35), así como estas composiciones también serían útiles para la liberación controlada y sostenida del ingrediente activo (Col. 5, líneas 7 a 11).

Es de aclarar que aunque la reivindicación 1 incluya el porcentaje de vardenafilo a 25°C en 10 mL de disolución fisiológica de cloruro de sodio y la velocidad de liberación de la composición farmacéutica en 900 mL de disolución fisiológica de cloruro de sodio dentro de los primeros 5 minutos, estos corresponden a resultados a alcanzar y la forma de evaluar los mismos y por lo tanto no corresponden a características técnicas de la invención referida en este caso a una composición.

No obstante, la composición del documento D1 ya divulgaba un tiempo de desintegración de 0,5 minutos (Pág. 3, ejemplo 2, párr. 0054) y liberación del 100% del ingrediente activo en 5 minutos (Pág. 3, ejemplo 4, tabla 1).

Respecto al tamaño de partícula de clorhidrato de vardenafilo trihidrato menor a 20 μm , es conocido que la biodisponibilidad de un ingrediente activo es incrementada cuando este se encuentra en estado finamente subdividido ⁽¹⁾.

De acuerdo con lo expuesto la reivindicación 1 carece de nivel inventivo y puesto que las reivindicaciones independientes 2 a 8 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas; por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 18 de la Decisión 486.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría los alcoholes de azúcar enseñados en D2 en la composición del documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Ahora bien, sobre las objeciones realizadas por la oficina, la solicitante responde que el perfil de disolución y liberación de la invención corresponden a características técnicas y no a características farmacocinéticas o resultados a alcanzar. También afirma que los alcoholes de azúcar no se encuentran revelados en el documento D1 y que el perfil de disolución y liberación difiere del de la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

invención, así como, dice que en el ejemplo 6 de la presente invención se revela un comprimido para tragar.

En cuanto a los perfiles de disolución y liberación, éstos son resultados a alcanzar, no definen a la composición porque la invención no queda definida por el resultado a alcanzar, puesto que la reivindicación incluiría no sólo la solución propuesta por el solicitante, sino todas las alternativas presentes o futuras que lleguen a ese resultado.

Los alcoholes de azúcar presentes en la composición no están revelados en el documento D1, sin embargo, el documento D2 enseña que alcoholes de azúcar como el manitol y el sorbitol son de uso común en composiciones de rápida disolución o desintegración, que liberan el ingrediente activo con exposición a un ambiente acuoso y que además serían útiles para la liberación prolongada y sostenida del ingrediente activo (Col. 4, líneas 10 a 13; Col. 5, líneas 4 a 11; Col. 6, líneas 18 a 21; Col. 12, líneas 32 a 35). Además, éstos son agentes solubles comúnmente usados en la formulación de formas farmacéuticas sólidas como tabletas de compresión directa, tabletas elaboradas por granulación y tabletas moldeadas que se desintegran y disuelven rápidamente y son útiles para administración sublingual, bucal o para deglutir⁽¹⁾.

En los ejemplos divulgados en el capítulo descriptivo se encuentra el uso del producto de marca comercial Pharmaburst, el cual contiene los alcoholes de azúcar de la composición, es de anotar que es conocido por la persona normalmente versada en la materia el uso de este producto comercial para la formulación de tabletas de rápida desintegración que permiten que la tableta se desintegre en la boca sin agua adicional o con una pequeña cantidad de agua, así la tableta se convierte en una suave pasta o suspensión líquida que permite su fácil deglución, también es conocido que Pharmaburst se disuelve entre 30 y 40 segundos y que la cantidad de Pharmaburst a utilizar en la formulación se encuentra entre el 50 y 80%⁽²⁾. Adicionalmente, es parte del conocimiento del campo técnico que estas formulaciones pueden ser utilizadas para mejorar las propiedades de liberación sostenida de los ingredientes activos⁽²⁾.

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: Denegar la patente de invención a la creación titulada "FORMAS FARMACÉUTICAS CON PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS MEJORADAS".

- 1) Lieberman, H Et Al "Pharmaceutical Dosage Forms: Tablets", Volumen 1, Editorial Marcel Decker, 1989, Páginas 5, 152, 208, 209, 334, 552
- 2) Fu, Y. ET AL "Orally Fast Disintegrating Tablets: Developments, Technologies, Taste-Masking and Clinical Studies", Critical Reviews in Therapeutic Drug Carrier Systems, Vol. 21 No 6, 2004, Páginas 433 – 477.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Luz Clemencia de Páez, en su calidad de apoderada de Bayer Schering Pharma AG, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la 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
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
Carrera 4 N° 72 – 35.
Bogotá D.C.

Elaboró: Jeny Paola Villate Becerra ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓

Página 6 de 7

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 759132052

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19445

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/07-089251