

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

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 en esta Superintendencia el 31 de julio de 2007, con el número 07-078103-00000-0000, por la sociedad Troikaa Pharmaceuticals Ltd., a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PREPARACIONES INYECTABLES DE DICLOFENACO Y SUS SALES FARMACÉUTICAMENTE ACEPTABLES", que corresponde a la solicitud internacional PCT/IN2006/000033 del 30 de enero 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° 06130, notificado el 08 de abril de 2011, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de nivel inventivo, conforme lo establece el artículo 18 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 07-078103-00006-0000 del 06 de julio de 2011, respondió oportunamente el requerimiento formulado.

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 dado que se cancelan las reivindicaciones 1 a 16 (Fl. 75), subsisten las reivindicaciones 17 a 46 contenidas en los folios 75 a 85, las cuales no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

6.1. Objeto de la invención.

El objeto de la invención consiste en dar solución a la necesidad de suministrar preparaciones concentradas de sales solubles en agua de diclofenaco y reducir el volumen total de inyección a 1 mL que resulta en la minimización del dolor en el sitio de la inyección. Para solucionar este problema, la solicitud estudiada proporciona formulaciones inyectables de sales solubles en agua de diclofenaco, que originan significativamente menos dolor en el sitio de la inyección y se pueden administrar mediante ruta intradeltóide, además de ruta intraglúteo e intravenosa lenta.

6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 01 de febrero 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:

No.	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US 5,554,650	"Antiphlogistic, analgesic, antipyretic injection preparation"	10/Septiembre/1996
D2	US 5,389,681	"Parenteral Solutions for Diclofenac Salts"	14/Febrero/1995

El documento D1 da a conocer composiciones acuosas de sales de diclofenaco que se encuentran en concentraciones de 2 a 200mg/mL, que contienen alcoholes monohídricos como alcohol bencílico y alcohol etílico, alcoholes polihídricos como el propilenglicol, glicerina, 1,3-butilenglicol y polietilenglicol, en la que otros componentes pueden ser adicionados (Columna 2, renglones 14 a 23, 24 a 26 y 52 a 64, Fl. 99; Columna 3, renglones 48 a 52, Fl. 100).

El documento D2 enseña composiciones de sales de diclofenaco, solubilizadores como propilenglicol y polietilenglicol y otros excipientes como el alcohol bencílico, en la que el solvente es agua (Columna. 2, renglones 56 a 60 y 64 a 68, Fl. 105; Columna 3, renglones 39 a 59, Fl. 106; Columna 5 a 6, ejemplos 1 a 4, Fl. 107). La dosis a ser administrada en una forma farmacéutica individual puede ser 75 mg o 100mg y el volumen total de la composición es de 1 a 5mL (Col. 3, renglones 53 a 59, Fl. 106). El documento D1 también divulga el proceso para preparar esta composición (Col. 4, renglones 1 a 7, Fl. 106; Columna 5 a 6, ejemplos 1 a 4, Fl. 107).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

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 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 17 está referida a: *"Una formulación inyectable de sales solubles en agua de diclofenaco, que comprende 75 mg/mL de diclofenaco sodio o sus cantidades terapéuticamente equivalentes de sales solubles en agua de éstas y un cosolvente/solubilizador único seleccionado del grupo que consiste de alcohol monohídrico, alcohol polihídrico, y éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo, en donde el alcohol monohídrico contiene aproximadamente 4% a 25% de v/v, y el alcohol polihídrico contiene aproximadamente 27 % a 45% v/v, y el éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo contiene aproximadamente 18% a 35% v/v en combinación con agua; o en donde la formulación inyectable comprende 75mg/mL de diclofenaco de sodio o sus cantidades terapéuticamente equivalentes de sales solubles en agua de ésta, un sistema solvente que comprende una combinación de dos o más cosolventes/solubilizadores se seleccionan del grupo que consiste de alcohol monohídrico, alcohol polihídrico, y éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo; en combinación con agua y en donde el alcohol monohídrico contiene hasta aproximadamente 15% v/v, el alcohol polihídrico contiene hasta aproximadamente 25% v/v y el éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo contiene aproximadamente 25% v/v siempre y cuando la cantidad total de cosolvente/solubilizadores no exceda 35% v/v de la composición; y en donde la formulación inyectable tiene una viscosidad que varía desde aproximadamente 1.50 a 4.70 centipoises (CPS) y un pH de aproximadamente 8 -9" (Fl. 75).*

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 17, y las reveladas en D1 y D2 que representa el estado de la técnica:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

Características esenciales de la reivindicación 17	D2	D1
Composición inyectable de sales solubles de diclofenaco que comprende	Composición inyectable de sales de diclofenaco	Composición inyectable de sales de diclofenaco
75 mg/mL diclofenaco de sodio	75 mg/mL diclofenaco de sodio	Diclofenaco de sodio en concentración entre 2 – 200 mg/mL
Un cosolvente/solubilizador único seleccionado de: 4 a 25% v/v alcohol monohídrico 27 a 45% v/v alcohol polihídrico 18 a 35% v/v éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo o una combinación de dos o más cosolventes/solubilizadores seleccionados de hasta 15% v/v alcohol monohídrico hasta 25% v/v alcohol polihídrico hasta 25% v/v éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo, siempre y cuando la cantidad total de cosolvente/solubilizadores no exceda 35% v/v	Alcohol bencílico (Alcohol bencílico) Propilenglicol y Polietilenglicol (Alcoholes polihídricos) Los solubilizadores se encuentran entre 5 y 50% p/v	0,5 a 30% p/p Alcoholes monohídricos y polihídricos Hasta 25 % p/p de alcohol monohídrico

La composición de la reivindicación 19 tampoco tiene nivel inventivo, la cual está referida a: *"Una formulación inyectable de sales solubles en agua de diclofenaco, que comprende 100 mg/mL sodio o sus cantidades terapéuticamente equivalentes de sales solubles en agua de ésta en un sistema solvente que comprende una combinación de dos o más cosolventes/solubilizadores seleccionados del grupo que consisten de alcohol monohídrico, alcohol polihídrico, y éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo; en donde el alcohol monohídrico contiene hasta aproximadamente 15% v/v, el alcohol polihídrico contiene hasta aproximadamente 25% v/v y el éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo contiene aproximadamente 25% v/v, y en donde el agua es el principal solvente; siempre y cuando la cantidad total de cosolvente/solubilizadores no exceda 35% v/v de la composición; y en donde la formulación inyectable tiene una viscosidad que varía desde aproximadamente 2.50 a 3.70 centipoises (CPS) y un pH de aproximadamente 8 -9" (Fl. 76).*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

Características esenciales de la reivindicación 19	D2	D1
Composición inyectable de sales solubles de diclofenaco que comprende	Composición inyectable de sales de diclofenaco	Composición inyectable de sales de diclofenaco
100 mg/mL diclofenaco de sodio	100 mg/mL diclofenaco de sodio	Diclofenaco de sodio en concentración entre 2 – 200 mg/mL
Una combinación de al menos dos cosolventes/solubilizadores seleccionados de hasta 15% v/v alcohol monohídrico hasta 25% v/v alcohol polihídrico hasta 25% v/v éter de propilenglicol de alcohol tetrahidrofurfurilo, siempre y cuando la cantidad total de cosolvente/solubilizadores no exceda 35% v/v	Alcohol bencílico (Alcohol bencílico) Propilenglicol y Polietilenglicol (Alcoholes polihídricos) Los solubilizadores se encuentran entre 5 y 50% p/v	0,5 a 30% p/p Alcoholes monohídricos y polihídricos Hasta 25 % p/p de alcohol monohídrico

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en las reivindicaciones 17 y 19 porque divulgan composiciones inyectables de sales de diclofenaco. El documento D1 divulga composiciones acuosas de sales de diclofenaco que se encuentran en concentraciones de 2 a 200 mg/mL, que contienen alcoholes monohídricos y alcoholes polihídricos de 0,5 a 30% p/p en la composición con hasta 25% de alcohol monohídrico (Columna 2, renglones 14 a 23, 24 a 26 y 52 a 64, Fl. 99; Columna 3, renglones 1 a 4 y 48 a 52, Fl. 100). El documento D2 da a conocer composiciones de diclofenaco de sodio y solubilizadores como propilenglicol y polietilenglicol y otros excipientes como el alcohol bencílico, en las que el solvente es agua y los solubilizadores se encuentran entre 5 y 50% p/v (Columna. 2, renglones 14 a 23, 56 a 60 y 64 a 68, Fl. 105; Columna 3, renglones 1, 2 y 39 a 59, Fl. 106; Columna 5 a 6, ejemplos 1 a 4, Fl. 107); la dosis de diclofenaco en una forma farmacéutica individual puede ser 75 mg o 100 mg y el volumen total de la composición es de 1 mL (Col. 3, renglones 53 a 59, Fl. 106).

El documento D1 también enseña que el pH de la composición se encuentra entre 3 y 10 (Columna 1, renglón 65), que los alcoholes monohídricos incluyen alcohol bencílico y alcohol etílico y los alcoholes polihídricos incluyen propilenglicol, glicerina, 1,3-butilenglicol, polietilenglicol de 300 a 4000 dalton, tales como, polietilenglicol 300, polietilenglicol 400 y tensoactivos (Columna 2, renglones 52 a 64, Fl. 99). Este documento también da a conocer que el proceso de fabricación en el que el alcohol monohídrico o polihídrico es mezclado con la sal de diclofenaco de sodio en el solvente, se adiciona la solución buffer para ajustar el pH (Columna 4 renglón 63 a Columna 5, renglón 11, ejemplo 1, Fl. 101)

Página 5 de 9

Al contestar favor indique el número de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1384472836

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

Además, el documento D2 da a conocer composiciones con un pH de 8,0 a 8,3 (Columna 5, ejemplos 1 y 2, renglones 17 y 43, Fl. 107). Este documento también divulga un proceso en el que se utiliza una atmósfera de nitrógeno en la que el diclofenaco de sodio es mezclado con el alcohol monohídrico o polihídrico en el solvente y se ajusta el pH (Columna 4, renglones 8 a 29, Fl. 106; Columna 5, ejemplos 1 y 2, Fl. 107)

La diferencia entre la invención, definida en las reivindicaciones 17 o 19 y los documentos D1 y D2 es que no se divulga una composición con porcentajes de alcohol monohídrico, alcohol polihídrico y alcohol tetrahidofurfurilo como las de la composición de la solicitud.

El efecto que logra tener una composición de diclofenaco de sodio con concentraciones de alcohol monohídrico, alcohol polihídrico y alcohol tetrahidofurfurilo es la obtención de una composición inyectable que origina significativamente menos dolor en el sitio de la inyección y se puede administrar mediante ruta intradeltoide, además de ruta intraglúteo e intravenosa lenta.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar la composición conocida en D2 para obtener una composición inyectable que origina significativamente menos dolor en el sitio de la inyección y se puede administrar mediante ruta intradeltoide, además de ruta intraglúteo e intravenosa lenta".

Sin embargo, el documento D1 ya divulgaba que el propilenglicol puede causar dolor por la inyección (Columna 4, renglones 13 a 23, Fl. 100) y además da a conocer que los alcoholes monohídricos y polihídricos funcionan como solubilizadores, cosolventes y tensoactivos (Columna 2, renglones 52 a 64, Fl. 100).

Adicionalmente, como la solicitante menciona en el capítulo descriptivo, es conocido que el volumen de administración recomendado para el músculo deltoide es de 1 mL o menos (Pág. 2, renglones 11 a 23, Fl. 22). Teniendo en cuenta la solubilidad del diclofenaco de sodio⁽¹⁾, la persona del oficio normalmente versada en la materia disminuiría la cantidad de solubilizador/cosolvente manteniendo el diclofenaco de sodio en disolución.

Respecto a los datos de pH y viscosidad estos corresponden a resultados a alcanzar y no a características técnicas de la composición, sin embargo las composiciones de D1 y D2 ya mostraban valores de pH como los de la composición de la solicitud como se mencionó anteriormente.

1) Ficha técnica de Diclofenaco de sodio. Fecha de revisión 27.08.03

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia utilizaría concentraciones menores de solubilizador/cosolvente, disminuyendo así la cantidad del agente causante del dolor y la viscosidad de la composición para obtener composiciones que causen menos dolor por la inyección. Por lo cual se considera obvia.

Ahora bien, sobre la objeción realizada por la oficina al nivel inventivo, la solicitante señala que la composición del documento D1 es de liberación sostenida en la que se forman microemulsiones o micelas, que esta composición contiene un tensoactivo, que las concentraciones de sales de diclofenaco de las composiciones de D1 son inferiores, que las formulaciones de D1 con altos niveles de tensoactivo serían inadecuadas para las altas concentraciones de la composición de la solicitud y que la viscosidad sería inaceptable, dice la solicitante que las reivindicaciones de la solicitud son novedosas y tienen nivel inventivo respecto a D1.

En cuanto a D2 la solicitante dice que no existen ejemplos con concentración de 75mg/mL con los disolventes en proporciones como las de la solicitud que permitan solubilizar el diclofenaco de sodio con bajas cantidades de disolvente, y que las cantidades altas de disolventes producirían un aumento de viscosidad de la composición y que este documento no afecta la novedad ni el nivel inventivo de la composición reivindicada. Adicionalmente, la solicitante presenta datos de viscosidad de composiciones como las de los ejemplos 3 y 4 del documento D2 en composiciones de concentración de 75mg/3mL y 75mg/2mL, y afirma que la composición de la invención presenta novedad y nivel inventivo frente al documento D2.

Al respecto, primero se aclara que el nivel inventivo es evaluado respecto a las enseñanzas de los documentos D1 y D2, y no de cada documento individualmente, teniendo en cuenta lo anterior, se aclara que aunque el documento D1 da a conocer composiciones de liberación sostenida que contienen microemulsiones o micelas, el documento D2 da a conocer composiciones que son de liberación inmediata en las que no se utilizan tensoactivos como los del documento D1, porque no es necesaria la formación de microemulsiones o micelas; además, el documento D1 enseña que los alcoholes monohídricos o polihídricos funcionan como solubilizadores, cosolventes y tensoactivos (Columna 2, renglones 52 a 57, Fl. 99); en cuanto a la concentración de sales de diclofenaco en la composición, el documento D1 da un rango de 2 a 200 mg/mL (Columna 2, renglones 24 a 26, Fl. 99) y el documento D2 da a conocer que la composición puede contener una dosis de 75 mg o 100 mg en una composición de 1 mL (Columna 3, renglones 53 a 58, Fl. 106); respecto a que las concentraciones altas de tensoactivo producirían incrementos en la viscosidad, esta oficina está de acuerdo, por lo tanto es obvio que la persona del oficio normalmente versada en la materia no incluiría tensoactivos usados para estabilizar composiciones con microemulsiones o micelas para una composición de liberación inmediata como la de la solicitud.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

En cuanto a los argumentos respecto a D2, aunque en los ejemplos dados a conocer en este documento no se encuentre ninguna composición específica con esta concentración, como ya se dijo, el documento D1 da un rango de 2 a 200 mg/mL (Columna 2, renglones 24 a 26, Fl. 99) y el documento D2 da a conocer que la composición puede contener una dosis de 75 mg o 100 mg en una composición de 1 mL (Columna 3, renglones 53 a 58, Fl. 106). En el documento D1, además ya se divulgaba las propiedades como solubilizadores, cosolventes y tensoactivos de los alcoholes monohídricos y polihídricos (Columna 2, renglones 52 a 57, Fl. 99) así como, que el dolor en la inyección es causado por el propilenglicol (Columna 4, renglones 13 a 23, Fl. 100). Teniendo en cuenta las enseñanzas de los documentos D1 y D2 y que el diclofenaco de sodio en agua, la persona del oficio normalmente versada en la materia utilizaría menores proporciones de alcoholes monohídricos y polihídricos. Adicionalmente, el mismo solicitante afirma que el uso de cantidades altas de propilenglicol y polietilenglicol da como resultado viscosidades inaceptables, lo cual es conocido en el campo técnico y por lo tanto la persona del oficio normalmente versada en la materia no utilizaría concentraciones altas de estos componentes.

En cuanto a los datos presentados de viscosidad de composiciones como las del documento D2, estos datos corresponden a resultados a alcanzar y no a características técnicas de la invención y que son específicos para las composiciones de éste documento y no de composiciones derivadas de la combinación de los documentos D1 y D2.

De acuerdo con lo expuesto las reivindicaciones 17 y 19 carecen de nivel inventivo y puesto que las reivindicaciones 18 y 20 a 46 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

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 "PREPARACIONES INYECTABLES DE DICLOFENACO Y SUS SALES FARMACÉUTICAMENTE ACEPTABLES".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución al doctor Alvaro Correa Ordóñez, en su calidad de apoderado de Troikaa Pharmaceuticals Ltd, 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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19441

Por la cual se deniega una patente de invención

Ra. PCT/07-078103

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

Doctor
ALVARO CORREA ORDOÑEZ
Avenida 82 N° 10 – 62, Piso 6.
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 ✓