

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

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 28 de octubre de 2010, con el N°. 10-134187-A-00000-0000, por la sociedad Gilead Sciences, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PARTICULAS PORTADORAS SÓLIDAS PARA MEJORAR LA PROCESABILIDAD DE UN AGENTE FARMACÉUTICO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/042607 del 01 de mayo de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 632 del 20 de septiembre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N°. 2405 y notificado por fijación en lista el 04 de marzo de 2014 se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N°. 10-134187-A-00002-0000 del 30 de mayo de 2014, presentó el nuevo título: "COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN PARTÍCULAS PORTADORAS DE DIÓXIDO DE SILICIO SÓLIDAS Y UN COMPUESTO TIAZOL UREÍDO". Se aceptó el nuevo título presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en la Decisión 486.

QUINTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N°. 10-134187-A-00002-0000 del 30 de mayo de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 36 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.

SEXTO: Que en este caso la solicitud parental 10-134187 fue denegada mediante la Resolución No. 5039 del 19 de febrero de 2013 y esta decisión fue confirmada mediante la Resolución No. 55306 del 18 de septiembre de 2013.

SÉPTIMO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina "*Los países miembros otorgarán patentes para las*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

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".

OCTAVO: Que las reivindicaciones 1 a 36 contenidas en el radicado 10-134187-A-00002-0000, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

8.1. Objeto de la invención

El problema técnico se refiere a la necesidad de proporcionar una composición para inhibir la actividad de citocromo P-450, para solucionar este problema la solicitud presenta una composición que comprende, un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y una pluralidad de partículas de vehículo sólidos.

8.2. Determinación del estado de la técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad invocada, es decir el 02 de mayo de 2008.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2008010921	"Modulators of pharmacokinetic properties of therapeutics"	24/Enero/2008
D2	WO03037379	"Use of granular materials based on pyrogenically produced silicon dioxide in pharmaceutical compositions"	08/Mayo/2003

El documento D1¹ divulga un compuesto de Fórmula I, o una sal farmacéuticamente aceptable, un solvato y/o un éster de los mismos, composiciones que contienen tales compuestos, métodos terapéuticos que incluyen la administración de tales compuestos, y métodos terapéuticos que incluyen la administración de tales compuestos con al menos un agente terapéutico adicional (resumen y Pág. 1).

El documento D2² divulga el uso en composiciones farmacéuticas, de materiales granulares a base de dióxido de silicio, un adsorbato que consiste en el material granular y al menos una sustancia adicional seleccionada de principios activos farmacéuticos y sustancias auxiliares, y la producción de tales adsorbatos (resumen y reivindicación 1).

¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008010921A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20080124&DB=&locale=en_EP

²http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20030508&CC=WO&NR=03037379A1&KC=A1

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876
Por la cual se deniega una patente de invención

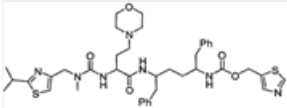
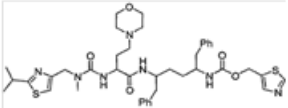
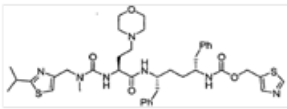
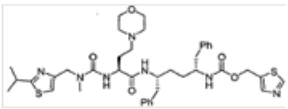
Rad. PCT/10-134187A

8.3. Nivel Inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma 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"*.

En el presente caso, la composición reclamada en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Una composición que comprende una pluralidad de partículas portadoras de dióxido de silicio sólidas, y un compuesto de fórmula (I): (...) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo sobre o dentro de las partículas portadoras de dióxido de silicio y el compuesto es mayor que la higroscopicidad de la mezcla conformada por las partículas portadoras de dióxido de silicio y el compuesto."* (Pág. 8 del radicado 10-134187-A-00002-0000).

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

Tabla 1		
Características esenciales	D1	D2
Reiv 1		
Composición que contiene	Composición que contiene	Composición que contiene
		Diversidad de compuestos activos
Compuesto (I)	último compuesto Reiv 12, Pág. 312	Págs. 13 a 16
Y portador sólido	Y portador sólido Pág. 160, línea 26	Y portador sólido Pág. 1, líneas 4 a 9, Págs. 10 a 15 y Pág. 17, líneas 1 a 11
en partículas		en partículas que tienen alta área superficial Pág. 1, líneas 18 y 19
Reiv 11		
		
Compuesto (Ia)	Pág. 216, Ej. 54	

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga una composición que comprende compuestos de fórmula (I), sus sales farmacéuticamente aceptables y sus estereoisómeros (reivindicación 12, Pág. 312, último compuesto) y portadores sólidos (Pág. 160, línea 26). Los compuestos de fórmula (I)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

son inhibidores de la monooxigenasa del citocromo P450 y están indicados en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y la composición del documento D1 consiste en que el portador sólido está en forma de partículas.

No hay evidencia de que el incluir el portador sólido en forma de partículas proporcione una composición con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba la del documento D1, puesto que la composición del documento D1 ya tiene actividad inhibidora de la monooxigenasa del citocromo P450, por lo cual está indicada en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH (Pág. 1, líneas 20 y 21 y Pág. 2, línea 25).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar la composición conocida en documento D1 para proporcionar otra composición alternativa, inhibidora de la monooxigenasa del citocromo P450 e indicada en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH.

El documento D2 divulga que los materiales tales como aquellos a base de dióxido de silicio (un adsorbato) utilizados en composiciones farmacéuticas tipo tabletas, son granulares (reivindicación 1), es decir están en forma de partículas. Y tienen un diámetro de partícula promedio de entre 10 y 120 μm y un área superficial de 40 a 400 m^2/g (Pág. 4, líneas 30 a 34, Pág. 13, líneas 5 a 11, Pág. 21, líneas 4 a 19 y reivindicaciones 2, 6 y 11)

En consecuencia, la persona normalmente conocedora de la materia, incluiría el portador sólido en forma de partículas en las composiciones que se conocen en el documento D1, teniendo en cuenta que mantienen la misma actividad inhibidora de la monooxigenasa del citocromo P450 y están indicadas en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH. Por lo cual la reivindicación 1 de la solicitud se considera obvia.

Se aclara, en referencia al efecto técnico observado en la descripción que consiste en que la higroscopicidad de (a) el compuesto de fórmula (I), de (b) el dióxido de silicón AEROPERL®300 y de (c) la combinación del compuesto de fórmula (I) sobre AEROPERL®300 (Ej. 2 y Fig. 2) resultó ser: (a) el compuesto de fórmula (I) adsorbió 4,8% de agua, (b) AEROPERL®300 adsorbió 9,3% de agua y (c) la combinación de AEROPERL®300 mezclado con el compuesto de fórmula (I) adsorbió solo 2,4% de agua; que la persona versada esperaría tal comportamiento porque el formulador conoce los métodos de preparación, las propiedades de los compuestos activos y los excipientes y es parte de su trabajo de rutina elegir los que no contengan agua para mantener la estabilidad de las composiciones y facilitar la buena compresión (esto significa elegir componentes poco higroscópicos y un excipiente que aporte fluidez a la mezcla, como el dióxido de silicón AEROPERL®300 o sílice ahumado), hacer los ensayos de compresibilidad y modificar la formulación o las condiciones del proceso, por tanto lograr este objetivo no es sorprendente para la persona versada en la materia. Por lo tanto puede concluirse que el objeto reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876

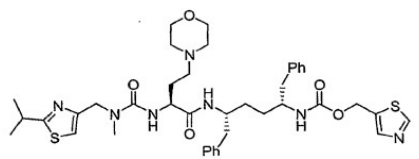
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

De otro lado, los resultados obtenidos en los ensayos realizados tan sólo verifican la causa por la cual el dióxido de silicio es un excipiente tan comúnmente utilizado en el campo técnico como adsorbente (categoría funcional en la cual se clasifica, como se sabe bien en el medio y se puede verificar en las publicaciones de uso común tales como Pharmaceutical Excipients, Pág. 486³); así, en el campo técnico se sabe bien que este excipiente es adsorbente debido al tamaño pequeño de sus partículas y su gran área superficial, las cuales le dan su deseable propiedad de flujo que es aprovechada para mejorar las propiedades de flujo de polvos secos en un número de procesos tales como el tableteo.

De otro lado, se aclara que el formulador conoce los diversos métodos de preparación de los productos comerciales finales y debe elegir compuestos activos y excipientes que no contengan agua para mantener la estabilidad de las composiciones y facilitar la buena compresión, además de que estos componentes deben ser poco higroscópicos para asegurar la buena estabilidad física y química, como se sabe bien en el medio y lo presentan los manuales de uso común (Aulton⁴, Pág. 132, Col. derecha). De manera que es lógico que el formulador utilice la forma que no sea higroscópica (es decir que absorba menos de 0,5 % de agua en un medio que tiene humedad relativa menor que 95 %) y un excipiente que mejore el flujo de la mezcla (también llamado antiadherente, mejorador de flujo o lubricante, tal como el sílice ahumado (Aulton, Págs. 298, 209 y 297)), que haga los estudios de compresibilidad de drogas utilizando máquinas de tableteo en el laboratorio para conocer el potencial de las tabletas, con el fin de prever los posibles problemas durante la compactación, tales como la laminación o la adhesión a los punzones de la tableteadora, lo cual puede requerir la modificación de la formulación o de las condiciones de procesamiento (ibid. Pág. 11). Por lo tanto, tales modificaciones no son sorprendentes para la persona versada en la materia y el objeto de esta solicitud se considera obvio y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Dado que las reivindicaciones dependientes 2 – 11 y 21 a 36 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al objeto de la reivindicación independiente, se considera que tampoco tienen nivel inventivo. Las reivindicaciones que se caracterizan por contener el estereoisómero de fórmula (Ia), es decir la estructura:



no tienen nivel inventivo, dado que este aparece divulgado en el documento D1 (Pág. 216, Ej. 54).

En el presente caso, el método reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 13 se refiere a: *“Un método que comprende combinar el compuesto de fórmula (I): (...) Un solvente adecuado y una pluralidad de partículas*

³Pharmaceutical Excipients. Raymond C Rowe, Paul J Sheskey and Siân C Owen. 2005, Pág. 486.

⁴Pharmaceutics: the science of dosage form design. Aulton, Michael E., 2da. Ed. Elsevier Ltd, Philadelphia, 2002. Pág. 132.

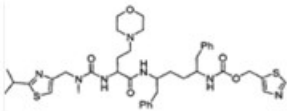
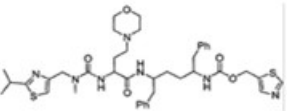
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

portadoras sólidas para proveer una mezcla(...)" (Pág. 10 del radicado 10-134187-A-00002-0000).

La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 12, y las reveladas en los documentos D1 y D2 que representan el estado de la técnica:

Tabla 2		
Características esenciales	D1	D2
reivindicación 12		
Método que comprende combinar:	Método que comprende combinar:	Método que comprende combinar:
		Diversidad de compuestos activos
Compuesto (I)	último compuesto Reiv12, Pág. 312	Págs. 13 a 16
Solvente	Solvente	Solvente
Portador sólido en partículas	Portador sólido en partículas Pág. 164, líneas 11 a 17	Portador sólido en partículas Ejs. 1 a 5 y reiv14

El documento D2, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 12, divulga un método para formar una mezcla que consiste en combinar un compuesto activo (Págs. 13 a 16) con un solvente y un portador sólido que está en forma de partículas (Ejs. 1 a 5 y reivindicación 14).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 12, y el método divulgado en el documento D2 consiste en que con el método se forma la mezcla que contiene el compuesto (I) específico.

No hay evidencia de que el incluir específicamente el compuesto (I) proporcione un método con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el método del documento D2.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar el método conocido en el documento D2 para proporcionar otro método alternativo, para formar una mezcla que contenga el compuesto (I).

El documento D1 sugiere un método para formar una mezcla, que comprende combinar el compuesto (I), que es inhibidor de la monooxigenasa del citocromo P450 y está indicado en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH (último compuesto de la reivindicación 12, Pág. 312) con un solvente y un portador sólido en forma de partículas (Pág. 164, líneas 11 a 17).

En consecuencia, la persona normalmente conocedora de la materia, incluiría el compuesto (I) en el método que se conoce en el documento D2, dado que el método alternativo reivindicado, de la misma manera que el método del estado de la técnica, está también

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

destinado a proporcionar una composición de un compuesto inhibidor de la monooxigenasa del citocromo P450, indicado en el tratamiento de infecciones virales tales como VIH. Por lo cual la reivindicación 12 de la solicitud se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones dependientes 13 – 20 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al objeto de la reivindicación independiente, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

Se reitera a la solicitante que se aceptó para examen el nuevo capítulo reivindicatorio del radicado 10-134187-A-00002-0000 y el examen confirmó la falta de nivel inventivo, según se había comunicado previamente mediante el requerimiento presentado de acuerdo con el Artículo 45.

Con respecto a los argumentos de la solicitante se reitera que los efectos técnicos observados no son sorprendentes porque el estado de la técnica enseña que el dióxido de silicio es un adsorbente de uso común que mezclado con los compuestos activos mejora sus propiedades de flujo; y según entiende la persona versada esto se debe a su gran capacidad para adsorber el agua que de otra manera adsorbería el compuesto activo y así mejora sus propiedades de flujo y facilita su tableteo, por lo cual lograr este efecto no es sorprendente para la persona versada, el objeto reivindicado es obvio y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

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 “COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN PARTÍCULAS PORTADORAS DE DIÓXIDO DE SILICIO SÓLIDAS Y UN COMPUESTO TIAZOL UREÍDO”.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49876

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/10-134187A

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Gilead Sciences, Inc., 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 22 Ago 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE, notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño Fernández