

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

**CONSIDERANDO:**

**PRIMERO:** Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 19 de septiembre de 2008, con el N° 08-099603-00000-0000, por la sociedad Vertex Pharmaceuticals incorporated, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2007/064294 del 19 de marzo de 2007.

**SEGUNDO:** Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 613 del 19 de febrero de 2010, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

**TERCERO:** Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 15205 y notificado por fijación en lista el 28 de agosto de 2012 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 visibles a folios 369 a 377 del cuaderno administrativo, 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° 08-099603-00006-0000 del 23 de noviembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 28 (Fls. 387 a 391) 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 de acuerdo con la modificación presentada por la sociedad solicitante y teniendo en cuenta el objeto reivindicado, se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "MÉTODO PARA SECAR POR ROCIADO VX-950 EN UN SISTEMA SOLVENTE".

**SEXTO:** 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 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.*"

**SÉPTIMO:** Que las reivindicaciones 1 a 28 contenidas en los folios 387 a 391, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

**7.1. Objeto de la invención**

Página 1 de 7

Al contestar favor indique el número  
de radicación que se indica a continuación:  
Cod Verificación: 836788797

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](http://www.sic.gov.co) e-mail: [contactenos@sic.gov.co](mailto:contactenos@sic.gov.co)  
Bogotá D.C. Colombia

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

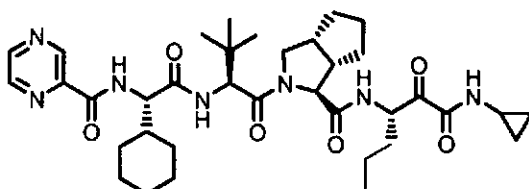
**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

El problema técnico planteado en esta solicitud consiste en suministrar un método de secado para aumentar la biodisponibilidad del compuesto telaprevir (VX-950).

Para resolver el problema técnico la solicitud en estudio proporciona un método de secado por rociado de un fármaco, que comprende formar o proveer una mezcla del fármaco, que comprende formar o proveer una mezcla del fármaco en un sistema de solventes que comprende al menos un solvente donde el solvente es un solvente no volátil seleccionado del grupo que consiste de ácido acético glacial y agua, o una combinación de solventes que comprenden un solvente volátil seleccionado del grupo que consiste de cloruro de metileno y acetona y un solvente no volátil seleccionado del grupo que consiste de ácido acético glacial y agua, para formar una mezcla del fármaco y solvente y secar la mezcla por rociado para obtener un producto farmacológico amorfo, en donde el fármaco comprende el compuesto de fórmula:



## 7.2. 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 20 de marzo de 2006.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

| Ítem | Documento    | Título                                                                                                                                                         | Fecha de Publicación |
|------|--------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D2   | Nasdaq: VRTX | Vertex Pharmaceuticals Reports that VX-950, an Investigational Oral Hepatitis C Protease Inhibitor, Displays Potent Antiviral Activity in Early Clinical Study | 10 de mayo de 2005   |
| D3   | WO2005000267 | Pharmaceutical formulation comprising a water-insoluble active agent                                                                                           | 06 de enero de 2005  |

El documento D2<sup>1</sup> divulga el compuesto VX-950 (telaprevir) y su uso como inhibidor de la proteasa del virus de la hepatitis C (FIs. 378 y 379).

1 <http://investors.vrtx.com/releasedetail.cfm?releaseid=233071>

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

El documento D3<sup>2</sup> Enseña un método para preparar partículas que comprenden agentes activos insolubles en agua (Pág. 5, líneas 3 – 8). Dentro de los agentes activos que pueden ser usados en dicho proceso se mencionan los agentes antivirales (Pág. 5, línea 19). Las partículas que comprenden agentes activos insolubles en agua se preparan por secado por rocío (Pág. 11, líneas 10 y 11). El documento enseña que el secado por rocío es una operación unitaria utilizada para producir partículas sólidas secas a partir de materiales líquidos y en suspensión y establece que el líquido o la suspensión de partida comprende un primer y un segundo solvente, el agente activo soluble en agua y opcionalmente uno o más excipientes (Pág. 11, líneas 17 – 19). El documento D3 establece que el control del proceso de secado por rocío con el sistema de cosolventes permite impartir las características de partículas deseadas a los polvos secos (Por Ej. Estabilidad, dispersibilidad, biodisponibilidad, entre otras) (Pág. 11, líneas 16 – 19). Adicionalmente, la anterioridad D3 divulga que el método de secado por rocío puede ser usado para incrementar la biodisponibilidad de los principios activos insolubles (Pág. 17, líneas 8 y 9). Los solventes sugeridos como primer solvente en la anterioridad son agua y/o un ácido orgánico como ácido acético y el segundo solvente comprende un alcohol, una amina, un aldehído, una cetona, un éster, un haluro, un aromático y/o un alcano (Pág. 10, líneas 27 – 31), entre los solventes orgánicos sugeridos se mencionan alcoholes como metanol, cetonas como acetona e hidrocarburos hidrogenados como cloruro de metileno (Pág. 18, líneas 27 – 33).

**7.3. 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"*.

En el presente caso, el método reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Un método de secado por rociado de un fármaco, que comprende formar o proveer una mezcla del fármaco, que comprende formar o proveer una mezcla del fármaco en un sistema de solventes que comprende al menos un solvente donde el solvente es un solvente no volátil seleccionado del grupo que consiste de ácido acético glacial y agua, o una combinación de solventes que comprenden un solvente volátil seleccionado del grupo que consiste de cloruro de metileno y acetona y un solvente no volátil seleccionado del grupo que consiste de ácido acético glacial y agua, para formar una mezcla del fármaco y solvente y secar la mezcla por rociado para obtener un producto farmacológico amorfo, en donde el fármaco comprende el compuesto de fórmula:*

<sup>2</sup>[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?bclId=2&II=0&KC=A2&date=20050106&FT=D&adjacent=true&DB=worldwide.espacenet.com&return=true&locale=en_EP&ND=3&CC=WO&NR=2005000267A2)

bclId=2&II=0&KC=A2&date=20050106&FT=D&adjacent=true&DB=worldwide.espacenet.com&return=true&locale=en\_EP&ND=3&CC=WO&NR=2005000267A2

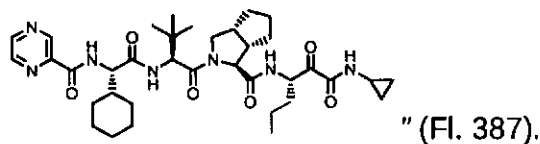
Página 3 de 7

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603



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 D2 y D3, que representan el estado de la técnica:

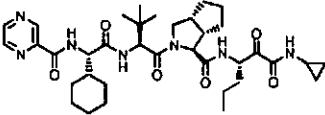
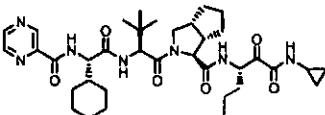
**Tabla 1**

| Características esenciales                                                                                                           | D3                                                                                                                                                                                                                          | D2             |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
| Un método de secado por rociado de un fármaco que comprende:                                                                         | Un método de secado por rociado de un fármaco que comprende (Pág. 11, líneas 10 y 11):                                                                                                                                      | No lo menciona |
| Formar o proveer una mezcla del fármaco en un sistema de solventes donde el solvente es una combinación de solventes que comprenden: | Formar o proveer una mezcla del fármaco en un sistema de solventes donde el solvente es una combinación de solventes (Pág. 11, líneas 10 y 11). que comprenden:                                                             | No lo menciona |
| Un solvente volátil seleccionado del grupo que consiste de cloruro de metileno y acetona                                             | Un segundo solvente menos polar que el primer solvente seleccionado del grupo que consiste de alcoholes como metanol, cetonas como acetona e hidrocarburos hidrogenados como cloruro de metileno (Pág. 18, líneas 27 – 33). | No lo menciona |
| Y un solvente no volátil seleccionado del grupo que consiste de ácido acético glacial y agua                                         | Un primer solvente altamente polar seleccionado del grupo que consiste de agua y/o un ácido orgánico como ácido acético (Pág. 10, líneas 27 – 31).                                                                          | No lo menciona |

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**  
*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

| Características esenciales                                                                                                                                                                                                                                              | D3                                                                                                                                                               | D2                                                                                                                                                                                                               |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>Para formar una mezcla del fármaco y solvente y secar la mezcla por rociado y obtener un producto farmacológico amorfo, en donde el fármaco comprende el compuesto de fórmula:</p>  | <p>El control del proceso de secado por rocío con el sistema de co-solventes permite impartir las características de partículas deseadas a los polvos secos.</p> | <p>Divulga el fármaco VX-950</p>  <p>y su uso como inhibidor de la proteasa del virus de la hepatitis C (Fls. 378 y 379).</p> |

El documento D3 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque enseña un método para preparar partículas que comprenden agentes activos insolubles en agua (Pág. 5, líneas 3 – 8). Dentro de los agentes activos que pueden ser usados en dicho proceso se mencionan los agentes antivirales (Pág. 5, línea 19). Las partículas que comprenden agentes activos insolubles en agua se preparan por secado por rocío (Pág. 11, líneas 10 y 11). El documento enseña que el secado por rocío es una operación unitaria utilizada para producir partículas sólidas secas a partir de materiales líquidos y en suspensión y establece que el líquido o la suspensión de partida comprende un primer y un segundo solvente, el agente activo soluble en agua y opcionalmente uno o más excipientes (Pág. 11, líneas 17 – 19). El documento D3 establece que el control del proceso de secado por rocío con el sistema de co-solventes permite impartir las características de partículas deseadas a los polvos secos (Por Ej. Estabilidad, dispersibilidad, biodisponibilidad, entre otras) (Pág. 11, líneas 16 – 19). Adicionalmente, la anterioridad D3 divulga que el método de secado por rocío puede ser usado para incrementar la biodisponibilidad de los principios activos insolubles (Pág. 17, líneas 8 y 9). Los solventes sugeridos como primer solvente en la anterioridad son agua y/o un ácido orgánico como ácido acético y el segundo solvente comprende un alcohol, una amina, un aldehído, una cetona, un éster, un haluro, un aromático y/o un alcano (Pág. 10, líneas 27 – 31), entre los solventes orgánicos sugeridos se mencionan alcoholes como metanol, cetonas como acetona e hidrocarburos hidrogenados como cloruro de metileno (Pág. 18, líneas 27 – 33).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, el método del documento D3 consiste en que el documento D3 no menciona específicamente al fármaco telaprevir (VX-950), sin embargo el documento menciona que el método puede ser usado en fármacos insolubles tales como agentes antivirales.

No se encuentra algún efecto técnico logrado por el hecho de seleccionar específicamente el compuesto telaprevir.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el método divulgado en el documento D3 para obtener un

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

método de secado por rociado para aumentar la biodisponibilidad del compuesto telaprevir (VX-950)?

Ahora bien, el documento D2 da a conocer el compuesto VX-950 (telaprevir) y su uso como inhibidor de la proteasa del virus de la hepatitis C (Fls. 378 y 379).

En consecuencia, una persona normalmente versada en la materia interesada en aumentar la biodisponibilidad del compuesto telaprevir, se vería motivada por lo revelado en el documento D3 a usar el método de secado por rocío para el fármaco telaprevir porque el documento D3 señala que dicho método es útil para aumentar la biodisponibilidad y la estabilidad de los fármacos poco solubles y porque señala que dicho método se puede usar en fármacos antivirales como lo es el telaprevir según lo revelado en el documento D2. Por lo tanto se considera que el método reclamado se deriva de forma obvia de lo divulgado previamente en el estado de la técnica y por lo tanto no presenta nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 28 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La solicitante argumenta que: "(...) las referencia citadas describen un método de secar por rociado una amplia clase de fármacos, en particular agentes antivirales. Las referencias no enseñan ni sugieren o contemplan secado por rociado de inhibidores de proteasa, muchos menos del producto VX-950. Adicionalmente, el solicitante ha mostrado, inesperadamente, que las dispersiones sólidas de la invención incrementan significativamente la biodisponibilidad, así como también la estabilidad física y química del compuesto VX-950. Por lo tanto es claro que el nuevo capítulo reivindicatorio posee tanto novedad como nivel inventivo".

Es importante aclarar que el examen de nivel inventivo llevado a cabo se basa en las enseñanzas que en conjunto revelan los documentos D2 y D3. El documento D3 enseña el método de secado por rociado tal como el reclamado en la presente solicitud y señala que dicho método puede ser usado para aumentar la biodisponibilidad de fármacos poco solubles en ácido tal como los antivirales y el documento D2 enseña el fármaco VX-950 como un antiviral potente para el tratamiento de infección causada por el virus de la hepatitis C, por lo tanto una persona de nivel medio versada en la materia interesada en aumentar la biodisponibilidad del compuesto VX-950 se vería motivada a usar el método enseñado en el documento D3 porque dicho documento enseña que el método de secado por rocío permite aumentar la biodisponibilidad y estabilidad de fármacos poco solubles. Teniendo en cuenta lo dicho anteriormente, se considera que el aumento de biodisponibilidad y estabilidad del fármaco VX-950 señalados por la solicitante son resultado esperados.

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,

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 81049**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/08-099603

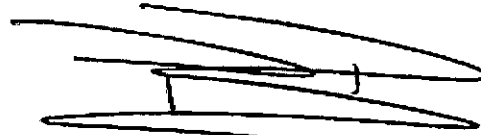
**RESUELVE:**

**ARTÍCULO PRIMERO:** Denegar la patente de invención a la creación titulada "MÉTODO PARA SECAR POR ROCIADO VX-950 EN UN SISTEMA SOLVENTE".

**ARTÍCULO SEGUNDO:** Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Vertex Pharmaceuticals Incorporated 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 cinco 5 días hábiles siguientes a ella.

**NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE**  
Dada en Bogotá D.C., el 27 Dic 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO



**PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO**

Doctor  
**ALVARO CORREA ORDOÑEZ**  
alvaro.correa@bakermckenzie.com

Elaboró: Juanita Catalina Rico Valbuena ✓  
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓  
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓  
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓