

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	08-133462
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	E 12761
	Folios	10

Patente de Invención	☐	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☐	Cap. I ☐	Cap. II ☐

No. Solicitud Internacional PCT/EP 2007/005476
Fecha de Presentación Internacional 21 de junio de 2007

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:	Folios 52-91	16 diciembre de 2008
Reivindicaciones:	Folios 93-99	16 diciembre de 2008
	Folios 177-181	16 de febrero de 2010
Oposiciones:	Folios 121-169 Gynopharm	31 de julio de 2009
Respuesta del solicitante:	Folios 172-175	16 de febrero de 2010
Prioridad:	GB 0612540.5	junio 23 de 2006

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

Título de la solicitud: "Formulaciones Galénicas de Alisquireno e Hidroclorotiazida"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de desarrollar una formulación galénica adecuada y robusta exhiban mejores propiedades de disolución

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona una formulación que contiene una combinación de Alisquireno e HCTZ con un diluyente hidrofílico.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 9/20; A61K 31/165; A61K 31/549.

4. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 24-25 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara:

- Cuando emplea el término "una cantidad terapéuticamente efectiva", porque no define el rango o proporción del principio activo que es terapéuticamente efectivo, razón por lo cual, se sugiere al solicitante definir adecuadamente las características esenciales de la reivindicación.
- No se comprende la expresión "un relleno hidrofílico", razón por la cual, se solicita definirla claramente de acuerdo a la descripción.

Los rangos empleados para el componente a) en las reivindicaciones 2 y 3 son muy amplios, se sugiere restringirlos a un rango mas estrecho de acuerdo a lo soportado. De igual manera aplica para el componente b) de la reivindicación 8 y el componente c) de la reivindicación 10 y 11.

El término: "aproximadamente", empleado frecuentemente en el capítulo reivindicatorio es impreciso y no permite definir el alcance de la reivindicación, se sugiere sustituirlo por un término preciso o un rango concreto.

La reivindicación 14 no es concisa cuando utiliza la expresión "se selecciona a partir del grupo de carbohidratos y combinaciones de los mismos", porque no limita el alcance de la reivindicación, ni cuales son las combinaciones de carbohidratos y sus proporciones, se sugiere limitar el alcance de la reivindicación de manera precisa.

La reivindicación 16 no es clara la materia que se desea proteger, porque no se comprende la expresión "relleno adicional", se sugiere al solicitante definirlo de manera inequívoca.

La reivindicación 18 no es concisa cuando utiliza la expresión "desintegrante" porque incluye a todos los compuestos que pueden cumplir con la función, por lo que se sugiere restringir la expresión a los desintegrantes de acuerdo al alcance de la presente solicitud, es decir que se encuentran debidamente sustentados. De igual manera aplica para las reivindicaciones 21, 22 y 23.

La reivindicación 28 no es clara porque ésta es una reivindicación dependiente de si misma, se sugiere establecer la dependencia adecuada.

El término "derrapante" utilizado en la reivindicación 22 no es un término difundido en el estado de la técnica, por lo que se sugiere definirlo de una manera adecuada.

Las unidades empleadas a lo largo del capítulo reivindicatorio para definir la concentración de los componentes, son en unas reivindicaciones porcentajes y en otras reivindicaciones miligramos, se sugiere al solicitante unificarlas.

6. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Gynopharm

La sociedad opositora argumenta que:

1. La patente trata de reivindicar métodos terapéuticos y que éstos no son aplicables industrialmente desde el punto de vista de la Decisión 486. Y no tienen aplicabilidad industrial.
2. Los documentos WO03097098 de noviembre de 2003, US2005271720 de diciembre de 2005 anticipan la invención.
3. WO03097098 revela un inhibidor de renina y bloqueador de canales de calcio además de un diurético (Página 15, párrafo 3, reivindicaciones 2 y 5) revela una composición que puede comprender alisquireno y HCTZ.
4. US2005271720 revela composiciones con alto contenido de lbersartán, en las páginas 5 tabla 6 y página 6, tabla 7-9, también se divulga composiciones que comprenden HCTZ y almidón como relleno hidrofílico.
5. Por tal motivo, cualquier persona versada en la materia a partir de la composición que incluye aliskireno e HCTZ divulgado en WO03097098 en combinación con la composición que incluye HCTZ y almidón divulgado en US2005271720 podrá llegar al objeto reivindicado de la actual solicitud. Por lo cual, ésta no tiene altura inventiva.

Respuestas del Solicitante

1. En primer lugar modifican el capítulo descriptivo donde se eliminan las reivindicaciones 26-29 las cuales se referían a métodos terapéuticos. Superando así la materia no patentable.
2. La materia que se pretende patentar es una materia que comprende exclusivamente alisquireno, HCTZ donde las cantidades de desintegrante pueden ser reducidas a dada la presencia de un diluyente hidrofílico. D1 no rerefiere a composiciones que tengan estas características, tampoco sugiere un método para su preparación que comprenda las etapas de i) granular independientemente cada principio activo y el diluyente; ii) secar el granulado; iii) mezclar el granulado con los ingredientes de la fase externa; iv) compresión en una tableta y; v) opcionalmente aplicar una cubierta.
3. D2 no revela no se enfoca en la solución de problemas asociados en la formulación de alisquireno o a las diferencias en las velocidades de disolución y HCTZ en una única formulación.

4. D1 y D2 no proporcionan enseñanzas o sugerencias que condujeran a solucionar los problemas asociados con la formulación de alisquireno en combinación con HCTZ, y tampoco sugieren el método para la manufactura de las composiciones de la invención, con las ventajas anteriormente expuestas.

Respuesta del Examinador Técnico

1. El documento US2005271720 alegado por el opositor enseñan el uso de HCTZ en combinación con rellenos hidrofílicos y con un componente adicional como el ibersartán, el cual presenta problemas similares a los que pueden presentarse con el Alisquireno, y como resultado del estudio muestra que se obtienen favorables perfiles de disolución, características técnicas esenciales de la actual solicitud.
2. El Documento WO03097098 revela composiciones que pueden incluir Alisquireno y HTCZ como activos en la formulación, Características técnicas esenciales de la actual solicitud.
3. En cuanto a los argumentos esgrimidos por el solicitante en cuanto al proceso en la actual solicitud, los documentos alegados por el opositor no revelan el proceso reivindicado en la actual solicitud

Teniendo en cuenta las características reveladas en los documentos alegados por el opositor, éstos serán considerados dentro del Examen de Patentabilidad.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de Presentación de la Solicitud de la Solicitud de Prioridad: 23 de junio de 2006

Y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO 03097098	Pharmaceutical composition comprising a renin inhibitor, a Calcium channel blocker and a Diuretic	27 de noviembre de 2003
D2	WO2005077418	Combination Of Renin Inhibitor And Diuretics	25 de agosto de 2005
D3	WO2006041763	Renin Inhibitors For Treating Transplantation Induced Diseases	20 de abril de 2006
D4	WO 2005089729	Galenic formulations of organic compounds	29 de septiembre de 2005
D5	US20050271720	Pharmaceutical composition containing Ibersartan	08 de diciembre de 2005
D6	WO0032174	Pharmaceutical Combination Preparations	08 de junio de 2000
D7	WO03077929	Fosinopril Formulation	25 de septiembre de 2003
D8	EP0747050	Pharmaceutical Compositions Containing Irbesartan	11 de diciembre de 1996

D1

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=03097098A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20031127&DB=EPODOC&locale=en> EP

La invención se refiere a una composición farmacéutica que comprende (i) un inhibidor de renina, (ii) un bloqueador de los canales de calcio (BCC), y (iii) un

diurético

D2

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2005077418&KC=&FT=E&locale=en> EP

La invención se refiere a una combinación, composición farmacéutica que comprende (i) un inhibidor de renina o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y (ii) del mismo la amilorida diurético o triamtereno o una sal farmacéuticamente aceptable, y (iii) un diurético adicional (por ejemplo, hidroclorotiazida) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

D3

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2006041763&KC=&FT=E&locale=en> EP

La invención se refiere al uso de inhibidores de la renina, para la preparación de un medicamento, para el tratamiento de diversas enfermedades

D4

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005089729A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20050929&DB=&locale=en> EP

Divulga una forma de dosificación oral sólida que comprende una cantidad terapéuticamente eficaz de aliskiren o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, y en donde el ingrediente o ingredientes activos está presente en una cantidad de más de 46% en peso basado en el peso total de la dosificación oral.

D5

<http://www.google.com/patents?id=2x-VAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=US20050271720&hl=en&sa=X&ei=I2eqT8guEoiJtweri4zICQ&ved=0CDcQ6AEwAA>

Divulga composiciones farmacéuticas que comprenden el principio activo ibersartan en combinación con HTCZ (ejemplos 3-6), Divulga que los perfiles de disolución mejorados para el principio activo ibersartán (párrafo 9), el ibersartán presenta características de flujo indeseables, densidad (párrafo 5)

D6

<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=0032174&KC=&FT=E&locale=en> EP

La presente invención se refiere a una preparación de una combinación farmacéutica para el tratamiento de trastornos cardíacos y cardiovasculares tales como hipertensión, angina de pecho, insuficiencia cardíaca y enfermedades asociadas con la misma, que contiene el activo carvedilol sustancias o una sal del mismo farmacéuticamente aceptable e hidroclorotiazida o una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos, así como aditivos farmacéuticamente usuales.

D7

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=03077929&KC=&FT=E&locale=en_EP

Divulga una formulación farmacéutica que comprende fosinopril. La formulación se caracteriza porque comprende un intervalo de entre aproximadamente 0,25 a aproximadamente 5% dibehenato de glicerilo el cual es un lubricante de gran utilidad en la fabricación de tabletas de acuerdo con la presente invención, la mejora de la estabilidad de fosinopril en comparación con las formulaciones de la técnica anterior.

D8
http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=EP&NR=0747050&KC=&FT=E&locale=en_EP

Las composiciones farmacéuticas que contienen irbesartán, solos o en combinación con un diurético, proporcionando comprimidos con una alta cantidad relativa de agente activo y humectación excelente y propiedades de desintegración.

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

- La reivindicación 1 consiste en una composición oral sólida que comprende:
- a. Una cantidad terapéuticamente efectiva de Alisquireno o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo
 - b. Hidroclorotiazida y un relleno hidrofílico seleccionado a partir de un carbohidrato, o combinaciones del mismo, y
 - c. Un relleno hidrofílico seleccionado a partir de un carbohidrato, o combinaciones del mismo.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2	D3
Composición que comprende Alisquireno	Formulaciones que Incluyen Alisquireno	Formulaciones que Incluyen Alisquireno	Formulaciones que Incluyen Alisquireno
Composición que comprende HCTZ	Formulaciones que Incluyen HCTZ	La formulación contiene HCTZ	No se revela esta característica
Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos o combinaciones de ellos	No se revela esta característica	No se revela esta característica	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos o combinaciones de ellos

Características esenciales	D4	D5	D6
Composición que comprende Alisquireno	Formulaciones que Incluyen Alisquireno	No se revela esta característica	No se revela esta característica
Composición que comprende HCTZ	No se revela esta característica	La formulación contiene HCTZ	La formulación contiene HCTZ
Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos o combinaciones de ellos	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de lactosa o carbohidratos	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de almidon	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de lactosa y sacarosa

Características esenciales	D7	D8
Composición que comprende Alisquireno	No se revela esta característica	No se revela esta característica
Composición que comprende HCTZ	La formulación contiene HCTZ	La formulación contiene HCTZ
Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos o combinaciones de ellos	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de lactosa y almidón	Incluye un relleno hidrofílico seleccionado de lactosa y almidón

El documento D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

D1 divulga composiciones que comprenden Alisquireno y HCTZ (página 7, párrafos 4 y 5), el contenido de Alisquireno se encuentra en el rango de 1mg- 1000mg (página 15, párrafo 4) contenido que abarca las concentraciones de las reivindicaciones 5 y 6; el contenido de HCTZ se encuentra en el rango de 1mg-40mg (página 15, párrafo 5) contenido que abarca las reivindicaciones 7-9.

D2 divulga composiciones que comprenden Alisquireno y HCTZ (páginas 13 y 14, literales i) y iii)), el contenido de Alisquireno se encuentra en el rango de 10mg-1500mg (página 16, párrafo 4), contenido que abarca las concentraciones de las reivindicaciones 5 y 6; el contenido de HCTZ se encuentra en el rango de 1mg-40mg (página 15, párrafo 5) contenido que abarca las reivindicaciones 7-9.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y las composiciones de D1 y D2 consiste en que éstas no revelan el uso de un relleno hidrofílico a partir de carbohidratos o combinaciones de estos.

El efecto que logra el incluir el relleno hidrofílico seleccionado a partir de carbohidratos, es que mejora las propiedades de la farmacocinéticas de la composición.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo una composición que comprenda Alisquireno e Hidroclorotiazida con propiedades mejoradas".

Comparación D1 o D2 con D3

La utilización de un relleno hidrofílico para mejorar las propiedades de desintegración y por ende de disolución, ya está divulgada en el documento D3 que divulga composiciones que contienen Alisquireno con la inclusión de un relleno hidrofílico (página 26, ejemplo 1), lo que muestra que uso de un relleno hidrofílico no tiene interacciones negativas con el Alisquireno.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos de D3 en la composición de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Comparación D1 o D2 con D4

La utilización de un relleno hidrofílico para mejorar las propiedades de desintegración y por ende de disolución, ya está divulgada en el documento D4 que divulga composiciones que contienen Alisquireno con la inclusión de un relleno hidrofílico seleccionado de almidón o lactosa entre otros (página 5, párrafo 5), lo que muestra que uso de un relleno hidrofílico no tiene interacciones negativas con el Alisquireno.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos de D4 en la composición de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Comparación D1 o D2 con D5 o D6 o D7 o D8

La utilización de un relleno hidrofílico para mejorar las propiedades de desintegración y por ende de disolución, ya está divulgada en cualquiera de los documentos D5-D8 que divulga composiciones que contienen Alisquireno con la inclusión de un relleno hidrofílico seleccionado de almidón (D5: tabla 8 y 9), sacarosa y lactosa (D6: ejemplo A) y lactosa y almidón (D7: ejemplo 3, D8: tabla A), lo que muestra que uso de un relleno hidrofílico consistente de almidón, sacarosa y lactosa, o lactosa y almidón, no tiene interacciones negativas con el Alisquireno.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el relleno hidrofílico seleccionado de carbohidratos de D5, o D6, o D7, o D8 en la composición de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Es de anotar que en la reivindicación 28, el relleno hidrofílico no es mezclado con la fase granular de Alisquireno, de lo que se puede concluir que el relleno hidrofílico no es esencial para la estabilidad del Alisquireno y de esta manera solucionar el problema técnico planteado en la presente solicitud.

Las reivindicaciones 2-25 no incluyen características que hagan nueva o inventiva la reivindicación 1 por lo tanto se consideran obvias.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 26 reivindica un método de preparación que comprende los pasos:

- i) granular los componentes a), b), y c), aditivos, con un líquido de granulación;
- ii) secar el granulado.
- iii) Mezclar el granulado con excipientes de fase externa
- iv) Comprimir una mezcla resultante para formar una dosificación oral sólida como una tableta núcleo

v) Opcionalmente recubrir una tableta de núcleo resultante para dar una tableta cubierta por película.

Características esenciales	D1	D4
granular los componentes a), b), y c), aditivos, con un líquido de granulación;	Divulga composiciones que contienen Alisquireno e Hidroclorotiazida como activos y un relleno hidrofílico	mezclar el ingrediente activo y los aditivos y granulación dichos componentes con un líquido de granulación;
Secar el granulado.		secar un granulado resultante
Mezclar el granulado con excipientes de fase externa		mezclar el granulado seco con excipientes fase externa
Comprimir una mezcla resultante para formar una dosificación oral sólida como una tableta núcleo		comprimiendo una mezcla resultante para formar una dosificación oral sólida como un núcleo de comprimido,
Opcionalmente recubrir una tableta de núcleo resultante para dar una tableta cubierta por película.		opcionalmente recubrir un núcleo de comprimido resultante para dar un comprimido recubierto con película

El documento D4 se considera el proceso más cercano al proceso de la reivindicación 26 describe un proceso para la preparación de la composición (página 12, líneas 1-11) que comprende las etapas 1) mezclar el ingrediente activo y los aditivos y granulación dichos componentes con un líquido de granulación; 2) secar un granulado resultante; 3) mezclar el granulado seco con excipientes fase externa; 4) comprimiendo una mezcla resultante para formar una dosificación oral sólida como un núcleo de comprimido, y 5) opcionalmente recubrir un núcleo de comprimido resultante para dar un comprimido recubierto con película. Por tal motivo, el proceso reivindicado no es nuevo.

La diferencia entre el proceso de D4 y el reivindicado en la actual invención, es que ésta incluye Hidroclorotiazida dentro de los componentes en la etapa 1 del proceso.

El hecho de incluir el agente activo Hidroclorotiazida en el proceso que se daba a conocer en D1, permite que obtener procesos para la elaboración de formas de dosificación oral que contienen Alisquireno e Hidroclorotiazida.

Por tanto, el Problema Técnico Objetivo consiste en "cómo modificar el proceso conocido según D4 para proporcionar un método de elaboración de una composición que contiene Alisquireno, Hidroclorotiazida y un relleno hidrofílico"

Sin embargo D1 describe una composición que incluye Hidroclorotiazida y Alisquireno como componentes (página 7, párrafos 4 y 5)

De donde sería obvio para la persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de "cómo modificar el proceso conocido en D4 para proporcionar un método de elaboración de una composición que contiene Alisquireno, Hidroclorotiazida y un relleno hidrofílico", incluiría "el agente activo hidrocortiazida" que se revela en D1, dentro del proceso que se revela en D4, logrando de esta forma el proceso objeto de esta solicitud.

Por lo cual el proceso de la Reivindicación 26 carece de Nivel Inventivo.

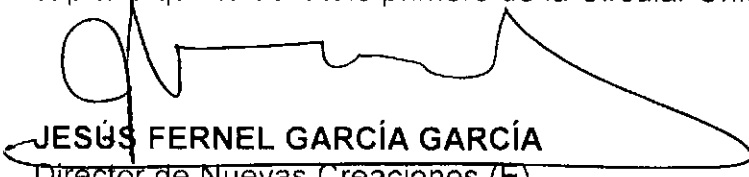
9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03097098	1-28	Nivel Inventivo
D2	WO2005077418	1-28	Nivel Inventivo
D3	WO2006041763	1-28	Nivel Inventivo
D4	WO 2005089729	1-28	Nivel Inventivo
D5	US20050271720	1-28	Nivel Inventivo
D6	WO0032174	1-28	Nivel Inventivo
D7	WO03077929	1-28	Nivel Inventivo
D8	EP0747050	1-28	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.

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.


JESÚS FERNEL GARCÍA GARCÍA

Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

25 JUL 2012

Elaborado por: Harvey Alonso Jaramillo

Revisado Por: Jacqueline Alfonso

oket