

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO Radicación 08 127 736
 Trámite 11
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio 078 23
 Folios 8

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad
Vía Nacional		
Via PCT (Fase Nacional)	☒	☒ Capítulo I ☒ Capítulo II
No. Solicitud Internacional	PCT/US2007/013048	
Fecha de Presentación Internacional	01/Junio/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 21 a 29	01/Diciembre/2008
Reivindicaciones:	Folios 30 a 32	01/Diciembre/2008
	Folios 152 a 154	18/Mayo/2010
Oposiciones:	Folios 42 a 72	Lafrancol 31/Julio/2009
	Folios 73 a 138	Gynopharm 31/Julio/2009
Respuesta del solicitante:	Folios 146 a 148	A Lafrancol 18/Mayo/2010
	Folios 149 a 151	A Gynopharm 18/Mayo/2010
Prioridad:	US 60 810 018	01/Junio/2006

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta 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 de liberación pulsada de fenilefrina y composiciones farmacéuticas".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar una composición farmacéutica que contengan fenilefrina que libere el principio activo de manera pulsada.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una

composición farmacéutica que comprende un componente de liberación inmediata en una forma sólida, donde el componente de liberación inmediata comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y además donde el componente de liberación retardada comprende microcristales recubiertos con una cubierta entérica y sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K9/08//9/10//9/16//9/28//31/137

4. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 6, 10-14 y 16-18 no son claras porque utilizan los términos "aproximadamente", "uno o más", que son imprecisos por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término preciso o un rango concreto.

Las reivindicaciones 10 y 11 no son claras porque utiliza la expresión "donde el tamaño de partícula promedio de los microcristales es..." lo cual es un resultado a alcanzar que no define la composición farmacéutica ni el método de preparación reclamado. 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. Se sugiere reemplazarlos por las características esenciales, estructurales o funcionales, que contribuyan a la obtención de esos efectos.

La reivindicación 19 no es clara, ni concisa cuando utiliza términos como "antihistamínico", "analgésico", "antipirético", "antiinflamatorio no esteroide", ya que definen los componentes de la composición por su función pero no por un compuesto como tal, lo que hace que se obtengan un número indefinido de composiciones que no encuentran soporte en la descripción. Se recuerda al solicitante que el fundamento de una combinación está dado por el efecto de los dos componentes, como sinergismo, disminución de efectos colaterales, entre otros, lo cual no encuentra soporte en la descripción para las familias de compuestos mencionados. Se sugiere al solicitante eliminar esta reivindicación.

5. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Lafrancol

Dice el oponente que esta solicitud no tiene novedad, ni nivel inventivo, porque las formulaciones de liberación pulsada o composiciones farmacéuticas que comprenden un componente de liberación inmediata y un componente con recubrimiento entérico formulados conjuntamente ya sea en forma sólida o en una suspensión y que compromete fenilefrina y antihistamínicos como loratadina o desloratadina son totalmente comunes en la industria farmacéutica. Como prueba de lo anterior se tiene:

1. En "The Merck Index" la loratadina fue patentada en Estados Unidos bajo el No. US 4.282.233.
2. En la patente estadounidense No. 4.816.264 divulga formulaciones de liberación sostenida en las cuales se incluye en el acápito del núcleo fenilefrina.

3. En la patente estadounidense No. 4.623.664 se menciona la fenilefrina como sustancia conocida en el campo farmacéutico.

Argumentaciones de Gynopharm

Afirma el oponente que esta solicitud no es objeto de patentabilidad porque carece de:

1. Altura inventiva: a partir del documento D1 (US2005266032, publicado el 01 de diciembre de 2005) se puede llegar de manera evidente a las composiciones farmacéuticas sobre las cuales busca protección el capítulo reivindicatorio porque aquel revela una composición farmacéutica que puede comprender una solución o una suspensión en la que la fenilefrina puede entregarse de manera controlada y donde el activo de liberación controlada está recubierto a partir de hidroxipropilcelulosa.

2. Aplicación industrial: algunas cláusulas reclaman usos y métodos terapéuticos los cuales no son aplicables industrialmente porque no se obtienen un producto o proceso y no son repetibles a escala industrial.

Respuestas del Solicitante

Respuesta a Lafrancoi

En los documentos presentados por el opositor, D1 (patente US 4.816.264) utiliza un sistema de liberación sostenida caracterizado por el uso de una membrana semipermeable junto con un núcleo de la tableta, y D2 (patente US 4.623.664) revela una suspensión oleosa que contiene como principio activo fenilefrina en su forma base, formulada como medicamento oftálmico. Por lo tanto, ninguno de los documentos citados por el opositor revela las características esenciales de la composición farmacéutica de la presente invención, ni brindan enseñanzas que conduzcan a la persona medianamente versada en la materia a desarrollar una formulación farmacéutica que utilice microcristales sembrados con fenilefrina y con una cubierta entérica, característica de la presente invención.

Respuesta a Gynopharm

En primer lugar, modifica el capítulo reivindicatorio en el que se eliminan las reivindicaciones 21 y 22 referidas a la materia no patentable por carencia de aplicación industrial.

Respecto a la carencia de nivel inventivo, el documento D1 (US2005266032) divulga formulaciones líquidas o sólidas que comprenden un primer y un segundo principio activo, particularmente tabletas de dos o más capas donde cada una de ellas tiene un perfil de liberación diferente. Por lo tanto, la persona medianamente versada en la materia, no encontraría ningún tipo de sugerencia para desarrollar una formulación farmacéutica que utilice microcristales sembrados con fenilefrina y con una cubierta entérica, con el fin de realizar una administración retardada del ingrediente activo, característica de la presente invención.

Respuesta del Examinador Técnico

Aunque en la invención se mencione el principio activo loratadina, el documento presentado en la oposición correspondiente a "The Merck Index" no desvirtúa la

novedad, ni el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; por lo cual no se consideran dentro del examen de patentabilidad.

El documento US 4.816.264 revela un sistema de liberación para fármacos, el cual comprende dos partes: un núcleo de tableta producido por la mezcla del fármaco y un polímero gelificante, y una membrana semipermeable o un recubrimiento que rodea el núcleo. Este documento no desvirtúa la novedad, ni el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; por lo cual no se considera dentro del examen de patentabilidad.

El documento US 4.623.664 enseña una composición farmacéutica que contiene fenilefrina para su uso como midriático. Consiste en una suspensión oleosa, la cual no comparte las características esenciales de la invención. Debido a que este documento no desvirtúa la novedad, ni el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; no se considera dentro del examen de patentabilidad.

Por otra parte, el documento US2005266032 aunque divulga una composición farmacéutica que comprende un fármaco seleccionado del grupo de descongestionantes, antitusivos, expectorantes, analgésicos y antihistamínicos y otro fármaco seleccionado del mismo grupo, donde la composición farmacéutica puede ser bicapa de liberación prolongada, este no divulga las características esenciales de la invención, de tal manera que no desvirtúa la novedad, ni el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; por lo que no se considera dentro del examen de patentabilidad

6. 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 01 de junio de 2006y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US 5.133.974	Extended release pharmaceutical formulations	28/Julio/1992
D2	US 20030118654	Taste masked aqueous liquid pharmaceutical composition	26/Junio/2003

D1
<http://www.google.com/patents?id=mmAaAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=us+5133974&hl=en&sa=X&ei=qFSVT-W4BaPk6QGtpOnuBA&sqi=2&ved=0CDIQ6AEwAA>, divulga (col. 1, lns 14-25, col 3, lns 18-30, col 4, lns 26-28, 43) una composición farmacéutica que comprende un componente de liberación inmediata en una forma sólida que comprende descongestionantes como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y un componente de liberación retardada que consiste en partículas sembradas con descongestionantes como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma recubiertas con una cubierta entérica.

D2
<http://www.google.com/patents?id=RMaIAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=us+20030118654&hl=en&sa=X&ei=w2uVT4958PTAd3vscYE&ved=0CDIQ6AEwAA>, divulga (pg. 1, pár. 002, 0010, 0013, pg. 2, pár. 0014, 0015, pg. 12, reivindicación 43) composiciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina y su método de preparación.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en una composición farmacéutica que comprende un componente de liberación inmediata en una forma sólida, donde el componente de liberación inmediata comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma y además donde el componente de liberación retardada comprende microcristales recubiertos con una cubierta entérica y sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma.

Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:	
Características esenciales	D1
Composición farmacéutica que comprende:	Composición farmacéutica que comprende (col. 1, lns 14-25):
Un componente de liberación inmediata en una forma sólida que comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma	Un componente de liberación inmediata en una forma sólida que comprende descongestionante como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma (col 3, lns 18-30, col 4, lns 26-28, 43)
Un componente de liberación retardada que comprende microcristales sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y recubiertos con una cubierta entérica	Un componente de liberación retardada que comprende microcristales sembrados con descongestionante como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y recubiertos con una cubierta entérica (col 3, lns 18-30, col 4, lns 26-28, 43)

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer una composición farmacéutica que comprende un componente de liberación inmediata en una forma sólida que comprende descongestionantes como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y un componente de liberación retardada que consiste en partículas sembradas con descongestionantes como fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma recubiertas con una cubierta entérica.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Además, D1 también enseña que la composición farmacéutica comprende además por lo menos un componente activo seleccionado del grupo que consiste en una antihistamínico, un analgésico, antipirético, antiinflamatorio no esteroide y mezclas de dos o más de dichos componentes activos (col. 3, lns 31-38).

Por lo tanto la reivindicación dependiente 19 no menciona alguna característica que haga nueva a la composición farmacéutica de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es nueva.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 2 consiste en una composición farmacéutica que comprende un componente de liberación inmediata y un componente de liberación retardada suspendido o disuelto en un líquido, donde el componente de liberación inmediata comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma y además donde el componente de liberación retardada comprende microcristales recubiertos con una cubierta entérica y sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma.

Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:		
Características esenciales	D2	D1
Composición farmacéutica que comprende:	Composición farmacéutica que comprende una suspensión:	Composición farmacéutica que comprende (col. 1, lns 14-25):
Un componente de liberación inmediata que comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma suspendida o disuelta en un líquido	Un componente de liberación inmediata que comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma (pg. 1, pár. 002, 0010, 0013, pg. 2, pár. 0014, 0015)	Un componente de liberación inmediata en una forma sólida que comprende fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutica de la misma (col 3, lns 18-30, col 4, lns 26-28, 43)
Un componente de liberación retardada suspendido o disuelto en un líquido que comprende microcristales sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y recubiertos con una cubierta entérica	No se menciona	Un componente de liberación retardada que comprende partículas sembradas con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma y recubiertos con una cubierta entérica (col 3, lns 18-30, col 4, lns 26-28, 43)

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 2 porque divulga composiciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2 y la composición farmacéutica de D2 consiste en que en la formulación también se encuentra suspendido o disuelto un componente de liberación retardada que comprende microcristales sembrados con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma, recubiertos con una cubierta entérica.

El efecto que logra el incluir esta característica es que las formulaciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina además liberan de manera retardada el principio activo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de modificar las composiciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina de liberación inmediata conocidas en D2, para que se libere de manera retardada el principio activo.

D1 describe un componente de liberación retardada que comprende partículas sembradas con fenilefrina o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma, recubiertos con una cubierta entérica.

La reivindicación 2 es obvia, porque la persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de ¿cómo modificar las composiciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina de liberación inmediata conocidas en D2, para que se libere de manera retardada el principio activo?, incluiría el recubrimiento con una cubierta entérica a partículas sembradas con fenilefrina, o una sal aceptable para uso farmacéutico de la misma, que se revela en D1, dentro de las composiciones que se enseñan en D2, logrando de esta forma la composición objeto de esta solicitud.

Por lo cual la composición la reivindicación 2 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Además, D2 también enseña:

Que en la composición farmacéutica el líquido es acuoso (abstract, pg. 1, pár. 0013).

Que la composición farmacéutica además comprende un buffer, donde el buffer comprende ácido cítrico y citrato de sodio (pg. 3, pár. 0039).

Que la composición farmacéutica tiene un pH que se encuentra entre 2.5 y 8 (pg. 1, pár. 0011).

Que la composición farmacéutica comprende además un modificador de la viscosidad, donde el agente modificador de la viscosidad se selecciona del grupo que consiste en polivinilpirrolidona, hidroxipropilmetilcelulosa y mezclas de las mismas (pg. 3, pár. 0029).

Que el componente de liberación inmediata además comprende loratadina o desloratadina (pg. 2, pár. 0015).

Por otra parte, D1 también enseña:

Que el tamaño promedio de los microcristales es de 200 a 300 micras (malla -10 + 60, estándar U.S) (col. 3, lns 28-30)

Que los microcristales se forman a partir de uno o más ingredientes seleccionados del grupo que consiste en almidón, lactosa, talco, polivinilpirrolidona, celulosa, metilcelulosa y mezclas de dos o más de los mismos (col. 3, lns 21-30, col. 5, pg. 38-46).

Que la cubierta entérica se forma a partir de uno o más polímeros seleccionados del grupo que consiste de derivados de celulosa, copolímeros del ácido metacrílico y mezcla de dos o más de los mismos (col. 6, lns 41-59, col 6 ln 67- col. 7, ln 10)).

Que aproximadamente entre el 0-50% del principio activo se encuentra en la parte de liberación inmediata y el componente de liberación retardada puede ser de hasta el 100% (col. 3, lns 62-68)

Que la composición farmacéutica comprende además por lo menos un componente activo seleccionado del grupo que consiste en un antihistamínico, un analgésico, antipirético, antiinflamatorio no esteroide y mezclas de dos o más de dichos componentes activos (col. 3, lns 31-38).

Por lo tanto las reivindicaciones dependientes 3 - 19 no mencionan alguna característica que hagan nueva a la composición farmacéutica de la reivindicación 2, por lo cual tampoco se pueden considerar inventivas.

La reivindicación 20 consiste en un método de preparación de una composición de acuerdo con la reivindicación 2, que comprende mezclar cristales con una cubierta entérica que contiene fenilefrina, fenilefrina a granel y un líquido.

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

Características esenciales	D2
Método de preparación de una composición farmacéutica que comprende:	Método de preparación de una composición farmacéutica que comprende:
Mezclar: - Cristales con una cubierta entérica que contiene fenilefrina - Fenilefrina a granel, y - Un líquido.	Mezclar (pg. 12, reivindicación 43): - Fenilefrina a granel, y - Un líquido

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 2 porque divulga un método de preparación de composiciones farmacéuticas que contienen fenilefrina.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2 y el método de preparación de D2 consiste en que en se agrega además cristales con una cubierta entérica que contiene fenilefrina a la mezcla.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado al método reclamado en esta solicitud ya que no parece presentar ventajas respecto del estado de la técnica cercano.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de modificar el método de preparación de las composiciones farmacéuticas líquidas de fenilefrina conocido en D2, para introducir los cristales que contienen fenilefrina con una cubierta entérica.

Sin embargo, la simple adición de otro ingrediente y su posterior mezcla es una actividad rutinaria en la preparación de formas farmacéuticas líquidas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia consideraría agregar los cristales con una cubierta entérica que contienen fenilefrina a la preparación y mezclar con los demás ingredientes. Por lo cual se considera obvia.

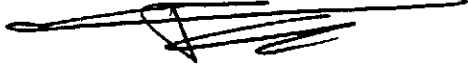
8. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US 5.133.974	1 y 19	Novedad
D1	US 5.133.974	2 - 19	Nivel inventivo
D2	US 20030118654	2 - 20	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.


JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 1 MAY 2012

Elaborado por: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisado por: Jacqueline Alfonso Roza *oxlt*