

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

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 10 de marzo de 2009, con el N° 09-024629-00000-0000, por la sociedad Takeda Pharmaceutical Company Limited, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "Composiciones farmacéuticas", que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2007/065666 del 09 de agosto de 2007.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 615 del 20 de abril de 2010, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 13991 y notificado por fijación en lista el 14 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 233 a 237 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-024629-00008-0000 del 07 de noviembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 4 (Fl. 248) 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 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."*

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 4 contenidas en el folio 248, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

Página 1 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

6.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en mejorar la solubilidad del ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico o una sal del mismo, de una preparación sólida que lo contiene. Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona una composición farmacéutica sólida caracterizada porque comprende el ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico o una sal del mismo, polietilenglicol que tiene un punto de fusión de 20°C a 90°C e hidroxipropilcelulosa que tiene una viscosidad de 1 a 4 mPa.s, medida a 20°C usando una solución acuosa al 2% con un viscosímetro de Brookfield.

6.2. Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 10 de agosto de 2006, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

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

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US 5354766	Compound and salts thereof which antagonize angiotensin II	11/octubre/1994
D2	US 5055304	Stabilized pharmaceutical composition and method of producing same	08/octubre/1991

El documento D1¹ divulga en el ejemplo 58 el compuesto ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7- carboxílico (Pág. 60, Col. 1).

De igual modo, da conocer una composición farmacéutica que contiene un antagonista de angiotensina II que comprende una cantidad terapéutica efectiva del componente o la sal fisiológicamente aceptable de acuerdo con una reivindicación 1 en combinación con un vehículo aceptable farmacéuticamente,

1

<http://www.google.com/patents?>

[id=BpgfAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=Compound+and+salts+thereof+which+antagonize+angiotensin+II&hl=en&sa=X&ei=qIHsT-_O6mm6gGv3pmpBQ&sqi=2&ved=0CDMQ6AEwAA](http://www.google.com/patents?id=BpgfAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=Compound+and+salts+thereof+which+antagonize+angiotensin+II&hl=en&sa=X&ei=qIHsT-_O6mm6gGv3pmpBQ&sqi=2&ved=0CDMQ6AEwAA)

Página 2 de 7

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 925941924

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
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

excipiente o diluyente (Pág.71).

Finalmente, divulga dentro de las realizaciones preferida dos composiciones farmacéuticas sólidas (cápsulas o tabletas) para el compuesto de fórmula (I) (Pág. 23, Col. 2) que comprende 1.) el principio activo correspondiente al ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-carboxílico, 2.) un desintegrante (almidón de maíz), 3.) un aglutinante (lactosa o celulosa microcristalina) y 4.) un lubricante (estearato de magnesio).

El documento D2² divulga en el ejemplo 1 una composición farmacéutica mejorada que comprende polietileno-glicol 6000 como componente similar a grasa o aceite de bajo punto de fusión e hidroxipropilcelulosa en combinación con un principio activo y otros componentes (Pág. 4, Col. 2).

Adicionalmente, divulga que al adicionar una sustancia similar a grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo (Polietilenglicol 6000) aumenta la estabilidad durante del ingrediente activo durante el almacenamiento (Pág. 5, Col. 1).

6.4. 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, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 refiere a: *"una composición farmacéutica sólida caracterizada porque comprende 1.) el ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico o una sal del mismo, 2.) polietilenglicol que tiene un punto de fusión de 20°C a 90°C y 3.) hidroxipropilcelulosa que tiene una viscosidad de 1 a 4 m Pa.s, medida a 20°C usando una solución acuosa al 2% con un viscosímetro de Brookfield"*.

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 más cercano:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

Tabla 1.

Características Esenciales	D1	D2
Combinación farmacéutica sólida que comprende	Combinación farmacéutica sólida que comprende	Combinación farmacéutica sólida que comprende:
El ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-carboxílico o una sal del mismo	El ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-carboxílico (Pág. 60,Col. 1)	Un principio activo (ATP-2Na) (Pág. 4, Col. 2).
Polietilenglicol que tiene un punto de fusión de 20°C a 90°C	No refiere	Una sustancia similar a grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo (Polietilenglicol 6000) (Pág. 4, Col. 2).
Hidroxipropilcelulosa que tiene una viscosidad de 1 a 4 mPa.s, medida a 20°C usando una solución acuosa al 2% con un viscosímetro de Brookfield	No refiere	Un aglutinante y desintegrante de baja viscosidad (hidroxipropilcelulosa L) (Pág. 4, Col. 2).

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga una composición o combinación farmacéutica sólida de mayor estabilidad que comprende como ingrediente activo, una sustancia similar a grasa o aceite y que tiene un punto de fusión bajo (polietilenglicol 6000) y un aglutinante (hidroxipropilcelulosa).

Las diferencias entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la composición farmacéutica sólida divulgada en el documento D2 consiste en que 1.) el principio activo definido en la composición reclamada es el ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7- carboxílico y el documento D2 lo define como ATP-2Na y 2.) el documento D2 no describe la mejora en el perfil de solubilidad de las composiciones farmacéuticas resultantes. Sin embargo, divulga que al adicionar una sustancia similar a grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo (Polietilenglicol 6000) se aumenta la estabilidad durante el almacenamiento del ingrediente activo (Pág. 5, Col. 1).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la combinación farmacéutica del ejemplo 2 del documento D1 consiste en que 1.) la combinación farmacéutica sólida no refiere como excipientes una sustancia similar a grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo y un aglutinante de baja viscosidad y 2.)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

no refiere que la composición presente una sustancia similar a grasa o aceite que tenga un punto de fusión bajo y un aglutinante de baja viscosidad para mejorar la estabilidad del principio activo o la disolución de la forma farmacéutica.

El efecto que logra el sustituir el principio activo ATP-2Na por el ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7- carboxílico es que se obtiene una combinación o composición farmacéutica sólida de mayor estabilidad y disolución que las formas farmacéuticas previamente divulgadas para el principio activo ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo sustituir el principio activo de la composición farmacéutica sólida conocida en el documento D2 para hacer una combinación farmacéutica sólida de mayor estabilidad y disolución que las previamente divulgadas para el ácido 2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico.

Sin embargo, el uso de un vehículo farmacéutico que contiene una sustancia similar a grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo (polietilenglicol 6000) y un aglutinante y desintegrante (hidroxipropilcelulosa L) para una obtener una composición farmacéutica sólida de mayor estabilidad, ya está divulgada en el documento D1, a través del ejemplo A (Pág. 4, Col. 5, Líneas 35 a 65), donde se evidencia el efecto sobre la estabilidad en la tabletas de adenosina trifosfato por la inclusión del PEG 6000 al ser comparado con la composición Control B.

En cuanto a los argumentos de la solicitante frente al análisis de nivel inventivo según los cuales: 1.) el problema técnico planteado consiste en mejorar la solubilidad del ácido (2-etoxi-1-[[2'-(2,5-dihidro-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-3-il)bifenil-4-il]bencimidazol-7-ácido carboxílico o una sal del mismo y obtener una preparación sólida que lo contenga con la adición de una sustancia similar a la grasa o aceite que tiene un punto de fusión bajo y que 2.) la adición de la hidroxipropilcelulosa como aglutinante de baja viscosidad evidencia el incremento considerable en la disolución, frente al uso de un aglutinante de alta viscosidad, y 3.) que dicho efecto no podría haber sido previsto por ninguno de los documentos citados, es pertinente señalar lo siguiente:

Este despacho concluyó que el problema técnico planteado consiste en el resultado de los hallazgos que se reportan en el capítulo descriptivo de la solicitud, específicamente en lo que corresponde al campo de la invención, ya que la solicitante manifiesta que la solicitud se refiere a una composición farmacéutica sólida que es superior en estabilidad y propiedad de disolución porque comprende una sustancia aglutinante de baja viscosidad. Por otra parte y como lo afirma la solicitante, el principio activo puede ser cualquier compuesto siempre y cuando

Página 5 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

sea un compuesto cuya estabilidad en una composición farmacéutica mejore por medio de la adición de una sustancia similar a la grasa y aceite que presente un punto de fusión bajo (Fl. 61, Líneas 3 a 8.). En este orden de ideas, al redefinir el problema técnico y objeto de la solicitud en la respuesta a las objeciones de patentabilidad frente a su solicitud, se encuentra que la solución a problemas similares relacionados con la velocidad de disolución de sustancias farmacológicamente activas fue prevista en el estado de la técnica como se demuestra en el documento D1.

Adicionalmente, es conocido por la persona del oficio normalmente versada en la materia la funcionalidad de la hidroxipropilcelulosa-L(hidroxipropilcelulosa sustituida inferior) como agente desintegrante y aglutinante³, el mismo excipiente al que se recurre en el diseño de formulación reclamado y que fuera divulgado en el documento D2. En consecuencia su incorporación a una composición farmacéutica era predecible y también su efecto sobre el perfil de desintegración y disolución del activo a partir de las formas farmacéuticas. Por lo cual la reivindicación 1 se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 2 a 4 no presentan características técnicas que le concedan nivel inventivo a la solicitud, también se consideran obvias y por lo tanto, no cumplen con el Art. 18 de la Decisión 486.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud presentada, se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS SÓLIDAS QUE COMPRENDE POLIETILENGLICOL 6000 E HIDROXIPROPILCELULOSA DE BAJA SUSTITUCIÓN PARA MEJORAR LA ESTABILIDAD DEL PRINCIPIO ACTIVO Y LA DISOLUCIÓN DE LA FORMA FARMACÉUTICA ELABORADA".

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 FARMACÉUTICAS SÓLIDAS QUE COMPRENDE POLIETILENGLICOL 6000 E HIDROXIPROPILCELULOSA DE BAJA SUSTITUCIÓN PARA MEJORAR LA ESTABILIDAD DEL PRINCIPIO ACTIVO Y LA DISOLUCIÓN DE LA FORMA FARMACÉUTICA ELABORADA"

³ <http://www.ucm.es/BUCM/tesis/19911996/D/1/AD1022601.pdf> (Pág. 32)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78981

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-24629

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Takeda Pharmaceutical Company Limited., 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 20 Dic 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctora
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
cavelier@cavelier.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓