

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-296682- -9	FECHA: 2014-12-04 17:37:18
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 8
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

Asunto: Radicación: 13-296682- -9
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 15172
Folios: 8

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2012/059147				
Fecha de Presentación Internacional	16/05/2012				

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:	Rad. No. 13-296682-00000-0000	19/Diciembre/2013
Reivindicaciones:	Rad. No. 13-296682-00000-0000	19/Diciembre/2013
	Rad. No. 13-296682-00008-0000	03/Octubre/2014
Oposiciones:	Rad. No. 13-296682-00001-0000	Procaps S.A. 04/Abril/2014
	Rad. No. 13-296682-00002-0000	Lafranco S.A.S 07/Abril/2014
Respuesta del solicitante:	Rad. No. 13-296682-00008-0000	03/Octubre/2014
Prioridad:	IN 1727/CHE/2011	20/Mayo/2011
	US 61/499,856	22/Junio/2011
	EP 11305923.2	13/Julio/2011

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

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. Para tal efecto se estudia el capítulo reivindicatorio en su totalidad.

Título de la solicitud: "Composiciones farmacéuticas que comprenden fexofenadina"

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar composiciones farmacéuticas que comprenden fexofenadina, con mejor solubilidad y biodisponibilidad del principio activo.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende:

- a) 1 a 35% (p/p) de hidrocloreto de fexofenadina;
- b) Al menos 60% (p/p) de una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K9/48, 47/16, 31/4545.

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

El uso de la reivindicación 14 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

5. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Procaps

Dice la sociedad oponente que las reivindicaciones que se refieren a usos y métodos de tratamiento, los cuales no son patentables. Específicamente, en cuanto a los métodos de tratamiento señala que no tienen aplicación industrial. Por otra parte, señala que el documento WO2005062722, publicado el 14 de julio de 2005, afecta la novedad de la invención. Indica que dicha anterioridad "...describe una composición oral que comprende clorhidrato de fexofenadina y una mezcla de tensioactivos hidrófilos e hidrófobos en cantidades superiores al 60% (...) la materia pretendida ya se había divulgado con anterioridad en el documento D1 (...) carece evidentemente de NOVEDAD."

Argumentaciones de Lafrancol

Afirma la sociedad oponente que "...las composiciones y formulaciones farmacéuticas que comprenden fexofenadina en un sistema disolvente adecuado, útiles en el tratamiento de alergias, son prácticas y eventos totalmente conocidos en la industria farmacéutica..." Sustenta lo anterior con base en "The Merck Index", citando las patentes DE 3007498 y US 4254129, que se refiere al principio activo Fexofenadina. Además, señala que la solicitud carece de novedad y/o nivel inventivo frente a los documentos WO2005/062722 y US2003/180352.

Respuestas del Solicitante

En primer lugar, la solicitante modifica el capítulo reivindicatorio. Respecto a los argumentos de la opositora Lafrancol S.A.S. señala que *“se limita a enumerar unos documentos, sin indicar cuál es el efectivamente relevante para el estudio de novedad o nivel inventivo (...) sin análisis de fondo alguno sobre los mismos y frente a la invención, para llegar a conclusiones no sustentadas desde el punto de vista de patentes con respecto a la real ausencia de los requisitos de patentabilidad...”* también manifiesta que los documentos citados por la opositora corresponden a patentes de ingredientes activos como fexofenadina, por lo que no son válidos para afectar la novedad de una composición farmacéutica. Asimismo, indica que *“es claro que los documentos citados por la opositora (...) no son relevantes para el estudio del nivel inventivo de la presente solicitud, por cuanto se refieren a componentes por separado de la composición farmacéutica y (...) no sugieren o enseñan la composición farmacéutica acá reivindicada.”*

En cuanto a la oposición presentada por Procaps S.A. señala que la invención es nueva frente al documento WO2005/062722 porque este se refiere a tabletas y no hubiese sido utilizado por la persona del oficio normalmente versada en la materia porque las tecnologías usadas son muy diferentes. En cuanto al nivel inventivo indica que aunque dicho documento se considerara como el más cercano a la invención, *“...la persona del oficio normalmente versada en la materia se enfrentaría con el problema de encontrar composiciones alternativas de fexofenadina que reducen el sabor de los remanentes residuales y proporcionan una biodisponibilidad de fexofenadina mejorada. Por lo tanto, el documento D1 no conduciría al técnico medio versado en la materia a la invención reivindicada. Además, es importante resaltar que formulaciones no sólidas son más propensas a la inestabilidad química y la incompatibilidad cápsula-envoltura.”*

Respuesta del Examinador Técnico

Respecto de la oposición presentada por Procaps S.A, es importante destacar que la solicitante modificó el capítulo reivindicatorio, sin embargo, mantiene alusión a un método de tratamiento que está exceptuado de patentabilidad conforme a lo establecido por la normatividad andina, como se explicó anteriormente. En lo que tiene que ver con el documento WO2005/062722, debido a la modificación realizada por la solicitante la invención es nueva frente a este documento. Sin embargo, la invención carece de nivel inventivo frente a dicha anterioridad como se explica adelante.

En cuanto a la oposición presentada por Lafrancol S.A.S. y el documento The Merck Index, y la mención de las patentes DE 3007498 y US 4254129, referenciadas en dicho documento, no resulta útil para afectar la novedad o el nivel inventivo de la invención, toda vez que no pertenecen al mismo campo técnico de la invención, es decir, no se refieren o siquiera mencionan composiciones farmacéuticas que comprendan fexofendina. Ahora bien, respecto del documento WO2005/062722, si bien la sociedad opositora no argumenta cómo afecta la novedad o el nivel inventivo de la invención, del análisis de este documento, esta Oficina considera que desvirtúa el nivel inventivo de la invención como se expone adelante. En cuanto al documento US2003/180352 se encuentra que no afecta la novedad o el nivel inventivo de la invención toda vez que a pesar de referir composiciones que comprenden fexofenadina, dichas composiciones comprenden un elemento adicional correspondiente a un solubilizador, el cual no es elemento esencial en las composiciones de la invención.

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, 20 de mayo de 2011, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2005062722	Oral pharmaceutical composition	14/Julio/2005
D2	US 6451339	Compositions and methods for improved delivery of lipid regulating agents	17/Septiembre/2002

D1¹ divulga (resumen, reivindicaciones; pág. 2, líneas 4-7).composiciones orales sólidas que comprenden hidrocloreto de fexofenadina y una mezcla de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico. Asimismo, enseña que el área superficial del piperidinoalcohol (fexofenadina) es superior a 1.0m²/g con el fin de mejorar la biodisponibilidad del activo.

D2² enseña (resumen, col. 26, líneas 17-27, col. 28, líneas 10-16; col. 24, líneas 15 y 57, reivindicación 1) una composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende entre el 0.1% al 60% de un principio activo hidrófobo como hidrocloreto de fexofenadina y una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en una cantidad suficiente para formar una dispersión acuosa clara, así como un método para prepararlas.

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en una composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende:

- 1 a 35% (p/p) de hidrocloreto de fexofenadina;
- Al menos 60% (p/p) de una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2
Composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende	Composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende (resumen, col. 26, líneas 17-27, col. 28, líneas 10-16):
1 a 35% (p/p) de hidrocloreto de fexofenadina	Entre el 0.1% al 60% de un principio activo hidrófobo como hidrocloreto de fexofenadina (col. 24, líneas 15 y 57)
Al menos 60% (p/p) de una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico	Una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en una cantidad suficiente para formar una dispersión acuosa clara (reivindicación 1).

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D2, el cual enseña una composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende entre el 0.1% al 60% de un principio activo hidrófobo como hidrocloreto de fexofenadina y una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en una cantidad suficiente para formar una dispersión acuosa clara (resumen, col. 26, líneas 17-27, col. 28, líneas 10-16; col. 24, líneas 15 y 57, reivindicación 1).

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva según lo divulgado en el documento D2.

1 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005062722A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20050714&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

2 http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20020917&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP&CC=US&NR=6451339B2&KC=B2&ND=4

Asimismo, el documento D2 enseña que el tensioactivo no iónico hidrofóbico tiene un valor de HLB menor que 10 (reivindicación 1). Que el tensioactivo no iónico hidrofóbico se selecciona de laurato de propilenglicol, monocaprilato de propilenglicol y mezcla de éstos (Col. 11, líneas 56-67, Tabla 7). Que el tensioactivo no iónico hidrofílico tiene un valor de HLB mayor que 10 (Col. 5, líneas 28-30). Que el tensioactivo no iónico hidrofílico puede ser polisorbato 80 (Tabla 19, reivindicación 26).

Por lo tanto, las reivindicaciones dependientes 3-8 y 11 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en una composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende:

- a) 1 a 35% (p/p) de hidrocloreto de fexofenadina;
- b) Al menos 60% (p/p) de una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende	Composición farmacéutica oral de liberación inmediata que comprende (resumen):	Composición farmacéutica en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende (resumen):
1 a 35% (p/p) de hidrocloreto de fexofenadina,	Una cantidad terapéuticamente efectiva de fexofenadina o sus sales (reivindicación 1)	Entre el 0.1% al 60% de un principio activo hidrófobo como hidrocloreto de fexofenadina (párr. [0035], [0082], [0106]-[0108])
Al menos 60% (p/p) de una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico	Una mezcla de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en una proporción entre el 5% y el 95% en peso de la composición (reivindicaciones 2 y 6)	Una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en una cantidad suficiente para formar una dispersión acuosa clara (párr. [0035]).

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga composiciones orales sólidas que comprenden hidrocloreto de fexofenadina y una mezcla de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y las composiciones del documento D1 consiste en que la forma farmacéutica corresponde en una cápsula blanda para administración oral, mientras que en la anterioridad es una forma farmacéutica sólida oral.

El efecto que logra el incluir esta característica es que proporciona composiciones de hidrocloreto de fexofenadina alternativas a las del estado del arte.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de composiciones de hidrocloreto de fexofenadina alternativas a las del estado del arte.

Sin embargo, las formas farmacéuticas de hidrocloreto de fexofenadina que consisten en cápsulas blandas para administración oral habían sido divulgadas en el documento D3, que enseña una composición farmacéutica estable en la forma de una cápsula blanda para administración oral, que comprende entre el 0.1% al 60% de un principio activo hidrófobo como hidrocloreto de fexofenadina y una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico en

una cantidad suficiente para formar una dispersión acuosa clara (resumen, col. 26, líneas 17-27, col. 28, líneas 10-16; col. 24, líneas 15 y 57, reivindicación 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, desarrollará composiciones farmacéuticas estables en la forma de una cápsula blanda para administración oral, de acuerdo a lo enseñado en el documento D3, del compuesto hidrocloreto de fexofenadina del documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16) frente al documento D1, pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18) respecto de las enseñanzas de los documentos D1 y D2.

Asimismo, el documento D1 divulga que el área superficial del piperidinoalcohol (fexofenadina) es superior a 1.0m²/g con el fin de mejorar la biodisponibilidad del activo (pág. 2, líneas 4-7). Que la cantidad total de tensioactivo se encuentra entre el 5% y el 95% en peso de la composición.

En lo que tiene que ver con el pH es un parámetro que no le confiere ningún efecto técnico a la invención y su ajuste en las composiciones reivindicadas obedece a las características intrínsecas del compuesto (el clorhidrato de fexofenadina tiene valores aproximados de pKa 4 y pKb 9³).

Por su parte, el documento D2 enseña que el tensioactivo no iónico hidrofóbico tiene un valor de HLB menor que 10 (reivindicación 1). Que el tensioactivo no iónico hidrofóbico se selecciona de laurato de propilenglicol, monocaprilato de propilenglicol y mezcla de éstos (Col. 11, líneas 56-67, Tabla 7). Que el tensioactivo no iónico hidrofílico tiene un valor de HLB mayor que 10 (Col. 5, líneas 28-30). Que el tensioactivo no iónico hidrofílico puede ser polisorbato 80 (Tabla 19, reivindicación 26).

Por lo tanto, las reivindicaciones dependientes 2-12 y 14 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

La reivindicación 13 consiste en un método para preparar una composición farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, que comprende las etapas sucesivas siguientes: disolver el hidrocloreto de fexofenadina en una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico, con agitación, con el fin de obtener una mezcla homogénea; y ajustar el pH entre 5-6 usando una cantidad suficiente de un agente acidificante o basificante.

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2
Método para preparar una composición farmacéutica según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, que comprende las etapas sucesivas siguientes:	Método para preparar una composición farmacéutica que comprende un principio activo hidrófobo y una mezcla de de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico, que comprende:
Disolver el hidrocloreto de fexofenadina en una mezcla líquida de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico, con agitación, con el fin de obtener una mezcla homogénea; y	Mezclar los componentes con agitación (Col. 26, línea 54-col. 27, línea 3)
Ajustar el pH entre 5-6 usando una cantidad suficiente de un agente acidificante o basificante.	No se menciona

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un método para preparar una composición

³ En <http://pubchem.ncbi.nlm.nih.gov/compound/63002?from=summary#section=Top>. Octubre, 2006.

farmacéutica que comprende un principio activo hidrófobo y una mezcla de de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico que comprende mezclar los componentes con agitación.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el procedimiento del documento D2 consiste en que menciona que se debe ajustar el pH de la composición a un valor entre 5 y 6.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja al procedimiento reclamado en esta solicitud ya que no parece presentar ventajas respecto del método 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 suministrar un método alternativo al divulgado en el estado del arte para la elaboración de una composición farmacéutica que comprende un principio activo hidrófobo y una mezcla de de al menos un tensioactivo no iónico hidrofílico y al menos un tensioactivo no iónico hidrofóbico.

Sin embargo, hace parte de los conocimientos previos de la persona del oficio normalmente versada en la materia el hecho de que al elaborar composiciones farmacéuticas líquidas, que en este caso van a ser encapsuladas, el pH se ajusta de acuerdo las propiedades fisicoquímicas del compuesto, para el caso en particular, de acuerdo a las características de la fexofenadina, que tiene valores de pka y pkb de aproximadamente 4 y 9 respectivamente⁴.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, ajustaría el pH de las composiciones en el procedimiento de D1, de acuerdo a sus conocimientos y las propiedades fisicoquímicas del clorhidrato de fexofenadina, para llegar así al objeto de la reivindicación 13 de la solicitud, por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 13 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D2	US 6451339	1, 3-8 y 11	Novedad
D1	WO2005062722	1-12 y 14	Nivel inventivo
D2	US 6451339	1-14	Nivel inventivo

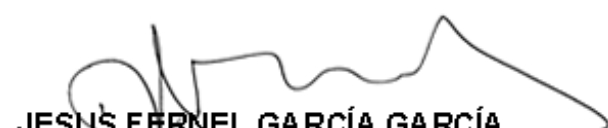
⁴ Ibidem

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 del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2014-12-09

Elaboró: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza