

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
DILIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

ASUNTO	Radicación	09 010 383
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	5

E 15208

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	
Via Nacional			
Via PCT (Fase Nacional)	☒	Capítulo I	Capítulo II ☒
No. Solicitud Internacional	PCT/IB2007/002199		
Fecha de Presentación Internacional	31/Julio/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 11 a 27	04/Febrero/2009
Reivindicaciones:	Folios 28 a 30	04/Febrero/2009
	Folios 137 a 138	25/Mayo/2010
Dibujos:	Folios 31 a 37	04/Febrero/2009
Oposiciones:	Folios 98 a 133	Procaps 28/Octubre/2009
Respuesta del solicitante:	Folios 135 a 136	25/Mayo/2010
Prioridad:	IT MI2006A001692	05/Septiembre/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: "Uso de polioles para obtener formas polimorfas estables de rifaximina".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar un procedimiento para la estabilización de la forma polimorfa β de rifaximina.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un proceso caracterizado por la adición de uno o más polioles a la rifaximina en estado sólido.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K9/16//9/20//9/50//31/437//9/28//47/10//47/26//47/36//47/38.

4. De la Solicitud de Patente

Titulo

El título hace referencia a temas que son excluidos o exceptuados de patentabilidad como es el uso de polioles. Se sugiere modificarlo para que se ajuste a las categorías de producto y/o procedimiento.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 y 2 no son claras porque hacen referencia a un proceso, pero este no se define mediante características como alguna etapa ó alguna condición específica en que debiera realizarse. Se sugiere, entonces, definir la invención por sus características esenciales, estructurales o funcionales.

Las reivindicación 2 no es clara cuando emplea el término "alquilo inferior", sin indicar los átomos de carbono que los conforman, lo que es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica, además, no es de conocimiento común en el sector farmacéutico. Se sugiere definir los radicales de manera precisa de tal manera que pueda definirse claramente el objeto de la invención, así como restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados.

La reivindicación 7 no es clara cuando emplea el término "que tiene un contenido residual de agua inferior a...", el cual es un resultado a alcanzar, no definen al proceso porque 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 reemplazarlo por las características esenciales, estructurales o funcionales, que contribuyen a la obtención de ese efecto o eliminar la reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 12 no es clara cuando emplea el término "bolsas de tabletas selladas con calor", lo cual no es una característica técnica que defina la composición farmacéutica, sino describe su presentación. Se solicita eliminar el término del pliego reivindicatorio.

5. Análisis de las Oposiciones

Argumentaciones de Procaps S.A.

Dice el oponente que la solicitud y lo reivindicado no es objeto de patentabilidad pues no cumple con dos de los tres requisitos de patentabilidad:

1. Carece de altura inventiva: señala el oponente que el documento D1 (EP1676847, publicada el 05 de julio de 2006), "[...] revela el uso de excipientes polioles en una composición que comprende rifaximina alfa, beta o γ". Por lo tanto, "[...] a la fecha de prioridad, 5 de septiembre de 2005, cualquier persona versada en la materia puede llegar a partir de su conocimiento en combinación con lo revelado en el documento D1 a derivar una formulación de rifaximina estabilizada con polioles".

2. Carece de aplicación industrial: "[...] algunas cláusulas reclaman el método terapéutico y estos no son aplicables industrialmente porque primero no se obtiene un producto o proceso; y segundo no es reproducible o repetible a escala industrial."

Respuesta del Solicitante

En cuanto al nivel inventivo, el solicitante afirma que "partiendo de D1 no es obvio pensar que los polioles con más de un grupo hidroxilo puedan tener la propiedad de

estabilizar y mantener la forma beta". Argumenta que "[...] en D1, el propilenglicol nunca se emplea para obtener y para estabilizar rifaximina [...]", agrega, "más aún, en la presente solicitud el propilenglicol no actúa como plastificante, y esto se demuestra en el ejemplo 3, en donde al ser sustituido por otro compuesto, el plastificante conocido como 1.2.3-propoanotriol triacetato, se encuentra que no se conserva la forma beta".

Por otra parte, respecto a la aplicación industrial, para superar la objeción que hace referencia al uso, el solicitante presenta un nuevo capítulo reivindicatorio "[...] en el cual se habla de un método y no de un uso".

Respuesta del Examinador Técnico

El oponente tiene razón en que composiciones farmacéuticas que contienen rifaximina beta y polioles son conocidas a la fecha de prioridad de la presente solicitud, de acuerdo a lo divulgado en el documento EP1676847, citado en la oposición. Si bien es cierto, el solicitante tiene razón en que la persona del oficio normalmente versada en la materia no puede deducir a partir de ese documento que los polioles estabilizan la forma beta de la rifaximina, también es cierto que lo actualmente reivindicado corresponde a un proceso que se caracteriza por la adición de polioles a rifaximina en estado sólido, independientemente del uso que se le dé al poliol en la formulación, pues se recuerda que los usos no son objeto de patentabilidad. Razón por la cual, el documento EP1676847, publicado el 05 de julio de 2006, desvirtúa la novedad del objeto de esta solicitud, por lo cual será tenido en cuenta en el 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 05 de septiembre de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	EP 1676847	Polymorphous forms of rifaximin as antibiotics	05/Julio/2006
D2	CO 07-84417	Formulaciones farmacéuticas gastroresistentes que contienen rifaximina	18/Enero/2008*

*Publicado en la gaceta de propiedad industrial No. 587 de 18/Enero/2008. Corresponde al documento WO2006/094737, con fecha de prioridad 07 de marzo de 2005.

D1 (folios 114 a 124) divulga (fl 118, col. 7, pár. 0048 – 0050; fl 119, col 9, ejemplo 3 y col 10, ejemplo 6) la adición de uno o más polioles como manitol, lactosa, sorbitol, almidones, gomas, polietilenglicol, derivados de celulosa, entre otros, a rifaximina α , β , γ , así como un proceso para la obtención del polimorfo β de rifaximina.

D2 divulga (fl 63 - 64; fl 73-75, ejemplo 1, reivindicaciones) la adición de uno o más polioles como etilenglicol o polietilenglicol, entre otros, a rifaximina α , β , γ , δ o ϵ .

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un proceso caracterizado por la adición de uno o más polioles a la rifaximina en estado sólido.

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

Características esenciales	D1	D2
Proceso caracterizado por:	Proceso caracterizado por:	Proceso caracterizado por:
Adición de uno o más polioles a:	Adición de manitol, lactosa, sorbitol, almidones, gomas, polietilenglicol, derivados de celulosa, entre otros (fl 118, col. 7, pár. 0048 – 0050)	Adición de etilenglicol, propilenglicol, (fl 63 - 64; fl 73-75, ejemplo 1)
Rifaximina en estado sólido	Rifaximina α , β o γ .	Rifaximina α , β , γ , δ o ϵ (reivindicaciones)

Las características esenciales del proceso de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1 y D2, los cuales enseñan la adición de uno o más polioles como manitol, lactosa, sorbitol, almidones, gomas, polietilenglicol, derivados de celulosa, entre otros, a rifaximina α , β , γ , δ o ϵ . (D1: fl 118, col. 7, pár. 0048 – 0050; D2: fl 63 - 64; fl 73-75, ejemplo 1, reivindicaciones).

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva según lo divulgado en el documento D1 y D2.

La reivindicaciones dependientes 2 y 9 – 12 no mencionan alguna característica que haga nuevo al proceso de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 3 consiste en un proceso para la preparación de rifaximina en forma polimórfica β , caracterizado porque la rifaximina en estado sólido se pone en contacto con una solución acuosa de uno o más polioles, a una concentración de 5 - 59% (p/p), a una temperatura entre 30°C y 90°C por un periodo de tiempo comprendido entre 1 hora y 24 horas, y porque tras la separación de sólidos residuales, se seca a una temperatura de entre 30°C y 80°C, a una presión ambiente o bajo vacío, por un periodo de tiempo comprendido entre 2 horas y 72 horas.

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

Características esenciales	D1
Proceso para la preparación de rifaximina en forma polimórfica β , caracterizado porque:	Proceso para la preparación de rifaximina en forma polimórfica β , caracterizado porque (fl 119, col 10, ejemplo 6):
La rifaximina en estado sólido se pone en contacto con una solución acuosa de uno o más polioles, a una concentración de 5 - 59% (p/p), a una temperatura entre 30°C y 90°C por un periodo de tiempo comprendido entre 1 hora y 24 horas.	La rifaximina en estado sólido se pone en contacto con una solución acuosa de etanol, a una temperatura de 57 $\pm$ 3°C por 30 minutos, luego a 40°C por 20 horas (fl 119, col 9, pár. 0059)
Separación de sólidos residuales, y	Separación de sólidos residuales, y
Secado a una temperatura de entre 30°C y 80°C, a una presión ambiente o bajo vacío, por un periodo de tiempo comprendido entre 2 horas y 72 horas	Secado a temperatura ambiente bajo vacío (fl 119, col 10, ejemplo 6).

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un proceso para la preparación de rifaximina en forma polimórfica β , caracterizado porque la rifaximina en estado sólido se pone en contacto con una solución acuosa de etanol, a una temperatura de 57 $\pm$ 3°C por 30 minutos, luego a 40°C por 20 horas, y tras la separación de sólidos residuales, y se seca a temperatura ambiente bajo vacío.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 3 y el proceso de D1

consiste en que la solución de cristalización del polimorfo β de rifaximina está conformada por polioles, a una concentración de 5 - 59% (p/p).

El efecto que logra el incluir esta característica es que proporciona un método alternativo para obtener el polimorfo β de rifaximina.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de procesos para la obtención del polimorfo β de rifaximina alternativos a los conocidos en el estado del arte.

Sin embargo, es de conocimiento común para la persona del oficio normalmente versada en la materia que la obtención de polimorfos se basa en técnicas como cristalización y re-cristalización basadas en la disolución de la molécula en diferentes solventes¹, por diferencias en solubilidad y modificación de parámetros adicionales como temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación, etc.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, encontraría la sugerencia o motivación suficiente para utilizar las técnicas de cristalización y recristalización basadas en la disolución de la molécula en diferentes solventes, utilizando una solución acuosa de uno o más polioles, en lugar de la solución de etanol del proceso de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión: La reivindicación 3 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

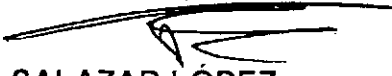
8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 1676847	1 - 2 y 8 - 12	Novedad
D2	CO 07-84417	1 - 2 y 8 - 12	Novedad
D1	EP 1676847	3	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

28 AGO. 2012

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

¹ Helman José, Farmacotecnia teórica y práctica. Tomo IV. Editorial Continental, Tercera impresión, México, Noviembre de 1982. Capítulo 30 Cristalización pág. 1103 a 1143.