

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/10-134179

**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 28 de octubre de 2010, con el N° 10-134179-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Astrazeneca AB., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DEPÓSITO FARMACÉUTICO QUE COMPRENDE N-{5-[(CICLOPROPILAMINO) CARBONIL] -2-METILFENIL} -3-FLUORO-4-(PIRIDIN-2-ILMETOXI) BENZAMIDA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/GB2009/050353 del 09 de abril de 2009.

**SEGUNDO:** Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 631 del 22 de agosto de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

**TERCERO:** Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 20098, notificado por fijación en lista el 06 de noviembre 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, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

**CUARTO:** Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 10-134179-00009-0000 del 12 de marzo de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 10 que remplace(n) 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.*"

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/10-134179

**SEXTO:** Que las reivindicaciones 1 a 10, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

**6.1. Objeto de la invención**

El problema técnico consiste en la necesidad de un depósito farmacéutico, en donde el principio activo pueda ser proporcionado en una concentración alta sostenida en el sitio de administración, para proveer su liberación de manera controlada y/o sostenida, y a su vez sea hidrolíticamente estable. Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un depósito farmacéutico (composición) que comprende micropartículas o nanopartículas del compuesto N-{5-[(ciclopropilamino) carbonil] -2-metilfenil} -3-fluoro-4-(piridin-2-ilmetoxi) benzamida, y un polímero biodegradable de ácido láctico-ácido glicólico.

**6.2. Determinación del estado de la técnica**

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 09 de abril de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

| Nº | Documento    | Título                                                                                          | Fecha de publicación |
|----|--------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1 | WO2005061465 | Amide derivatives Bearing A Cyclopropylaminoacarbonil Substituent useful as cytokine Inhibitors | Julio 7 de 2005      |
| D2 | US5876761    | Sustained Release Formulations Of water Soluble Peptides                                        | Marzo 2 de 1999      |

D1<sup>1</sup> divulga un compuesto de la fórmula I, procedimientos para su preparación, composiciones farmacéuticas que lo contienen y su utilidad en el tratamiento de enfermedades o condiciones médicas mediadas por citoquinas.

<sup>1</sup>[http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=WO2005061465&ST=advanced&locale=en\\_EP&DB=EPODOC](http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=WO2005061465&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC)

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/10-134179

D2<sup>2</sup> enseña micropartículas que comprenden una matriz polimérica, preferiblemente PLGA y formulaciones de liberación sostenida que contienen dichas micropartículas y el uso de dichas formulaciones en el tratamiento de acromegalia y cáncer.

**6.3. 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, el depósito farmacéutico reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *“Un depósito farmacéutico que comprende micropartículas o nanopartículas de N - {5-[(ciclopropilamino)carbonil]-2-metilfenil} - 3 - fluoro - 4 - (piridin-2-ilmetoxi) benzamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma...”* (Ver página 6 del radicado N° 10-134179-00009-0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

**Tabla 1**

| Características esenciales                                                                                                                                                                     | D1                                                                                                                                                         | D2                                     |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------|
| Un depósito farmacéutico (composición) que comprende:                                                                                                                                          | Composiciones que comprenden:                                                                                                                              | Composiciones que comprenden:          |
| micropartículas o nanopartículas de N - {5- [ (ciclopropilamino) carbonil ] -2- metilfenil}-3-fluoro- 4 - ( piridin-2-ilmetoxi) benzamida o una sal farmacéuticamente aceptable de la misma y, | El compuesto N - {5- [ (ciclopropilamino) carbonil ] -2- metilfenil}-3- fluoro - 4 - (piridin-2-ilmetoxi ) benzamida o una sal farmacéuticamente aceptable | Otro principio activo .Micropartículas |
| Un polímero biodegradable de ácido láctico-ácido glicólico.                                                                                                                                    | No menciona                                                                                                                                                | Matriz polimérica de PL                |

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/10-134179

Como se dijo anteriormente, los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque D1 divulga el compuesto N - {5- [(ciclopropilamino)carbonil] -2- metilfenil } - 3 – fluoro - 4 - (piridin-2-ilmetoxi) benzamida o una sal farmacéuticamente aceptable (ej.43), los cuales se incluyen en composiciones farmacéuticas.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y las composiciones del documento D1 consiste en que esta menciona el polímero biodegradable de ácido láctico-ácido glicólico (PLGA).

El efecto que logra el incluir el polímero biodegradable de ácido láctico-ácido glicólico (PLGA) es la entrega de liberación prolongada o sostenida del compuesto N - {5- [(ciclopropilamino)carbonil] -2-metilfenil }-3-fluoro-4-(piridin-2-ilmetoxi) benzamida.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar las composiciones farmacéuticas que comprenden el compuesto N- {5-[(ciclopropilamino) carbonil]-2-metilfenil }-3-fluoro-4-(piridin-2-ilmetoxi) benzamida, divulgado en D1, para obtener una composición de liberación prolongada o sostenida?.

Sin embargo, en D2 se divulgaba composiciones en forma de micropartículas (col. 7, líneas 45-51) en las cuales se utilizan polímeros para obtener un sistema de entrega sostenido de principios activos, en donde dicho copolímero es lactido:glicólido, PLGA (ejs. 1 a 5) el cual genera un medio ácido para la liberación del principio activo (col.10, literal C), y está en proporciones de 75:25 a 25:75 (col. 7, líneas 15-44).

Por otro lado cabe mencionar, que los ejemplos 1 y 2 de la presente descripción (págs. 20 a 24) muestran la obtención de micropartículas del compuesto N - {5- [ (ciclopropilamino)carbonil]-2- metilfenil }-3 – fluoro- 4-( piridin-2-ilmetoxi ) benzamida con el copolímero PLGA, en proporciones de 50:50 y de 95:5, las cuales presentan un perfil de liberación a tiempos diferentes, lo cual está de acuerdo con lo conocido en el arte previo<sup>3</sup> que divulga micro y nanopartículas obtenidas con el copolímero PGLA, mediante la técnica de microencapsulación la cual presenta ventajas (pág. 2477, col. derecha numeral 3) como son: estabilidad, rendimiento y calidad si presentar agregación o adherencia de las micropartículas), también se muestra que se puede utilizar el copolímero en las proporciones 50:50 y 85:15 (pág 2482), además se concluye que se pueden encapsular diferentes principios activos utilizando el copolímero biodegradable PLGA, para ser entregados en diferentes periodos de tiempo y por diferentes rutas, donde el perfil de liberación se puede variar por el ajuste de la composición del PLGA (diferentes proporciones pág. 2484). Además, según lo

<sup>3</sup> The manufacturing techniques of various drug loaded biodegradable poly(lactide-co-glycolide) (PLGA) devices. Biomaterials 21 (2000) 2475}2490 Rajeev A. Jain\*

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/10-134179

enseñado por Horisawa<sup>4</sup> se confirma que el copolímero PLGA se puede utilizar en proporciones de entre 100:0 a 50:50 (pág. 405, tabla 1), en composiciones emulsionadas como micro o nanopartículas para la entrega prolongada o sostenida del principio activo dexametasona, en el tratamiento de la osteoartritis, las cuales se administran por inyección directa intraarticularmente (pág 403).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, conociendo el arte previo citado, incluiría el PLGA en las proporciones ya conocidas en D2, en las composiciones del compuesto N - {5-[(ciclopropilamino)carbonil]-2-metilfenil}-3- fluoro -4-(piridin-2-ilmetoxi) benzamida, divulgado en D1 para lograr así el objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia y por lo tanto, sin altura inventiva.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 10 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Es oportuno aclarar que, los documentos D1 y D2 por separado no revelan todas las características técnicas de la invención, por lo tanto no afectan la novedad del depósito farmacéutico reivindicado, pero estos en conjunto si afectan el nivel inventivo porque ya se conocían que se podían obtener dichas composiciones con el copolímero PLGA para el mismo fin, que es la entrega de principios activos mediante liberación sostenida en diferentes tiempos, variando las proporciones de ácido láctico y ácido glicólico.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

**RESUELVE:**

**ARTÍCULO PRIMERO:** Denegar la patente de invención a la creación titulada "DEPÓSITO FARMACÉUTICO QUE COMPRENDE N-{5-[(CICLOPROPILAMINO) CARBONIL]-2-METILFENIL}-3-FLUORO-4-(PIRIDIN-2-ILMETOXI) BENZAMIDA".

**ARTÍCULO SEGUNDO:** Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Astrazeneca AB., entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella(s) procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de

---

4 Prolonged Anti-Inflammatory action of DL-Lactide/Glycolide Copolymer Nanospheres Containing Bethametasone Sodium Phosphate for Intra-Articular Delivery System in Antigen-Induced Arthritic Rabbit Pharmaceutical Research, Vol. 19, N° 4, Abril 2002.  
Página 5 de 6

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No: 27439**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

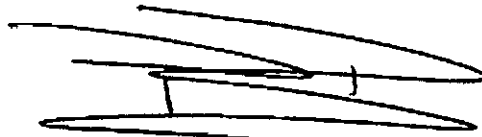
Rad. PCT/10-134179

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 10 May 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



**PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO**

Doctor(a)

**ALICIA LLOREDA RICAURTE**

notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓