

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
MAURICIO JARAMILLO C.
(Apoderado)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-028925- -00020-0000

Fecha: 2011-12-15 15:13:51 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 519 TRASLADOINFORME Folios: 1

ASUNTO	Radicación	07028925
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	014

10-03-2011

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☒ Cap. II ☐

No. Sol. Internacional PCT/US2005/030541
Fecha de Presentación Internacional 29-08-2005

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 le comunica:

1. Documentos estudiados:

1.1. <u>Descripción:</u>	(Folios: 11 a 46)	23-03-2007
1.2. <u>Reivindicaciones:</u>	Folios: 47 a 51	23-03-2007
	Folios: 170 a 174	10-03-2011
1.3. <u>Rta. Del Solicitante:</u>	Folios: 164 a 169	
1.4. <u>Prioridad:</u>	US 60/604725 27/08/2004	

2. Análisis de la Prioridad:

La prioridad de la presente solicitud corresponde al objeto reivindicado.

3. Objeto de la invención:

Título de la solicitud: "Composición que comprende una dispersión sólida comprendiendo metilamida del ácido 4{4-[3-(cloro-3-trifluorometilfenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico y la matriz y proceso para su preparación".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de composiciones farmacéuticas sólidas para aplicaciones orales que contienen el compuesto de fórmula I, con una mejor disolución, absorción y exposición en mamíferos, mayor variabilidad entre pacientes y una mayor eficacia general en el uso clínico.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una composición que comprende una dispersión sólida que comprende el compuesto de fórmula I.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/44, 9/16; A61P 35/00.

4. De la solicitud de Patente

4.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

De acuerdo con lo revelado en el capítulo reivindicatorio, la composición de la reivindicación 1 y sus dependientes es muy general puesto que no especifican sus componentes como tales, además, hay términos que no son concisos, por ejemplo: "matriz aceptable", "hidrato", "solvato", "comprende", "hidroxialquilcelulosa", "polímeros reticulados", "derivados de almidón".

5. Determinación del Estado de la Técnica:

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

Fecha de presentación de la solicitud prioritaria 27-08-2004

Teniendo en cuenta la fecha indicada, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a esta.

Se encontró como anterioridades que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D4	CO 06-5884	omega carboxiaril-difenil-úrea sustituida con flúor para el tratamiento y la prevención de enfermedades y afecciones	03 de febrero de 2005 ¹
D5	Artículo ²	Improving drug solubility for oral delivery using solid dispersions	2000

D4 (folios: 217 a 225): Divulga compuestos omega carboxiaril-difenil-úrea sustituida con flúor, especifica el compuesto ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico (regorafenib) y composiciones farmacéuticas que lo contienen, entre ellas dispersiones sólidas.

D5 (folios: 175 a 188): Divulga la utilización de dispersiones sólidas para mejorar la solubilidad de fármacos y en donde se emplean diferentes métodos o procedimientos para su elaboración.

1 Este documento corresponde a una solicitud de patente presentada en Colombia y fue presentada antes de la fecha de prioridad de la solicitud que se está estudiando.

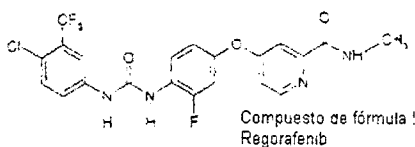
2 Leuner, C., Dressman J. "Improving drug solubility for oral delivery using solid dispersions". European Journal of Pharmaceuticals and Biopharmaceutics 50 (2000) 47-60.

6. Examen de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Novedad (artículo 16 D486)

La reivindicación 1 de la presente solicitud se refiere a:

Una composición que comprende una dispersión sólida comprendiendo el compuesto metilamida del ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico de la fórmula I o una sal, hidrato o solvato del mismo y una matriz aceptable para uso farmacéutico que comprende un compuesto seleccionado del grupo que consiste en polivinilpirrolidona, hidroxialquilcelulosa, celulosa microcristalina, carboximetilcelulosa sódica y polímeros reticulados de la misma, almidón y derivados de almidón.



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

Características técnicas esenciales	D4
metilamida del ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico de la fórmula I o una sal, hidrato o solvato del mismo	metilamida del ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico de la fórmula I o una sal
Dispersión sólida	Dispersión sólida
Matriz aceptable para uso farmacéutico que comprende un compuesto seleccionado de: polivinilpirrolidona, hidroxialquilcelulosa, celulosa microcristalina, carboximetil celulosa sódica y polímeros reticulados de la misma, almidón, derivados de almidón	Componentes que pueden estar en la composición: celulosa microcristalina, carboximetilcelulosa sódica, hidroxipropilcelulosa, almidón glicolado sódico, almidón de maíz
Formas farmacéuticas: tableta, cápsula, polvo, granulado o sachet	Tableta, cápsula, polvo, granulado

Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D4, el cual enseña composiciones de metilamida del ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico que contiene el principio activo (folio: 218, página 20), componentes de matriz para uso farmacéutico (folios: 222 y 223, páginas: 59 y 60) y las formas farmacéuticas en las que pueden estar dichas composiciones (folios: 224 y 225, páginas: 61 y 62); este documento también menciona que la composición puede estar en forma de polvo y gránulos dispersables (folio: 221, página: 49).

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D4.

La(s) reivindicación(ones) dependiente(s) 2 a 16 (folios: 170 a 172) no menciona(n) alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no es(son) nueva(s).

6.2. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La presente solicitud de patente reivindica lo siguiente: un proceso para la preparación de una composición que comprende someter simultáneamente el compuesto de la fórmula I y un agente de matriz a cualquiera de los pasos de:

Extrusión del material fundido en caliente, donde ambos se extruden en un extrusor a una temperatura de 160°C a 200°C o

Técnicas de evaporación de solventes donde ambos se disuelven en un solvente seleccionado del grupo que consiste en metanol, etanol, n-propanol, isopropanol y acetona y mezclas de los mismos, hasta que todos estén en solución y se evapora el solvente bajo vacío hasta sequedad.

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

Características técnicas esenciales	D4	D5
Proceso para la preparación de una dispersión sólida	Métodos conocidos en la técnica para la elaboración de composiciones	Proceso para la preparación de una dispersión sólida
Regorafenib	Regorafenib	No menciona
Cualquiera de los pasos de: Extrusión del material fundido en caliente donde ambos extruden en un extrusor a una T° 160°C-200°C o Técnicas de evaporación de solventes donde ambos se disuelven en un solvente seleccionado del grupo: metOH, EtOH, n-propanol, isopropanol, acetona, y mezclas. Hasta que todos estén en solución y se evapora el solvente bajo vacío hasta sequedad	No menciona	Método de extrusión de material fundido en caliente en donde el fármaco y el portador son fundidos simultáneamente, homogenizados y extruidos para después formar tabletas, gránulos, etc. La T° empleada es a la que estable el fármaco Método de solvente: disolver tanto principio activo como portador en un solvente y luego evaporar el solvente por vacío hasta producir una solución sólida.

Los documentos D4 y D5 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan el proceso para la preparación de una composición de regorafenib.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 17, y el proceso de D4 consiste en que no se especifica alguno de los pasos establecidos en la reivindicación 17.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 17, y el proceso de D5 consiste en que no se especifica el principio activo involucrado.

En la presente solicitud no hay evidencia de un efecto técnico inesperado frente a otros procedimientos de obtención de estas formulaciones.

Así que, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "Procedimiento alternativo para obtener composiciones de regorafenib".

Sin embargo, el documento D4 se relaciona con el compuesto metilamida del ácido 4-{4-[3-(4-cloro-3-trifluorometil-fenil)-ureido]-3-fluoro-fenoxi}-piridin-2-carboxílico (regorafenib) que es un fármaco usado en el tratamiento de enfermedades hiperproliferativas, incluyendo cáncer y menciona que se pueden preparar composiciones mediante técnicas convencionales.

La persona del oficio normalmente versada en la materia habría logrado lo que se reivindica en la reivindicación 17 puesto que D5 enseña algunas técnicas para la obtención de dispersiones sólidas, específicamente el método de extrusión de material fundido en caliente (página 50, col. 2, párrafo 2, folio: 178 y página 51, col. 1, párrafo 2) y método de evaporación de solvente (página 51, col. 2, folio: 179) y dichas técnicas son habitualmente empleadas.

Conclusión:
La reivindicación 17 y sus dependientes cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

7. Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D4	CO 06-5884	1 a 16	Novedad
		17 a 22	Nivel inventivo
D5	Artículo ²	17 a 22	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 días contados a partir de la fecha de la 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 _____

8011 - 2 DIC. 2011

Elaborado por: Lina Patricia Forero Tobaría
Revisado por: Consuelo Leguizamón L. *g*

2 Leuner, C., Dressman J. "Improving drug solubility for oral delivery using solid dispersions". European Journal of Pharmaceuticals and Biopharmaceutics 50 (2000) 47-60.

