

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante Resolución N° 76393 del 16 de diciembre de 2014, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: “DEPÓSITO FARMACÉUTICO QUE COMPRENDE N-{5-[(CICLOPROPILAMINO)CARBONIL]}-2-METILFENIL}-3-FLUORO-4-(PIRIDIN-2-ILMETOXI)BENZAMIDA”, con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 29 de enero de 2015 con el N° 13-153126-00011-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Astrazeneca AB, interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La recurrente no está de acuerdo con la afirmación de esta Oficina, según la cual no se superó la objeción por falta de claridad dado que no se definió la reivindicación como “composición farmacéutica de liberación sostenida” sino como “depósito farmacéutico” y que el rango de proporciones de los ácidos láctico y glicólico son muy amplios. La recurrente sostiene que la expresión “depósito farmacéutico” hace parte del preámbulo de las reivindicaciones y está definido en la descripción, por lo cual considera que es claro, conciso y está sustentado en la descripción. Considera que la relación molar de ácido láctico:ácido glicólico en el rango de 100:00 a 50:50 es conciso y es una generalización de los resultados experimentales. Asegura que las reivindicaciones dependientes 2 y 3 mencionan las realizaciones de relación de ácido láctico:ácido glicólico de 95:5 a 50:50.

Señala a continuación, que los Ejs. 1 a 6 presentan que las micropartículas con PLGA 50:50 logran alta eficiencia de encapsulación y tienen cargas de compuesto activo del 13% y se liberan *in vitro* durante 1 mes y se liberan *in vivo* durante 21 días con baja concentración en plasma (Ejs. 1, 3 y 4). Y las micropartículas con PLGA 95:5 se liberan *in vitro* durante 3 meses (Ej. 2). Agrega que la administración del mismo compuesto activo pero no como parte de este tipo de formulación presentó falta de eficacia y que se requiere el depositar el compuesto activo en la articulación por períodos sostenidos para lograr el efecto (Ejs. 5 y 6).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

En cuanto se refiere al documento D1, considera que no sugiere el objeto de la solicitud porque revela una gran cantidad de compuestos dentro de los cuales está el compuesto activo al que se refiere la solicitud y aunque incluye las composiciones farmacéuticas, no ilustra una formulación para administración parenteral.

La recurrente afirma que el documento D2 da a conocer las propiedades de las composiciones que contienen PGLA y los métodos de preparación pero no enseñan formulaciones para administración parenteral, por lo cual, considera que no subsana las deficiencias del documento D1.

Afirma, además, que el documento D3 da a conocer que la betametasona puede ser formulada en un depósito de PLGA para su administración intraarticular, mostrando de esta manera que una formulación de nanopartículas de betametasona fue segura cuando se administró en la articulación artrítica de conejo.

Agrega que se ha encontrado de manera sorprendente que el compuesto activo incluido en depósito reivindicado es estable en el microclima ácido que se crea cuando se degrada el polímero PLGA; además, que hay un alto grado de impredecibilidad para la persona normalmente versada en la materia cuando formula composiciones inyectables de nano o micropartículas.

La recurrente considera que un ejemplo de lo impredecible de formular este tipo de composiciones está dado en el documento WO2007024719 que se refiere a formulaciones inyectables de acción prolongada que requieren de un “solvente volátil” en el que se disuelven el compuesto activo y el polímero y en el que se mantienen en solución antes de la inyección.

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto en los siguientes términos:

En relación con el argumento de la recurrente según el cual no está de acuerdo con esta Oficina cuando afirma que no se superó la objeción por falta de claridad dado que no se definió la reivindicación como “composición farmacéutica de liberación sostenida” sino como “depósito farmacéutico”, esta Oficina aclara que la expresión “depósito farmacéutico” no es común en el campo técnico para definir una forma farmacéutica comercial. De hecho, como se conoce bien en el campo técnico (Aulton¹), el depósito se forma

¹Pharmaceutics: the science of dosage form design. Aulton, Michael E., 2da. Ed. Elsevier Ltd, Philadelphia, 2002.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

dentro del organismo después de aplicar una composición que contiene un compuesto activo que está suspendido en un vehículo insoluble en los fluidos corporales, depósito que es un reservorio de compuesto activo que se libera lentamente en la circulación sistémica. Estas preparaciones son administradas por inyección intramuscular profunda en los músculos esqueléticos o en el tejido subcutáneo. Tales sistemas incluyen microesferas sólidas, microesferas poliméricas biodegradables (por ejemplo PLGA). Más generalmente, las inyecciones subcutáneas permiten que el compuesto activo sea colocado cerca de los vasos sanguíneos capilares y el compuesto activo se difunde después dentro de los vasos sanguíneos capilares.

Con respecto a los rangos de proporciones de los ácidos láctico y glicólico, es cierto que son muy amplios porque una relación molar de ácido láctico:ácido glicólico en el rango de 100:00 a 50:50 significa que la proporción de ácido láctico es de 50 hasta 100 y de ácido glicólico es de 0 a 50 y teniendo en cuenta la combinación de proporciones, resulta un número muy grande de polímeros reivindicados, de manera que en realidad es poco definido y no es conciso. De otro lado, contrario a lo afirmado por la recurrente, solamente fueron ejemplificadas las proporciones 50:50 y 95:5, de manera que los rangos reivindicados no son una generalización de los ensayos presentados.

Con relación a los argumentos según los cuales: los Ejs. 1 a 6 presentan que las micropartículas con PLGA 50:50 tienen cargas de compuesto activo del 13%, logran alta eficiencia de encapsulación y se liberan *in vitro* durante 1 mes e *in vivo* durante 21 días alcanzando baja concentración en plasma (Ejs. 1, 3 y 4), y las micropartículas con PLGA 95:5 se liberan *in vitro* durante 3 meses (Ej. 2), así como que la administración del mismo compuesto activo en otro tipo de formulación presentó falta de eficacia y que se requiere el depositar el compuesto activo en la articulación por períodos sostenidos para lograr el efecto (Ejs. 5 y 6), esta Oficina aclara que todos estos resultados son efecto de la conocida técnica de microencapsulación con un polímero PLGA, como enseña el estado de la técnica; así, el documento D2 enseña la técnicas de fabricación de formas de liberación de PGLA y enseña las micro y las nanopartículas obtenidas con el copolímero PGLA, mediante la técnica de microencapsulación (Pág. 2477, Col. derecha, numeral 3), y el documento D3 menciona nanoesferas de PGLA que contienen fosfato sódico de betametasona, para la liberación sostenida del activo, el donde el PGLA se puede utilizar en proporciones de 100:0 a 50:50 (Resumen, Pág. 405, Tabla 1). Por lo cual, ante la ausencia de efecto técnico sorprendente, se concluye que el objeto de la solicitud es obvio para la persona normalmente versada en la materia, frente a los documentos D1 y D3 (o D2), y no tiene nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

Por otra parte, en relación con el argumento según el cual el documento D1 no sugiere el objeto de la solicitud porque revela una gran cantidad de compuestos dentro de los cuales está el compuesto activo al que se refiere la solicitud y aunque incluye las composiciones farmacéuticas, no ilustra una formulación para administración parenteral, esta Oficina aclara que el examen de nivel inventivo se realiza teniendo a la vista las enseñanzas de los dos documentos D1 y D3 (además también del documento D2); el documento D1 enseña el compuesto activo de la composición reivindicada y el documento D3 revela nanoesferas de PGLA para la liberación sostenida del activo fosfato sódico de betametasona, donde el PGLA está en proporciones de 100:00 a 50:50; de manera que para la persona normalmente versada en la materia, ante la ausencia de efecto técnico sorprendente, era obvio formular una composición con uno de los compuestos activos divulgados en el documento D1 y el polímero PLGA que se enseña en el documento D3 (o D2), de donde se infiere que el objeto reivindicado no tiene nivel inventivo.

En referencia al argumento de la recurrente según el cual el documento D2 da a conocer las propiedades de las composiciones que contienen PGLA y los métodos de preparación, pero no enseñan formulaciones para administración parenteral, por lo cual considera que no subsana las deficiencias del documento D1, esta Oficina aclara que el documento D2 enseña las técnicas de preparación de formas de liberación en micro y nanopartículas que contienen PGLA y presenta las ventajas de la liberación sostenida (Pág. 2477, Col. derecha, numeral 3), de manera que sugiere claramente a la persona normalmente versada en la materia las composiciones de liberación sostenida en forma de micropartículas o nanopartículas que contienen PGLA y como se explicó, es parte de sus conocimientos comunes que estas composiciones se aplican parenteralmente (es decir por inyección), por lo tanto, puede concluirse que el objeto reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo.

Por otra parte, resulta del caso señalar que el documento D3 da a conocer que la betametasona puede ser formulada en nano esferas de PLGA para su administración intraarticular, mostrando de esta manera que una formulación de nanopartículas de betametasona fue segura cuando se administró en la articulación artrítica de conejo. Además, el documento D3 menciona que las nanoesferas de PGLA que contienen fosfato sódico de betametasona, para la liberación sostenida del activo, contienen el PGLA en proporciones de 100:0 a 50:50 (resumen, Pág. 405, Tabla 1), es decir, en las mismas proporciones que se reivindican en la solicitud, por lo cual este documento, junto con las enseñanzas del documento D1, anula el nivel inventivo de la solicitud, de manera que no cumple con los requisitos de patentabilidad.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

Ahora bien, con referencia a su manifestación en el sentido que se ha encontrado de manera sorprendente que el compuesto activo incluido en depósito reivindicado es estable en el microclima ácido que se crea cuando se degrada el polímero PLGA y que hay un alto grado de impredecibilidad para la persona normalmente versada en la materia cuando formula composiciones inyectables de nano o micropartículas, esta Oficina aclara que el hecho de que el compuesto activo sea estable frente al polímero PLGA no es un efecto inesperado porque el polímero PLGA es un excipiente muy utilizado para elaborar composiciones farmacéuticas de liberación sostenida, dado que es compatible con la mayor parte de los compuestos activos (tal como enseñan los documentos D2 y D3). De otro lado, es obvio que el formulador elija los excipientes de la composición farmacéutica que no sean reactivos con el compuesto activo. Lo cual se puede predecir en cierto grado, porque se conoce de manera general que ciertos excipientes son compatibles con compuestos que tienen reacción ácida y son incompatibles con compuestos que tienen reacción alcalina y viceversa, de manera que la persona normalmente versada en la materia tiene a su alcance los conocimientos teóricos para elegir uno u otro excipiente y a la vez la posibilidad de realizar los ensayos de rutina para corroborar la estabilidad del producto terminado, por lo tanto, se reitera la falta de nivel inventivo del objeto reivindicado.

En relación con el argumento de la recurrente según el cual es impredecible formular este tipo de composiciones porque el documento WO2007024719 se refiere a formulaciones inyectables de acción prolongada que requieren de un “solvente volátil”, en el que se disuelven el compuesto activo y el polímero y en el que se mantienen en solución antes de la inyección, esta Oficina aclara que también la formulación objeto de la solicitud requiere que sea disuelta en un solvente antes de inyectar, como enseña la descripción (Pág. 23). Por lo tanto, este documento, que enseña las proporciones de 100:0 a 50:50, incluyendo la proporción 95:5 (Pág. 14, Párr. 2), indica también a la persona normalmente versada en la materia, cómo es posible obtener el objeto de esta solicitud con los efectos mencionados, los cuales de ninguna manera resultan sorprendentes, por tanto, el objeto en cuestión no cumple con los requisitos que hacen posible el otorgamiento de patente.

Por lo anterior, se reitera que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad legalmente previstos, específicamente el de nivel inventivo; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:50390

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/13-153126

En virtud de lo expuesto, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución N° 76393 del 16 de diciembre de 2014, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Astrazeneca AB, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 18 Ago 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE, notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Revisó: Carlos Alberto Ortiz Lopez
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: JosÉ Luis Londoño FernÁndez