

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

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 11 de marzo de 2009, con el N° 09-025191-00000-0000, por la sociedad Bayer Schering Pharma Aktiengesellschaft., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada: "4-[4-(((4-CLORO-3-(TRIFLUOROMETIL)FENIL)CARBAMOIL)-AMINO)-3-FLUOROFENOXI]-N-METILPIRIDINA-2-CARBOXAMIDA-MONOHIDRATO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2007/008503 del 29 de septiembre de 2007.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 615 del 20 de abril de 2010, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 12484 y notificado por fijación en lista el 18 de junio 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 visibles a folios 132 a 139 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-025191-00006-0000 del 26 de noviembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 4 (Fl. 153) que reemplazan 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.*"

SEXTO: Que la reivindicación 1 contenida en el folio 153, no cumple con el requisito de

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327

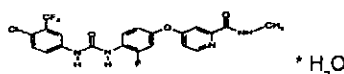
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

novedad. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención:

El problema técnico planteado consiste en la necesidad de suministrar una forma cristalina del compuesto 4-[4-([(4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida más estable para la fabricación de composiciones farmacéuticas. Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona un compuesto de la fórmula (I).



6.2. 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 invocada, es decir, el 11 de octubre de 2006

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO 2006/026500	New pharmaceutical compositions comprising 4-(4-(3-(4-chloro-3-trifluoromethyl-phenyl)-ureido)-3-fluorophenoxy)-pyridine-2-carboxylic acid for the treatment of hyper-proliferative disorders.	09/marzo/2006
D2	Remington Farmacia, 19 Ed. Editorial Panamericana. Tomo I páginas 371 a 373 y Tomo II páginas 2226 a 2231 y 2446	Capítulo 20. Cinética de la formación de partículas. Capítulo 83. PREFORMULACIÓN.Polimorfismo. Capítulo 91. Polvos Precipitación y cristalización.	1998

El documento D1^[1] divulga el ácido 4-[4-([(4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida o metilamida del ácido 4-[4-([(4-cloro-3-(trifluorometilfenil[4-[4-([(4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]ureido)-3-3-fluorofenoxi] -piridina-2-carboxílico sus solvatos, hidratos, sales farmacéuticamente aceptables, o una combinación de éstos (Fl. 8, líneas. 1-15)

¹:http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20070515&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=MX&NR=2007002397A&KC=A&ND=2

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

El documento D2² enseña el estudio del polimorfismo (formas cristalinas) como una tarea rutinaria dentro del campo farmacéutico, específicamente en las etapas de preformulación de preparados farmacéuticos y que la variedad de formas cristalinas de un compuesto permite obtener diferencias en las propiedades como solubilidad, estabilidad, velocidad de disolución entre otras. (Fls. 177-178 y 250 a 260)

6.3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D186)

Del compuesto

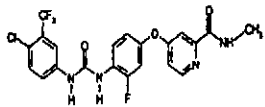
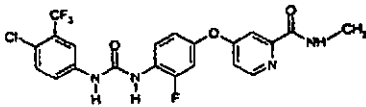
6.4. Novedad.

Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486: *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida"*.

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no es nuevo, teniendo en cuenta que, la reivindicación 1 está referida a: "4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida monohidrato" (Fl. 153).

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

Tabla 1

Características esenciales	D1
El compuesto de fórmula II  * H₂O compuesto II que corresponde al 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida monohidrato.	El compuesto de fórmula I  compuesto I que corresponde al 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida que incluyendo sus hidratos.

Las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, el cual da a conocer el compuesto de fórmula (I): 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida o

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

metilamida del ácido 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometilfenil)ureido]-3-fluorofenoxi]-piridina-2-carboxílico sus solvatos, hidratos, sales farmacéuticamente aceptables, o una combinación de éstos (Fl. 8, Ins. 1-15)

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

De los procedimientos

6.5. 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 procedimiento reclamado en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 2 se refiere a: “Un procedimiento para la preparación del compuesto de la fórmula (II)...” (Ver página 11 del radicado N° 09-025191-00006-0000)

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 2

Características esenciales		D1	D2
Característica A	Un procedimiento para preparar el compuesto:	Un procedimiento para preparar el compuesto:	Un procedimiento de recristalización:
Característica B	4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida monohidrato	4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida clorhidrato	No refiere
Etapas 1	Disolver el 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida en un disolvente inerte	Disolver el 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida en un	No refiere

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

Características esenciales		D1	D2
		tetrahidrofurano	
Etapas 2	Añadir agua hasta precipitación	No refiere	Añadir agua hasta precipitación

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la materia reclamada definida en la reivindicación 2 porque divulga un procedimiento para preparar el clorhidrato de la 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamid el cual comprende las etapas de disolver el compuesto base en un disolvente inerte como tetrahidrofurano anhidro y adicionar HCl en dioxano.

La diferencia entre la solicitud, definida en la reivindicación 2 y el procedimiento definido en el documento D1 consiste en que la solicitud refiere la etapa de añadir agua hasta precipitación y el documento D1 no refiere esta posibilidad.

El efecto que logra el incluir incluir la etapa de añadir agua hasta precipitación en el procedimiento divulgado en el documento D1 en obtener la sal monohidrato de la 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así como modificar el procedimiento divulgado en D1 para obtener la sal monohidrato de la 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida.

Sin embargo, dado que el documento D2 refiere que durante los procesos de cristalización algunos compuestos pueden tener la tendencia a atrapar a una relación molar fija moléculas del solvente en estado cristalino, los cuales se denominan solvatos y si el solvente atrapado es agua se denominan hidratos. (Fl. 235, columna 2).

En referencia a los argumentos del solicitante, según los cuales: el documento D1 no describe el monohidrato del compuesto sino que únicamente dice que puede haber hidratos del compuesto y que el monohidrato no se menciona específicamente en el documento D1, por lo tanto, la reivindicación 1 es novedosa y que con la modificación del capítulo reivindicatorio se logró que las reivindicaciones de procedimiento fueran más detalladas, este Despacho aclara que:

El documento D1 divulga específicamente el compuesto de fórmula (I) correspondiente a la 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida o como lo refiere el documento D1 la metilamida del ácido 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil] carbamoil] amino)-3-fluorofenoxi)ureido]-3-3-fluorofenoxi]-piridina-2-carboxílico y no sólo comprende el compuesto de la fórmula (I) sino también a sus solvatos, hidratos, sales farmacéuticamente aceptables, o una combinación de estos (Fl. 8, Ins. 1-15) y puesto que el solicitante define la reivindicación 1 en la forma de compuesto y no en la forma de una forma cristalina es claro que la divulgación de D1 afecta su novedad.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

En cuanto a las modificaciones efectuadas por la solicitante al capítulo reivindicatorio, específicamente frente al procedimiento de elaboración del monohidrato de la 4-[4-(((4-cloro-3-(trifluorometil)fenil]carbamoil]amino)-3-fluorofenoxi]-N-metilpiridina-2-carboxamida, es pertinente señalar que la solicitante no refiere características técnicas esenciales de un procedimiento que corresponden a una serie de etapas ordenadas que indiquen la totalidad de condiciones necesarias para obtener el producto, permitiendo a una persona del oficio normalmente versada en la materia comprender directamente y sin ambigüedad los pasos para la fabricación del producto, sino que se restringe a mencionar un proceso de precipitación del compuesto que es la simple aplicación de un concepto fundamental de la mecánica de polvos y de los medios para producirlos y manipularlos como lo refiere el documento D2 (Fl. 371, columna 1), con el fin de obtener formas y hábitos cristalinos diferentes.

Para una persona normalmente versada en la materia es conocido que aplicando los métodos y conocimientos generales sobre las formas cristalinas revelados en el documento D2 a cualquier compuesto (Ej. el compuesto divulgado en el documento D1) y utilizando las técnicas de cristalización y recristalización basadas en la disolución de la molécula en diferentes solventes, tal como lo establece la bibliografía básica utilizada por el técnico medio³⁾ resulta obvio diseñar una secuencia de cristalización-recristalización en diferentes solventes o estos mismos en diferentes proporciones, con el ánimo de obtener formas sólidas de interés a partir de un compuesto base, más aún si se conoce el fundamento teórico para la obtención de cristales por diferencias en solubilidad y modificando parámetros adicionales como temperatura, velocidad de enfriamiento, agitación, presión, evaporación etc..., con lo que se tendría expectativa razonable de encontrar ordenamientos cristalinos como señalados en el capítulo descriptivo de la solicitud. Por lo tanto, las reivindicaciones 2 a 4 no cumplen con el requisito de nivel inventivo según las enseñanzas de los documentos D1 y D2.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "4-[4-(((4-CLORO-3-(TRIFLUOROMETIL)FENIL]CARBAMOIL]AMINO)-3-FLUOROFENOXI]-N-METILPIRIDINA-2-CARBOXAMIDA MONOHIDRATO" de acuerdo con la modificación presentada por la sociedad solicitante.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Bayer Schering Pharma Aktiengesellschaft., entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 27327

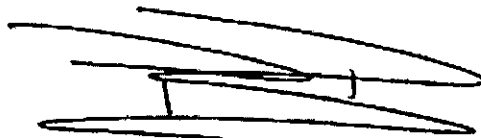
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-25191

ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de 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
JAIME EDUARDO DELGADO VILLEGAS
mde@mdelaw.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓