

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 008804

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT 00 93680

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E)
en ejercicio de sus facultades legales, especialmente de las conferidas en el
numeral 54 del artículo 3, del Decreto 1687 de 2010, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante la Resolución No. 21820 del 30 de abril de 2009, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó la solicitud de patente de invención denominada "COMPUESTOS DE PIRROLO [2,3-d] PRIMIDINA", con fundamento en los artículos 14 y 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar la solicitud no cumple con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el día 03 de junio de 2009, con el número 00 093680 00014 0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, el doctor Carlos R. Olarte, en su calidad de apoderado de la sociedad Pfizer Products INC, presentó recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

En primer lugar, considera el recurrente que una persona versada en la materia siguiendo las enseñanzas de D2 y D3, por mucho, se encontraría motivado a reemplazar la posición 4 de el núcleo 7Hpirrolo[2,3-d]pirimidina con una amina sustituida con un anillo mono o bicíclico seleccionado entre fenilo, piridina, tetralina, indano, 2-oxindol, quinolina, isoquinolina e indol (de acuerdo con D3), o con una amina sustituida por fenilo o por bencilo (de acuerdo con D2).

Adicionalmente, argumenta que incluir un anillo de piperidina en los compuestos de la solicitud presentada, en lugar de un anillo de fenilo (D2) o heteroarilos (D3), no es obvio dadas las diferencias fisicoquímicas entre los grupos.

Por otro lado, señala el interesado que *"D2 enseña que los compuestos allí revelados son inhibidores específicos de tirosin y/o serin proteinquinasas. A su vez, D3 no menciona ninguna actividad selectiva sobre enzima alguna o receptor específico"*.

El recurrente manifiesta que no existen enseñanzas en el arte previo que muestren que compuestos con la configuración estructural de la invención reclamada, serían específicamente activos sobre proteinquinasas JAK3. Asimismo, solicita que se citen las secciones específicas de los documentos D2 y D3 que muestren esta enseñanza y brinden una expectativa razonable al técnico versado en la materia, sobre qué compuestos con un núcleo específico de N-(piperidin-4-yl)-7H-pirrolo[2,3-d]pyrimidin-4-alkyl(C₀₋₂)aminas proporcionan una actividad útil en la modulación selectiva de receptores proteinquina JAK3. 

311 8804

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 008804

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT 00 93680

El recurrente hace referencia a unos datos aportados, que muestran "valores de IC_{50} para 61 compuestos de la invención y constituyen suficiente evidencia de la actividad de los compuestos de la presente invención sobre los receptores de quinasa JAK3".

Alega el recurrente que el examinador falla en explicar por qué el compuesto específico de la reivindicación 22, que demostró una actividad IC_{50} de 3.4nM frente a la quinasa JAK3, no es inventivo. Considera que el compuesto es nuevo e inventivo porque tiene una estructura inesperada y proporciona un efecto inesperado.

Por otro lado, señala que no se demostró específicamente cuales eran las enseñanzas del arte previo que le permitirían a una persona normalmente versada en la materia a obtener la materia reclamada como, por ejemplo, las que indiquen que la "inclusión de un grupo de piperidina en lugar de un grupo de fenilo o heteroarilo, podría modificarse la selectividad de un compuesto con actividad específica sobre serin y/o tirosin quinasas y obtener actividad específica sobre proteinquinasa JAK3".

Considera el interesado que se realizó un análisis en retrospectiva (hindsight), al señalar "que para la SIC es simple argumentar en relación con la selectividad de los compuestos de la invención, que revelar una actividad específica de compuestos novedosos no es inventivo, puesto que la actividad terapéutica final es similar a la de compuestos cercanos estructuralmente al arte previo". Agrega que no se debe anticipar a los resultados presentados en la invención, pues en dado caso todo objeto de solicitud de patentes sería obvio, sin tener en cuenta el trabajo, el intelecto y la creatividad involucrada en la invención.

El recurrente afirma que las proteínas proteinquinasas son un amplio género de enzimas y no se puede asegurar que diferentes subgéneros, como las serin y/o tirosin quinasas, muestran la misma configuración estructural de las proteinquinasa JAK3 y, muchos menos, que los compuestos activos sobre un tipo particular de estas enzimas puedan llegar a inactivarlas a todas.

Por último, el apoderado afirma que en muchos países han concedido patente a solicitudes equivalentes a la presentada, como es el caso de Perú y Bolivia, que al igual que Colombia son miembros de la Comunidad Andina de Naciones y se rigen por la misma legislación en propiedad intelectual.

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

En primer lugar, con relación a que un experto en la materia sólo reemplazaría la posición 4, es importante aclarar que la expresión "anillo mono o bicclico" sugiere al experto en la materia "fenilo, piridina y también piperidina", porque para el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 008804

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT 00 93680

experto es obvio reemplazar el anillo piridin (insaturado) por el anillo piperidin (saturado), que es un grupo biosótero, con el fin de lograr compuestos para tratamiento de condiciones mediadas por proteinquinasa. Así, el experto está motivado porque conoce la estrategia del bioisosterismo para diseñar compuestos, que consiste en el reemplazo de un grupo por otro, que es similar, en primer lugar, en tamaño, volumen, distribución electrónica de los átomos; en segundo lugar, en grado de solubilidad lipídica y acuosa, para poder predecir la alteración de propiedades fisicoquímicas; en tercer lugar, en reactividad química de los grupos funcionales y de los grupos bioisósteros, para predecir las alteraciones en el proceso de biotransformación, incluyendo la eventual alteración en el perfil tóxico de los metabolismos y, en cuarto lugar, en la capacidad de formación de enlaces de hidrógeno inter o intramoleculares.

En este caso específico, el reemplazo de piridin por piperidin es un tipo de bioisosterismo clásico, del tipo de reemplazo de anillos bioequivalentes, por lo cual los compuestos se consideran nuevos, pero debido a que su efecto era de esperarse, se consideran que carecen de nivel inventivo (Folios 142-145).

Argumenta el recurrente que incluir piperidina en lugar de fenil o heteroarilos, no es obvio. Sin embargo, contrario a esta afirmación, la piperidina es similar al fenil y a heteroarilos, en su tamaño, distribución electrónica, solubilidad, reactividad química, capacidad de formación de enlaces de hidrógeno, razón por la cual se consideran grupos biosósteros y así el intercambio de uno por otros es obvio para la persona técnica normalmente versada en la materia.

Por otra parte, en relación con los argumentos sobre D2 y D3, se reitera que D2 enseña compuestos que tienen un radical fenil e inhiben la tirosin proteína quinasa y son indicados para tratamiento de enfermedades hiperproliferativas. Asimismo, D3 da a conocer compuestos que tienen un radical piridin e inhiben la tirosina quinasa y están indicados en el control de enfermedades del sistema inmune, cáncer y complicaciones debidas a diabetes, lo cual sugiere al experto en la materia los compuestos de esta solicitud, que tiene radical piridin con actividad sobre la proteína quinasa. El hecho de dilucidar el mecanismo de acción específico de los compuestos reivindicados sobre la proteína quinasa JAK3 no les concede el carácter de inventivos, ya que la actividad se debe al núcleo central conocido y no al grupo piperidin y, por lo tanto, la indicación terapéutica de unos y otros es la misma, esto es, como agentes inmunosupresores, tratamiento de lupus, esclerosis múltiple, artritis, diabetes, cáncer, asma y leucemia.

En relación con que no existe sugerencia alguna en el arte previo, este Despacho considera que justamente porque la actividad sobre proteinquinasas JAK3 se debe al núcleo específico de las N-(piperidin-4-yl)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-alkyl(C₀-2)aminas, es que se considera que el hecho de dilucidar este mecanismo de acción no los hace inventivos, porque este núcleo, al cual se debe la actividad



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 008804'
Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT 00 93680

sobre los receptores quinasa JAK3, está presente tanto en los compuestos del estado de la técnica como en los compuestos reivindicados (Folios 142-143).

Por otro lado, frente a los datos presentados por el recurrente, es claro que los compuestos reivindicados son activos sobre los receptores quinasa JAK3, pero también es cierto que la mencionada actividad se debe al núcleo que contienen tanto los compuestos de la solicitud como los compuestos conocidos. Teniendo en cuenta que este núcleo se daba a conocer en el estado de la técnica, el experto en la materia esperaría que compuestos que conservan el núcleo activo (llamado grupo farmacofórico) y sólo difieren en el sustituyente piperidina (en lugar de piridina), tengan el mismo tipo de actividad.

Teniendo en cuenta lo relacionado con la reivindicación 22, esta Oficina aclara que el compuesto específico de esta reivindicación, que demostró actividad IC₅₀ de 3.4nM frente a la quinasa JAK3, no es inventivo por la misma razón que los compuestos anteriores, es decir, porque era de esperarse que el compuesto que tiene el núcleo activo y el grupo piperidina (que es biosótero de piridina), fuera activo sobre los receptores quinasa JAK3, debido a que la actividad se debe precisamente al núcleo.

El recurrente señala que en el examen de fondo no se especifica las enseñanzas del arte previo. Al respecto, se reitera que incluir un grupo piperidina en lugar de fenilo o heteroarilo es la aplicación de bioisosterismo en el diseño de los compuestos, dado que se pretende cambiar un grupo por otro similar (en tamaño, distribución electrónica, solubilidad, reactividad química, capacidad de formación de enlaces de hidrógeno) la actividad de los compuestos diseñados será esperada. En este caso concreto, la actividad específica sobre proinquinasa JAK3 no se debe al grupo piperidina, sino a la estructura central de los compuestos, que ya es conocida, motivo por el cual los compuestos se consideran nuevos, pero dado que el efecto era de esperarse carecen de nivel inventivo.

De conformidad con lo expuesto por el recurrente frente al análisis en retrospectiva, esta Despacho reitera que la actividad mencionada no se debe al grupo introducido en los compuestos conocidos, puesto que este es un grupo biosótero del grupo previo. Por lo demás, es del caso aclarar que, contrario a lo que alega el recurrente, el análisis de patentabilidad no partió de la solución sino del estado del arte previo que demuestra que era posible prever los compuestos reivindicados.

Por otro lado, en relación con los argumentos de las proteínas proteinquinasas, es cierto que la configuración estructural de las proteínas proteinquinasas (serin y/o tirosin quinasas) es diferente de la configuración estructural de la proteinquinasa JAK3, por lo cual los compuestos que son activos sobre una de ellas podría no serlo sobre otras. 

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN

Por la cual se resuelve un recurso de reposición, **008807**

Rad. PCT 00 93680

Para este caso particular, era de esperarse que los compuestos en estudio fueran activos sobre una y sobre otra, ya que son compuestos que tienen una mínima diferencia estructural con los compuestos activos conocidos. El soporte es el bioisosterismo, que es conocido por un experto medio en la materia y, como se explicó anteriormente, consiste en reemplazar dentro de un compuesto, un grupo particular por otro de características similares, con la esperanza de formar un compuesto nuevo que tenga el mismo tipo de propiedades.

Por último, el recurrente señala que en otros países de la Comunidad Andina de Naciones fueron otorgadas patentes a solicitudes equivalentes a la presentada. Es preciso anotar que las patentes otorgadas en otras oficinas no constituyen un indicio de patentabilidad para esta Oficina, como quiera que, en materia de patentes, imperan los principios de territorialidad y de autonomía, según los cuales los derechos de propiedad industrial se circunscriben al ámbito geográfico y normativo en el que se concedieron, de tal manera que cada país es autónomo al momento de conceder o denegar un privilegio de patente de invención.

Así mismo, es pertinente recordar el principio de independencia en relación con el estudio de patentabilidad que realizan otras oficinas de patentes. Este principio significa que *"cada país miembro juzgara la validez de las patentes que otorgue conforme a sus reglas generalmente aplicables a tales patentes, sin alterar sus efectos en función de las reglas o estado jurídico que correspondan a la misma invención patentada en otros países de la Unión o fuera de esta"*¹.

Al respecto, el Tribunal de Justicia Andina ha señalado:

"El sistema de otorgamiento de patentes que se adoptó en la Comunidad Andina se encuentra soportado en la actividad autónoma e independiente de las Oficinas Competentes en cada País Miembro. Dicha actividad, que aunque de manera general se encuentra regulada por la normativa comunitaria, deja a salvo la mencionada independencia y es así...como regula el procedimiento para la obtención de una patente e instaura en cabeza de las Oficinas Nacionales Competentes el trámite del procedimiento y del respectivo examen de patentabilidad.

Que se haya obtenido una patente de invención en un País Miembro no significa que indefectiblemente se deba conceder dicha patente de invención en Otro País Miembro, así como si se ha negado la solicitud de patente de invención en un País Miembro se deba negar igualmente en otro".

Así mismo, el Tribunal señala: *"No se está afirmando que la oficina de patentes no tenga límites a su actuación y que no puede utilizar como precedentes sus propias actuaciones. Lo que está diciendo es que la oficina de patentes tiene la obligación en cada caso de hacer un análisis de patentabilidad de conformidad con la normativa vigente y teniendo en cuenta los aspectos y pruebas que obran en cada*

¹ Proceso 51 IP 2008, refiriéndose a convenio de París, el Dr. Guillermo Cabanellas.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN 008804'
Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT 00 93680

*trámite. Además, los límites a la actuación administrativa de dichas oficinas se encuentran dados por la propia norma comunitaria y las acciones judiciales para defender la legalidad de los actos administrativos proferidos*².

Así las cosas, cada oficina de patentes es autónoma de realizar los análisis correspondientes y, según los resultados, toma una decisión, siempre y cuando se cumplan con las disposiciones normativas que regulan la materia.

En ese orden de ideas, se sostiene que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos exigidos para su patentabilidad; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio (E),

RESUELVE

ARTÍCULO PRIMERO: CONFIRMAR la decisión contenida en la Resolución No. 21820 del 30 de abril de 2009, por medio de la cual se denegó la solicitud de patente de invención a la creación denominada "COMPUESTOS DE PIRROLO [2,3-d] PIRIMIDINA".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente Resolución al doctor Carlos R. Olarte, en su calidad de apoderado de la sociedad Pfizer Products INC, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por lo cual queda agotada la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá, D.C., a los

18 FEB. 2011'

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO (E),



ALEJANDRO GIRALDO LÓPEZ

Doctor
Carlos R. Olarte
Diagonal 34 No. 5 - 28
Bogotá D.C.
202097

² Proceso 51 IP 2008