

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78862

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/09-149835

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 31 de diciembre de 2009, con el N° 09-149835-00000-0000, por la sociedad UCB PHARMA S.A, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE TIAZOL FUSIONADOS COMO INHIBIDORES DE QUINASA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/GB2008/02194 del 24 de junio de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 627 del 20 de abril de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 15167 y notificado por fijación en lista el 28 de agosto 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 107 a 110 del cuaderno administrativo, 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° 09-149835-00006-0000 del 20 de noviembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 11 (Fls. 120 y 121) 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 las reivindicaciones 1 a 11 contenidas en los folios 120 y 121, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

Página 1 de 5

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 348219942

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78862

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/09-149835

El objeto de la invención consiste en la necesidad de suministrar compuestos útiles como inhibidores selectivos de PI3 quinasa. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) sus sales y composiciones que lo contienen.

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 26 de Junio de 2007.

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

Nº	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2006114606	Fused Thiazole derivatives as kinase inhibitors	Noviembre 2 del 2006
D2	Libro	Foye's principles of Medicinal Chemistry	2002

D1¹, enseña el compuesto derivado de tiazol fusionado con actividad como inhibidores de quinasa de fórmula (I), sus sale y composiciones que lo contienen.

D2² se refiere al bioisosterismo como herramienta para la modificación de compuestos.

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"*.

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20061102&CC=WO&NR=2006114606A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20061102&CC=WO&NR=2006114606A1&KC=A1

² Foyer's principles of Medicinal Chemistry sixth Edition Thomas L. LEMKE, M David A. WILLIAMS, Victoria F. ROCHE, S. William Zito; Classical Bioisosteres, Pág. 50, 2002, (págs. Portada y 49, Fls. 111 y 112).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

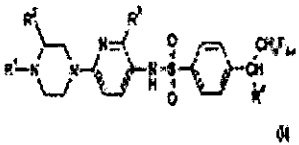
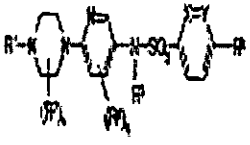
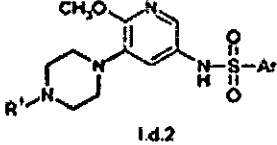
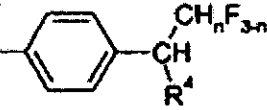
RESOLUCIÓN No: 78862
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/09-149835

En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un compuesto de fórmula (I)...” (Fl. 120).

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

TABLA 1

Características esenciales	D1	D2
 R1=H, alquilo C1-3 R2=H, -CH3 R3= H, -CH3, -OCH3, -CF3	 R1=H,CH3,CH2CH3,CH2-CH2-CH3 R2¹= H, -CH3; R2²= H, -CH3; R2³= H, -CH3 H, -CH3, -OCH3, -CF3, fórmulas la.1a - b.1k (págs.11 y12)	 R1=H, alquilo C1-4 H
 R4=alquilo, alquilo fluorado n=0,1,2	 Rb=alquilo fluorado es - CF3 (págs. 21,23 y 24) n=0,1,2	Id.4, Id.8, Id.8, Id.10, Id.12, Id.14, Id.16, Id.18, Id.20, Id.22, Id.24; donde Ar es fenilo sustituido por alquilo fluorado diferentes del - CF3

Como se dijo anteriormente el documento D1 constituye el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, el cual da a conocer el compuesto de fórmula IIE (pág.31) sus sales, solvatos y enantiómeros (págs.2, 5 y 6); además de sus composiciones farmacéuticas (reivindicación 16, pág.140).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y los compuestos del documento D1 consiste en que se incluye un átomo de N en el anillo de ciclohexanona para formar la piperidinona y en los significados de los sustituyentes R25 y R23.

No obstante estas diferencias no se observa un efecto sorprendente porque en la descripción de la presente solicitud se observan resultados de un ensayo para la inhibición de la actividad de PI3Kα y/o PI3Kβ, y/o PI3Kγ y/o PI3Kδ humanas, con valores de IC50 de 50µM o mejores (pág.18, Fl.24), que al ser comparados con los valores obtenidos a través del ensayo para determinar la misma actividad de PI3Kα y/o PI3Kβ y/o PI3Kγ y/o PI3Kδ, divulgado en D1 (enzyme inhibition assays pág.40) se comprueba que son iguales y adicionalmente no se evidencia que el compuesto sea un inhibidor selectivo y potente de las enzimas PI3K, por lo tanto no existe un efecto

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78862

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/09-149835

técnico inesperado.

Por tanto, el Problema Técnico Objetivo consiste en ¿cómo modificar el compuesto según D1, para lograr un compuesto alternativo con la misma actividad que el conocido?.

No obstante, D2 muestra que es posible cambiar un grupo -CH₂- por un grupo -NH- (tabla 2.8, pág.49) con la expectativa de mantener la misma actividad en el compuesto reivindicado.

En consecuencia, la reivindicación es obvia, porque la persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de "¿cómo modificar el compuesto según D1, para lograr un compuesto alternativo con la misma actividad que el conocido?", incluiría el grupo -NH- equivalente a -CH₂-, que se revela en D2 en el compuesto que se enseña en D1, logrando de esta forma el compuesto reivindicado. Por lo cual el compuesto de la Reivindicación 1 carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 9 y 11 no mencionan características que las hagan inventivas, tampoco tienen nivel inventivo.

Es oportuno aclarar que, el documento D2 revela la equivalencia de los grupos -CH₂- y -NH- aún en un ciclo³, con la expectativa de mantener la misma actividad ya conocida por compuestos similares del estado de la técnica.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual las diferencias de la solicitud frente al compuesto de D1 (formula IIE) se obtiene un compuesto inhibidor selectivo y potente de las enzimas PI3K, se aclara que en la descripción no existe evidencia de lo afirmado por el solicitante y que por el contrario lo consignado en dicha descripción son resultados de un ensayo de la actividad de PI3K α y/o PI3K β , y/o PI3K γ y/o PI3K δ humanas, con valores de IC₅₀ de 50 μ M o mejores (pág.18, Fl.24), iguales a los ya conocidos en D1 (pág.40). De manera que el nivel de actividad de los compuestos de la solicitud estudiada no es sorprendente para la persona normalmente conocedora de la materia, a la luz de lo enseñado en el arte previo citado antes.

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

3 Universidad federal do Rio de Janeiro Instituto de Química Orgânica pós-graduacao em química orgânica seminário de mestrado, Bioisosterismo: uma estratégia de modificacao molecular para a otimizacao de um composto-protótipo, Ana paula Cunha Rodrigues maio 2006 (Fls.122-136).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 78862

Por la cual se deniega una patente de invención

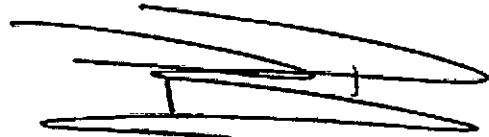
Rad. PCT/09-149835

"DERIVADOS DE TIAZOL FUSIONADOS COMO INHIBIDORES DE QUINASA".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad UCB PHARMA S.A, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra 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 20 Dic 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor
JUAN PABLO CADENA SARMIENTO
jcadena@bc.com.co;
notificaciones@bc.com

Elaboró: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓