

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

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 22 de octubre de 2010, con el N° 10-131479-00000-0000, por la sociedad Gilead Sciences, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "ANÁLOGOS DE CARBA NUCLEÓSIDOS PARA TRATAMIENTO ANTIVIRAL", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/041432 del 22 de abril de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 630 del 21 de julio de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 19681 y notificado por fijación en lista el 30 de octubre 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 229 a 234 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° 10-131479-00008-0000 del 28 de enero de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 13 (Fls. 248 a 256) que reemplazan las

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

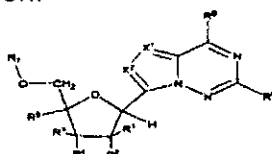
originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

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 13 contenidas en los folios 248 a 256, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar compuestos útiles para el tratamiento de infecciones por virus de la familia *flaviviridae*. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



Compuesto 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 23 de abril de 2008.

Página 2 de 11

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1085267207

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: 36960

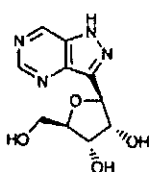
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

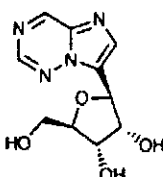
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1999, 2929–2936	Synthesis of C-ribosyl imidazo[2,1-f] [1,2,4]triazines as inhibitors of adenosine and AMP deaminases	01/enero/1999
D2	US 20040067901	Nucleoside derivatives as inhibitors of RNA- dependent RNA viral polymerase	02/diciembre/2004

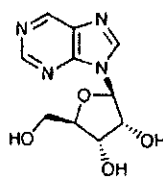
El documento D1⁽¹⁾ divulga que el 3-β-D-ribofuranósido de la imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina es isomérico e isoelectrónico con el nucleósido deaminoformicina y es un inhibidor de la adenosina desaminasa (ADA) (Fl. 1, Resumen.)



Compuesto 1



Compuesto 6



Compuesto 5

El documento D1 también enseña que los inhibidores de la enzima desaminasa relacionada con adenosina ADA resultan de interés como potenciales antivirales e indica que el isomérico ADA inhibidor (compuesto 6) es un ribofuranósido de purina, el cual, se une a la enzima como hidrato covalente. Por último, el documento D1 divulga que un simple cambio de C-4 y N-8 sobre el anillo pirazolo-pirimidina en el compuesto 1 da como resultado una nueva molécula diana (compuesto 6) correspondiente a una furanosil imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina.

1: <http://pubs.rsc.org/en/Content/ArticleLanding/1999/P1/a904065j>
Página 3 de 11

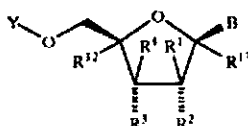
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

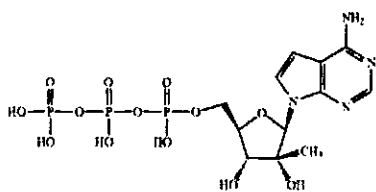
Rad.PCT/10-131479

El documento D2²³ divulga una serie de compuestos derivados de nucleósido de fórmula (I) útiles como inhibidores de la replicación del ARN viral dependiente de ARN. Los compuestos son particularmente útiles en el tratamiento de la infección por hepatitis C porque son inhibidores de la polimerasa NS5B del virus (Fl. 1, Resumen).

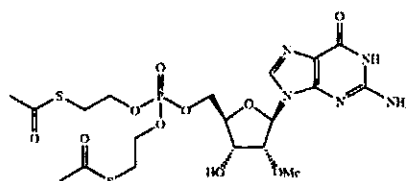


Compuesto 1.

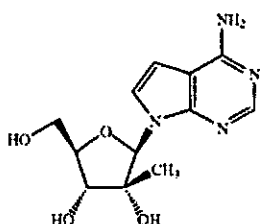
Adicionalmente, el documento D2 da a conocer los siguientes compuestos:



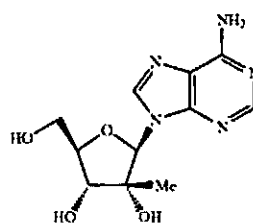
Ejemplo 129 (Fl. 62, Párrafo. [1217])



Ejemplo 73 (Fl. 45, Párrafo. [1015])



Ejemplo 62 (Fl. 41, Párrafo. [0959])



Ejemplo 52 (Fl. 10, Párrafo. [0941])

2: <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

FT=D&date=20040408&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=2004067901A1&KC=A1&ND=2

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

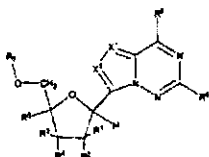
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

6.4. 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, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 define un compuesto de fórmula (I).



compuesto I

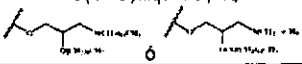
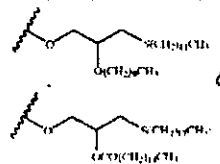
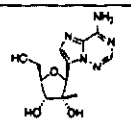
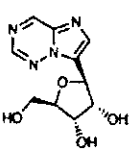
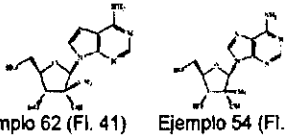
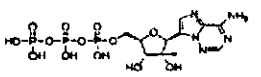
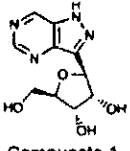
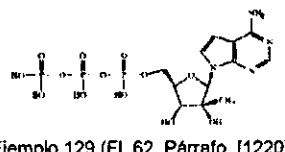
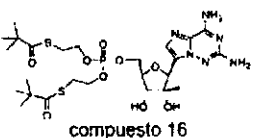
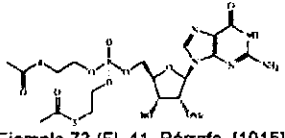
La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2, que representan el estado de la técnica cercano:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

Y o Y¹ Cada uno son O, S, NR, [*]N(O)(R), N(OR), [*]N(O)(OR), o N-NR₂;		R³ hidroxi, OCH₂CH₂SC(=O)alquiloC₁-C₄, OCH₂CH₂SC(=O)OalquiloC₁-C₄, OCH₂O(=O)OalquiloC₁-C₄, NHCHMeCO₂Me, OCH₂(alquiloC₁-C₄), O(C=O)alquiloC₁-C₄ 
W¹ y W² al ser tomados juntos, son -Y²(C(R¹)₂)₃Y³-, o uno de W¹ o W² junto con R³ o R⁴ es -Y²- y el otro de W¹ o² de W es fórmula Ia; o W¹ y W² cada uno, son de forma independiente, un grupo de la fórmula Ia:  Donde : cada Y² independientemente es un enlace, O, CR₂, NR, [*]N(O)(R), N(OR), [*]N(O)(OR), N-NR₂, S, S-S, S(O) o S(O)₂; cada Y³ es independientemente O, S o NR.		R¹⁰ hidroxi, OCH₂CH₂SC(=O)alquiloC₁-C₄, OCH₂CH₂SC(=O)OalquiloC₁-C₄, OCH₂O(=O)OalquiloC₁-C₄, NHCHMeCO₂Me, OCH₂(alquiloC₁-C₄), O(C=O)alquiloC₁-C₄ 
Características esenciales	D1	D2
Realizaciones preferidas	Compuestos divulgados	Ejemplos
 compuesto 1	 Compuesto 6	 Ejemplo 62 (Fl. 41) Ejemplo 54 (Fl. 40)
 compuesto 10	 Compuesto 1	 Ejemplo 129 (Fl. 62, Párrafo. [1220])
 compuesto 16		 Ejemplo 73 (Fl. 41, Párrafo. [1015])

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la materia reclamada, definida en la reivindicación 1, porque refiere un derivado 3-β-D-ribofuranósido de la imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina útil como inhibidor de la enzima desaminasa relacionada con adenosina ADA, y con uso potencial en el tratamiento quimioterapéutico y como antivirales.

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 1 y el compuesto 6 divulgado en el documento D1 corresponde a que en la solicitud se define para la posición 5 del anillo imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina un grupo de sustituyentes que incluyen: halógeno, amino, ciano, entre otros mientras que el documento D1 divulga un sustituyente hidrógeno.

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 1 y el compuesto (I) del documento D2 consiste en que: la solicitud define como sustituyente en la posición 2 de anillo tetrahydrofurano una base nitrogenada seleccionada entre la imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina y la [1,2,4]triazolo[3,4-f][1,2,4]triazina, mientras que el documento D2 define dentro de los sustituyentes bases nitrogenadas que incluyen: 9H-purina, 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina, 1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina y 7H-pirrol[3,2-d]pirimidina.

El efecto técnico asociado a la diferencia estructural consiste en obtener compuestos antivirales alternativos útiles para el tratamiento de infecciones por virus de la familia *flaviviridae*

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los compuestos del documento D1 para así obtener nuevos compuestos antivirales útiles para el tratamiento de infecciones por virus de la familia *flaviviridae*.

Sin embargo, el documento D1 refiere que el 3-β-D-ribofuranósido de una nueva imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina (compuesto 6), es isomérico e isoelectrónico con el nucleósido deaminoformicina (compuesto 1) por lo que una persona versada en la materia encontraría sin dificultad que el anillo imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina es isomérico e isoelectrónico al anillo 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina en el caso de los ribofuranósidos antivirales y dado que el documento D2 divulga que los derivados nucleósidos del anillo 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina son inhibidores de la RNA-polimerasa viral dependiente de RNA útiles como inhibidores de la replicación del virus de la hepatitis C.

Página 8 de 11

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1085267207

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: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

En consecuencia, existía suficiente sugerencia o motivación para remplazar los sustituyentes del compuesto 6 divulgado en el documento D1 por los sustituyentes específicos divulgados en el documento D2 dado que los anillos imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina y 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina son isoméricos e isoelectrónicos y por lo tanto, resultan equivalentes biológicos, por lo que permite obtener una nueva serie de compuestos inhibidores de la de la RNA-polimerasa viral dependiente de RNA, por lo cual la reivindicación 1 se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-10 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

De las composiciones farmacéuticas.

Dado que los compuestos la solicitud son bioisómeros de los compuestos divulgados en el documento D2, y se espera un comportamiento similar dentro de composición farmacéutica y que la solicitud solo define la composición farmacéutica indicando que comprende una cantidad terapéuticamente efectiva de los compuestos de las reivindicaciones anteriores y un vehículo farmacéuticamente aceptable y que el documento D2 divulga las mismas características técnicas sobre la cantidad de principio activo, el vehículo farmacéuticamente aceptable y los agentes terapéuticos adicionales, este Despacho concluye que las reivindicaciones 11 a 13 tampoco tienen nivel inventivo.

En referencia a los argumentos de la solicitante, según los cuales el documento D1 falla en enseñar la sustitución en la posición 5 del anillo de [2,1-f][1,2,4]triazina para el caso de los compuestos reclamados y que este revela el uso de los compuestos como inhibidores de adenosina y AMP desaminasas pero no enseña o sugiere que los compuestos allí divulgados puedan ser útiles para tratamiento antiviral, este Despacho aclara a la solicitante que el documento D1 revela los compuestos 1 y 3 correspondientes a la deaminoformicina y el β -D-ribofuranósido de la 7H-purina, los cuales son inhibidores de adenosina y AMP desaminasas (Fl. 1, columna 1) y puesto que forman parte del alcance del documento D2, una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría sin dificultad que los compuestos señalados son tanto inhibidores de adenosina y AMP desaminasas como de la replicación de la RNA-polimerasa viral dependiente de RNA del virus de la hepatitis C de acuerdo con las enseñanzas del documento D2. Lo anterior porque el documento D2 menciona dentro de los posibles

Página 9 de 11

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1085267207

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: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131479

sustituyentes del anillo tetrahidrofurano un grupo extenso de bases nitrogenadas incluyendo entre otros el anillo 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina y además reporta actividad como inhibidores de VCH y porque el documento D1 da a conocer que los anillos 3H-pirazolo[4,3-d]pirimidina y imidazo[2,1-f][1,2,4]triazina son serie isomérica e isoelectrónica.

Así las cosas, una persona del oficio normalmente versada en la materia enfrentada al problema de obtener antivirales alternativos con acción específica sobre la replicación de la RNA-polimerasa viral dependiente de RNA del virus de la hepatitis C o cualquier otro virus de la familia *flaviviridae* estaría motivada a utilizar o remplazar los sustituyentes específicos de los compuestos divulgados en el documento D2 en el compuesto 6 divulgado en el documento D1, para así generar una serie de compuestos alternativos útiles como inhibidores de la replicación de la RNA-polimerasa viral dependiente de RNA del virus de la hepatitis C (HCV) y otros virus de la familia *flaviviridae*, por lo anterior, este Despacho concluye que la serie reclamada no presenta nivel inventivo.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud presentada, se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "NUCLEÓSIDOS DE IMIDAZOL[1,5-F][1,2,4]TRIAZINIL, IMIDAZOL[1,2-F][1,2,4]TRIAZINIL Y [1,2,4]TRIAZOLO[4,3-F][1,2,4]TRIAZINIL PARA EL TRATAMIENTO ANTIVIRAL".

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 "NUCLEÓSIDOS DE IMIDAZOL[1,5-F][1,2,4]TRIAZINIL, IMIDAZOL[1,2-F][1,2,4]TRIAZINIL Y [1,2,4]TRIAZOLO[4,3-F][1,2,4]TRIAZINIL PARA EL TRATAMIENTO ANTIVIRAL" de acuerdo con la modificación presentada por la sociedad solicitante.

Página 10 de 11

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1085267207

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: 36960

Por la cual se deniega una patente de invención

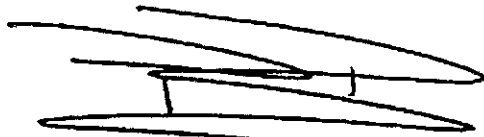
Rad.PCT/10-131479

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Gilead Sciences, Inc., 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 Jun 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctora
Alicia LLoreda
notificacionespatentes@lloredacamacho.com

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

Página 11 de 11

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1085267207

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