

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

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° 10-131510-00000-0000, por la sociedad Daiichi Sankyo Compañy, Limited., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADO DE TETRAHIDROISOQUINOLEINA NOVEDOSO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2009/055738 del 24 de marzo de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 625 del 21 de febrero de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 18635 y notificado por fijación en lista el 23 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 938 a 944 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° 10-131510-00005-0000 del 18 de enero de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 19 (Fls. 980 a 986) 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 de acuerdo con el objeto de la solicitud presentada, se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "DERIVADOS CICLOALQUIL ÉSTER O

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

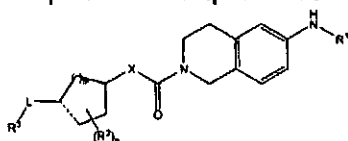
AMIDA DEL ÁCIDO-6-[-3-(FENIL)-UREIDO]-3,4-DIHIDRO-1H-ISOQUINOLINA-2-CARBOXÍLICO, ÚTILES COMO INHIBIDORES DE DGAT1".

SEXTO: 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."*

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 19 contenidas en los folios 980 a 986, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar compuestos inhibidores de la acilcoenzima: diacilglicerol acil transferasa (DGAT), particularmente, de la DGAT1, útiles en el tratamiento de enfermedades como adiposidad, obesidad, hiperlipidemia, hipertrigliceridemia, lipidosis, entre otras. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



Compuesto I

7.2. 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 marzo de 2008.

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

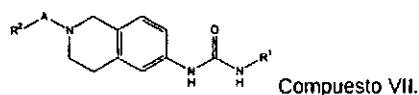
RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

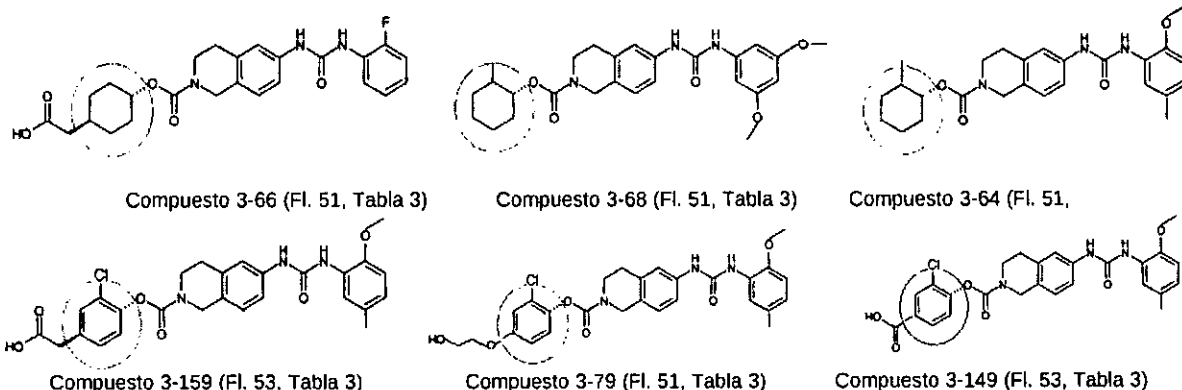
Rad.PCT/10-131510

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO 2006/004200	Urea derivades	12/enero/2006
D2	Current Medicinal Chemistry, 2005, Vol. 12, No. 1	Bioisosterism: A Useful Strategy for Molecular Modification and Drug Design	2005

El documento D1^[1] divulga una serie de derivados del compuesto fórmula (VII) inhibidores de la DGAT1 (Fl. 47. Tabla. 3).



Adicionalmente, el documento D1 da a conocer los compuestos:



El documento D2^[2] divulga que el bioisosterismo es una estrategia de la química medicinal para el diseño racional de nuevos fármacos, que permite partir de un compuesto líder o base a través de un proceso especial de modificaciones moleculares. El objetivo de este proceso es desarrollar nuevas sustancias que

1: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20070321&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=EP&NR=1764360A1&KC=A1&ND=4

2: <http://www.ff.ul.pt/FCT/PTDC/QUI-QUI/118094/2010/artigo32.pdf>
Página 3 de 8

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

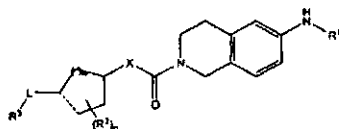
Rad.PCT/10-131510

sean terapéuticamente atractivas y es una herramienta útil para la modificación de estructuras a nivel molecular (Fl. 1. Introducción).

7.3. 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"*.

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

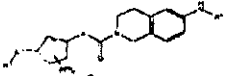
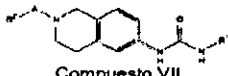
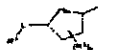
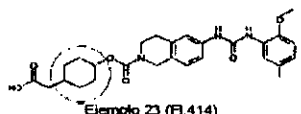
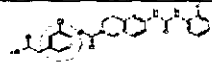
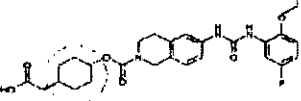
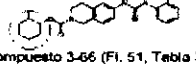
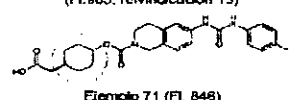
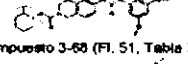
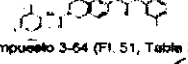
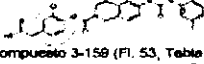
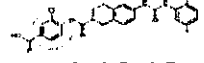
La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2, que representan el estado de la técnica cercano:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

Características esenciales Un compuesto de fórmula I	D1 Un compuesto de fórmula VII	D2
 Compuesto I	 Compuesto VII (Fl. 47, Tabla. 3).	
R ¹	R ¹	
fenilaminocarbonilo sustituido con 1 a 5 sustituyentes del grupo A.	Fenilo mono o di sustituido	
 Donde X es O o NH	A -NH-C(=O)- -O-C(=O)-	
 Donde L-R ² es CH ₂ CO ₂ H Y R ² es Alquilo	R ² 2-Me-ciclohexil (ejemplos 3-61 a 3-70) 4-CH ₂ CO ₂ H-2-Cl-fenil (ejemplos 3-151 a 3-160) 4-CO ₂ H-2-Cl-fenil (ejemplos 3-141 a 3-150)	
Realizaciones Preferidas	Ejemplos	Divulga que el bioisosterismo es una estrategia de la química medicinal para el diseño racional de nuevos fármacos (Fl. 1. Introducción).
 Ejemplo 23 (Fl. 414) (Fl. 985, reivindicación 14)	 Compuesto 3-156 (Fl. 53, Tabla 3)	
 Ejemplo 27 (Fl. 442) (Fl. 985, reivindicación 15)	 Compuesto 3-66 (Fl. 51, Tabla 3)	
 Ejemplo 71 (Fl. 848) (Fl. 986, reivindicación 17)	 Compuesto 3-68 (Fl. 51, Tabla 3)	
	 Compuesto 3-64 (Fl. 51, Tabla 3)	
	 Compuesto 3-159 (Fl. 53, Tabla 3)	
	 Compuesto 3-149 (Fl. 53, Tabla 3) Ejemplo 397 (Fl. 230)	
	 Compuesto 3-79 (Fl. 51, Tabla 3) Ejemplo 396 (Fl. 230)	

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la materia reclamada, definida en la reivindicación 1, porque divulga una serie de derivados del ciclohexil éster de la amida del ácido-6-[-3-(fenil)-ureido]-3,4-dihidro-1H-isoquinolina-2-carboxílico que presentan actividad como inhibidores de la diacilglicerol acil transferasa (DGAT).

Página 5 de 8

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1955415297

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: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 1 y el documento D1 consiste en que en la posición 4 del anillo ciclohexil se encuentra un sustituyente L-R³ y el documento D1 no ejemplifica esta opción para el anillo ciclohexilo. Sin embargo en el documento D1 se divulgan los compuestos 3-156 y 3-159 en los que se incluye un sustituyente acetilo o carboxilo en la posición 4 del grupo fenilo, compuestos que forman parte de una serie bioisótera del anillo ciclohexilo porque se encuentran dentro del grupo de los inhibidores de la diacilglicerol acil transferasa (DGAT).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar el compuesto 3-66 del documento D1 para obtener nuevos inhibidores alternativos de la diacilglicerol acil transferasa (DGAT).

Sin embargo, dado que el documento D1 divulga que los compuestos pueden tener un sustituyente acetilo o carboxilo en la posición 4 del anillo fenilo y que este grupo fenilo es una serie bioisótera del grupo ciclohexilo y que el documento D2 refiere que el bioisosterismo es una estrategia de la química medicinal para el diseño racional de nuevos fármacos, una persona de oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a modificar los compuestos conocidos, como es el caso del compuesto 3-66 divulgado en el documento D1, por medio de la introducción de un sustituyente acetilo o carboxilo o de otra serie bioisótera de estos grupos en la posición 4 del anillo ciclohexilo, tal y como lo sugiere el documento D2 con la expectativa razonable de conseguir alternativas terapéuticas que conserven la actividad farmacológica y de esta manera llegar al objeto de la reivindicación 1, por lo cual la dicha materia se considera obvia. Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-18 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas

De la composición.

Dado que los compuestos de la solicitud son series bioisóteras de los compuestos divulgados en el documento D1 y la composición farmacéutica solo se caracteriza indicando que comprende como ingrediente activo uno de los compuestos de las reivindicaciones anteriores y que a su vez el documento D1 divulga las mismas características técnicas frente a la cantidad de principio activo y el vehículo farmacéuticamente aceptable dispuesto en una composición se considera que la reivindicación 19 tampoco cumple con el requisito de nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

En referencia a los argumentos de la solicitante, según los cuales: los compuestos divulgados en el documento D1 son estructuralmente diferentes de los reclamados en la solicitud y que dicha publicación describe más de 1200 compuestos como preferibles y 120 como deseables, y que en ninguno de éstos se ejemplifica la presencia un grupo cicloalquilo y que por otra parte, de los 370 compuestos que fueron evaluados en el documento D1 en cuanto a su actividad ninguno ejemplifica un anillo cicloalquilo, este Despacho informa a la solicitante que:

El documento D1 ejemplifica a través de los compuestos 3-61 a 3-70 una serie de derivados ciclohexil éster o amida del ácido-6-[3-(fenil)-ureido]-3,4-dihidro-1*H*-isoquinolina-2-carboxílico (Fl.48, tabla 3) que como se demostró en el análisis de patentabilidad únicamente difieren de los compuestos específicos reclamados en la solicitud por el sustituyente en la posición 4 de anillo ciclohexilo, los cuales presentan además, el mismo efecto técnico como inhibidores de la DGAT1. Considerando lo anterior una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría sin dificultad que la materia reclamada y los compuestos 3-61 a 3-70 del documento D1 están relacionados estructuralmente y presentan la misma actividad biológica frente a la DGAT1.

Finalmente, aunque es cierto que el documento D1 describe más de 1200 compuestos preferidos, el documento divulga específicamente 160 derivados del éster o amida del ácido 6-[3-(fenil)-ureido]-3,4-dihidro-1*H*-isoquinolina-2-carboxílico, de los cuales 19 compuestos fueron evaluado como inhibidores de DGAT1 (compuestos 3-14, 3-20, 3-54 a 55, 3-71 a 75, 3-79, 3-81 a 85, 3-91, 3-94, 3-104 y 3-149 y Ejemplos 202, 203, 226, 227, 265 a 267, 280, 284, 285, 290, 291, 293, 297, 326, 397, 397, 409 y 410). Por lo tanto, es válido afirmar que a través de una razonable generalización efectuada por el autor en el documento D1 una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría sin dificultad que la serie reclamada tiene actividad como inhibidores de la DGAT1 y dado que esta serie presenta las características esenciales similares a la de la materia reclamada, la serie se considera obvia.

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 "DERIVADOS CICLOALQUIL ÉSTER O AMIDA DEL ÁCIDO-6-[3-(FENIL)-UREIDO]-3,4-DIHIDRO-1*H*-ISOQUINOLINA-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 29790

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-131510

2-CARBOXÍLICO, ÚTILES COMO INHIBIDORES DE DGAT1"

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Daiichi Sankyo Company, Limited., 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 22 May 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctora
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
cavelier@cavelier.com

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