

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

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 09 de mayo de 2011, con el N° 11-056552-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Daiichi Sankyo Company, Limited., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADO DE MORFOLINOPURINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2009/067738 del 13 de octubre de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 636 del 20 de enero de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 1520, notificado por fijación en lista el 05 de febrero de 2013, 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, 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° 11-056552-00008-0000 del 13 de junio de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 29 que remplace(n) 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 5, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

6.1. Objeto de la invención.

El problema técnico consiste en encontrar un compuesto de bajo peso molecular oralmente biodisponible que presente acción inhibitoria de PI3K potente y prolongada y un efecto antitumoral a base del mismo. Para resolver este problema técnico se presentan compuestos de las fórmulas 1a y 1b y composiciones que los contienen.

6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 14 de octubre de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2008116129	"Imidazolopyrimidine Analogs and Their Use as PI3 Kinase and mTOR Inhibitors"	25/Septiembre/2008

El documento D1¹ divulga un compuesto derivado de imidazopirimidina de fórmula (1b) útil como inhibidor de PI3K cinasa y mTOR (Pág. 13, Párr. [0055] a Pág. 35, Párr. [0071]; Págs. 163 a 185 reivindicaciones 1 a 17)

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"*.

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 representado por la fórmula (1a) o una sal del mismo"* (Ver páginas 4 a 8 del radicado N° 11-056552-00008-0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la

¹URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008116129A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080925&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

[CC=WO&NR=2008116129A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080925&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008116129A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080925&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

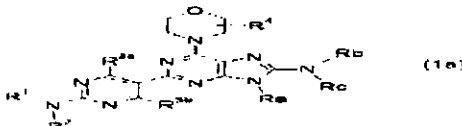
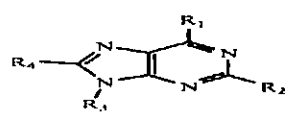
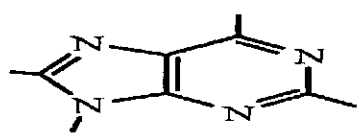
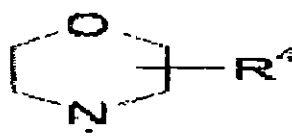
RESOLUCIÓN No: 38280
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

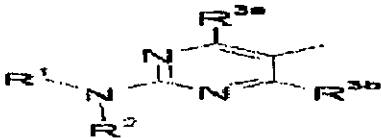
Características esenciales	D1
 (1a)	 Ib (Pág. 13, Párr. [0055] a Pág. 35, Párr. [0071]; Págs. 163 a 185 reivindicaciones 1 a 17)
	
 R¹ representa un grupo alquilo C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A o un átomo de hidrógeno (Ver páginas 4 a 8 del radicado N° 11-056552-00008-0000)	R₁ R₁ es N-morfolinilo sustituido por C₁-C₆ alquilo (Pág. 13)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

Características esenciales	D1
 R¹ y R² cada uno independientemente representan un grupo alquilo C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo alquilsulfonilo C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo arilo que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo B, o un átomo de hidrógeno R^{3a} y R^{3b} cada uno independientemente representan un grupo alquilo C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo alcoxi C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo alquilamino C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo dialquilamino C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo cicloalquilo C₁-C₆ que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo amino, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, o un átomo de hidrógeno (Ver páginas 4 a 8 del radicado N° 11-056552-00008-0000)	R₂ R₂ es C₁-C₆ heteroarilo (Pág. 16) sustituido por C₁-C₆ alquilo (Pág. 16) y por NR₁₂R₁₂ (Pág. 17) donde R₁₂ es C₁-C₆ alquilo (Pág. 18)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280
Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

Características esenciales	D1
Ra Ra representa un grupo $-Y-R^5$, en donde Y representa un enlace sencillo o un grupo alquileo C_1-C_6. R^5 representa un grupo alquilo C_1-C_6 que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo A, un grupo tetrahidrofurano que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo B, un grupo tetrahidropirano que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo B, un grupo pirrolidino que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo D, un grupo piperidino que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo B, un grupo piridinilo que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo D (Ver páginas 4 a 8 del radicado N° 11-056552-00008-0000)	R₃ R₃ es C_1-C_6 alquilo sustituido con uno o mas sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, $-NH_2$, $-NH(C_1-C_6$ alquilo), $-N(C_1-C_6$ alquilo)(C_1-C_6 alquilo), $-N(C_1-C_3$ alquilo)C(O)(C_1-C_6 alquilo), $-NH$ C(O)(C_1-C_6 alquilo), $-NH$ C(O)H, $-C(O)NH_2$, $-C(O)NH(C_1-C_6$ alquilo), $-C(O)N(C_1-C_6$ alquilo), $-CN$, $-OH$, $-O(C_1-C_6$ alquilo), $-C_1-C_6$ alquilo, $-C(O)OH$, $-C(O)O(C_1-C_6$ alquilo), $-C(O)(C_1-C_6$ alquilo), $-C_6-C_{14}$ arilo, $-C_1-C_9$ heteroarilo y $-C_3-C_8$ carbociclo (Pág. 18)
N(Rb)(Rc) Rb y Rc cada uno independientemente representan un grupo alquilo C_1-C_6 que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo E o un átomo de hidrogeno, o Rb y Rc, junto con el átomo de nitrógeno al cual Rb y Rc se unen pueden formar un grupo heterocíclico que contiene nitrógeno alicíclico de 4 a 7 miembros que puede tener uno o mas sustituyentes seleccionados del siguiente grupo E: cualquiera seleccionado de las siguientes formulas Rbc1 a Rbc80 (Ver páginas 5 a 7 del radicado N° 11-056552-00008-0000)	R₄ R₄ es C_1-C_6 alquilo (Pág. 33)

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto derivado de imidazopirimidina de fórmula (Ib) útil como inhibidor de PI3K cinasa y mTOR (Pág. 13, Párr. [0055] a Pág. 35, Párr. [0071]; Págs. 163 a 185 reivindicaciones 1 a 17)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos del documento D1 consiste en que este documento no divulga el sustituyente N(Rb)(Rc) en la posición 8 del anillo de 9H-purina y en que no divulga específicamente el anillo de pirimidina enlazando la posición 2 del anillo de 9H-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

purina

El efecto que logra el incluir el anillo de pirimidina en la posición 2 y el grupo N(Rb)(Rc) en la posición 8 del anillo de 9H-purina es que permite obtener compuestos alternativos como inhibidores de PI3K y mTOR

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar los compuestos conocidos en D1 para proporcionar compuestos que inhiban PI3K y mTOR?

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D1 da a conocer compuestos derivados de 9H-purina sustituidos por morfolinilo en la posición 6; una persona normalmente versada en la materia encontraría en este documento una sugerencia para incluir una pirimidina en la posición 2 del anillo de 9H-purina cuando se sugiere que esta posición corresponde al sustituyente R^2 que representa un C_1-C_9 heteroarilo (Pág. 16). Adicionalmente la fórmula IIa (Págs. 219 a 225 reivindicación 48) sugiere un anillo de pirimidina cuando X_3 es N; En cuanto al grupo N(Rb)(Rc) en la posición 8 del anillo de 9H-purina, una persona normalmente versada en la materia fácilmente utilizaría este grupo mediante un reemplazo bioisostérico a partir del grupo C_1-C_6 alquilo que incluye alquilos secundarios, dada la conocida relación bioisostérica entre los grupos $-CH-$ y $-N-$ para llegar al objeto de la reivindicación 1, por lo tanto se considera obvia y carente de nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 5 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Pese a que la solicitante incluye en la nueva reivindicación 1 los diversos grupos que forman los sustituyentes Rb y Rc junto con el átomo de nitrógeno al cual se encuentran unidos, la solicitante no responde a las objeciones realizadas en cuanto a la claridad y concisión de la solicitud, dando lugar a un sinnúmero de compuestos de los cuales no es posible establecer que la gran cantidad de compuestos que caen dentro de la definición de la formula Markush reclamada presenten un efecto técnico sorprendente con respecto a los compuestos conocidos en el estado de la técnica. Adicionalmente la solicitante deja opcional la posibilidad que los sustituyentes R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} , R^4 , R^5 , Rb y Rc que corresponden a grupos C_1-C_6 alquilo puedan estar sustituidos por los grupos A, B, D y E mencionados así como la opción que los radicales Rb y Rc puedan formar junto con el nitrógeno un anillo heterocíclico, de esta forma cualquier compuesto en que dichos sustituyente correspondan a un radical alquilo caen dentro de la definición de la formula reclamada y al estar estos sustituyentes alquilo completamente sugeridos en el documento D1; esta Superintendencia considera que la reivindicación 1 y sus reivindicaciones dependientes carecen de nivel inventivo y de concisión, motivo por el cual no cumplen con los requisitos de patentabilidad.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con lo expuesto, en el presente caso la(s) reivindicación(es) 6 a 29, cumplen los

2 Lidia Moreira Lima and Eliezer J. Barreiro. *Current Medicinal Chemistry*, 2005, 12, 23-49. "Bioisosterism: A Useful Strategy for Molecular Modification and Drug Design" (Ver Pág. 24, Fig. 1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial de que trata el artículo 14 de la Decisión 486, por lo tanto hay lugar a conceder para ellas el privilegio de patente solicitado; así mismo, se niega el privilegio de patente para la(s) reivindicación(es) 1 a 5, por carecer de nivel inventivo como se explicó anteriormente.

OCTAVO: Que de acuerdo con el objeto concedido se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: "DERIVADOS DE [6-MORFOLIN-4-IL-9H-PURIN-2-IL]-PIRIMIDIN-2-AMINA/N-METIL PIRIMIDIN-2-AMINA".

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

"DERIVADOS DE [6-MORFOLIN-4-IL-9H-PURIN-2-IL]-PIRIMIDIN-2-AMINA/N-METIL PIRIMIDIN-2-AMINA "

Clasificación IPC: C07D473/34

Reivindicación(es): 6 a 29 incluida(s) en el radicado bajo el N° 11-56552-00008-0000.

Titular(es): DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED.

Domicilio(s): Tokio, Japón.

Inventor(es): Kiyoshi Nakayama, Kazuyuki Sugita, Masaki Setoguchi, Yuichi Tominaga, Masanori Saitou y Takashi Odagiri.

Prioridad(es) N°: 2008-264797 **Fecha:** 14 de octubre de 2008 **País:** JP.

2009-121690

20 de mayo de 2009

JP.

Solicitud internacional N°: PCT/JP2009/067738 **Fecha:** 13 de octubre de 2009.

Vigente desde: 13 de octubre de 2009

Hasta: 13 de octubre de 2029

ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención solicitada para las reivindicaciones 1 a 5, de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

ARTÍCULO TERCERO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 38280

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-056552

ARTÍCULO CUARTO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTÍCULO QUINTO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Daiichi Sankyo Company, Limited., entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella(s) 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 27 Jun 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN

notificaciones@clarkemodet.com.co

clarkemodet@clarkemodet.com.co

Elaboró: Rodolfo Cadena Amaya ✓
Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓