

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 151

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 30 del decreto 3523 de 2009, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 1 de abril de 2003, bajo el número 03 - 027152, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada: "POLIARILCARBOXAMIDAS UTILES COMO AGENTES REDUCTORES DE LIPIDOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP01/09926 del 27 de agosto de 2001.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma en cuanto a los requisitos que debe llenar la solicitud, y cumplidas las exigencias legales, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad se encontró que la invención no cumple con los requisitos establecidos. En consecuencia, con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió al peticionario en dos oportunidades para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud.

CUARTO: Que el solicitante mediante escritos radicados el 19 de agosto de 2008 y el 16 de julio de 2009, atendió oportunamente a los requerimientos formulados, y presentó las respectivas aclaraciones. Finalmente, allegó un nuevo capítulo reivindicatorio, el cual se ajusta a las prescripciones establecidas en el artículo 34 de la mencionada Decisión 486.

QUINTO: Que según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se 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 17, contenidas en los folios 277 a 286, no cumplen con el requisito de nivel inventivo, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

1. Objeto de la invención

El objeto de la solicitud de patente de invención, se refiere a policarboxamidas

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 151

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

novedosas que tienen actividad inhibidora de apolipoproteína B y actividad reductora de lípidos concomitantemente, el proceso de obtención y una composición que la contiene.

El problema planteado en la solicitud, es la necesidad de nuevos agentes reductores de lípidos con mejorada eficiencia.

Para solucionar este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona las señaladas policarboxamidas.

2. Determinación del estado de la técnica

2.1. Fecha determinante para el análisis comparativo.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 4 de septiembre de 2000, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada respecto de la solicitud EP No. 00203067.4.

La prioridad fue tenida en cuenta para el examen de patentabilidad, según obra en los folios 287 y 288 del expediente en estudio.

2.2. Documentos del estado de la técnica

Consultadas las bases de datos y los archivos con que se cuenta, se encontró el siguiente documento anterior a la fecha de la prioridad invocada y relacionado con la materia reclamada:

No.	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO0032582	Benzamide derivatives and their use as apob-100 secretion inhibitors	2000-06-08

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."

El estado de la técnica, al tenor de lo dispuesto en el artículo 16 de la misma Decisión, comprende "...todo lo que haya sido accesible al público, por una

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 151

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida".

El Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha dicho sobre este requisito, lo siguiente:

El nivel inventivo, implica que la invención presente "...un salto cualitativo en relación con la técnica existente. Este requerimiento es desarrollado por el artículo 4 de la Decisión 344 (hoy artículo 18 D. 486) que presupone el requisito de nivel inventivo al establecer que la invención goza de dicho nivel al no derivar de manera evidente del estado de la técnica, ni resultar obvia para una persona entendida o versada en la materia.

"Este requisito ofrece al examinador la posibilidad de determinar si con los conocimientos técnicos que existían al momento de la invención, se hubiese podido llegar de manera evidente a la misma, o si el resultado hubiese sido obvio para un experto medio en la materia de que se trate, es decir, para una persona del oficio y normalmente versada en la materia técnica correspondiente."

(...)

"En este orden de ideas, se puede concluir que una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no es consecuencia clara y directa de dicho estado."

"Este Tribunal, al respecto, manifiesta que: *'el inventor debe reunir los méritos que le permitan atribuirse una patente, sólo si la invención fruto de su investigación y desarrollo creativo constituye "un salto cualitativo en la elaboración de la regla técnica", actividad intelectual mínima que permitirá que su invención no sea evidente (no obvia) del estado de la técnica. Es decir, que con el requisito del nivel inventivo, lo que se pretende es dotar al examinador técnico de un elemento que le permita afirmar o no si a la invención objeto de estudio no se habría podido llegar a partir de los conocimientos técnicos que existían en ese momento dentro del estado de la técnica (...)' (Proceso 13-IP-2004)*".

En el presente caso, el objeto carece de nivel inventivo, porque a los ojos de un experto medio en la materia, se trata de la simple aplicación de conocimientos técnicos, como a continuación se sustenta.

3.1. Sobre los compuestos de poliarilcarboxamida

La reivindicación independiente 1, se refiere a los compuestos de

¹ Proceso 105-IP-2008

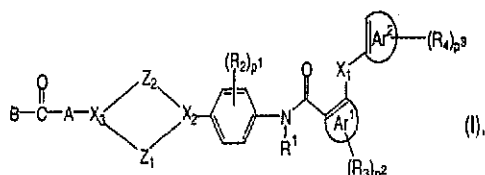
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 51

Por la cual se niega una patente de invención

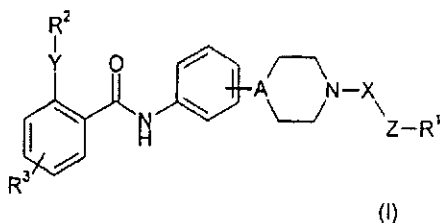
Rad. N° PCT/03-027152

poliarilcarboxamida de fórmula (I)



3.2. Comparación de las características técnicas de la solicitud y D1

El documento del estado de la técnica más cercano es D1, que enseña compuestos útiles para inhibir la producción hepática de apoproteína B-100 (apoB-100), por lo tanto son utilizados en el tratamiento de condiciones (obesidad o aterosclerosis, especialmente aterosclerosis coronaria, enfermedad cardíaca isquémica, enfermedad vascular periférica y enfermedad vascular cerebral) que provienen de elevados niveles de apoB-100 en la circulación (folio 200, pág. 1, renglones 1-5 y folio 203, pág. 18, renglones 20-25), representados por la fórmula general (I):



La solicitud se diferencia de D1, en que menciona para A el significado de un alcanodiilo C1-6 sustituido con un arilo o un heteroarilo, y para B los significados de: alquilo C₁₋₁₀, NR6R7 ó OR8.

De acuerdo a la diferencia anterior, no se evidencia que los compuestos reivindicados presenten efecto técnico sorprendente.

Además, los datos de la descripción (folios 158-163 págs. 112-117), muestran que los compuestos reclamados no tienen una eficiencia mejorada, dado que los valores de IC50 que presentan dichos compuestos, están entre 3000nM y 1.84nM, siendo mayores que los de los compuestos de D1, los cuales tienen valores de IC50 entre 10nM y 20nM (ejemplos 1, 3, 63, 4, 62, 2, 6, 64, 5, folios 255-256, págs. 67-68).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo identificado en la solicitud es la necesidad de compuestos alternativos de poliarilcarboxamida de fórmula (I), el cual, como ya se vio, fue solucionado en el estado de la técnica, concretamente

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 1251

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

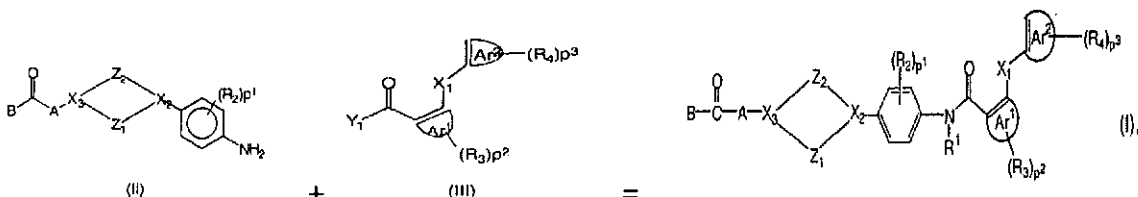
por D1.

Se considera entonces, que para una persona normalmente versada en la materia era obvio incluir los sustituyentes A y B en la estructura de los compuestos de D1, con el fin de lograr compuestos inhibidores de apolipoproteína B, como los reivindicados.

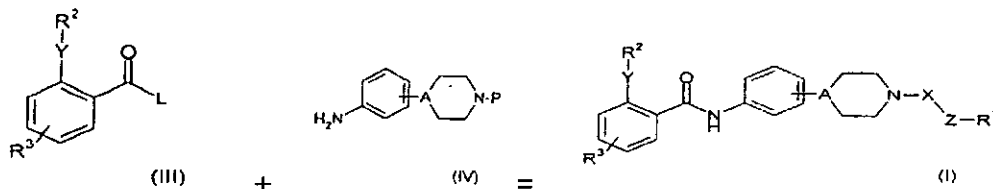
Como resultado del análisis anterior, se concluye que las reivindicaciones 1 a 5 relacionadas con los compuestos, así como las reivindicaciones 14 y 17 que se refieren a las composiciones que los contienen, no tienen nivel inventivo.

3.3. Sobre los procesos para obtener los compuestos de la reivindicación 1

La reivindicación 6, reclama un proceso caracterizado porque se hace reaccionar una fenilenamina de fórmula (II) con un ácido policarboxílico de fórmula (III), para obtener una poliarilcarboxamida.



El documento del estado de la técnica más cercano es D1, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un ácido policarboxílico de fórmula (III) con una fenilenamina de fórmula (IV), bajo condiciones estándar de acoplamiento ácido y amina (folio 204, pág. 23, renglones 4-25 y folio 205, pág. 24, renglones 1-17), para obtener una poliarilcarboxamida de fórmula (I).



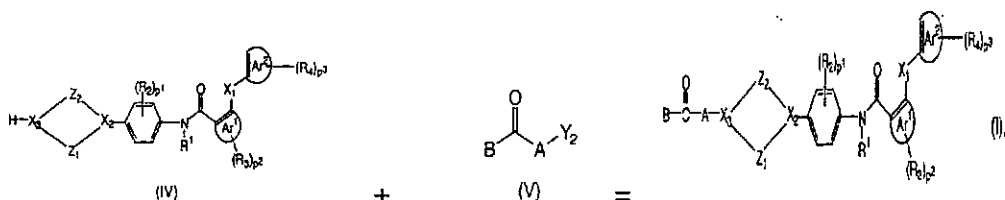
La reivindicación 7, consiste en un proceso caracterizado porque se hace reaccionar el intermediario de fórmula (IV) con un compuesto de fórmula (V).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

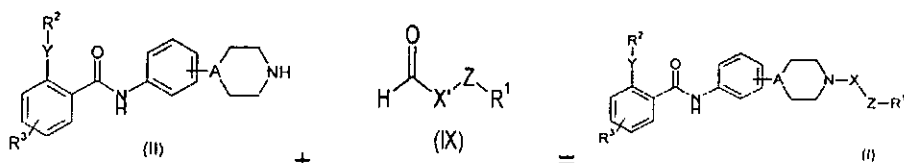
RESOLUCIÓN N° 51

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

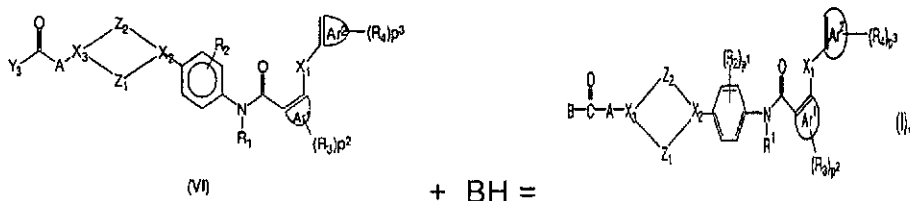


Dicho procedimiento esta sugerido por el D1, que enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (II) y compuesto de formula (IX), (folio 206, pág. 25, renglones 15-25):



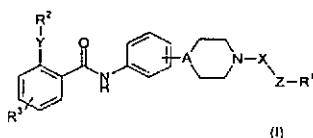
para obtener un compuesto de formula (I).

La reivindicación 8, se refiere a un proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (VI) con un compuesto de formula BH.



Cuando B (B is NR₆R₇ or OR₈), y Y₃ es halo ó hidroxí.

El estado de la técnica mas cercano es D1, y sugiere el procedimiento reivindicado, es decir, enseña un procedimiento para preparar compuestos de



fórmula (I), (en donde R¹ comprende una amida), el cual se puede preparar desde el compuesto de fórmula (I) cuando esta posición esta ocupada por un grupo acido carboxílico, que luego mediante métodos bien

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

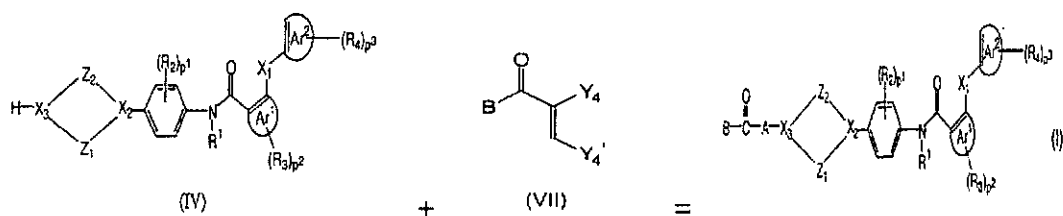
RESOLUCIÓN N° 51

Por la cual se niega una patente de invención

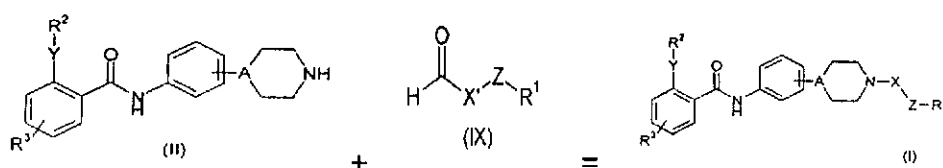
Rad. N° PCT/03-027152

conocidos en el estado de la técnica, se realiza la transformación de un éster a un ácido y luego en una amida, (folio 207, pág. 26, renglones 1-9).

La reivindicación 9, reclama un proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de formula (IV) con un compuesto de formula (VII).

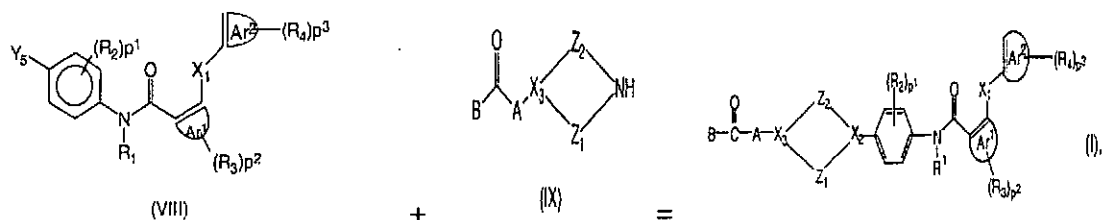


El estado de la técnica más cercano que es D1, sugiere el procedimiento reivindicado, al enseñar un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (II) y compuesto de formula (IX), (folio 206, pág. 25, renglones 15-25):



para obtener un compuesto de formula (I).

La reivindicación 10, se refiere a un proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (VIII) con uno de fórmula (IX).



Este proceso esta sugerido en el estado de la técnica más cercano que es D1, el cual enseña un procedimiento en donde reaccionan un compuesto de formula (III), donde Y es un enlace directo, R² es un fenilo o un heterociclil aromático y L es un grupo hidroxil; puede ser preparado primeramente acoplado el ácido

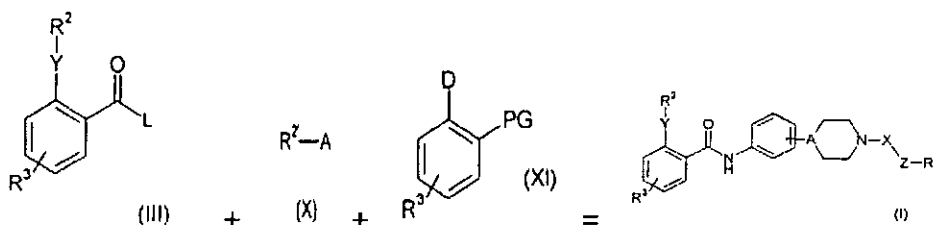
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 5

Por la cual se niega una patente de invención

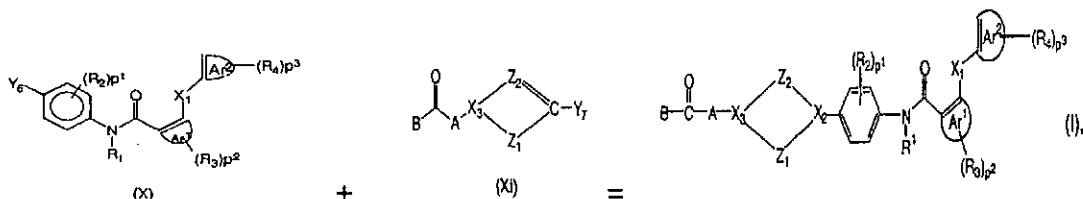
Rad. N° PCT/03-027152.

borónico con un grupo saliente disponible representado por el compuesto de la fórmula (X) y un compuesto de fórmula (XI), (folio 207, pág. 26, renglones 11-30):

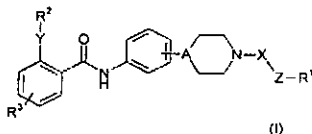


para obtener un compuesto de fórmula (I).

La reivindicación 11, consiste en un proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (X) con uno de fórmula (XI).



El proceso reivindicado también está sugerido en el estado de la técnica más cercano que es D1, ya que como se menciona en dicho documento: "...los métodos descritos en él, son útiles para introducir grupos deseados en cualquier etapa de la obtención del compuesto requerido, de manera gradual y se aprecia que estos métodos generales se pueden combinar de maneras diferentes en tales procesos; considerando que la secuencia de las reacciones en los procesos de varias etapas debe por supuesto ser elegida de modo que las condiciones de las reacciones usadas no afecten a los grupos en la molécula que se desea obtener, como producto final (folio 208, pág. 27, renglones 1-7), en este caso



compuestos de fórmula

La reivindicación 12, reclama un proceso caracterizado porque se hace reaccionar un compuesto de fórmula (XII) con uno de fórmula (XIII-a) o con (XIII-b)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 51

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/03-027152

Así las cosas, el objeto de la solicitud carece de nivel inventivo y, por tanto, no cumple con lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina.

4. Sobre la respuesta del solicitante

Afirma el solicitante sobre el análisis de nivel inventivo, que la diferencia con D1 consiste en que el radical A del compuesto de fórmula (I) de la solicitud, siempre es un grupo alcanodiilo sustituido invariablemente por un arilo, heteroarilo y cicloalquilo C3-10. Se aclara que con los compuestos ejemplificados en los folios 134 a 157, págs. 88 a 111, se comprueba que la sustitución es solo por un arilo (fenilo opcionalmente sustituido) y que no existen ejemplos con sustituciones de heteroarilo ni con cicloalquilo C3-10.

Por su parte, el solicitante allega una nueva tabla (folios 271-272, págs. 6 y 7), donde compara los compuestos 40 y 41 de la solicitud con los compuestos A y B, por el sintetizados, en donde se observa que en los compuestos reclamados está presente el anillo fenilo a diferencia de los de la anterioridad en donde en su lugar está un H. Al respecto cabe aclarar, que a pesar de no tener como sustituyente un grupo como el arilo (fenilo), los compuestos de D1 ya resolvían el problema como agentes reductores de lípidos, porque la anterioridad citada muestra resultados de actividad inhibitoria APoB superiores (entre 10 y 20 nM, compuestos de folio 255-256, pág. 67 y 68) a los mostrados por los compuestos de la invención entre (1.84nM y 3000nM).

A lo afirmado por el solicitante, en cuanto a que es incorrecto comparar los datos de las páginas 67 y 68 con los de capacidad inhibitoria de MTP de los compuestos de la invención, se aclara que la comparación se realiza con los resultados presentados en la tabla C.1 (folios 159 a 161, págs. 113 a 115), que se refieren a la cuantificación de la secreción de ApoB.

Por lo expuesto, se concluye que no obstante los comentarios formulados por el solicitante, la solicitud no cumple lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486, razón por la cual no es merecedora del privilegio de patente solicitado.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención a la creación denominada: "POLIARILCARBOXAMIDAS UTILES COMO AGENTES REDUCTORES DE LIPIDOS".

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 5 1

Por la cual se niega una patente de invención

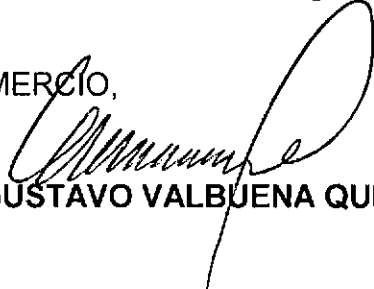
Rad. N° PCT/03-027152

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente a la doctora Alicia Lloreda Ricaurte, en su calidad de apoderada sustituta de la sociedad JANSSEN PHARMACEUTICA N.V., o a quien haga sus veces, el contenido de la presente resolución, entregándole copia de la misma, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición ante el Superintendente de Industria y Comercio al momento de notificarse o dentro de los 5 días hábiles siguientes.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los **07 ENE. 2010**

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctora
ALICIA LLOREDA RICAURTE
Calle 72 No. 5-83. Piso 5.
Bogotá D.C.

202067