

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:28490

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-063881

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 24 de mayo de 2011, con el N° 11-063881-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Boehringer Ingelheim International GmbH, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "PRIMIDINAS SUSTITUIDAS ÚTILES EN EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES TALES COMO CANCER", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2009/065768 del 24 de noviembre de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 651 del 31 de agosto de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 240, notificado por fijación en lista el 20 de enero de 2015, 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° 11-063881-00016-0000 del 13 de abril de 2015, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 19 que reemplaza(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 19 del radicado N° 11-063881-00016-0000, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

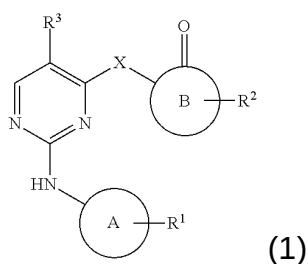
El problema técnico consiste en proporcionar nuevas sustancias que puedan emplearse para la prevención y/o tratamiento de enfermedades que se caracterizan por una proliferación celular excesiva o anómala. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de la fórmula general (I):

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:28490

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-063881



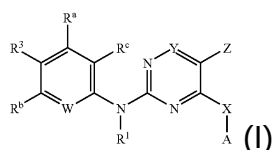
6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 24 de noviembre de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

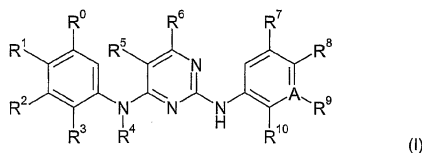
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D6	US 2006/0148800	"Pyrimidines as PLK Inhibitors"	06/Julio/2006
D7	MXPA05009883	"2,4-Di(Fenilamino)Pirimidinas Útiles en el Tratamiento de Enfermedades Neoplásicas, Trastornos Inflamatorios y del Sistema Inmune"	05/Diciembre/2005

El documento D6¹ divulga compuestos de pirimidina de fórmula general (I) que actúan como inhibidores de quinasas del ciclo celular, útiles para el tratamiento de enfermedades asociadas a la actividad de las quinasas del ciclo celular, caracterizadas por proliferación celular excesiva o anómala (Pág. 2, Párr. [0014] y [0015]).



El documento D7² divulga compuestos derivados de pirimidina de fórmula (I) y su uso en el tratamiento de enfermedades neoplásicas, inflamatorias e trastornos del sistema inmune (Resumen).



6.3. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: "Se considerará que una

1[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2006148800A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20060706&DB=&&locale=en_EP)

CC=US&NR=2006148800A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20060706&DB=&&locale=en_EP

2[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20040923&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=WO&NR=2004080980A1&KC=A1&ND=4)

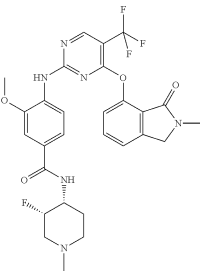
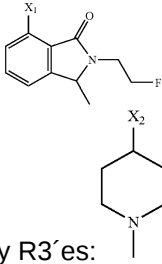
FT=D&date=20040923&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=WO&NR=2004080980A1&KC=A1&ND=4

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:28490

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-063881

Características esenciales	D6	D7
 (64)	 y R3'es: (Compuestos 54 y 56, Pág. 50; Compuesto 511, Pág. 147)	

El documento D6 se considera el estado de la técnica cercano a la solicitud definida en la reivindicación 1, porque divulga compuestos de fórmula (I) que se relacionan estructuralmente con los compuestos de la solicitud como se muestra en la tabla, los cuales son útiles para el tratamiento de condiciones caracterizadas por proliferación celular excesiva o anómala (Pág. 2, Párr. [0014] y [0015]; Pág. 50, Compuestos 54, 56; Pág. 147, compuesto 511; Págs. 249 – 251, Reivindicación 1).

La diferencia entre la solicitud, definida en la reivindicación 1 y los compuestos divulgados en el documento D6, es que en los compuestos reclamados la posición 4 de la pirimidina se encuentra sustituida por un átomo de oxígeno, mientras que en los compuestos específicos mostrados en el documento D6 esta posición se encuentra ocupada por un átomo de nitrógeno.

El efecto que logra la sustitución del átomo de N por uno de O en la posición 4 de la pirimidina es la obtención de compuestos inhibidores de FAK útiles para el tratamiento de enfermedades que se caracterizan por una proliferación celular excesiva o anómala como el cáncer.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular como la necesidad de modificar los compuestos divulgados en el documento D6 para proporcionar compuestos alternativos para el tratamiento de cáncer, los cuales además tengan actividad inhibitoria de FAK.

Sin embargo, el documento D6 menciona la posibilidad de que el sustituyente en posición 4 de la pirimidina, es decir el grupo X, sea un átomo de oxígeno (Págs.249 – 251, Reivindicación 1). Por su parte, el documento D7 da a conocer compuestos de la fórmula (I) y su uso en el tratamiento de enfermedades neoplásicas, inflamatorias y desordenes del sistema inmune (Resumen). El documento D7 menciona que dichos compuestos actúan como inhibidores de FAK (Pág. 26, líneas 22-23).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un átomo de oxígeno en la posición 4 del anillo de pirimidina según las enseñanzas del documento D6 y consideraría que dichos compuestos son capaces de actuar como inhibidores de FAK tal como lo demuestra el documento D7, llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual la materia allí reclamada se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 19 no mencionan características

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:28490

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-063881

adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Con respecto al argumento de la solicitante referido al documento D6 según el cual *“D6 divulga compuestos que son inhibidores de PLK, en particular PLK1 (...). El hecho de que estas quinasas son inhibidas por compuestos similares es accidental, y no se puede concluir o predecir que estos compuestos inhiben todos los tipos de quinasas”*, esta Oficina se permite aclarar que si bien no es posible determinar que los compuestos divulgados en D6 serán inhibidores de todas las quinasas, tampoco puede determinarse a priori que no lo harán, más aun cuando el problema que pretende solucionar la presente solicitud es *“presentar nuevas sustancias activas que puedan emplearse para la prevención y/o el tratamiento de enfermedades que se caracterizan por una proliferación celular excesiva o anómala”* (Pág. 2, radicado No. 11-063881-00000-0000); Por lo que la similitud estructural con los compuestos reclamados así como sus propiedades anti-proliferativas útiles en el tratamiento de enfermedades como el cáncer, hacen que los compuestos divulgados por el documento D6 afecten el requisito de nivel inventivo para los compuestos ahora reclamados.

Por otra parte, la solicitante manifiesta que los compuestos reclamados actualmente son selectivos como inhibidores de FAK y presenta resultados de un ensayo comparativo del efecto de los compuestos del documento D6 en el crecimiento de células HCT116, mostrando los valores de EC₅₀ para una pareja de compuestos de la solicitud, asegurando que dichos valores se relacionan con la selectividad por la inhibición de los compuestos sobre FAK. Frente a estos datos, esta Oficina aclara que al no presentarse un ensayo específico para esta enzima, y teniendo en cuenta que se presentan valores para solo dos de los compuestos divulgados en D6, dicho ensayo no proporciona evidencia que le atribuya un efecto técnico inesperado a los compuestos tal y como se reclaman.

Tal como lo manifiesta la solicitante en la página 8 de su respuesta (bajo el radicado No. 11-063881-00016-0000) *“las enfermedades oncológicas son muy diversas, heterogéneas y personales”* por lo que la inhibición del crecimiento de una única línea celular no implica la inhibición específica sobre una enzima.

Con respecto a D7, la solicitante manifiesta que *“(…) solo se encuentran 7 ejemplos de los 506 ilustrados en D7 con un grupo 2-sustituido-isoindolin-1-ona unido al anillo de pirimidina. De hecho estos 7 ejemplos (como D6) muestran un átomo de nitrógeno como puente entre el anillo de pirimidina y el grupo 2-sustituido-isoindolin-1-ona en lugar de un átomo de oxígeno”*, esta Oficina considera la mención de estos ejemplos, los cuales comparten no solo características estructurales sino actividad como inhibidores de FAK (Pág. 26, líneas 22-24), junto a las enseñanzas del documento D6, afecta el nivel inventivo de los compuestos reclamados. Por otra parte, la presencia de un átomo de oxígeno en la posición mencionada se encuentra sugerida por el documento D6, por lo que tampoco aporta nivel inventivo a los compuestos reclamados, mucho menos cuando la persona normalmente versada en la materia conoce la relación de bioisosterismo existente entre los átomos de nitrógeno y oxígeno³.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto concedido se modifica el título de la

3 Moreira L., Barreiro E.J. Curr Med Chem. 2005;12(1):23-49. Bioisosterism: a useful strategy for molecular modification and drug design. <http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/15638729>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:28490

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-063881

invención, el cual quedará de la siguiente manera: “DERIVADOS DE (4-OXI(PIRIMIDIN-2-IL)AMINO)-N-BENZAMIDA COMO INHIBIDORES DE FAK/PTK2”.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “DERIVADOS DE (4-OXI(PIRIMIDIN-2-IL)AMINO)-N-BENZAMIDA COMO INHIBIDORES DE FAK/PTK2”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Boehringer Ingelheim International GmbH, 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 29 May 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDÓ DEL CASTILLO

Doctor(a)

CARLOS R. OLARTE GARCIA, office@olartemoure.com

Elaboró: Ruth Andrea Rodriguez
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia
Aprobó: José Luis Londoño Fernández