

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

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 día 05 de julio de 2011 con el N° 11-083156-00000-0000, por la sociedad Otsuka Pharmaceutical CO., LTD., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTO Y COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE QUINOLONA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/JP2009/070719 del 04 de diciembre de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 633 del 20 de octubre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 23555, notificado por fijación en lista el 31 de diciembre 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° 11-083156-00008-0000 del 08 de mayo de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 11 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 de acuerdo con el objeto reclamado se modifica el título de la invención el cual quedará de la siguiente manera: "COMPUESTOS DERIVADOS DE QUINOLIN-4-ONA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN".

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 11 (radicadas mediante escrito 11 083156-00008-0000) no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

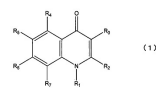
RESOLUCIÓN No:60375

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

7.1. Objeto de la invención.

El problema técnico consiste en la necesidad de proporcionar compuestos heteroarílicos que reduzcan la progresión de la disfunción neurológica. Para resolver este problema técnico la solicitud proporciona un derivado de quinolona de fórmula (I)



7.2 Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 05 de diciembre de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la 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
D1	EP1886996	“1H-Quinolin-4-one compounds with affinity for the GABA receptor, processes, uses and compositions”	13/Febrero/2008
D2	US 6,645,983	“Pharmaceutical compositions comprising 4-quinolones for treating cancers”	11/Noviembre/2003
D3	WO2004037792	“Novel nuclear hormone receptor ligands and methods”	06/Mayo/2004
D4	WO96/20914	“Tricyclic Retinoids methods for their production and use”	11/Julio/1996

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados de 1H-quinolin-4-ona útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas con la modulación de los receptores GABA_A tales como la ansiedad, la epilepsia, desordenes del sueño y relajación muscular (Resumen).

¹ . <https://www.google.com/patents/EP1886996A1?cl=en&dq=EP+1886996&hl=es&sa=X&ei=d0-vUuyYG8WtkAeQ4IDwBQ&ved=0CDkQ6AEwAA>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

El documento D2⁽²⁾ divulga composiciones farmacéuticas que comprenden derivados de quinolin-4-ona (Resumen).

El documento D3⁽³⁾ divulga compuestos derivados de quinolin-4-ona, útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas (Resumen).

El documento D4⁽⁴⁾ divulga compuestos tricíclicos derivados de quinolinas, útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas (Resumen y Pág. 130 Rv. 22).

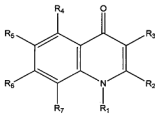
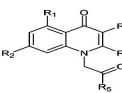
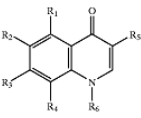
7.3. Nivel Inventivo

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, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un compuesto derivado de quinolona representando por la fórmula (I) o una sal del mismo, donde R1 representa a) hidrógeno (...)” (Pág. 11 del radicado N° 11-083156-00008-0000).

La siguiente tabla 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:

-Modalidad R4 y R5= Hidrógeno de forma independiente.

Tabla No 1		
Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de quinolona representado por la fórmula (I): 	Compuesto derivado de 1H-quinolin-ona:  (Págs. 23-24, Rv. 1)	Compuesto de fórmula (I): 
R1=Carbamoil C1-C6 alquilo sustituido por morfolin-alquilo C1-C6	 donde R5=NR6R7 R6=Alquilo C1-C6	R6=A-R9 A=C1-C4 alqueno R9=-CONR11R12 R11=Hidrógeno R12=Fenilo sustituido C1-C4

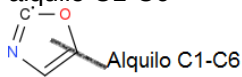
². <https://www.google.com/patents/US6645983?pg=PA50&dq=US+6,645,983&hl=es&sa=X&ei=mEvUriyGcXpkAePu4DoBQ&ved=0CDsQ6AEwAA>
3.[www.google.com/patents/ WO2004037792](https://www.google.com/patents/WO2004037792)
4.[www.google.com/patents/ WO1996020914](https://www.google.com/patents/WO1996020914)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375

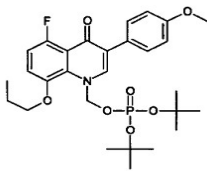
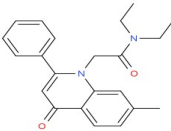
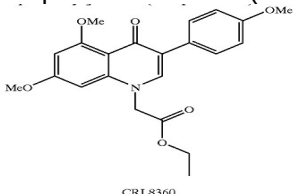
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

	R7=Oxazolil sustituido alquilo C1-C6  o R6R7 unidos al nitrógeno adyacente forman un anillo de morfolino (Págs. 23-24, Rv. 1)	(Cols. 127-128, Rv. 1)
R2=Hidrógeno	R4=Hidrógeno (Págs. 23-24, Rv. 1)	Hidrógeno (Cols. 127-128, Rv. 1)
R3=Fenilo	R3=Fenilo (Págs. 23-24, Rv. 1)	R5=Fenilo (Cols. 127-128, Rv. 1)
R4 y R5= Independientemente cada uno es hidrógeno	R1=Hidrógeno (Págs. 23-24, Rv. 1)	R1=Hidrógeno (Cols. 127-128, Rv. 1)
		R2=Hidrógeno (Cols. 127-128, Rv. 1)
R6=Hidrógeno	R2=Hidrógeno (Págs. 23-24, Rv. 1)	R3=Hidrógeno (Cols. 127-128, Rv. 1)
R7= Alcoxi C1-C4	Hidrógeno (Págs. 23-24, Rv. 1)	R4=Alcoxi C1-C4 (Cols. 127-128, Rv. 1)

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 en la modalidad en la cual R4 y R5 son independientemente hidrógeno porque el documento D1 divulga compuestos derivados de 1H-quinolin-4-ona útiles en el tratamiento de enfermedades asociadas con la modulación de los receptores GABA_A tales como: la ansiedad, la epilepsia, desórdenes del sueño y relajación muscular (Resumen). Por su parte, el documento D2 divulga composiciones farmacéuticas que comprenden derivados de quinolin-4-ona (Resumen).

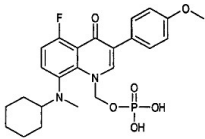
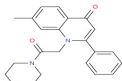
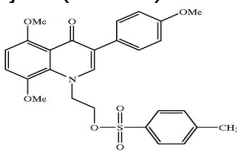
Además, los compuestos reclamados presentan similitudes estructurales de con los compuestos reclamados en los documentos D1 y D2, de acuerdo con lo presentado en el siguiente cuadro:

Compuesto Reclamado	D1	D2
Rv. 10 	Rv. 6  N,N-Dietil-2-(7-metil-4-oxo-2-fenil-4H-quinolin-1-il)-acetamida	Compuesto CRL8360 (Col.35)  CRL8360

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

Rv. 10 	Rv. 6  7-Metil-1-(2-morfolin-4-il-2-oxo-etil)-2-fenil-1H-quinolin-4-ona	Ej. 55(Col. 64) 
--	---	---

La diferencia entre el compuesto definido en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye en la posición 8 del anillo de quinolin-4-ona un sustituyente alcoxi C1-C4, mientras que en la misma posición del anillo el compuesto revelado en el documento D1 incluye un hidrógeno.

El efecto que logra el incluir en la posición 8 del anillo de quinolin-4-ona un alcoxi C1-C4 consiste en que se mejora la reducción en la progresión de la disfunción neurológica.

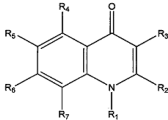
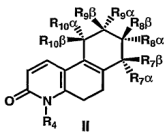
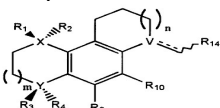
El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: Cómo proporcionar un compuesto alternativo derivado de quinolin-4-ona con una mayor actividad biológica.

Sin embargo, la inclusión de un alcoxi C1-C4 en la posición 8 del anillo de quinolin-4-ona, está divulgada en el documento D2 que revela compuestos con un anillo central de quinolil-4-ona que en la posición 8 presentan un alcoxi (Cols. 127-128, Rv. 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir en la posición 8 del anillo de quinolin-4-ona el grupo alcoxi C1-C4 de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 en la estructura del compuesto divulgado en el documento D1 uniéndolo en la posición 8 del anillo de quinolin-4-ona, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud en la modalidad en la cual R4 y R5 son hidrógeno de forma independiente. Por lo cual, la materia reclamada se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-11 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

-Modalidad R4 y R5 se enlazan para formar un tercer ciclo que está fusionado a la quinilín-4-ona.

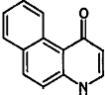
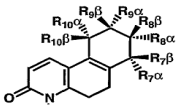
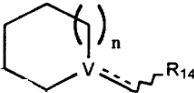
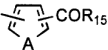
Características esenciales	D3	D4
Un compuesto de quinolona representado por la fórmula (I): 	Compuesto de fórmula (II)  II	Compuesto de fórmula (III)  (Págs. 121-125, Rv. 1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

	(Pág.29, Rv. 1)	
R1=Alquilo	R4=Hidrógeno (Pág.29, Rv. 1)	X=O Y=N R3=Hidrógeno R4=Alquilo C1-C6 m=1 (Págs. 121-125, Rv. 1)
R2=Hidrógeno	Hidrógeno	Hidrógeno (Págs. 121-125, Rv. 1)
R3=Fenilo	Hidrógeno	No menciona
R4 y R5= Se enlazan para formar un tercer ciclo que está fusionado a la quinolin-4-ona. 	 R7α=Alquilo y R7β=Hidrógeno R8α y R8β=Hidrógeno R9α y R9β=Hidrógeno R10α y R10β=Hidrógeno (Pág.29, Rv. 1)	 V=C n=0-2 R14=  R15=OR16 R16=Hidrógeno (Págs. 121-125, Rv. 1)
R6=Hidrógeno	Hidrógeno	R9=Hidrógeno (Págs. 121-125, Rv. 1)
R7= Alcoxi C1-C4	Hidrógeno	R10=AlquiloC1-C6 (Págs. 121-125, Rv. 1)

Como se dijo anteriormente, el documento D3 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 en la modalidad en la cual R4 y R5 forman un tercer anillo fusionado porque el documento D3 divulga compuestos derivados de quinolin-4-ona útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas (Resumen). Por su parte, el documento D4 revela compuestos tricíclicos derivados de quinolinas, útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas (Resumen y Pág. 130 Rv. 22).

La diferencia entre el compuesto definido en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D3 consiste en que el compuesto reclamado incluye en el nitrógeno de la posición 1 del anillo un sustituyente alcano, mientras que en la misma posición del anillo el compuesto revelado en el documento D3 incluye un hidrógeno.

El efecto que logra el incluir en el nitrógeno de la posición 1 del anillo un alcano, consiste en que se mejora la reducción en la progresión de la disfunción neurológica.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: Cómo proporcionar un compuesto alternativo derivado de quinolin-4-ona con una mayor actividad biológica.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

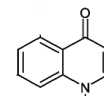
Sin embargo, la inclusión de un alcano en el nitrógeno de la posición 1 del anillo está divulgada en el documento D4 que revela compuestos tricíclicos derivados de quinolinas, útiles en el tratamiento de enfermedades neurodegenerativas que presentan unidos al nitrógeno de la posición 1 un alcano (Resumen, Págs. 121-125, reiv. 1 y Pág. 130 reiv. 22).

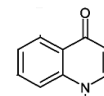
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir en la posición 1 del anillo el grupo alquilo enlazado al nitrógeno de acuerdo con lo revelado en el documento D4 dentro de la estructura del compuesto divulgado en el documento D3, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud en la modalidad en la cual R4 y R5 forman un tercer anillo fusionado. Por lo cual, la materia reclamada se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-11 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La solicitante argumenta que a partir de las enseñanzas de los documentos D1 y D2 no es posible derivar la solución al problema técnico planteado, que consiste en proporcionar compuestos derivados de quinolonas que reduzcan la progresión de la disfunción neurológica, comoquiera que el documento D1 revela quinolonas que actúan inhibiendo la acción GABA mejorando el tratamiento de la ansiedad, de la epilepsia, de desórdenes del sueño y de la relajación muscular y que por su parte, el documento D2 se encamina hacia el desarrollo de quinolonas como agentes antineoplásicos, por ende una persona normalmente versada en la materia no alcanzaría la solución propuesta.

Este Despacho manifiesta en primer lugar que los documentos D1 y D2 revelan



compuestos cuya estructura general responde al anillo bicíclico , es decir, que ambos documentos enseñan compuestos derivados de quinolin-4-ona. Además, el documento “*Quinolonas: Aspectos generales sobre su estructura y clasificación*”⁽³⁾ revela que la modificación de los sustituyentes en las diferentes posiciones del anillo varían el efecto y mecanismo del compuesto. De aquí, que los mecanismos de acción no son características esenciales del compuesto ya que variadas quinolonas con diferentes sustituyentes y que actúan mediante mecanismos de acción distintos resuelven el mismo problema técnico.

Como segundo aspecto, el documento D1 revela varias de las sustituciones del anillo de quinolona reclamadas en la presente solicitud, es decir, que las mismas ya han sido probadas en el estado de la técnica. La diferencia mencionada entre los compuestos de la solicitud y los compuestos revelados en el documento D1 (posición 8 presencia de un grupo alcoxi C1-C4), es suplida por el documento D2 que enseña quinolonas sustituidas en la posición 8 por un alcoxi C1-C4, por lo

³. Revista Chilena de infectología(2000); 17(1):53-66.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:60375

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-083156

cual una persona normalmente versada en la materia tendría suficiente motivación de combinar las enseñanzas de los documentos D1 y D2 para llegar así a la solución propuesta.

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 “COMPUESTOS DERIVADOS DE QUINOLIN-4-ONA Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS QUE LOS CONTIENEN”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Otsuka Pharmaceutical CO., LTD., 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 01 Oct 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, cavelier@cavelier.com

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia
Aprobó: Maria Jose Lamus Becerra