

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

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 04 de agosto de 2011, con el N° 11-098671-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Chiesi Farmaceutici S.P.A, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "(1-FENIL-2-PIRIDIN-4-IL)ETIL ÉSTERES DEL ÁCIDO BENZOICO COMO INHIBIDORES DE FOSFODIESTERASA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2010/000676 del 04 de febrero de 2010.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 640 del 15 de marzo de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 367, notificado por fijación en lista el 22 de enero 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, 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° 11-098671-00007-0000 del 15 de abril de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 15 que remplaza(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 la reivindicación 1 contenida en la página 23 del radicado N° 11-098671-00007-0000, no cumple con el requisito de novedad y las reivindicaciones 2 a 15, 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 la necesidad de proporcionar compuestos alternativos como inhibidores de PDE4. Para resolver este problema técnico se presenta un compuesto de fórmula general (I) (Ver pág. 23 del radicado N°11-098671-00007-0000)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 06 de febrero de 2009, 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	CO-106261	"DERIVADOS DE ALCOHOLES DE 1 FENIL-2-PIRIDINILALQUILO COMO INHIBIDORES DE LA FOSFODIESTERASA "	08/Agosto/2007 (Fecha de Prioridad)
D2	WO2008006509A	"DERIVATIVES OF 1-PHENYL-2-PYRIDINYL ALKYLENE ALCOHOLS AS PHOSPHODIESTERASE INHIBITORS"	17/Enero/2008

El documento D1 divulga el compuesto éster 1-(3-ciclopropil metoxi -4- difluorometoxi-fenil) -2-(3,5-dicloro-1-oxi-piridin-4-il) etílico del ácido 3-ciclopropil metoxi-4-metansulfonilamino - benzoico (Pág. 23 de la descripción, radicado N°10-006261-00000-0000)

El documento D2¹ divulga un compuesto de la fórmula (I) útil como inhibidor de PDE-4 (Pág. 4 línea 6 a Pág. 6 línea 28)

6.3. Novedad.

Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486: *"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica.*

El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una 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".

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no es nuevo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: *"Un compuesto de la fórmula general (I) como (-) enantiómero (Ver página 23 del radicado N° 11-098671-00007-0000)*

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 que representa(n) el estado de la técnica:

¹URL:<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?>

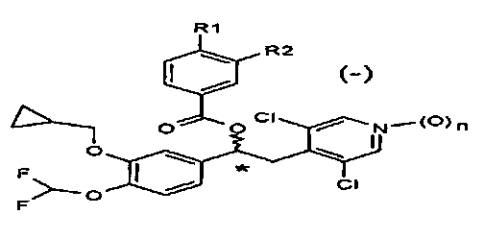
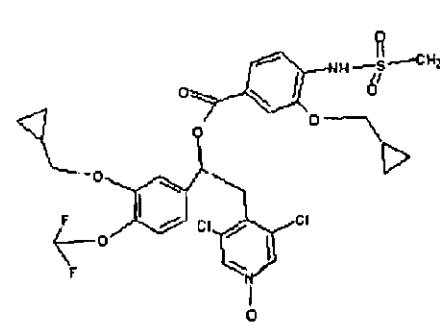
CC=WO&NR=2008006509A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20080117&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

Tabla 1

Características esenciales	D1
 R1 y R2 pueden ser iguales o diferentes, y son seleccionados del grupo que consiste de: -alquilo C₁-C₆ lineal o ramificado sustituido opcionalmente con uno o mas átomos de halógeno. -OR₃ donde R₃ es un -alquilo C₁-C₆ lineal o ramificado opcionalmente sustituido con uno o mas átomos de halógeno o grupos cicloalquilo C₃-C₇ y. - HNSO₂R₄ en donde R₄ es -alquilo C₁-C₄ lineal o ramificado opcionalmente sustituido con uno o mas átomos de halógeno, en donde por lo menos uno de R1 y R2 es HNSO₂R₄.	 Compuesto 69: éster 1-(3-ciclopropil metoxi -4- difluorometoxi-fenil) -2-(3,5-dicloro-1-oxi-piridin-4-il) etílico del ácido 3-ciclopropil metoxi-4-metansulfonilamino - benzoico (Ver pág. 23 de la descripción, radicado N°10-006261-00000-0000)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el (los) documento(s) D1, el cual da a conocer el compuesto éster 1-(3-ciclopropil metoxi -4- difluorometoxi-fenil) -2-(3,5-dicloro-1-oxi-piridin-4-il) etílico del ácido 3-ciclopropil metoxi-4-metansulfonilamino – benzoico. La existencia del (-) enantiómero del compuesto corresponde a una característica implícita del compuesto lo cual no puede ser considerado como una característica novedosa.

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en el (los) documento(s) D1.

Es oportuno aclarar que, contrario a lo afirmado por la solicitante, la invención reclamada si se encuentra contenida en el estado de la técnica de forma total y absoluta por cuanto todas las características del compuesto reclamado están comprendidas en el compuesto 69 del documento D1. Pese a que la solicitante manifiesta que en el campo de la química un enantiómero es nuevo sobre la mezcla racémica, es oportuno de aclarar que *"si el documento del estado de la técnica da a conocer una mezcla racémica, la persona del oficio normalmente versada en la materia puede derivar directamente los isómeros ópticos reivindicados que son las formas especulares que conforman la mezcla racémica. Por lo cual, concluirá que en este caso los isómeros ópticos no son nuevos"*²

2 SuperIntendencia de Industria y Comercio " Guía para examen de solicitudes de patente de invención y modelo de utilidad" Numeral 2.12.3.5
Página 3 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

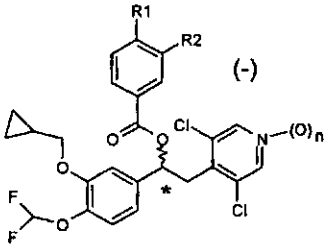
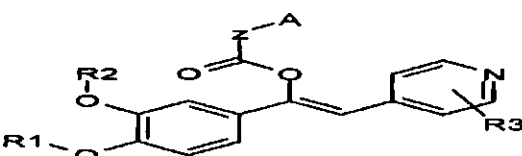
6.4. Nivel Inventivo.

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 2 se refiere a: “Un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R1 es HNSO₂R₄, en donde R4 es metilo, R2 es OR3, en donde R3 es ciclopropilmetilo y n es 0.” (Ver página 23 del radicado N° 11-098671-00007-0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 2, y las reveladas en el (los) documento(s) D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 2

Características esenciales	D2
 R1 es HNSO₂R₄ en donde R₄ es metilo, R2 es OR₃ donde R₃ es ciclopropilmetilo y n es 0.	 R1 y R2 se seleccionan de alquilo C₁-C₆ lineal o ramificado sustituido por cicloalquilo C₃-C₇ Z es (CH₂)_n siendo n igual a 0 A es un anillo sustituido por grupos seleccionados de: - OR₇ siendo R₇ un alquilo C₁-C₆ lineal o ramificado - HNSO₂R₁₂ siendo R₁₂ un alquilo C₁-C₆ lineal (Pág. 4 línea 6 a Pág. 6 línea 28)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

Como se dijo anteriormente, el documento D2 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 2 porque divulga un compuesto de la fórmula (I) útil como inhibidor de PDE-4 (Pág. 4 línea 6 a Pág. 6 línea 28)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2, y los compuestos del documento D2 consiste en que el compuesto de la solicitud presenta un grupo etilo enlazando los anillos de fenilo y piridina en lugar del grupo vinilo del compuesto divulgado en D2

El efecto que logra el incluir un éster etílico del compuesto derivado de ácido benzoico en la molécula es que proporciona nuevos compuestos alternativos como inhibidores de PDE-4.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto conocido en el documento D2 para proporcionar nuevos compuestos alternativos como inhibidores de PDE-4."

Ahora bien, teniendo en cuenta que el documento D2 da a conocer compuestos ésteres derivados de ácido benzoico inhibidores de PDE4; Se puede observar que el hecho que los compuestos reclamados correspondan a ésteres etílicos derivados de ácido benzoico en lugar de los ésteres vinílicos derivados de ácido benzoico del documento D2 es la única diferencia estructural entre los compuestos reclamados y los compuestos conocidos según el documento D2. Pese a esta diferencia no se presenta evidencia de un efecto técnico sorprendente otorgado al compuesto al reemplazar un éster vinílico por un éster etílico. Lo anterior teniendo en cuenta que la solicitud establece que para los compuestos reclamados se determinaron valores de IC_{50} para inhibición de liberación de TNF- α inducido por LPS comprendidos entre 0,06 y 4,4 nM (Ver pág. 46 de la descripción; radicado N° 11-098671-00000-0000). El documento D2 establece que dichos valores son de 0,0009; 0,00377; 0,0031; 0,0010; 0,0022 y 0,002 μ M para los compuestos CHF5408, CHF5526, CHF5533, CHF5546, CHF5532 y CHF5555 respectivamente (Págs. 46 y 47). Se puede observar que estos valores se encuentran en el mismo rango establecido para los compuestos de la invención. De esta manera esta oficina concluye que el efecto presentado por los compuestos reclamados es esperado según el efecto presentado por los compuestos conocidos según el documento D2.

Lo anterior considerando que la modificación realizada en la estructura, es una modificación menor y no se observa que ocasione una variación importante en su actividad, lo cual es considerado obvio y por lo tanto, sin altura inventiva.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 3 a 15 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La reivindicación 8 que se refiere al proceso para la preparación de los compuestos reclamados carece de nivel inventivo por cuanto una persona normalmente versada en la materia fácilmente realizaría dicho proceso de acuerdo a las enseñanzas del documento D2 que enuncia la

Página 5 de 7

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-098671

oxidación de un anillo de fenilo sustituido en las posiciones 3 y 4 por los sustituyentes OR_2 y OR_1 y posterior reacción con una piridina sustituida por sustituyentes R_3 (Pág. 23 esquema 1) siendo R_3 un átomo de halógeno (Pág. 5 línea 18) constituyendo una sugerencia para realizar la reacción del compuesto 3-ciclopropilmetoxi-4-difluorometoxi-fenilaldehído con metildicloropiridina y posterior derivación del enantiómero para llegar al proceso de la reivindicación 8 por lo cual se considera obvia.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual la invención proporciona inhibidores mucho más potentes que los reportados en el arte previo y que una persona normalmente versada en la materia no habría encontrado motivación alguna para llegar a los compuestos reclamados de acuerdo a lo mostrado en el documento D2, se aclara a la solicitante que una persona normalmente versada en la materia esperaría que se mantuviera el efecto inhibitor de PDE4 mostrado por los compuestos conocidos en el documento D2 al utilizar compuestos derivados de ésteres etílicos de ácido benzoico en lugar de compuestos derivados de ésteres vinílicos de ácido benzoico, por cuanto los sustituyentes utilizados en el compuesto reclamado se encuentran ampliamente sugeridos en este documento (los sustituyentes $HNSO_2R_4$ y OR_3 siendo R_3 igual a metilo, se encuentran presentes en los compuestos CHF5526 y CHF 5546; el anillo 3-ciclopropilmetoxi-4-difluorometoxi-fenilo se encuentra presente en el compuesto CHF5514) y a su vez, se encuentra que el reemplazo de un grupo vinilo (alquenileno) por un grupo etilo (alquileno) es la única diferencia estructural de los compuestos reclamados con respecto a los compuestos conocidos en el documento D2 constituye una modificación menor sobre la estructura de la molécula. Se reitera a la solicitante, que el efecto presentado por los compuestos reclamados es similar al efecto presentado por los compuestos del documento D2, como ya se indicó previamente, por lo cual se concluye que el nivel de actividad de los compuestos de la solicitud estudiada no es sorprendente para la persona normalmente conocedora de la materia, a la luz de lo enseñado en el documento D2.

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 "1-FENIL-2-PIRIDIN-4-IL)ETIL ÉSTERES DEL ÁCIDO BENZOICO COMO INHIBIDORES DE FOSFODIESTERASA".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es), Chiesi

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 37078

Por la cual se deniega una patente de invención

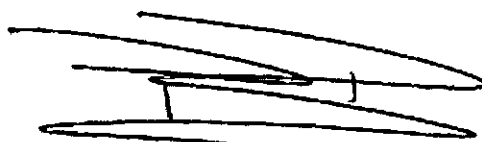
Rad. PCT/11-098671

Farmaceutici S.P.A, 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 20 Jun 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

notificaciones@clarkemodet.com.co

clarkemodet@clarkemodet.com.co

Elaboró: Rodolfo Cadena Amaya ✓

Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓

Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓