

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante Resolución N° 10006 del 21 de febrero de 2014, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: “PROCESO DE SÍNTESIS DE COBICISTAT”, con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 31 de marzo de 2014 con el N° 11-114749-00013-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Gilead Sciences, Inc. interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La recurrente adjunta un nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 16 reivindicaciones, presentado el 31 de marzo de 2014 con el N° 11-114749-00013-0000.

Señala a continuación que las características del método reivindicado logran disminuir el costo, tiempo y cantidad de desechos en la preparación del compuesto de fórmula I. Agrega que no hay razón para que la persona normalmente versada en la materia estuviese motivada a modificar las enseñanzas del documento D1 con los métodos del documento D3 para llegar al método reivindicado.

La recurrente resalta que la diferencia entre el método de la solicitud y el divulgado en el documento D1 es que se realiza un paso de dimerización de la aziridina, mientras que en el documento D1 se realiza una condensación aldólica en lugar de la dimerización de la aziridina; agrega que en el documento D1 se realiza la síntesis con el compuesto 21 que tiene un grupo protector Boc (tert-butiloxycarbonilo).

Afirma además que el documento D3 describe la migración de N a C en aziridinas alfa-litiadas que están protegidas con el grupo Boc, en lugar de la dimerización, por lo cual las reacciones del documento D3 no producirán el compuesto 21 que tiene el grupo protector Boc.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

Considera que de acuerdo con las enseñanzas del documento D3 y del documento Hodgson et. al. (que fue citado en el primer concepto técnico, Oficio 5598) la dimerización de aziridinas sólo se aplica a materiales de partida que tengan un grupo protector Bus (tert-butilsulfonilo). Adicionalmente afirma que el documento Hodgson et. al. aclara que las aziridinas protegidas con N-Boc no produjeron dímeros y que las aziridinas protegidas con N-Bus produjeron dímeros con rendimiento del 90%.

La recurrente afirma que el objeto de la reivindicación 13, que divulga una reacción de acoplamiento que incluye una sal ($-\text{COO}^-\text{M}^+$), no es obvio frente a las enseñanzas del documento D2 porque este enseña una reacción de acoplamiento del compuesto 13 con un ácido ($-\text{COOH}$). Agrega que cuando esta reacción de acoplamiento se lleva a cabo en diclorometano, tolueno o una mezcla de estos, se logran resultados mejorados inesperados (descripción, Pág. 32, líneas 17 a 25).

Considera que el análisis de nivel inventivo realizado por esta Oficina es del tipo 'hindsight' o en retrospectiva.

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto en los siguientes términos:

Con relación al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 16 reivindicaciones, presentado el 31 de marzo de 2014 con el N° 11-114749-00013-0000, esta Oficina considera que es procedente admitirlo para el estudio pertinente porque se canceló la tasa respectiva y no amplía el objeto inicialmente presentado.

Con relación al argumento según el cual las características del método reivindicado logran disminuir el costo, tiempo y cantidad de desechos en la preparación del compuesto de fórmula I, esta Oficina considera que no hay evidencia en esta solicitud, de que el método reivindicado logre las ventajas mencionadas por la recurrente.

Ahora bien, en referencia al argumento de la recurrente según el cual no hay razón para que la persona normalmente versada en la materia estuviese motivada a modificar las enseñanzas del documento D1 con los métodos del documento D3 para llegar al método reivindicado, esta Oficina aclara que, teniendo en cuenta que la diferencia que proporciona el proceso reivindicado, en relación con el proceso conocido en el documento D1, es que se realiza la dimerización de la aziridina (de fórmula II) para obtener un compuesto (de fórmula V), mientras que en el documento D3 del estado de la técnica el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

compuesto de fórmula 21 se obtiene por condensación tipo aldol entre los compuestos 17 y 18, generando el compuesto 19, el cual se deshidrata para obtener el compuesto 20 y se desprotege para obtener el compuesto 21. Por lo tanto, y ante la ausencia de un efecto técnico sorprendente, se considera que en el proceso reivindicado se realiza un paso alternativo, es decir, que el resultado de este método es de la misma naturaleza que el de los documentos del estado de la técnica. En este orden de ideas, el documento D3 enseña que las aziridinas que tienen un grupo protector N-organosulfonilo se someten a una dimerización rápida para dar 2-ene-1,4-diaminas, que es una etapa característica del proceso reivindicado; de manera que, dado que el documento D3 enseña el incluir el grupo protector N-organosulfonilo, esta enseñanza sugiere a la persona normalmente versada en la materia incluir un grupo protector N-organosulfonilo en lugar del grupo N-Boc enseñado en el método del documento D1. La cuestión era, entonces, ensayar los grupos protectores conocidos N-organosulfonilo y N-Boc, dado que los dos producen 2-ene-1,4-diaminas y la elección de un grupo N-organosulfonilo es obvia y no tiene nivel inventivo.

En cuanto tiene que ver con el argumento según el cual la diferencia entre el método de la solicitud y el divulgado en el documento D1 es que se realiza un paso de dimerización de la aziridina (mientras que en el documento D1 se realiza una condensación aldólica en lugar de la dimerización de la aziridina); esta Oficina reitera que es cierto que la diferencia entre el método de la solicitud y el divulgado en el documento D1 es que se realiza un paso de dimerización de la aziridina, porque en la solicitud el compuesto de fórmula V se obtiene mediante la dimerización de dos moléculas de aziridina de fórmula II, mientras que en el documento D1 el compuesto 21 se obtiene por condensación aldólica entre los compuestos 17 y 18 con lo cual se forma el compuesto 19, posterior deshidratación de este para obtener el compuesto 20 y desprotección para obtener el compuesto 21. En este orden de ideas, es claro que en los dos casos se obtiene una 2-ene-1,4-diamina y que no hay evidencia de que este paso tenga un efecto inesperado sobre todo el proceso de síntesis realizado.

Con respecto al argumento de la recurrente según el cual en el documento D1 se realiza la síntesis con el compuesto 21 que tiene un grupo protector Boc (tert-butiloxycarbonilo), esta Oficina aclara que asiste razón a la recurrente porque el documento D1 enseña el grupo protector Boc (tert-butiloxycarbonilo) y se aclara, además, que está al alcance de la persona normalmente versada en la materia el incluir el grupo protector Boc o un grupo protector N-organosulfonilo, dado que el documento D3 enseña la dimerización de aziridinas protegidas con un grupo protector N-organosulfonilo (Pág. 10009, resumen, síntesis b).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

Ahora bien, con respecto al argumento de la recurrente según el cual el documento D3 describe la migración de N a C en aziridinas alfa-litiadas que están protegidas con el grupo Boc, en lugar de la dimerización, por lo cual las reacciones del documento D3 no producirán el compuesto 21 que tiene el grupo protector Boc; esta Oficina aclara que el documento D3 sí enseña la dimerización de dos aziridinas que tienen el grupo protector N-organosulfonilo, de la cual se obtiene la 2-ene-1,4-diamina (Pág. 10009, resumen, síntesis b), de la misma manera que en la solicitud. De otro lado, no tiene mucho sentido la afirmación según la cual las reacciones del documento D3 no producirán el compuesto 21 que tiene el grupo protector Boc, porque el compuesto 21 que tiene el grupo protector Boc no es objeto de la solicitud estudiada sino del documento D1 con el que realiza el examen y la importancia del documento D3 en el examen consiste en que enseña la dimerización de dos aziridinas que tienen el grupo protector N-organosulfonilo (que no divulga el documento D1).

Se reitera que la persona normalmente versada en la materia ante la necesidad de proteger las aminas primarias ($-NH_2$) durante la reacción, recurriría bien sea al grupo N-Boc o a un grupo protector N-organosulfonilo, según enseñan los documentos del estado de la técnica (documento D1, Pág. 189, esquema 8, compuestos 8 y 17 a 22 y Pág. 217, esquema 22, compuesto 57 y documento D3, Pág. 10009, resumen, síntesis b). La aziridina de la solicitud tiene el grupo $SO_2NR_aR_b$ que es un grupo protector N-organosulfonilo y la aziridina del documento D3 también tiene un grupo protector N-organosulfonilo.

Y como se explicó, tanto uno como el otro son sólo grupos protectores del nitrógeno, que se eliminan del proceso y no proporcionan, en este caso particular, efectos sorprendentes.

Se advierte además, en referencia al argumento de la recurrente según el cual de acuerdo con las enseñanzas del documento D3 y del documento Hodgson et. al. (que fue citado en el primer concepto técnico, Oficio 5598) la dimerización de aziridinas sólo se aplica a materiales de partida que tengan un grupo protector Bus (tert-butilsulfonilo), ya que el documento Hodgson et. al. aclara que las aziridinas protegidas con N-Boc no produjeron dímeros y que las aziridinas protegidas con N-Bus produjeron dímeros con rendimiento del 90%, esta Oficina aclara que asiste razón a la recurrente y justamente porque los documentos D3 y Hodgson et. al. enseñan que la dimerización de aziridinas se aplica a materiales de partida que tengan un grupo protector N-organosulfonilo, estos documentos sugieren a la persona normalmente versada en la materia la dimerización de aziridinas reivindicada que se

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

realiza con un material de partida que tiene un grupo protector N-organosulfonilo, el proceso reivindicado se considera obvio porque este paso está claramente sugerido en el estado de la técnica. Más aún porque el documento Hodgson et. al. aclara que las aziridinas protegidas con N-Boc no produjeron dímeros y que las aziridinas protegidas con un grupo protector N-organosulfonilo produjeron dímeros con rendimiento del 90%, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir el grupo protector grupo protector N-organosulfonilo; por lo tanto puede concluirse que el objeto reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo.

Por otra parte resulta del caso señalar que, contrario a lo argumentado por la recurrente, el objeto de la reivindicación 13, que divulga una reacción de acoplamiento que incluye una sal ($-\text{COO}^-\text{M}^+$), está claramente sugerido en el documento D2 que enseña una reacción de acoplamiento del compuesto 8 (que es una amina secundaria) con el compuesto 23 (que tiene un grupo ácido ($-\text{COOH}$)) (Pág. 228, Esquema 9), por lo cual este paso es obvio para la persona normalmente versada en la materia quien conoce este documento del estado de la técnica. Además, respecto al argumento de la recurrente según el cual cuando esta reacción de acoplamiento se lleva a cabo en diclorometano, tolueno o una mezcla de estos, se logran resultados mejorados inesperados (descripción, Pág. 32, líneas 17 a 25), esta Oficina aclara por un lado que el documento D1 enseña previamente la conveniencia de llevar a cabo este tipo de reacciones en solventes tales como el diclorometano (Pág. 95, línea 9) y por otro lado que estos solventes son comúnmente utilizados en la técnica y que adicionalmente no proporcionan algún efecto técnico sorprendente y por tal razón no están mencionados en el capítulo reivindicatorio; de donde se infiere que el objeto de la solicitud puede derivarse de manera evidente del estado de la técnica, y no cumple con los requisitos de patentabilidad.

Por otra parte, contrario a lo argumentado por la recurrente, el examen de nivel inventivo realizado por esta Oficina no es del tipo 'hindsight' o en retrospectiva, porque como se explicó se consideraron documentos del estado de la técnica con fecha previa a la fecha de presentación de la solicitud prioritaria los cuales dan a conocer las características técnicas del método reivindicado, es decir: (1) método para sintetizar el compuesto S, (2) que consiste en obtener una 2-ene-1,4-diamina, desprotegerla, reducirla para tener la diamina con un enlace sencillo, tratarla con ácido y acoplarla para formar el compuesto final. Además, dado que el método reivindicado no presenta algún efecto técnico que sea sorprendente para la persona normalmente versada en la materia, teniendo en cuenta las enseñanzas del estado de la técnica, se considera que es obvio y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:39063

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/11-114749

Por lo anteriormente expuesto, se reitera que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad legalmente previstos, específicamente el de nivel inventivo; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución N° 10006 del 21 de febrero de 2014, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Gilead Sciences, Inc., advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 30 Jul 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE, notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Revisó: Carlos Daniel Lemus Giraldo
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: JosÉ Luis Londoño FernÁndez