

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 33743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 4, numeral 5 del decreto 2153 de 1992, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 29 de septiembre de 2004, bajo el número 04 097165 00000000, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE LA BENZAMIDA ÚTILES COMO INHIBIDORES DE LA HISTONA DEACETILASA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/GB03/01442 del 02 de abril de 2003.

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 30 de mayo de 2008 y el 29 de abril de 2009, atendió oportunamente a los requerimientos formulados presentando aclaraciones. Adicionalmente, 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 nuevas reivindicaciones 1 a 12, contenidas en los folios 344 a 356 del expediente en estudio, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

1. Objeto de la invención

La invención del expediente bajo estudio, se relaciona con derivados de la benzamida o sales farmacéuticamente aceptables, o ésteres hidrolizables *in vivo* o

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 3 3 7 4 3

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

unas amidas de los mismos. Los derivados de la benzamida poseen la actividad inhibidora de la histona deacetilasa (HDAC) y por tanto son valiosos en el tratamiento de estados patológicos asociados al cáncer, fibrosis quística, corea de Huntington.

En general, puede señalarse que las histonas rodeadas por 146 pares de bases de ADN forman el nucleosoma, la unidad fundamental de la cromatina y las colas terminales de N de las histonas contienen lisinas que son sitios para la acetilación posterior a la transcripción. Las histonas deacetilasas son enzimas que contiene zinc y catalizan la extracción de los grupos acetilo del terminal ϵ -amino de los residuos de lisina agrupados cerca al terminal amino de las histonas nucleosomales.

A la fecha solo conocen unos pocos inhibidores de HDAC en el estado de la técnica y por lo tanto es necesario identificar otra variedad de compuestos con dicha actividad.

2. No se cumple el artículo 25

El artículo 25 de la Decisión 486 señala que "La solicitud de patente sólo podrá comprender una invención o un grupo de invenciones relacionadas entre sí, de manera que conformen un único concepto inventivo."

De acuerdo al artículo presente podemos señalar que, la unidad de invención en los casos de las solicitudes que reivindican varios procesos de síntesis para la obtención de una estructura común, se determina en virtud de las enseñanzas del estado del arte, toda vez que entre ellos el único elemento técnico unificador corresponde al producto final obtenido.

Con fundamento en lo anterior, es de anotar que mediante la evaluación *a posteriori* de unidad de invención fue posible concluir que entre los tres procesos no existe un grupo de características comunes o elemento técnico unificador – estructura Markush- que de por sí cumpla con el requisito de altura inventiva.

La tabla (I) incorporada en la valoración del nivel inventivo de la estructura Markush – concepto común entre los procesos – permite demostrar que los elementos estructurales, químicos y funcionales del producto obtenido han sido anticipados por las enseñanzas reveladas en los documentos del estado del arte JP 11302173 (en adelante denominado D1) y US5232937 (en adelante denominado D2).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 3 37 4 3

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

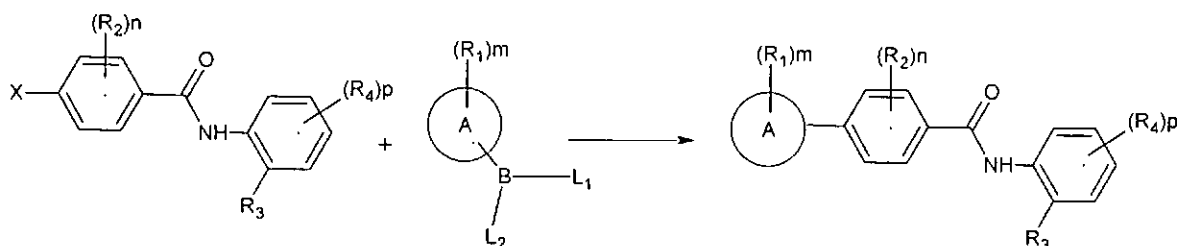
Adicionalmente, cada proceso presenta un conjunto específico de sustancias de partida, cuyas condiciones de reacción resultan disímiles en razón a las características funcionales y químicas de los reactivos, razón por la cual, tampoco es posible considerar su coexistencia en razón a los elementos característicos de la transformación química.

En consecuencia, durante las dos oportunidades jurídicas anteriores, esto es mediante oficio 3164 de 29 de febrero de 2008 y oficio 1088 de 30 de enero de 2009, se requirió al señor solicitante para que modificara su solicitud a fin de que existiera un grupo de invenciones relacionadas entre sí por un mismo concepto común e inventivo. Sin embargo, el solicitante conservó el pliego reivindicatorio contenido en los folios 344 a 356.

Por las razones expuestas se reitera que existen tres invenciones particulares definidas en la cláusula (11), a saber:

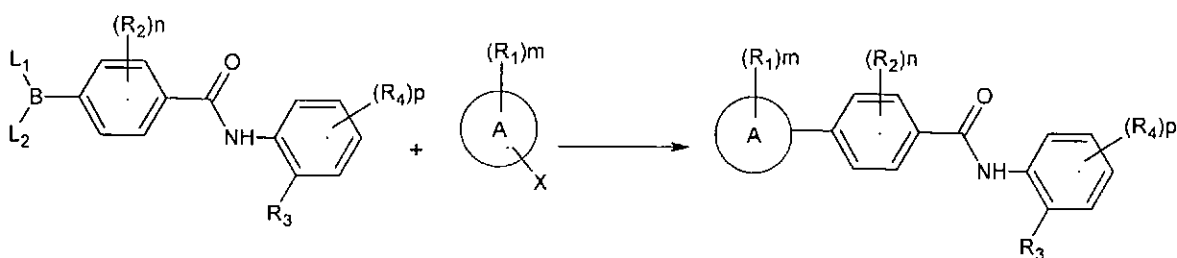
1. La primera derivada de la reacción definida en el literal a):

La reacción de un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula (III).



2. La segunda definida en el literal b):

La reacción de un compuesto de fórmula (IV) con un compuesto de fórmula (V).



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

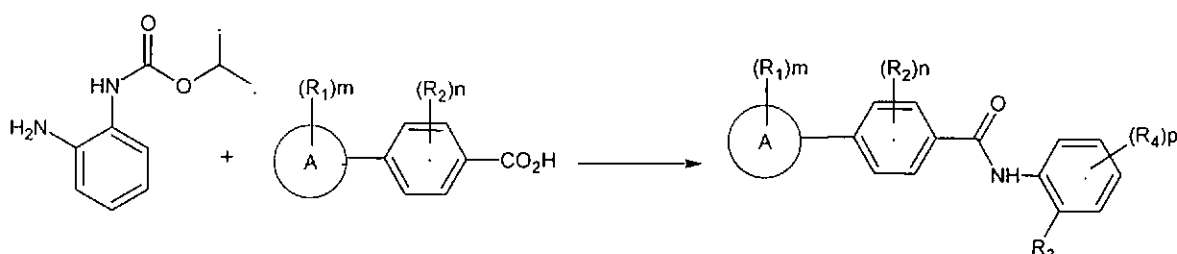
RESOLUCIÓN N° 33743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

3. La tercera definida en el literal c)

La reacción en presencia de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazinil-2-il)-4-cloruro de metil-morfolina de un compuesto de fórmula (VI) con un compuesto de fórmula (VII).



Posteriormente si es necesario i) convertir un compuesto de la fórmula (I) en otro compuesto de fórmula (I) y ii) extraer cualquier grupo de protección.

De lo anterior, se concluye que el solicitante no presentó un pliego reivindicatorio ajustado a las disposiciones del artículo 25 de la Decisión 486. De esta manera se ratifica la falta de unidad de invención *a posteriori*, relativa al contenido de la cláusula 11, toda vez que existen en el estado de la técnica los documentos **D1** y **D2** que anticipan las características técnicas del concepto unificador que para el caso corresponde a la estructura Markush de la fórmula (I).

3. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de invención de la cual se reivindica prioridad es el 05 de abril de 2002, se buscaron documentos del estado de la técnica relacionados, con fecha de publicación anterior a ella, encontrándose lo siguiente:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	JP11302173	"Histone deacetylase inhibitor"	02/11/1999
D2	US5232937	"Derivatives of N-phenylbenzamide with anti-ulcer and anti-allergy"	03/08/1993

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° **3 3 7 4 3**

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

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."

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 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."

A su vez, sobre este requisito el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina recientemente ha dicho:

"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 (...). En este punto conviene advertir que uno es el examen que realiza el técnico medio respecto de la novedad y otro el que se efectúa con respecto al nivel inventivo; si bien en uno y otro se utiliza como parámetro de referencia el 'estado de la técnica', en el primero, se coteja la invención con las 'anterioridades' existentes dentro de aquella, cada uno (sic) por separado, mientras que en el segundo (nivel inventivo) se exige que el técnico medio que realiza el examen debe partir del conocimiento general que él tiene sobre el estado de la técnica y realizar el cotejo comparativo con su apreciación de conjunto, determinado si con tales conocimientos técnicos existentes ha podido o no producirse tal invención."¹

Teniendo en cuenta lo anterior, y considerando los documentos encontrados en el estado de la técnica, las reivindicaciones presentadas por el solicitante carecen de nivel inventivo. Es así como, al evaluar los elementos característicos de los compuestos revelados por el estado del arte es posible establecer, las siguientes diferencias técnicas con respecto a la materia reivindicada:

¹ Proceso 192 IP 2005.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

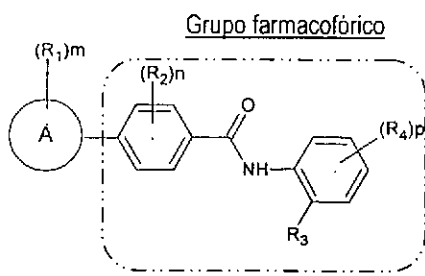
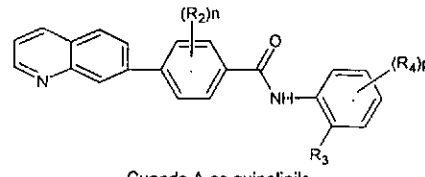
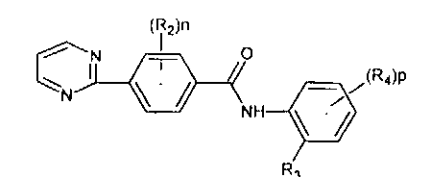
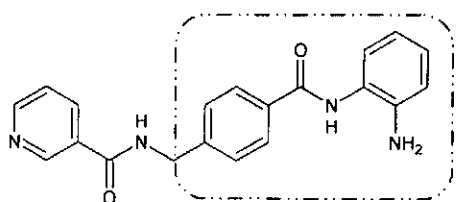
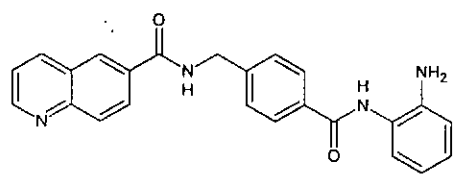
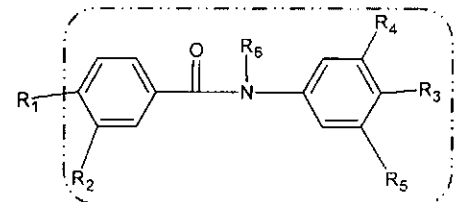
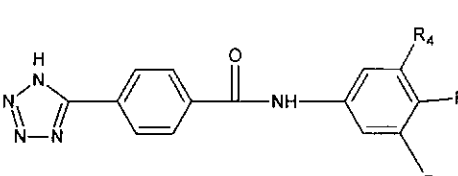
Nº 3 3 7 4 3

RESOLUCIÓN Nº

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. Nº PCT/04- 97165

Tabla I.

Materia Reivindicada	Antecedente D1	Antecedente D2
<u>Grupo farmacofórico</u>  A es piridilo, quinolilo, indolilo, pirimidinilo, mofolinilo, piperidinilo, piperazinilo, piridazinilo, pirazinilo, tiazolilo, tienilo, tienopirimidinilo, tienopiridinilo, purinilo, tiazinilo, oxazolilo, pirazolilo o furanilo Es decir, dentro de las modalidades particulares de la invención se encuentran las especies químicas:  Cuando A es quinolinilo  Cuando A es pirimidinilo	El documento D1 revela las siguientes especies químicas:  	El documento D2 presenta la estructura Markush  R₁ es tetrazol-5-il R₃, R₄ y R₅ son H R₆ es H Es decir, al reemplazar R₁ por la connotación señalada se obtienen compuestos con las siguientes características químicas y funcionales: 

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 3 37 4 3

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

De acuerdo a la tabla anterior, podemos señalar que:

- Con relación al antecedente **D1**, la diferencia estriba en la incorporación de un segundo puente carbamoilo para enlazar el anillo de benzamida con las estructuras de piridina o quinolina.
- Con relación al antecedente **D2**, la diferencia estriba en que el anillo enlazado a la estructura de benzamida por la posición 3 respecto del grupo carbamoilo es de tipo tetrazol-5-il.

Ahora bien, de acuerdo con la memoria descriptiva de la solicitud existía la necesidad de diseñar derivados de benzamida con actividad inhibidora de la histona deacetilasa, terapéuticamente efectivos frente al tratamiento de estados patológicos asociados al cáncer.

Así las cosas, fue la búsqueda de alternativas terapéuticas para el tratamiento del cáncer la que motivó la investigación de estructuras derivadas del anillo de benzamida, y al respecto es claro que el antecedente D1 ya había motivado a un técnico medio en la materia a estudiar la actividad de derivados dobles de carboxamida que incluyeran dos anillos de fenilo y estructuras heterocíclicas en el extremo izquierdo; aunque las estructuras del antecedente, se diferencian de la materia objeto de estudio en que presentan un doble puente carboxamido, dichos compuestos presentan la misma actividad terapéutica, situación que permite concluir que se trata de series bioisósteras con capacidad para enlazarse a la enzima histona deacetilasa.

Por otra parte, las diferencias encontradas con el antecedente D1 se subsanan con las enseñanzas reveladas por el estado del arte en el documento D2, que se relacionan con derivados de benzamida con un único puente carboxamido y sustituciones heterocíclicas de tipo tetrazol en el extremo izquierdo de la molécula.

Si bien es cierto, el núcleo de tetrazol no forma parte de la definición que el memorialista indica para el radical A dentro de la estructura de fórmula (I), además éste señala la posibilidad de que A sea un núcleo heterocíclico de cinco miembros como tiofeno, furano u oxazol, razón ésta que le permite concluir a un técnico medio en la materia que las enseñanzas del antecedente resultan válidas para encaminar la investigación de estructuras con actividad sobre la histona deacetilasa, como quiera que los conocimientos básicos sobre relación estructura-actividad, permiten aseverar que incluso series con anillos tipo quinolina y piridina en dicho extremo conservan la actividad farmacológica.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 3 3 7 4 3
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

En general, se ha admitido que los fármacos ejercen sus acciones biológicas como resultado de su interacción con estructuras celulares denominadas receptores, por tal razón resulta evidente que para que dos compuestos se consideren bioequivalentes es preciso que exista la máxima relación de analogía en cuanto a sus propiedades estéricas, polares y químicas, tal como ocurre entre la serie que revela el antecedente D1 y la serie reivindicada por el solicitante.

De acuerdo con los conocimientos básicos sobre equivalencias bioisósteras, en sistemas cíclicos se cumple la regla de equivalencia cuando se sustituye un anillo de fenilo por tiofeno, no obstante se produzca un cambio en el número de átomos que componen el anillo y se consideren no isoelectrónicos. Esta misma situación ocurre con el anillo de piridina y el anillo de tiazol, razón por la cual la serie reivindicada por el solicitante presenta analogía con la serie que revela el antecedente D1, dado que sin importar la presencia de quinolina o piridina en la estructura se conserva la actividad.

Adicionalmente, existe amplia bibliografía y documentos de referencia que señalan la existencia del fenómeno del bioisosterismo como estrategia para el diseño y modificación de estructuras terapéuticamente activas. Por ejemplo, se ha señalado en el documento *"Bioisosterism: a useful strategy for molecular modification and drug design"* que en una serie de estructuras la farmacológicamente activas es posible efectuar variaciones homólogas entre derivados cíclicos y variaciones homólogas entre derivados alifáticos.

El documento de referencia señala el biosisosterismo existente entre estructuras que difieren en el anillo heterocíclico, por ejemplo entre un benzooxazol y un indol – ver esquema 13 del documento – entre una piridina y un oxazol, entre benceno y tiofeno, entre 1,2-diazoles como el pirazol y el anillo de pirazol[1,5-a]pirimidina, es decir, ejemplifica la intercambiabilidad existente entre anillos y la amplia evidencia sobre la conservación de la actividad farmacológica.

Estos estudios confirman la regla de la equivalencia biológica entre anillos cuando conservan las propiedades estéricas y polares, aún cuando existan diferencias estructurales entre ellos.

De esta manera, el documento de referencia es una publicación que corrobora y fundamenta las razones técnicas esbozadas por este Despacho durante las etapas de examen previas, por cuanto las publicaciones D1 y D2 – que conforman el estado del arte más cercano a la invención – revelan compuestos que presentan equivalencia biológica con las estructuras reivindicadas, toda vez que actúan como inhibidores de la enzima histona deacetilasa, aunque presentan variación en la estructura heterocíclica del extremo izquierdo de la molécula o han eliminado el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 33743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

punto de carbamoilo que se verificaba entre la estructura heterocíclica y el anillo de fenilo, tal y como se demuestra a continuación en el esquema.

Así mismo, esta situación se corrobora cuando se estudian con detenimiento los ejemplos y realizaciones preferidas de la invención, en particular, el método de síntesis para la obtención de las estructuras 30 a 36 que corresponden a los derivados dobles de carboxamida con anillo heterocíclico de pirimidina que forman parte del sustento descriptivo de la solicitud, razón por la cual, está claro que el mismo solicitante tiene claridad acerca de la equivalencia biológica que existe entre estructuras aún cuando se incluyan dos puentes de carbamoilo entre los anillos de fenilo y la estructura heterocíclica.

Dado lo anterior, la propuesta de la solicitud no representa un avance tecnológico o un salto cualitativo sobre el estado de la técnica, razón por la cual no puede acceder al privilegio solicitado.

5. Respuesta a los argumentos del solicitante.

El solicitante afirma que: *“(…) hay claras diferencias adicionales que existen entre D2 y las reivindicaciones de la presente solicitud (sic). Por ejemplo, las reivindicaciones en estudio requieren la presencia de un grupo R^3 (el cual puede ser amino o hidroxilo) en el anillo de fenilo en la posición adyacente a donde se adjunta el nitrógeno del grupo carbamoilo. Esta característica no se encuentra divulgada en D2, por lo tanto, la persona versada en el arte que aplicara las enseñanzas de dicho documento, se sentiría motivada a utilizar un anillo fenilo sin sustitución en la posición adyacente a donde se adjunta el nitrógeno del grupo carbamoilo y en consecuencia, daría como resultado compuestos diferentes a los de la presente invención”.*

Frente al anterior argumento, es preciso aclarar que en el documento D2 se precisa la existencia de un anillo de fenilo que sustituye el nitrógeno de la estructura benzamida con sustituyentes adicionales tipo R_3 , R_4 y R_5 , cuyas connotaciones funcionales y químicas oscilan entre hidrógeno, hidroxilo, metoxilo, o un grupo tetrazol.

Por su parte, el solicitante reclama protección para el grupo farmacofórico de la fenil benzamida en el que el anillo de fenilo se encuentra sustituido por los grupos R^3 – cuyas connotaciones químicas son amino o hidroxilo – y $(R^4)_p$ que no necesariamente se presenta toda vez que $p = 0, 1$ ó 2 ; sin embargo, cuando se presenta puede ser halo, nitro, hidroxilo, acoxi C_{1-3} , entre otras.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 33743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

De esta manera, es claro que la materia reivindicada coincide con las enseñanzas reveladas por el estado del arte en D2, toda vez que este anillo de fenilo puede tener sustituciones tipo hidroxil y acoxi C₁₋₃, es decir, las mismas que revela D2 cuando indica que R₃, R₄ y R₅ puede ser hidroxil o metoxilo.

Ahora bien, aunque la publicación D2 no señala la presencia de grupos amino sobre el anillo de fenilo, dicha diferencia se precisa subsanada cuando se analiza con detenimiento las enseñanzas del documento D1, en el que claramente se establece la existencia de grupos amino sobre el anillo de fenilo para formar la benzamida con el anillo de anilina (NH₂-φ) (ver las estructuras reveladas por D1 en la tabla del folio 359).

Con relación a la existencia del anillo de tetrazol-5-il el solicitante señala que: *"Una vez revisada la reivindicación 1 del documento D2, se puede observar que el anillo tetrazol-5-il referido por el señor Examinador, representa un valor particular de una lista de posibles opciones para R1, siendo los otros valores ciano, nitro, halógeno, hidroxil, alquil C1-4 o metoxi. Cabe resaltar que tetrazol-5-il es la única estructura de anillo divulgada en esta lista y de ahí que D2 claramente enseña que si R1 es una estructura de anillo, entonces es esencial que sea un anillo de tetrazolil y además que sea un anillo tetrazol-5-il. No habría razón para que la persona versada en arte (SIC), teniendo alguna expectativa razonable de éxito, creyera que fuera posible reemplazar el tetrazol-5-il con otros anillos. Adicionalmente, para llegar a los compuestos de la presente invención, la persona versada necesitaría además hacer otras selecciones a partir de grupos variables de la divulgación genérica de D2. Por ejemplo, R₅ tendría que ser hidrógeno, R₃ hidrógeno y R₂ también hidrógeno."*

Respecto a este argumento, es preciso aclarar que no se afectó el nivel inventivo con fundamento exclusivo en las enseñanzas del documento D2, toda vez que la objeción de nivel inventivo formulada en el segundo examen técnico fue efectuada con fundamento en las enseñanzas que en conjunto revelan los documentos D1 y D2 y evidentemente con base en las similitudes estructurales entre los compuestos reivindicados y los divulgados en los antecedentes técnicos antes mencionados.

Es importante destacar, que en el documento D2 no sólo se contempla la connotación heterocíclica tipo tetrazol-5-il para el radical R₁ sobre el grupo benzamido, sino que existen otra clase de connotaciones particulares para este radical, como es el caso de los grupos alifáticos alquilo C₁₋₄, o de radicales funcionalmente diversos como ciano, nitro, halógeno o hidroxil.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 3 3743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

Así las cosas, este Despacho no desconoce la presencia de otra clase de radicales sobre el anillo de benceno del farmacóforo fenil-benzamida con estructura química diferente del núcleo heterocíclico, como tampoco desconoce que en efecto, el solicitante al sustentar la materia reivindicada incorpora dentro de la memoria descriptiva ejemplos que incluyen radicales alquílicos sobre el anillo de benceno, tal como se presenta en la ilustración 5 del ejemplo 23 del folio 115.

Por tal motivo, no es técnicamente dable argumentar que los radicales -CN, -NO₂, -Halo y alquilo C₁₋₄ constituyen la diferencia fundamental entre el estado del arte revelado en D2 y la materia reivindicada, por cuanto en la misma memoria descriptiva presentada por el interesado se incluyen sustituciones alquílicas sobre el farmacóforo, en especial sobre el anillo de benceno del complejo benzamido y sobre las mismas también se predica la actividad inhibidora de la enzima histona deacetilasa. Y por otra parte, el sustento descriptivo de la solicitud no señala que la actividad de la estructura anular tan compleja que presenta el pliego reivindicatorio varía en su actividad farmacológica si al grupo benzamido se le incluye un grupo CN, NO₂ o halo en contraposición a un grupo alquilo o heterocíclico.

Así las cosas, no existe fundamento técnico relacionado con ensayos de actividad que demuestren cómo estas diferencias técnicas secundarias con respecto a D2 constituyen un indicador de actividad inesperada o sorprendente frente al conjunto de elementos técnicos que revelan los dos antecedentes D1 y D2.

En consecuencia, el antecedente D2 no sólo forma parte del estado del arte más cercano a la materia reclamada en virtud de los elementos funcionales y estructurales de la fórmula Markush, sino que allana el camino para identificar otra clase de actividad farmacológica relacionada con el grupo farmacofórico en comento, actividad que se confirma cuando se analizan en su conjunto las enseñanzas reveladas en el documento D1 para grupos estructurales similares a los revelados por D2 y evidentemente a los reivindicados por el señor solicitante.

Ahora bien, solicitante señala en su memorial de respuesta, que no considera viable el hecho de que una persona versada en la materia, al enfrentar el problema de proveer compuestos con actividad inhibidora del ciclo celular, combinara las divulgaciones D1 y D2, toda vez que la publicación D2 se refiere a derivados de N-fenilbenzamida con actividad antialérgica y antiulcerativa.

Al respecto es preciso señalar que uno de los dos criterios básicos para la evaluación de actividad inventiva se basa en la evaluación de la relación estructural y el segundo se relaciona con la actividad farmacológica y terapéutica y es precisamente en virtud de la analogía estructural que este Despacho considera

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 33743

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

viable que un técnico versado en la materia estaría en posibilidad de derivar los elementos estructurales que caracterizan la fórmula Markush reivindicada, en virtud de las enseñanzas que en conjunto presentan los documentos D1 y D2, ya que como bien se ha ilustrado la cercanía funcional y química es evidente a los ojos de un conocedor de la materia.

Por otro lado, es claro que el mismo solicitante reconoce que ha encontrado la actividad sobre derivados de N-fenilbenzamida con sustitución heterocíclica independientemente de las características del anillo que sustituya el grupo farmacofórico, y esto incluye sustituciones tipo tetrazol como las reveladas en D2, sólo que durante la etapa del trámite administrativo el solicitante delimitó el contenido y alcance del radical A de la estructura Markush, aún cuando no existe evidencia técnica que sustente la exclusión arbitraria de otros grupos que pueden llegar a catalogarse dentro del género funcional heterocíclico.

Ahora bien, en virtud de los conocimientos básicos sobre bioisosterismo se ha demostrado que el mismo solicitante incluye indiscriminadamente radicales heterocíclicos de 5 miembros como oxazol, tienilo, furanilo, tiazolilo y pirazinilo, los que constituyen una serie de radicales estructuralmente análogos del anillo de cinco miembros de tetrazol, que corresponde al sustituyente R₁ en la fórmula revelada en D2, razón por la cual, el argumento del solicitante no tiene asidero técnico, por cuanto es clara la evidencia de bioisosterismo entre series cíclicas homólogas como las que aquí se reivindican.

En consecuencia, en razón de las enseñanzas de los documentos D1 y D2, un técnico medio en la materia se encontraba en capacidad de anticipar alternativas terapéuticas para la inhibición de la histona deacetilasa, con el fin de conseguir un tratamiento adicional para el manejo del cáncer.

Por las razones expuestas anteriormente esta dependencia reitera que el arte previo afecta la altura inventiva de la materia reclamada y por consiguiente considera que existe incumplimiento de las disposiciones que contempla el artículo 18 del ordenamiento jurídico andino.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención a la creación denominada: "DERIVADOS DE LA BENZAMIDA ÚTILES COMO INHIBIDORES DE LA HISTONA DEACETILASA".

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente al doctor Juan Pablo Cadena

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 33743

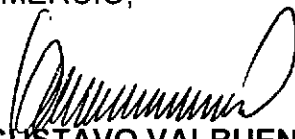
Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04- 97165

Sarmiento, en su calidad de apoderado de la sociedad ASTRAZENECA AB., 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 03 JUL. 2009
Dada en Bogotá D.C., a los

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,


GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctor
JUAN PABLO CADENA SARMIENTO
Carrera 7 N° 71 – 21, Torre B, Piso 4
Bogotá D.C.
202069

