

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N.º 24590

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N.º PCT/04 - 97772

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 30 de septiembre de 2004, bajo el número 04097772, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada: "DERIVADOS DE 2,4-DIAMINOPIRIMIDINA", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP03/02710 del 14 de marzo 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 5 de septiembre de 2008 y el 5 de enero 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 4, contenidas en los folios 216 a 220 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

El objeto de la presente invención consiste en compuestos derivados de 2,4-diaminopirimidina de fórmula general (I), a procesos para su preparación y sus composiciones farmacéuticas.

24590

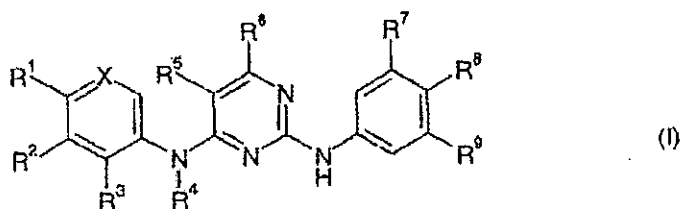
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 24596

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04 - 97772

La reivindicación 1 se refiere al compuesto de fórmula general (I):



La reivindicación 2 al proceso de producción del compuesto de fórmula general (I).

La reivindicación 3 a una composición farmacéutica que comprende un compuesto de fórmula general (I) junto con uno o más vehículos farmacéuticamente aceptables.

Y la reivindicación 4 a una combinación de un compuesto de fórmula general (I) con otro fármaco seleccionado del grupo de ciclosporinas, rapamicinas o ascomicinas.

El problema técnico planteado es la necesidad de proveer nuevos compuestos que actúen como inhibidores de proteínas quinasas tipo ZAP-70, FAK y/o Syk y puedan ser utilizados en el tratamiento de enfermedades tumorales.

Para resolver dicho problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de 2,4-diaminopirimidina de fórmula general (I), sus procesos de preparación y sus composiciones farmacéuticas.

2. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 15 de marzo de 2002, que corresponde a la fecha de prioridad invocada respecto de la solicitud UK 0206215.6. La fecha de prioridad fue tomada en cuenta para el estudio de patentabilidad, según obra a folios 221 y 222 del expediente en estudio.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos, anteriores a la fecha de prioridad y relacionados con la materia de solicitud en estudio:

No.	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US 5958935	Substituted 2-anilinopyrimidines useful as protein kinase inhibitors	28-09-1999
D2	WO 01/64654	Pyrimidine Compounds	07-09-2001

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 2459¹

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04 - 97772

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."

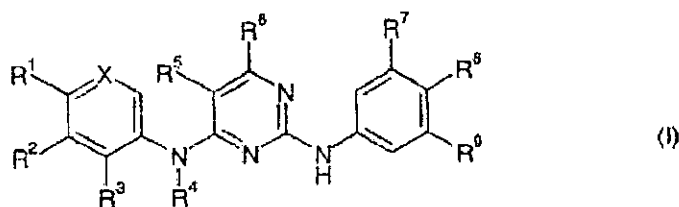
El estado de la técnica, al tenor de lo dispuesto en el artículo 16 de la misma Decisión, comprende "todo lo que haya sido accesible al público, por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en 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, por las razones que se exponen a continuación:

La reivindicación 1 divulga 2,4-diaminopirimidinas inhibidores de proteínas quinasas tipo ZAP-70 de fórmula general (I):



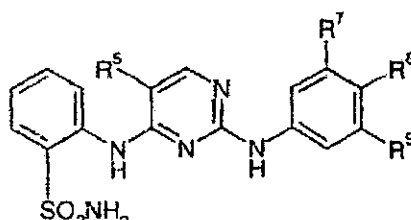
Dentro de las modalidades preferidas, se encuentran compuestos de fórmula:

¹ Proceso 192 IP 2005.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

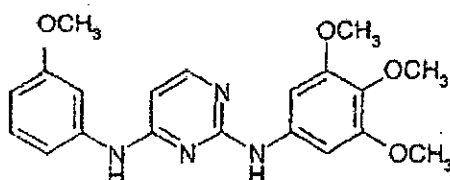
RESOLUCIÓN N° 24599
 Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04 - 97772



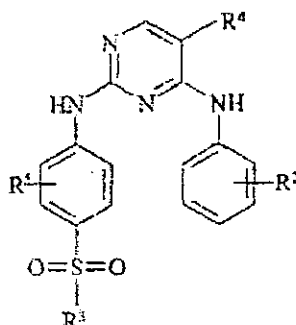
Donde R^5 es etilo y R^7 , R^8 y R^9 son cada uno OCH_3 (ejemplo 118).

A su vez, D1 describe 2,4-diaminopirimidinas inhibidores de proteínas quinasas ZAP-70 de fórmula (ejemplo 93):



Siendo así, la única diferencia entre lo solicitado y D1 es el sustituyente SO_2NH_2 y el etilo ubicado en la posición 5 del anillo de pirimidina.

Por su parte, D2 (ejemplo 26, página 40) describe 2,4-diaminopirimidinas inhibidores de proteínas quinasas de fórmula:



Donde R^3 es NH_2 , $R^4=Cl$, $R^2=CN$ y $R^5=OCH_3$

Como se observa, D2 sugiere la inclusión del sustituyente SO_2NH_2 en el núcleo de 2,4-diaminopirimidina y del sustituyente de la posición 5 del anillo de pirimidina, que no se encontraban divulgados en D1.

De esta manera, los compuestos revelados en D1 y D2 tienen propiedades farmacológicas como inhibidores de proteínas quinasas, entre ellas las de tipo ZAP-

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

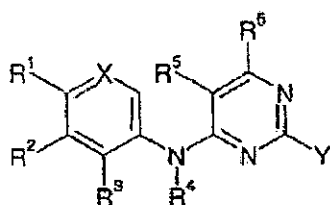
RESOLUCIÓN N° 24599

Por la cual se niega una patente de invención

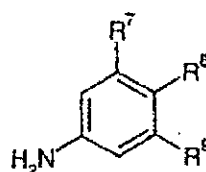
Rad. N° PCT/04 - 97772

70 con valores de CI_{50} del orden de los nM (columna 49 de D1 y páginas 26 y 27 de D2).

De otro lado, la reivindicación 2 de la solicitud se refiere a un proceso de preparación de compuestos de fórmula (I) haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (II) con una amina de fórmula (III).

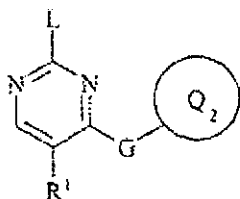


(II)

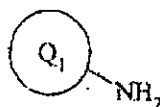


(III)

Por su parte, D2 (literal b, página 14) describe un proceso para la preparación de 2,4-diaminopirimidinas, que consiste en hacer reaccionar una piridina de fórmula (IV) con una amina de fórmula (V).



(IV)



(V)

Como se observa, el proceso reivindicado en la solicitud sólo se diferencia del descrito en D2 en los compuestos de partida y los productos, comprendiendo entonces la misma reacción y las mismas condiciones que el antecedente.

Así las cosas, las diferencias estructurales de la solicitud en comparación con los antecedentes encontrados, no le conceden a los compuestos reivindicados un efecto técnico inesperado o ventaja con respecto a los presentes en el estado de la técnica, ya que tienen las mismas propiedades farmacológicas que éstos, sin demostrar una mayor eficacia.

Ahora bien, teniendo en cuenta que el problema técnico objetivo de la solicitud es proveer nuevos compuestos que actúen como inhibidores de proteínas quinasas tipo ZAP-70, FAK y/o Syk y que puedan ser utilizados en el tratamiento de enfermedades tumorales, es posible afirmar que la información suministrada por las anterioridades citadas, le sugieren al técnico medio en la materia utilizando sus conocimientos generales, sintetizar compuestos derivados de 2,4 diaminopirimidina similares, para

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN-Nº 24590

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. Nº PCT/04 - 97772

solucionar así este problema técnico de manera obvia, tal como ocurre con el invento de la presente solicitud, de allí que carezca de nivel inventivo.

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.

4. Respuesta a los argumentos del solicitante

El solicitante manifiesta haber modificado la reivindicación 1 incluyéndole un disclaimer, para excluir así los compuestos que afectaban la novedad de los compuestos de la presente invención (folio 207, líneas 21 a 23).

Al respecto vale decir que dicha modificación es aceptada, y que con ella, se supera la objeción trasladada sobre la falta de novedad del invento.

Tratándose del nivel inventivo, el solicitante afirma que “en el primero de los ensayos se demostró que los compuestos de la invención mostraron actividad sorprendente para cinasa **ZAP-70** y **Syk** con valores de IC_{50} en la escala de **10 nM** a $2\mu M$ y con mayor preferencia entre 10 nM y 100 nM.” (Folio 210, líneas 30 a 32)

No obstante dicha afirmación es preciso resaltar, que los compuestos de las anterioridades también enseñan valores de CI_{50} inferiores a 100 nM, por lo tanto la presencia de esos valores en la invención no puede considerarse sorprendente o inesperado, pues ya se encontraban divulgados en el estado de la técnica.

Visto lo anterior, se advierte que la invención en estudio no cumple el requisito de nivel inventivo, toda vez que para un experto medio en la materia, y de conformidad con el estado de la técnica que existía en ese momento, resulta obvia y a ella se hubiese podido llegar de manera evidente.

RESUELVE

ARTICULO PRIMERO: Negar el privilegio de patente de invención a la creación denominada: “DERIVADOS DE 2,4-DIAMINOPYRIMIDINA”.

ARTICULO SEGUNDO: Notificar personalmente a la doctora Jimena Escobar Uribe, en su calidad de apoderada de la sociedad Novartis AG., 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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN N° 24599

Por la cual se niega una patente de invención

Rad. N° PCT/04 - 97772

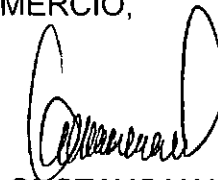
y Comercio al momento de notificarse o dentro de los 5 días hábiles siguientes.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los

18 MAYO 2009

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



GUSTAVO VALBUENA QUIÑONES

Doctora
JIMENA ESCOBAR URIBE
Carrera 11 N° 86 – 53, Piso 6
Bogotá D.C.



202068