

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49878

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el artículo 3, numeral 26, del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 22 de febrero de 2012, con el N°. 12-030983-00000-0000, por la sociedad Intellikine, LLC., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTOS HETEROCICLICOS Y USOS DE LOS MISMOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2010/045816 del 17 de agosto de 2010.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 661 del 01 de febrero de 2013, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N°. 198 y notificado por fijación en lista el 21 de enero de 2014 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°. 12-030983-00011-0000 del 28 de mayo de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 18 que reemplazan 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 las reivindicaciones 1 a 18 contenidas en el radicado 12-030983-00011-0000, 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:49878
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

6.1. Objeto de la invención

El problema técnico se refiere a la necesidad de proporcionar compuestos moduladores de la vía de señalización de las fosfoinositida 3-quinasas (PI3K), para solucionar este problema la solicitud presenta compuestos de la fórmula (I) y sus composiciones.

6.2. Determinación del estado de la técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad invocada, es decir el 17 de agosto de 2009.

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	US20080076758	"Pharmaceutical compounds"	27/marzo/2008
D2	WO2009097446	"Pyrazolopyrimidine PI3K inhibitor compounds and methods of use"	06/agosto/2009

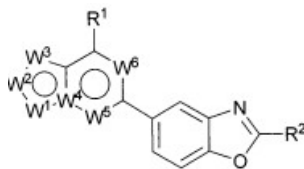
El documento D1¹ divulga compuestos de fórmula (Ia) y (Ib) que son inhibidores de la PI3K (resumen y Pág.1).

El documento D2² divulga compuestos de fórmula (I) que son inhibidores de la PI3K (resumen y Pág.1).

6.3. Nivel Inventivo

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la misma 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 1 se refiere a: *"Un compuesto, caracterizado*



porque tiene la Fórmula II: O una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en donde: W1 es S, NR3 o CR3, W2 es CR4, W3 es N y W4 es N o C, en donde

¹http://worldwide.espacenet.com/searchResults?bookmarkedResults=true&submitted=true&DB=EPODOC&locale=en_gb&sf=n&FIRST=1&F=0&CY=gb&LG=en&PN=CA2519208&Submit=SEARCH&=&=&=&=

²http://worldwide.espacenet.com/searchResults?bookmarkedResults=true&submitted=true&DB=EPODOC&locale=en_gb&sf=n&FIRST=1&F=0&CY=gb&LG=en&PN=US20040052846&Submit=SEARCH&=&=&=&=

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49878

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

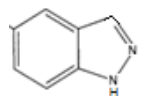
no más de dos átomos de N son adyacentes; W5 es N o CR7; W6 es N o CR8; R1 y R2 son independientemente hidrógeno (...), heterocicloalquilo (...) y R3 y R4 son independientemente hidrógeno (...), heterocicloalquilo (...); o R3 y R4 tomados juntos forman un resto cíclico; y R5, R7 y R8 son independientemente hidrógeno (...), heterocicloalquilo (...)" (Pág. 8 del radicado 12-030983-00011-0000).

La tabla 1 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.

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga compuestos derivados de la 4-(morfolin-4-il)tieno[3,2-d]pirimidina y 4-(morfolin-4-il)tieno[2,3-d]pirimidina que son inhibidores de la PI3K (resumen y Pág. 1).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1, y el compuesto divulgado en el

documento D1, es el anillo 1,3-benzoxazol-5-il:



, en lugar del anillo 1H-indazol:

No hay evidencia de que incluir el anillo 1,3-benzoxazol-5-il proporcione algún efecto técnico sorprendente a los compuestos divulgados previamente en el documento D1.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los compuestos divulgados previamente en el documento D1 para proporcionar compuestos inhibidores de la PI3K alternativos.

El documento D2 enseña compuestos que tienen el anillo 1,3-benzoxazol-5-il:



en su estructura, que tienen actividad inhibidora de la PI3K.

En consecuencia, la persona versada en la materia incluiría el anillo 1,3-benzoxazol-5-il divulgado en el documento D2 en el núcleo que se enseña en el documento D1, considerando que el anillo 1,3-benzoxazol-5-il es bioisómero del anillo 1H-indazol y en este caso se trata del remplazo de un anillo por otro bioequivalentes y por lo tanto los compuestos conservan la actividad inhibidora de la PI3K (tal como conoce bien la persona versada y se divulga en los textos de conocimiento común³). Por lo cual la reivindicación 1 se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

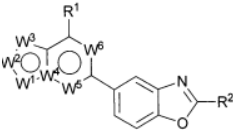
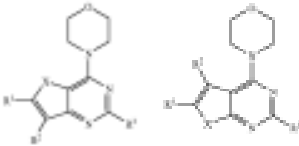
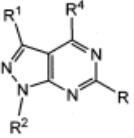
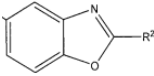
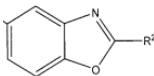
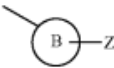
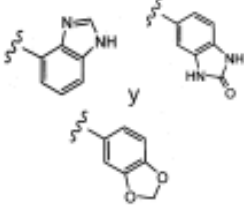
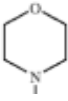
³Bioisosterism: A Useful Strategy for Molecular Modification and Drug Design. Lídia Moreira Lima and Eliezer J. Barreiro. Current Medicinal Chemistry, 2005, 12, 23-49.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49878

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

Tabla 1		
Características esenciales	D1	D2
Reiv 1		
	 (Compuestos Ia y Ib, Pág. 1 y resumen)	 (Compuesto I, Pág. 1 y resumen)
	 (benzoxazol) Cuando R3 =  Donde B = fenil Z = heteroaril de 5 a 12 miembros	
W1	X	
S, N, NR3 o CR3	S o O	N
W2		
N, Rr4, CR4 o C=O	C	N
W3	X	
S, N, NR3 o CR5	S o O	C
W4		
N o C	C	C
W5		
N o CR7	N	N
W6		
N o CR8	N	N
R1 heterocicloalquilo, H, alquilo, heteroalquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, arilalquilo, heteroarilo, heteroarilalquilo, alcoxi, heterocicloalquilo, amido, amino ...	 (morfolino)	R4 heterocicilo, NR10R13, OR10COOH, CONH2, O- alquilo, SCH3, arilo, heteroarilo, alcoxi, NH2 , hidroxi, urea o carbonato
R2 H, alquilo, heteroalquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo, arilalquilo ...	H	alquilo C1-12

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49878

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 18 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

Con respecto a los resultados de la descripción, se observa que los compuestos más activos son los que tienen $IC_{50} < 100$ nM (cuya actividad está indicada como “++++”, según la Pág. 269); sin embargo muy pocos ejemplos presentan tal actividad, por lo cual no es posible inferir que todos los compuestos incluidos en la reivindicación 1 tienen actividad inhibidora de la PI3K. De hecho, el compuesto 5 que de acuerdo con la descripción es uno de los preferidos, presenta baja actividad (Pág. 269) y el compuesto 54, que también es uno de los preferidos, tan sólo presenta alta actividad inhibidora de la PI3K α (Pág. 281), pero en general tienen poca actividad antitumoral (Figs. 4 a 6).

Se reitera a la solicitante que se aceptó para examen el nuevo capítulo reivindicatorio del radicado 12-030983-00011-0000 y el examen confirmó la falta de nivel inventivo, según se había comunicado previamente mediante el requerimiento presentado de acuerdo con el Artículo 45.

Es oportuno aclarar en relación con la afirmación de la solicitante según la cual los compuestos de los documentos D1 y D2 no tienen el anillo benzoxazol, que el documento D1 no tiene el anillo 1,3-benzoxazol, pero sí tiene el anillo indazol (en los compuestos ejemplificados) y además en su reivindicación 1 el documento D1 enseña que en sus compuestos R3 es B-Z (donde B = fenilo y Z = heteroarilo de 5 a 12 miembros) es decir que enseña que R3 puede ser benzoxazol, dado que este es un anillo formado por un fenilo fusionado con un heteroarilo (que bien puede ser de 5 miembros siendo uno de ellos N y otro O). El anillo benzoxazol es bioisómero de los otros anillos específicamente mencionados en el documento, razón por la cual los compuestos de la solicitud conservan la actividad inhibidora de la PI3K. Por lo tanto el estado de la técnica sugiere los compuestos de la solicitud y estos no tienen nivel inventivo.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto denegado se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS HETEROCÍCLICOS FORMADOS POR DOS ANILLOS BICÍCLICOS, QUE SON INHIBIDORES DE LAS QUINASAS PI3K Y TIENEN ACTIVIDAD ANTICANCERÍGENA”.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPUESTOS HETEROCÍCLICOS FORMADOS POR DOS ANILLOS BICÍCLICOS, QUE SON INHIBIDORES DE LAS QUINASAS PI3K Y TIENEN ACTIVIDAD ANTICANCERÍGENA”.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:49878

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-030983

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Intellikine, LLC., 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 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 22 Ago 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

HUMBERTO RUBIO CAMACHO, hrubio@rubiolawyers.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca
Revisó: Sandra Carolina Crespo
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño Fernández