

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

**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 mayo de 2012, con el N° 12-073061-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Plexxikon Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTOS Y MÉTODOS PARA LA MODULACIÓN DE CINASAS, E INDICACIONES PARA ELLO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2010/055519 del 04 de noviembre de 2010.

**SEGUNDO:** Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 654 del 16 de octubre de 2012, habiéndose presentado oposición por parte de la(s) sociedad(es) Lafrancol S.A.S., la(s) cual(es) una vez fue(ron) estudiada(s) por el Despacho, no desvirtuó la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará más adelante.

**TERCERO:** Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 11169, notificado por fijación en lista el 02 de septiembre 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° 12-073061-00011-0000 del 07 de enero de 2015, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 8 que reemplaza(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 las reivindicaciones 1 a 8 presentes en el radicado N° 12-073061-00011-0000, 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:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

**6.1. Oposición presentada**

**Argumentos de Lafrancol S.A.S.**

La opositora afirma que las composiciones y combinaciones que comprenden compuestos de la presente solicitud y otros agentes que pueden ser alquilantes, antibióticos, un agente de inmunoterapia, un taxano, entre otros compuestos para el tratamiento de la artritis reumatoide y otras enfermedades, son prácticas y eventos totalmente conocidos en el campo químico farmacéutico y por lo tanto, no son nuevos ni contienen altura inventiva alguna, dado que compuestos como carboplatino, gemcitabina, pemetrexed, bevacizumab, imatinib, entre otros son plenamente conocidos e identificados. En el Index Merck se observa que el carboplatino se encuentra bajo el dominio público y que ostentó beneficios patentarios de Holanda y Estados Unidos bajo los documentos NL7307863 y US4140707. Por su parte, la gemcitabina tuvo beneficio patentario de Gran Bretaña y Estados Unidos bajo los documentos GB2136425 y US4808614. Por su parte, el pemetrexed obtuvo la patente concedido por la Unión Europea y Estados Unidos de América bajo los documentos EP432677 y US5344932. En el caso del bevacizumab, ostenta beneficio patentario de la WO9845331. Por último, se menciona que el imatinib cuenta con patentes otorgadas en la Unión Europea y Estados Unidos bajo los documentos EP564409 y US5521184. Además, la sociedad opositora menciona que las combinaciones para obtener un efecto sinérgico no se considera una invención, sino un descubrimiento encontrado durante estudios clínicos, por lo que se considera como un método de tratamiento.

**Respuesta de la solicitante**

La solicitante afirma que dentro el objeto de la solicitud consiste en un compuesto de la Fórmula II', eventualmente en combinación con agentes alquilantes, antibióticos, un agente de inmunoterapia, un taxano, entre otros. Con respecto a las monografías del Index Merck, es cierto que las moléculas descritas son ampliamente conocidas y susceptibles de combinación, pero que no se anticipan a la materia reclamada en la solicitud ni la hace obvia para una persona medianamente versada en la materia.

Las patentes citadas en la oposición que se refieren a los compuestos carboplatino (NL7307863 y US4140707), gemcitabina (GB2136425 y US4808614), pemetrexed (EP432677 y US5344932), bevacizumab (WO9845331) e imatinib (EP564409 y US5521184), no tienen relación alguna con los compuestos de la solicitud y no divulgan las características técnicas esenciales de los compuestos del Fórmula II'. Por lo tanto, la presente solicitud se puede considerar como nueva e inventiva la luz de los

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

documentos mencionados en la presente oposición.

**Respuesta de la Oficina**

Esta Oficina establece que los argumentos ni los documentos citados por la sociedad opositora logran anticipar el objeto de la presente solicitud. Ciertamente los compuestos relacionados en el Index Merck son ampliamente conocidos en el estado de la técnica, pero no se mencionan los compuestos de Fórmula II' ni se menciona la posibilidad de obtener composiciones y combinaciones farmacéuticas que contengan los compuestos de la fórmula II' y otros agentes anticancerígenos.

De acuerdo con lo expuesto, frente al nuevo capítulo reivindicatorio aportado, los argumentos presentados por la sociedad opositora no prosperan como elementos que permitan desvirtuar la patentabilidad de la solicitud que aquí se analiza.

**6.2. Objeto de la invención**

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de obtener compuestos alternativos inhibidores de kinasa para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes. Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio plantea la obtención de compuestos de la Fórmula II', como inhibidores de las kinasas FMS, KIT y FLT-3, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.

**6.3. Determinación del estado de la técnica**

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 06 de noviembre 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   | US2009/0076046 | "Compound modulating C – FMS and/or C - KIT activity and uses thereof" | 19/Marzo/2009        |
| D2   | WO2008/064265  | "Compound modulating C – FMS and/or C - KIT activity and uses thereof" | 29/Mayo2008          |

El documento D1<sup>1</sup> divulga compuestos derivados de pirrolo [2,3-b] piridina de

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:8167  
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-073061

la Fórmula I, como inhibidores de las kinasas C-KIT y C-FMS, para el tratamiento de enfermedades autoinmunes (Págs. 2 y 3, párr. [0012] – [0034]).

El documento D2<sup>2</sup> divulga compuestos derivados de pirrolo [2,3-b] piridina de la Fórmula I, como inhibidores de las kinasas C-KIT y C-FMS, para el tratamiento de enfermedades autoinmunes (Págs. 3 – 6).

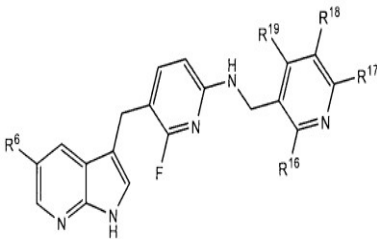
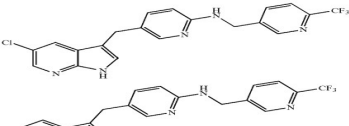
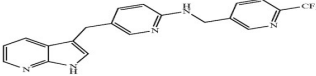
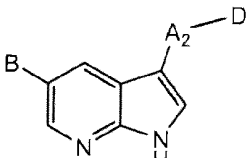
6.4. Nivel Inventivo.

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 1 se refiere a: “Un compuesto que tiene la Fórmula II’ o una sal, un tautómero, o un estereoisómero del mismo, en donde...” (Pág. 14 del radicado N° 12-073061-00011-0000).

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 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

| Características esenciales                                                                                         | D1                                                                                                                                                                                                                                       | D2                                                                                                                                                                     |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Compuesto de la fórmula II’<br> | Compuestos<br>P-0181, P-0182 (Pág. 98)<br><br>P-0273 (Pág. 99)<br> | Compuesto de la Fórmula II (Pág. 26)<br><br>De la cual se derivan los compuestos: |

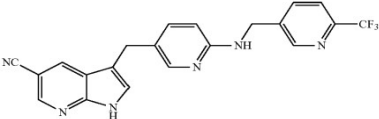
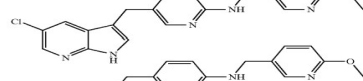
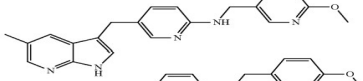
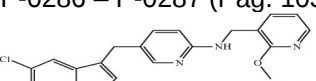
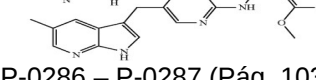
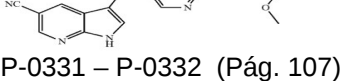
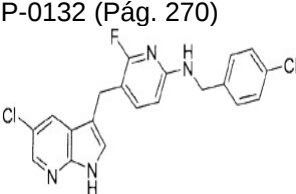
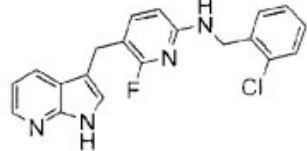
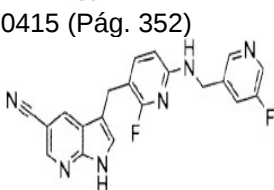
CC=US&NR=2009076046A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090319&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es\_ES  
2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008064265A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080529&DB=worldwide.espacenet.com&locale=es\_ES

REPÚBLICA DE COLOMBIA  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:8167

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-073061

|                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                                                                                                                                                       | <div><p>P-0282 – P-0285 (Pág. 102)</p><p>P-0286 – P-0287 (Pág. 103)</p><p>P-0331 – P-0332 (Pág. 107)</p></div> | <div><p>P-0132 (Pág. 270)</p><p>P-0335 (Pág. 311)</p><p>P-0415 (Pág. 352)</p></div> |
| F en posición 2 del anillo de (6 – aminometil) piridin – 3 – ilmetil                                                                                                                                  | No se menciona                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | F en posición 2 del anillo de (6 – aminometil) piridin – 3 – ilmetil                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| R <sup>6</sup> es CONHR <sup>14</sup> , SO <sub>2</sub> R <sup>15</sup> , NHCOR <sup>15</sup> , y NHSO <sub>2</sub> R <sup>15</sup> (R <sup>14</sup> y R <sup>15</sup> son alquilo C <sub>1-6</sub> ) | H, CH <sub>3</sub> , OCH <sub>3</sub> , F, Cl, CN en posición 5 del anillo de pirrolo [2,3-b] piridina                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | En la posición 5 del anillo de pirrolo [2,3-b] piridina, el sustituyente B puede ser CONHR <sup>23</sup> , SO <sub>2</sub> R <sup>23</sup> , NHCOR <sup>23</sup> , NHSO <sub>2</sub> R <sup>23</sup> (R <sup>23</sup> es alquilo) (Pág. 23, ln. 1 – 2; pág. 27, ln. 1 – 8)                                                                    |
| R <sup>16</sup> es H, alcoxi inferior                                                                                                                                                                 | H, OCH <sub>3</sub> en posición 2 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | No se menciona                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| R <sup>17</sup> es H, alcoxi inferior                                                                                                                                                                 | H, OCH <sub>3</sub> en posición 6 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | No se menciona                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| R <sup>18</sup> y R <sup>19</sup> son H                                                                                                                                                               | H en posiciones 4 y 5 del grupo piridin – 3 – ilmetilamino                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | No se menciona                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |

Como se dijo anteriormente, el documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a los compuestos de la solicitud de acuerdo con la reivindicación 19, porque se mencionan compuestos derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, como moduladores de kinasas FMS, KIT, para el tratamiento de enfermedades

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

inflamatorias y autoinmunes (D1: Pág. 98, comp. P-0181 y P-0182; pág. 99, comp. P-0273; pág. 102, comp. P-0282 – P-0285; pág. 103, comp. P-0286 y P-0287; pág. 107, comp. P-0331 – P-0332).

La diferencia entre los compuestos descritos en la solicitud en estudio con respecto a los compuestos divulgados en el documento D1, radica en que los compuestos de la presente solicitud contienen un F en la posición 2 del anillo de 6-metilamino piridin-3-ilmetil. Además, los compuestos de la solicitud contienen en la posición 5 del anillo de pirrolo [2,3-b] piridina un sustituyente R<sup>6</sup> que puede ser CONHR<sup>14</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>, NHCOR<sup>15</sup>, y NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>15</sup>.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o superior a los compuestos de la Fórmula II' de la presente solicitud, con respecto a los compuestos divulgados en el documento D1.

El problema técnico objetivo que se pretende resolver es el siguiente: Cómo modificar los compuestos divulgados en el documento D1 para obtener compuestos alternativos derivados de pirido [2,3-b] piridina, para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes.

El documento D2 divulga compuestos derivados de 3-metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina, donde en la posición 2 del anillo de (6-aminometil) piridin-3-ilmetil se incluye un átomo de F como sustituyente (Pág. 270, comp. P-0132; pág. 311, comp. P-0335; pág. 352, comp. P-0415). Además, el documento D2 menciona la inclusión de un sustituyente B en la posición 5 de pirrolo [2,3-b] piridina, donde el sustituyente B es CONHR<sup>23</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>23</sup>, NHCOR<sup>23</sup>, NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>23</sup> (Pág. 23, ln. 1 – 2; pág. 27, ln. 1 – 8).

Por lo tanto, una persona normalmente versada en la materia y conocedora de los conceptos mencionados en los documentos D1 y D2, sin ningún esfuerzo, modificaría los compuestos descritos en el documento D1, de tal manera que incluiría un átomo de F en la posición 2 del anillo de (6-aminometil) piridin-3-ilmetil e incluiría el sustituyente B, como lo sugiere el documento D2, para obtener los compuestos propuestos en esta solicitud, de manera obvia o evidente.

En consecuencia, la reivindicación 1, de acuerdo con los documentos D1 y D2, carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La solicitante afirma que los compuestos de la solicitud son nuevos e

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

inventivos y que los documentos D1 y D2 no anticipan los compuestos de la solicitud, porque el documento D1 que se considera como el estado de la técnica más cercano a la solicitud, divulga un compuesto que comprende los sustituyentes  $X_1$ ,  $X_2$ ,  $Y_1$ ,  $Y_2$ ,  $L^1$ ,  $L^2$ ,  $R^1$  y  $Ar_1$  los cuales comprenden una lista larga de posibles sustituyentes, además que este documento no divulga las definiciones del sustituyente  $R^6$  tal como lo describe la solicitud, por lo que una persona normalmente versada en la materia debería escoger los sustituyentes a partir de las opciones posibles y no puede obtener los compuestos de la solicitud. De igual manera, el documento D2 comprende un compuesto que contiene los sustituyentes  $X_1$ ,  $X_2$ ,  $Y_1$ ,  $Y_2$ ,  $L^1$ ,  $L^2$ ,  $R^1$  y  $Ar_1$  seleccionados de una lista larga de sustituyentes, que tampoco divulga el sustituyente  $R^6$ , por lo que el documento D2 no enseña ni sugiere la combinación específica para obtener los compuestos de la solicitud y por lo tanto, la persona normalmente versada en la materia no tiene la motivación suficiente para obtener los compuestos reivindicados.

Esta Oficina aclara que a pesar de que los documentos D1 y D2 proceden de la fórmula general que contiene los sustituyentes  $X_1$ ,  $X_2$ ,  $Y_1$ ,  $Y_2$ ,  $L^1$ ,  $L^2$ ,  $R^1$  y  $Ar_1$ , dentro del análisis realizado conforme a la tabla 1, se observa que el documento D1 divulga los compuestos P-0181, P-0182, P-0273, P-0282 – P-0285, P-0286, P-0287 y P-0331 – P-0332, los cuales son derivados de 3-[2-(piridin-3-il) metilamino piridin-5-il] metil pirido [2,3-b] piridina y son estructuralmente semejantes al compuesto de Fórmula II' de la solicitud, por lo que el documento D1 sí se puede considerar como el estado de la técnica más cercano. Ciertamente la diferencia entre los compuestos de la solicitud con respecto a los compuestos específicos del documento D1 consiste en los sustituyentes en la posición 5 del anillo de pirrolo [2,3-b] piridina (correspondiente al sustituyente  $R^6$  mencionado por la solicitante). Sin embargo, el documento D2 menciona dentro de la fórmula general I en la posición 5 del anillo de pirrolo [2,3-b] piridina un sustituyente B correspondiente a  $CONHR^{23}$ ,  $SO_2R^{23}$ ,  $NHCOR^{23}$ ,  $NHSO_2R^{23}$ , por lo que una persona normalmente versada en la materia encontraría una motivación suficiente para modificar los compuestos específicos del documento D1 e incluir el sustituyente B sugerido en el documento D2, para obtener los compuestos de la solicitud.

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:** Declarar infundada la oposición presentada por la(s) sociedad(es) Lafrancol S.A.S., de acuerdo con las razones expuestas en la

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

**RESOLUCIÓN No:8167**

*Por la cual se deniega una patente de invención*

Rad. PCT/12-073061

parte considerativa de la presente Resolución.

**ARTÍCULO SEGUNDO:** Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPUESTOS Y MÉTODOS PARA LA MODULACIÓN DE CINASAS, E INDICACIONES PARA ELLO”.

**ARTÍCULO TERCERO:** Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Plexxikon Inc., y a la(s) sociedad(es) opositora(s) Lafrancol S.A.S., advirtiéndoles que contra ellas 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 27 Feb 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



**PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO**

Doctor(a)

**CARLOS R. OLARTE GARCIA**, office@olartemoure.com

Doctor(a)

**TITO NOE PARRA MURILLO**, lafrancolasas@lafrancol.com

Elaboró: Dayron Alexander Ramirez Reyes

Revisó: Sandra Carolina Crespo

Revisó: Jose Luis Salazar Lopez

Aprobó: José Luis Londoño Fernández