

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:76363

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850

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 06 de julio de 2012, con el N° 12-113850-00000-0000, por la(s) sociedad(es) F.Hoffmann-La Roche AG. y SIENA Biotech S.P.A., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “2-AMINO-5,5-DIFLUOR-5,6-DIHIDRO-4H-OXAZASINAS COMO INHIBIDORES DE BACE1 Y/O BACE2”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2010/068912 del 06 de diciembre 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, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 8504, notificado por fijación en lista el 22 de julio 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° 12-113850-00004-0000 del 15 de octubre de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 19 que remplaza(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 de acuerdo con el objeto de la solicitud se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE 2-AMINO-5,5-DIFLUOR-5,6-DIHIDRO-4H-OXAZINA COMO INHIBIDORES DE BACE1 Y/O BACE2”.

SEXTO: 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.*”

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 19 (Radicado N° 12-113850-00004-0000) no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

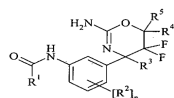
RESOLUCIÓN No:76363
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850

7.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos inhibidores BACE-1 y BACE-2, útiles en el tratamiento de enfermedades como el Alzheimer, cáncer, síndrome de Down, esclerosis y la diabetes tipo II.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuestos de fórmula (I) derivado de oxaxinas.



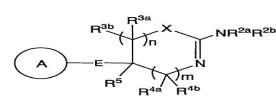
7.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 11 de diciembre de 2009, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la 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	EP1942105	“Aminodihydrothiazine Derivative”	09/Julio/2008

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos de fórmula general (I) con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen, Pág. 1 Párrs. [0001 a 0002] y Pág. 11 Párr. [0009]).



7.3. 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”.

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo,

¹ .www.googlepatents/ EP1942105

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

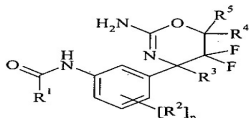
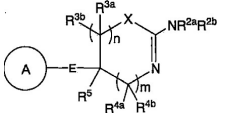
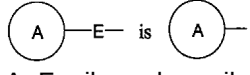
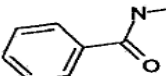
RESOLUCIÓN No:76363
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850

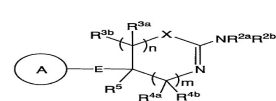
teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a “Un compuesto de fórmula (I) en la que R1 se elige entre el grupo conformado por i) arilo, (...)” (Pág. 8 del radicado 12-113850-00004-0000 -0000).

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionada en la reivindicación 1, y la revelada en el documento D1 que representan el estado de la técnica:

Tabla No 1

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula (I)  R3=Alquilo C1-C6 R4=Hidrógeno R5=Hidrógeno	Compuesto de fórmula 1  X=O NR^{2a}R^{2b} R^{2a}R^{2b}=H R^{3a} y R^{3b}=Hidrógeno, halogeno R^{4a} y R^{4b}=Hidrógeno R⁵=Alquilo n=1, m=1 (Pág. 262-263, Rv. 1)
R1=Arilo R2=Hidrógeno n=1	 A=Fenilo-carbamoilo  (Pág. 12 líneas 32-58; Pág. 13 líneas 1-58; Pág. 170 Ej. 986; y Pág. 262-263, Rv. 1)

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos de fórmula general (I) con actividad inhibitoria BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer (Resumen, Pág. 1 Párrs. [0001 a 0002] y Pág. 11 Párr. [0009]).



La diferencia entre los compuestos, definidos en la reivindicación 1 y los compuestos revelados en el documento D1 consiste en que los compuestos reclamados incluyen dos flúor enlazados al anillo oxazina, mientras que en el documento D1 no se revelan compuestos específicos que tengan los dos flúor.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

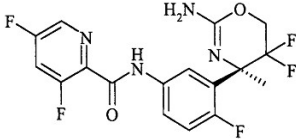
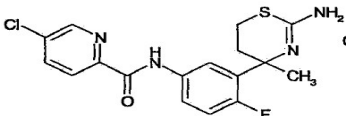
RESOLUCIÓN No:76363
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850

No se observa un efecto técnico asociado a la diferencia expuesta en cuanto a la actividad BACE-1 y BACE-2.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos derivados de oxazinas, útiles en el tratamiento del Alzheimer”.

Ahora bien, el documento D1 revela que R^{3a} y R^{3b} pueden ser halógenos (Pág. 345, Reivindicación 1). Esta anterioridad también enseña que el compuesto 1043 presenta una actividad BACE-1 de 0,027 µM (Pág. 260, Tabla 170) y por su parte, la solicitud da a conocer para los compuestos una actividad IC50 BACE comprendida entre 0,003 a 34,9 µM (Págs 61-76). Por lo anterior, no se observa un efecto técnico sorprendente por parte de la solicitud asociado a la diferencia expuesta.

Solicitud	D1
Compuesto 4  Actividad BACE-1: 0,031 µM	Compuesto 1043  Actividad BACE-1: 0,027 µM

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, realizaría una selección del compuesto divulgado en el documento D1, sin generar ningún efecto técnico inesperado, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-19 no mencionan características inventivas adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

Las solicitantes argumentan que a la luz del documentos D1 una persona normalmente versada en la materia no podría derivar la solución al problema técnico planteado en la presente solicitud, consistente en proporcionar compuestos inhibidores BACE-1 y BACE-2, útiles en el tratamiento de enfermedades como el Alzheimer, cáncer, síndrome de Down, esclerosis y la diabetes tipo II. Este Despacho en primera instancia señala que el documento D1 enseña compuestos heterocíclicos de fórmula (I) como inhibidores de la actividad BACE-1, útiles en el tratamiento del Alzheimer.



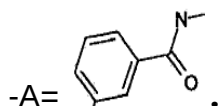
-X=O (Oxazinas)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:76363

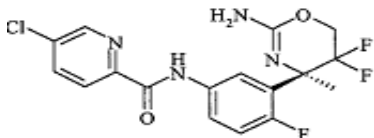
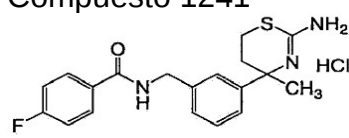
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850



De lo anterior, se concluye que el documento D1 divulga compuestos BACE-1 que incluyen en su estructura un anillo de oxazina enlazado con una fenilformamida, además, el documento “*The Organic chemistry of Drug Desing and Drug Action*”⁽²⁾ revela conceptos sobre bioisotermismos y enseña que los anillos ciclicos que incluyen el átomo oxigeno y átomo azufre son isosteros clásicos entre sí.

Así púes, los compuestos definidos en la solicitud presentan similitudes estructurales con respecto a los presentados en el documento D1 de acuerdo con lo presentado en el siguiente cuadro

Rv. 16	D1
	

Cabe agregar que, el documento D1 revela que el compuesto 1043 presenta una actividad BACE-1 de 0,027 μ M (Pág. 260, Tabla 170). Por su parte, la solicitud define para los compuestos una actividad IC50 BACE-1 comprendida entre 0,003 a 34,9 μ M (Págs 61-76), por lo anterior, no se observa un efecto técnico sorprendente por parte de la solicitud asociado a la diferencia expuesta.

Frente al artículo allegado por las solicitantes, se aclara que si bien se revela la actividad BACE-1 y BACE-2 de los compuestos de la solicitud, el mismo no permite evidenciar un efecto técnico inesperado para la materia reclamada, y es de resaltar que para que una selección se considere inventiva la totalidad de los compuestos derivados de la Markush deben tener efecto técnico inesperado y esto no ocurre en el presente caso.

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: Denegar la patente de invención a la creación titulada “COMPUESTOS DERIVADOS DEL OXAZIN-4-IL-4-FLUORFENIL-AMIDA DEL ÁCIDO PRIDIN-IL-CARBOXÍLICO”.

². The Organic chemistry of Drug Desing and Drug Action, Richard B. Silverman, Segunda Edición, 2004.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:76363

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/12-113850

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) F.Hoffmann-La Roche AG. y SIENA Biotech S.P.A., advirtiéndole(s) 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 diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 16 Dic 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE, NOTIFICACIONES@LLOREDACAMACHO.COM

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra
Revisó: Jesus Fernel Garcia Garcia
Aprobó: José Luis Londoño Fernández