

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante Resolución N° 2755 del 30 de enero de 2015, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: “DERIVADO DE ÁCIDO 3-(1-CICLOHEXIL-1H-IMIDAZOL-4-IL)-2-AMINOALQUILPROPANÓICO, INHIBIDORES DE LA ENZIMA TAFIa”, con fundamento en el artículo 18 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, al estimar que la invención en estudio no cumplió con el requisito de nivel inventivo.

SEGUNDO: Que mediante escrito radicado en esta Entidad el 09 de marzo de 2015 con el N° 12-121222-00009-0000, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, la sociedad Daiichi Sankyo Company, Limited interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

La recurrente adjunta un nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 35 reivindicaciones, presentado el 09 de marzo de 2015 con el N° 12-121222-00009-0000.

Señala a continuación que se han violado el Art 45 de la Decisión 486 y el derecho al debido proceso porque, aunque se limitó la reivindicación 1, se reitera la objeción de unidad de invención, esta vez con base en los documentos ES 2299026 y “Discovery of Potent & Selective Inhibitors of Activated Thrombin-Activatable Fibrinolysis Inhibitor for the Treatment of Thrombosis”, por lo cual considera que se hizo la negación con base en una objeción que no había sido trasladada previamente al solicitante. Agrega que, dado que la nueva reivindicación 1 se limitó al primer grupo inventivo mencionado por el examen, la solicitud cumple ahora con el requisito de unidad de invención.

Considera que no hay sugerencias para que, combinando los documentos D1 y D2, se llegue al objeto reivindicado. Agrega que el Ej. 1, que no tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, presenta una actividad expresada por su IC50 de 0,021 µM y que el Ej. 2, que sí tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, presenta una actividad expresada por su IC50 de 0,0083 µM, de manera que este último es 2,5 veces más activo como inhibidor de TAFIa que el Ej. 1. De la misma manera, presenta la comparación con el Ej. 40 que también tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, el cual presenta una actividad

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

expresada por su IC50 de 0,0026 μ M, de manera que este es 8 veces más activo como inhibidor de TAFIa que el Ej. 1.

La recurrente considera que el documento D2 no menciona la estereoquímica de los compuestos ni los compuestos sustituidos con cicloalquilo, por lo cual afirma que sus enseñanzas no llevarían a la persona normalmente versada en la materia al objeto de la solicitud.

La recurrente afirma que, contrario al examen realizado por esta Oficina, el grupo ciclohexilo no es el causante de la inhibición de TAFIa, por lo cual la presencia de este grupo en los compuestos del documento D2 no hacen obvio al objeto de la solicitud.

Agrega que en el examen de patentabilidad esta Oficina comparó el Ej. 21 del documento D1 con el Ej. 1 del documento D2 y concluye que el compuesto con el ciclohexilo del documento D2 es menos activo que el que tiene el alquilo; por lo cual, en su concepto, pareciera que incluir el ciclohexilo causa la disminución de la actividad. Agrega que, de la misma manera, esta Oficina comparó el Ej. 11 del documento D1 con el Ej. 33 del documento D2 y concluye que el compuesto con el ciclohexilo del documento D2 es más activo que el que tiene el alquilo; pero afirma que de aquí no puede concluirse que el grupo ciclohexilo es el causante de la actividad inhibidora de TAFIa.

La recurrente disiente de la afirmación contenida en el examen realizado por esta Oficina según la cual el documento D2 sugiere a la persona normalmente versada en la materia el sustituir el alquilo enseñado en el documento D1 por el cicloalquilo, con la expectativa de obtener compuestos con actividad inhibidora de TAFIa puesto que, en su concepto, con base en las comparaciones mencionadas y en las enseñanzas del documento D2, no es posible llegar a esta conclusión. Agrega que con base en las enseñanzas del documento D2 la persona normalmente versada en la materia pensaría que la actividad inhibidora de TAFIa está dada por la sustitución con grupos multicíclicos grandes sobre el anillo imidazol en lugar del grupo ciclohexilo sencillo, dado que este documento enseña la sustitución con grupos grandes.

Agrega que el problema no consiste en “cómo obtener compuestos alternativos con actividad inhibidora de TAFIa”, sino en “cómo obtener compuestos alternativos con actividad inhibidora de TAFIa mejorada”.

TERCERO: Que dentro del contexto antes descrito, esta Entidad procede a resolver el recurso de reposición interpuesto en los siguientes términos:

Con relación al nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 35 reivindicaciones, presentado el 09 de marzo de 2015 con el N° 12-121222-00009-0000, esta Oficina considera que es procedente admitirlo para el estudio pertinente porque no amplía el objeto inicialmente presentado y se canceló la tasa respectiva.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

Con relación al argumento según el cual se han violado el Art 45 de la Decisión 486 y el derecho al debido proceso porque, aunque se limitó la reivindicación 1, se reitera la objeción de unidad de invención y esta vez con base en los documentos “Discovery of Potent & Selective Inhibitors of Activated Thrombin-Activatable Fibrinolysis Inhibitor for the Treatment of Thrombosis” y ES2299026, por lo cual considera que se hizo la negación con base en una objeción que no había sido trasladada previamente al solicitante; esta Oficina aclara que no se ha violado ninguna de las normas mencionadas porque la reivindicación 1 (presentada en la respuesta al Oficio 9344 del 05 de agosto de 2014, radicada con el N° 12-121222-00005-0000 del 29 de octubre de 2014) menciona derivados del ácido valérico (es decir de 5 carbonos, cuando $Y = -CH_2-CHR^5-CH_2-NHR^6$) y también menciona derivados del ácido acético (es decir de 2 carbonos, cuando $Y = -OCHR^7-CH_2-NHR^8$), por lo cual no hay unidad de invención, como se había comunicado en el requerimiento del Oficio 9344.

De otro lado, no es cierto que se haya presentado una nueva una objeción que no se había trasladado a la solicitante porque los documentos “Discovery of Potent & Selective Inhibitors of Activated Thrombin-Activatable Fibrinolysis Inhibitor for the Treatment of Thrombosis” y ES2299026 son los documentos D1 y D2 con los cuales se hizo el examen de nivel inventivo en el examen de fondo trasladado a la recurrente mediante Oficio N 9344 del 05 de agosto de 2015. Ahora bien, resaltar que el núcleo de los compuestos reivindicados que son derivados del ácido valérico se había dado a conocer en estos documentos no es una nueva objeción, porque en el Oficio 9344 ya se había demostrado así, sino la confirmación de que la estructura central de estos compuestos se había dado a conocer previamente en estos dos documentos, por lo cual estos compuestos conforman el primer grupo inventivo.

En relación con el argumento de la recurrente según el cual, dado que la nueva reivindicación 1 se limitó al primer grupo inventivo mencionado por el examen, la solicitud cumple ahora con el requisito de unidad de invención, esta Oficina aclara que el nuevo capítulo reivindicatorio que consta de 35 reivindicaciones, presentado el 09 de marzo de 2015 con el N° 12-121222-00009-0000 solamente menciona derivados del ácido valérico (es decir de 5 carbonos, cuando $Y = -CH_2-CHR^5-CH_2-NHR^6$), por lo cual efectivamente cumple el requisito de unidad de invención.

En cuanto tiene que ver con el argumento según el cual no hay sugerencias para que, combinando los documentos D1 y D2, se llegue al objeto reivindicado, el Ej. 1, que no tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, presenta una actividad expresada por su IC_{50} de 0,021 μM y que el Ej. 2, que sí tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, presenta una actividad expresada por su IC_{50} de 0,0083 μM , de manera que este último es 2,5 veces más activo como inhibidor de TAFIa que el Ej. 1. De la misma manera, presenta la comparación con el Ej. 40 que también tiene el sustituyente trans-4-metil sobre el anillo ciclohexilo, el cual presenta una actividad expresada por su IC_{50} de 0,0026 μM , de manera que este es 8 veces más activo como inhibidor de TAFIa que el Ej. 1, esta Oficina considera que la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

persona normalmente versada en la materia esperaría que los compuestos que tienen un sustituyente metil sobre el anillo ciclohexilo fuesen más activos que los que no tienen sustitución sobre el ciclohexilo, porque el documento D2 enseña que el compuesto 33 que tiene sustituyentes metil sobre el anillo ciclohexilo es más activo ($K_i = 3 \text{ nM}$) que el compuesto 1 que no tiene sustitución sobre el ciclohexilo ($K_i = 30$).

En referencia al argumento de la recurrente según el cual el documento D2 no menciona la estereoquímica de los compuestos ni los compuestos sustituidos con cicloalquilo, por lo cual afirma que sus enseñanzas no llevarían a la persona normalmente versada en la materia al objeto de la solicitud, esta Oficina aclara que no es así, porque el documento D2 enseña que Y es cicloalquilo no sustituido o sustituido una, dos o tres veces con R1, y R1 es metil, entre otros (Págs. 1 y 2), de manera que este cicloalquilo y sus sustituyentes sugieren los compuestos de la solicitud, por lo tanto puede concluirse que el objeto reivindicado no cumple con el requisito de nivel inventivo.

Por otra parte resulta del caso señalar que no solamente el grupo ciclohexilo es el causante de la inhibición de TAFIa, porque los compuestos del documento D1 también son inhibidores de TAFIa; de otro lado, los compuestos del documento D2 indican a la persona normalmente versada en la materia que un cicloalquilo sustituido con un metil proporciona mayor actividad a este tipo de compuestos, de manera que el objeto de la solicitud puede derivarse de manera evidente del estado de la técnica y, por lo tanto, no cumple con los requisitos de patentabilidad.

Ahora bien, con referencia a su manifestación en el sentido que en el examen de patentabilidad esta Oficina comparó el Ej. 21 del documento D1 con el Ej. 1 del documento D2 y concluye que el compuesto con el ciclohexilo del documento D2 es menos activo que el que tiene el alquilo, por lo cual, en su concepto, pareciera que incluir el ciclohexilo causa la disminución de la actividad; esta Oficina aclara que no se hizo tal comparación, sino que se extrajo la enseñanza del documento D1, la cual está relacionada con el ácido valérico, la cual consiste en que los compuestos que tienen **ácido valérico** con su cadena de 5 carbonos son más activos (compuesto 21, $K_i = 10$) que los compuestos que tienen ácido acético (la cadena está interrumpida por un grupo amina, $-\text{NH}-$) (compuesto 11, $K_i = 84\text{nM}$).

De otro lado, el documento D2 enseña que es mejor sustituir el ciclohexilo con uno, dos o tres metilos, que dejarlo sin sustituciones, porque las sustituciones aumentan la actividad. De manera que es equivocada la conclusión de la recurrente según la cual 'incluir el ciclohexilo causa la disminución de la actividad'. Por lo tanto se reitera la falta de nivel inventivo del objeto reivindicado.

En relación con el argumento de la recurrente según el cual disiente de la afirmación contenida en el examen realizado por esta Oficina sobre que el documento D2 sugiere a la persona normalmente versada en la materia el sustituir el alquilo enseñado en el documento D1 por el cicloalquilo, con la expectativa de obtener compuestos con

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

actividad inhibidora de TAFla, puesto que, en su concepto, con base en las comparaciones mencionadas y en las enseñanzas del documento D2, no es posible llegar a esta conclusión, esta Oficina reitera que el documento D1 enseña que los compuestos que tienen ácido valérico son más activos que los compuestos que tienen ácido acético (la cadena está interrumpida por un grupo amina, -NH-) y que el documento D2 enseña que es mejor sustituir el ciclohexilo con uno, dos o tres metilos, que dejarlo sin sustituciones, porque las sustituciones aumentan la actividad.

Con respecto al argumento de la recurrente según el cual con base en las enseñanzas del documento D2 la persona normalmente versada en la materia pensaría que la actividad inhibidora de TAFla está dada por la sustitución con grupos multicíclicos grandes sobre el anillo imidazol en lugar del grupo ciclohexilo sencillo, dado que este documento enseña la sustitución con grupos grandes, esta Oficina aclara que no es así. El documento D2 enseña la sustitución con el grupo ciclohexilo sencillo; de hecho, allí se muestra que 'Y' es cicloalquilo no sustituido o sustituido con uno, dos o tres metilos, entre otros (Págs. 1 y 2). Y el ejemplo 3, que es el más activo ($K_i = 3$ nM), tiene el sustituyente dimetil-ciclohexilo. De manera que las enseñanzas de este documento, junto con las del documento D1, indican a la persona normalmente versada en la materia que es posible obtener los compuestos de esta solicitud con los efectos mencionados, los cuales de ninguna manera resultan sorprendentes, por tanto el objeto en cuestión no cumple con los requisitos que hacen posible el otorgamiento de patente.

Finalmente, en cuanto se refiere al argumento de la recurrente según el cual el problema no consiste en "cómo obtener compuestos alternativos con actividad inhibidora de TAFla", sino en "cómo obtener compuestos alternativos con actividad inhibidora de TAFla mejorada", esta Oficina remite al lector a la Tabla 1 de la resolución mediante la cual se negó la solicitud, donde claramente se muestran las similitudes estructurales de los compuestos reivindicados con los del estado de la técnica y sus respectivas actividades. La tabla presenta que la actividad de los ejemplos del documento D1 es $K_i = 10$ y 84 nM y de los ejemplos del documento D2 (ES2299026) es $K_i = 30$ y 3 nM; siendo esta última, que corresponde a la del compuesto con las sustituciones metilo en el ciclohexanilo, superior a la de los compuestos de la solicitud que tienen $K_i = 21$ y 5 nM. De manera que no puede inferirse que la actividad de los compuestos reivindicados sea 'mejorada', sino que son compuestos alternativos a los compuestos conocidos (es decir su actividad es similar o menor a la de los que ya se conocían). En razón de lo cual se concluye que el objeto de la solicitud es obvio para la persona normalmente versada en la materia frente a los documentos D1 y D2 y por lo tanto no tiene nivel inventivo.

Por lo anteriormente expuesto, se reitera que el objeto de la solicitud en estudio no cumple con los requisitos de patentabilidad legalmente previstos, específicamente el de nivel inventivo; en consecuencia, no se halla mérito para revocar la decisión impugnada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52605

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

Rad. PCT/12-121222

RESUELVE:

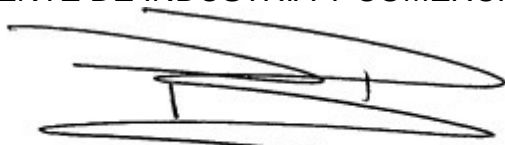
ARTÍCULO PRIMERO: Confirmar la decisión contenida en la Resolución N° 2755 del 30 de enero de 2015, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Daiichi Sankyo Company, Limited, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse agotada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 26 Ago 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, CAVELIER@CAVELIER.COM

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