

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

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 07 de marzo de 2013, con el N° 13-046171-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Millenium Pharmaceuticals, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "HETEROARILOS Y SUS USOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2011/047407 del 11 de agosto de 2011.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 669 del 17 de junio de 2013, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 3409, notificado por fijación en lista el 18 de marzo 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° 13-046171-00008-0000 del 30 de julio de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 10 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. Asimismo, presenta la solicitud divisional 14-165183-00000-0000 la cual será estudiada en trámite independiente y decidida en el respectivo expediente.

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."*

SÉXTO: Que las reivindicaciones 1 a 10, 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:56399
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

6.1. Objeto de la invención

El problema técnico consiste en la necesidad de proporcionar compuestos alternativos como inhibidores de la quinasa PI3K útiles para tratar enfermedades proliferativas inflamatorias o cardiovasculares.

6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 11 de agosto de 2010, 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
D2	US20100075951	"HETEROARYLS AND USES THEREOF"	25/Marzo/2010
D3	Current Medicinal Chemistry, 2005, 12, 23-49	"BIOISOSTERISM: A USEFUL STRATEGY FOR MOLECULAR MODIFICATION AND DRUG DESIGN"	2005

El documento D2¹ divulga un compuesto de fórmula I útil como inhibidor de PI3K (Pág. 36, reivindicación 1)

El documento D3² divulga la relación bioisostérica entre el grupo carboxilo y diversos anillos nitrogenados aromáticos (Pág. 26, Tabla 2; Pág. 39, Esquema 35; Pág. 42, Esquema 45; Pág. 43, Esquema 46)

6.3. 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(a) en la solicitud tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la(s) reivindicación(es) 1 está(n) referida(s) a: *"Un compuesto de*

1 URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2010075951A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20100325&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP
2 URL: <http://benthamscience.com/journal/abstracts.php?journalID=cmc&articleID=61727>

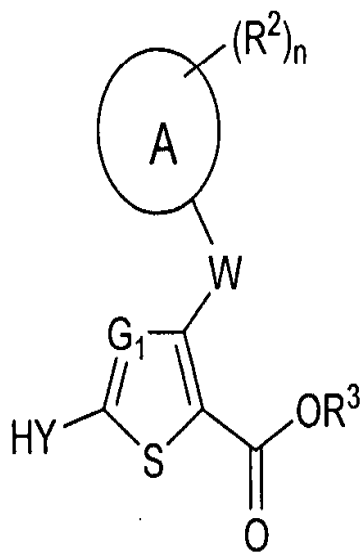
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

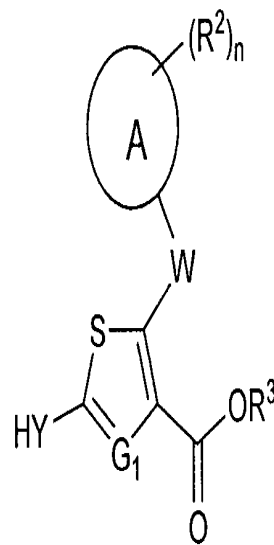
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

fórmula IA o IB:



IA-i



IB-i

o una sal aceptable para uso farmacéutico del mismo, donde....”(Ver radicado N° 13-046171-00008-0000)

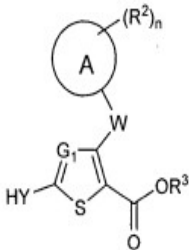
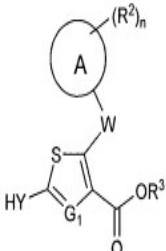
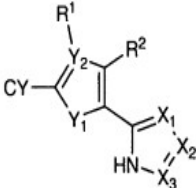
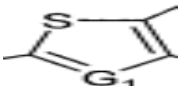
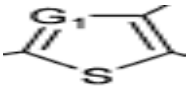
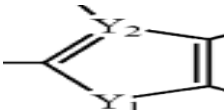
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

Tabla 2

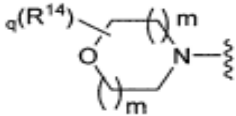
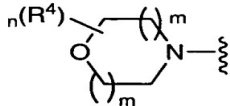
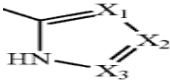
SOLICITUD	D2	D3
 IA-i  IB-i	 (Pág. 36, reivindicación 1) R¹ es H, CN, halógeno, Z-R³, C₁₋₆ alifático o cicloalifático de 3 a 10 miembros	Divulga la relación bioisostérica entre el grupo COOH y diversos anillos nitrogenados aromáticos (Pág. 26, Tabla 2; Pág. 39, Esquema 36; Pág. 42, Esquema 45; Pág. 43, Esquema 46)
 G₁ es N o -CR⁸ donde R⁸ es H, -CN, halógeno, -Z₂-R⁹, alifático C₁₋₆, o cicloalifático de 3 a 10 miembros (Ver radicado N° 13-046171-00008-0000)	 Y¹ es S Y² es C o N	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

SOLICITUD	D2	D3
HY es 	CY es 	Divulga la relación bioisostérica entre el grupo COOH y diversos anillos nitrogenados aromáticos (Pág. 26, Tabla 2; Pág. 39, Esquema 36; Pág. 42, Esquema 45; Pág. 43, Esquema 46)
COOR³ R³ es hidrógeno o un alifático opcionalmente sustituido C₁₋₆	 X₁, X₂ y X₃ son cada uno independientemente N o CR⁶	
W-A-(R²)_n W es -C(H) (N(R^{7b})₂) o -CH₂- en donde cada ocurrencia de R^{7b} es independientemente hidrógeno o alifático C₁₋₆ opcionalmente sustituido El anillo A es un grupo fenilo o naftilo Cada aparición de R² es independientemente halógeno, alquilo C₁₋₃, -CN, Haloalquilo C₁₋₃, -O-C₁₋₃ alquilo, -O-C₁₋₃ haloalquilo, -NHC(O)-C₁₋₃ alquilo, -NHS(O)₂-C₁₋₃ alquilo o -C(O)H	R² R² es W-R⁵ W es una cadena de alquilenos C₁₋₃ R⁵ es un arilo de 6 a 10 miembros.	

El documento D2 divulga un compuesto de fórmula I útil como inhibidor de PI3K (Pág. 36, reivindicación 1)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D2 consiste en la presencia del grupo COOR³ en lugar del anillo nitrogenado divulgado en el documento D2 y en que este documento no divulga específicamente un compuesto que presente los sustituyentes -C(H) (N(R^{7b})₂) o -CH₂- presentes en el compuesto reclamado como grupo W

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

El documento D3 divulga la relación bioisostérica entre el grupo carboxilo y diversos anillos nitrogenados aromáticos (Pág. 26, Tabla 2; Pág. 39, Esquema 36; Pág. 42, Esquema 45; Pág. 43, Esquema 46)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D3 consiste en que este documento no divulga específicamente un compuesto de fórmula IA o IB

El efecto que logra el incluir el grupo COOR^3 y los sustituyentes $-\text{C}(\text{H})(\text{N}(\text{R}^{7b})_2)$ o $-\text{CH}_2-$ como grupo W es que proporciona nuevos compuestos alternativos como inhibidores de la quinasa PI3K útiles para tratar enfermedades proliferativas inflamatorias o cardiovasculares

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el compuesto conocido en el documento D2 para proporcionar nuevos compuestos alternativos como inhibidores de la quinasa PI3K útiles para tratar enfermedades proliferativas inflamatorias o cardiovasculares”.

Sin embargo, el documento D3 divulga la relación bioisostérica entre el grupo COOH y diversos anillos nitrogenados aromáticos en particular el tetrazol (Pág. 26, Tabla 2; Pág. 39, Esquema 36; Pág. 42, Esquema 45; Pág. 43, Esquema 46). Adicionalmente el sustituyente $-\text{CH}_2-$ como grupo W ya se encuentra sugerida en el documento D2 cuando establece que el grupo W puede corresponder a una cadena de alquileo C_{1-3} (Pág. 36, reivindicación 1). En cuanto a las diversas opciones presentadas como sustituyente $(\text{R}_2)_n$, estas se encuentran presentes en los ejemplos que presenta el documento D2 (Págs. 23 a 34, Ej. 1 a 10)

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, reemplazaría el anillo divulgado en el documento D2 por un grupo COOR^3 manteniendo la fórmula Markush conocida en el documento D2 y utilizando un grupo metileno como grupo W, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 10 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

En referencia al argumento de la solicitante, según el cual “*el solicitante considera que D3 enseña de manera expresa que el bioisosterismo es un “proceso especial” para modificar un compuesto principal (ver, por ejemplo, página 23, columna izquierda), así como que el compuesto principal debe tener propiedades particulares*” y que “*El solicitante considera, además que dada la expresa enseñanza de D3 de que los reemplazos bioisostéricos requieren consideraciones de, por ejemplo, mecanismo bioquímico de acción y estructura del receptor, la persona experta en la técnica no consideraría las enseñanzas de D3 esquemas 35 (que se relaciona con las modificaciones de GABA), 45 (que se relaciona con las modificaciones de análogos de glutamato), y 46 (que se relaciona con modificaciones de candidatos a fármaco para el tratamiento de isquemia cerebrovascular) por tener alguna*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

relevancia a posibles modificaciones de los compuestos de D2”, para concluir finalmente que “Por al menos estas razones, el solicitante considera que su Despacho no ha mostrado que una persona medianamente versada hubiera modificado algunos de los compuestos de D2 de la manera propuesta por su Despacho para llegar a las actuales reivindicaciones. De acuerdo con esto, el solicitante considera que las actuales reivindicaciones son inventivas sobre D2 y D3”, se aclara a la solicitante que es ya conocido en el estado del arte el reemplazo bioisostérico entre el grupo carboxilo y un anillo de tetrazol y que no es necesario que en el documento D3 se presente específicamente el compuesto reclamado o un compuesto en el cual el reemplazo bioisostérico entre el grupo carboxilo y el anillo de tetrazol sea utilizado específicamente en la inhibición de la quinasa PI3K puesto que el examen de patentabilidad se basa en el método problema-solución, siendo claro que en este caso el documento más cercano a la materia reclamada es el documento D2 el cual divulga un compuesto que es muy similar al reclamado y que es activo como inhibidor de la quinasa PI3K útil para tratar enfermedades proliferativas inflamatorias o cardiovasculares y es el documento D3 el que suple las falencias presentadas en el documento D2, al presentar una opción de reemplazo para el anillo de tetrazol presente en el compuesto divulgado en el documento D2. Por lo tanto esta oficina considera que el documento D3 al ser combinado con las enseñanzas proporcionadas por el documento D2 constituye una motivación para reemplazar el anillo tetrazol por un grupo carboxilo dentro de la experimentación rutinaria para obtener compuestos alternativos como inhibidores de la quinasa PI3K. Adicionalmente la solicitante no presenta evidencia que bajo las mismas condiciones los compuestos de la presente invención presenten un efecto técnico sorprendente con respecto a los compuestos ya conocidos en el estado de la técnica y que sea la inclusión del grupo carboxilo la que otorgue un efecto técnico sorprendente al compuesto reclamado. Lo anterior teniendo en cuenta que tanto en la solicitud como en el documento D2 (Pág. 36, Párr. [0273]) se establecen que los compuestos presentados pueden presentar valores de IC50 en cuanto a inhibición de la quinasa PI3K menores a 0,1 µM. De manera que el nivel de actividad de los compuestos de la solicitud estudiada no es sorprendente para la persona normalmente conocedora de la materia, a la luz de lo enseñado en los documentos D2 y D3.

SÉPTIMO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud, el título quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE TIAZOL Y TIOFENO CARBOXI SUSTITUIDOS COMO INHIBIDORES DE PI3K QUINASA”.

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,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:56399

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-046171

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada COMPUESTOS DERIVADOS DE TIAZOL Y TIOFENO CARBOXI SUSTITUIDOS COMO INHIBIDORES DE PI3K QUINASA”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Millenium Pharmaceuticals, Inc., 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 23 Sep 2014

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALVARO CORREA ORDOÑEZ, OFFICE.BOGOTA@BAKERNET.COM

Elaboró: Rodolfo Cadena Amaya
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño Fernández