

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:3680

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

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 31 de mayo de 2013, con el N° 13-134023-00000-0000, por la sociedad Incyte Corporation, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE PIRROLOPIRIDINA Y PIRROLOPIRIMIDINA SUSTITUIDOS CON CICLOBUTILO COMO INHIBIDORES DE JAK", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2011/061374 del 18 de noviembre de 2011.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 676 del 30 de septiembre de 2013, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N°. 6230, notificado por fijación en lista el 27 de mayo 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° 13-134023-00007-0000 del 06 de octubre de 2014, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 37 que remplazan 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 37 contenidas en el radicado N° 13-134023-00007-0000, 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:3680

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

6.1. Objeto de la invención

El problema técnico se refiere a la necesidad de proporcionar compuestos que modulen la actividad de quinasas Janus (JAK) y sean útiles en el tratamiento de enfermedades tales como trastornos inflamatorios, trastornos autoinmunes, cáncer y otras enfermedades. Para solucionar este problema la solicitud presenta compuestos derivados de pirrolopirimidinas y pirrolopiridinas ciclobutilo sustituidas de la fórmula I y composiciones que los contengan.

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 19 de noviembre de 2010.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

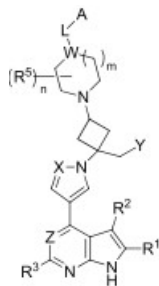
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D2	WO2009114512	"Azetidine and cyclobutane derivatives as JAK inhibitors"	17/Septiembre/2009

El documento D2¹ divulga derivados de azetidina y ciclobutano como inhibidores de JAK (resumen, reivindicación 18).

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, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: *"Un compuesto de la fórmula I:*



I o una de sus sales farmacéuticamente aceptables; en donde: X es CH o N; Y es H, ciano, halo, alquilo C₁₋₃ o haloalquilo C₁₋₃; Z es CR⁴ o N; W es CH o N; (...) R¹, R², R³ y R⁴ son cada uno, de modo independiente, H, hidroxí, halo, alquilo C₁₋₃ o haloalquilo C₁₋₃; (...) cada R⁵ es, de modo independiente, hidroxí, alcoxi C₁₋₄, flúor (...)." (Pág. 9 a 12 del radicado 13-134023-00007-0000).

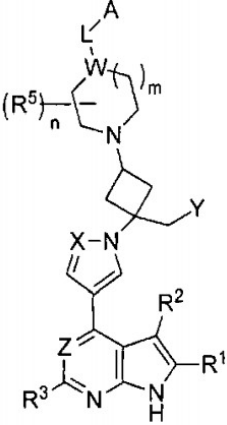
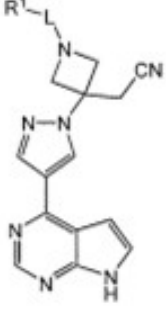
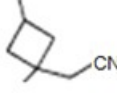
¹http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2009114512&KC=&locale=en_EP&FT=E

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:3680
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

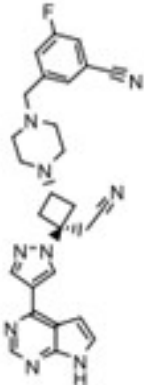
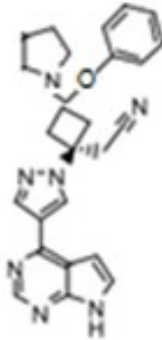
La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2 que representan el estado de la técnica:

Características esenciales	D2
Compuesto de la Fórmula I	Compuesto de la fórmula I (Reiv 18)
	
R1	
H, OH, halo, alquilo C1-3 o haloalquilo C1-3	H
R2	
H, OH, halo, alquilo C1-3 o haloalquilo C1-3	H
R3	
H, OH, halo, alquilo C1-3 o haloalquilo C1-3	H
	
Y	
H, CN, halo, alquilo C1-3 o haloalquilo C1-3	CN
	R5, R6
	heteroaril de 5 miembros
	
Z	
CR4 o N	N
X	
CH o N	N
L (cuando W = CH)	No menciona
O, S, C(R6)2, éter, amida, carboxilo, SO, SO2, sulfonilamida	
L (cuando W = N)	No menciona
C(R6)2, éter, amida, carboxilo, SO, SO2, sulfonilamida	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:3680
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

A	R1
H, alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo	H, alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, arilo o heteroarilo
	
	Cuando: R5 es benciloxi Y R6 es heteroaril de 5 miembros
(Pág. 215, Ej. 682)	(Reiv 18)

El documento D2 es considerado el estado de la técnica más cercano al compuesto definido en la reivindicación 1 porque divulga derivados de azetidina y ciclobutano como inhibidores de JAK (resumen, reivindicación 18).

La diferencia entre el compuesto de la solicitud definido en la reivindicación 1, con respecto al compuesto divulgado en el documento D2 consiste en la presencia del sustituyente L.

No existe efecto técnico sorprendente porque los valores de IC₅₀ de los compuestos divulgados en el documento D2 (IC₅₀ 1,1 a 5,5 nM para inhibir la JAK1 e IC₅₀ 0,3 a 1,5 nM para inhibir la JAK2 (documento D2, Pág. 155, tabla 3) son mejores con respecto a los valores de IC₅₀ de los compuestos de la solicitud (IC₅₀ menor que 10 nM para inhibir la JAK1 e IC₅₀ mayor que 100 nM para inhibir la JAK2).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar el compuesto conocido en documento D2 para proporcionar un compuesto alternativo, inhibidor de quinasa Janus.

Sin embargo, en el mismo D2 se mencionan compuestos que no mencionan la inclusión de un sustituyente L entre el grupo ciclobutil y un heterociclo, por lo cual la persona versada en la materia puede prescindir de L para obtener los compuestos de la solicitud. De manera que la reivindicación 1 de la solicitud se considera obvia y, en consecuencia, no tiene nivel inventivo.

Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 37 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al objeto de la reivindicación independiente, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:3680

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

La solicitante afirma que los compuestos del documento D1 no tienen anillo ciclobutilo (4 carbonos), por lo cual no anulan la novedad de los compuestos de la solicitud. Es oportuno aclarar que, tal como afirma la solicitante, los compuestos del documento D1 no tienen anillo ciclobutilo (4 carbonos), por lo cual no anulan la novedad; pero sí tienen el anillo ciclohexano (6 carbonos), por lo cual y dado que los compuestos del documento D2 sí lo enseñan, se considera que la persona versada, quien tiene a la vista los dos documentos, está en capacidad de incluirlo. Por lo tanto, el objeto de la solicitud no tiene nivel inventivo.

La solicitante argumenta que el anillo triazol enseñado en el documento D1 no es semejante a los anillos piridina y piperazina que presentan los compuestos de la solicitud. Esta Oficina aclara que, contrario a lo afirmado por la solicitante, el anillo triazol enseñado en el documento D1 sí es semejante a los anillos piridina y piperazina de los compuestos reivindicados, como se conoce bien en el medio y lo presentan los manuales de uso común (Aulton²) que enseñan, por ejemplo, la relación bioisostérica que hay entre los anillos indazol e indol, los cuales cuando se sustituyen equivalentemente, tienen las mismas propiedades electrónicas y el mismo patrón de aromaticidad, por lo cual pueden ser considerados bioequivalentes al nivel de interacciones con el mismo receptor (Pág. 32, Col. izq.). De la misma manera, este documento explica que se ha demostrado la relación bioisostérica que existe entre anillos heterocíclicos aromáticos y el anillo fenil (Pág. 32, Col. der.), tal como se menciona previamente en el Art 45, donde se afirma que la estructura continúa manteniendo la misma distribución estérica de las cargas, dado que esta es una consecuencia de sus grupos químicos.

Con respecto al argumento de la solicitante según el cual es equivocado afirmar que el término “heteroarilo” es sinónimo de “heterociclo”, esta Oficina aclara que el término “heteroarilo” sí es sinónimo de “heterociclo”, dado que “un compuesto heterocíclico es una sustancia que contiene un anillo formado por más de un tipo de átomos”, (como se conoce bien en el medio y lo presentan los manuales de uso común (por ejemplo el libro de texto de Morrison y Boyd³). el nombre genérico de este tipo de compuestos es independiente de que se trate de un anillo saturado (como en el caso de la piperazina de la solicitud) o insaturado (como en el caso del triazol del documento D1 y de la pirrolidina del documento D2).

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,

²Lídia Moreira Lima and Eliezer J. Barreiro. Current Medicinal Chemistry, 2005, 12, 23-49. Bioisosterism: A Useful Strategy for Molecular Modification and Drug Design. Pág. 32.

³Morrison y boyd. Química Orgánica. Fondo Educativo Interamericano, S. A. USA, 1976. Pág. 1025.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:3680

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/13-134023

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “DERIVADOS DE PIRROLOPIRIDINA Y PIRROLOPIRIMIDINA SUSTITUIDOS CON CICLOBUTILO COMO INHIBIDORES DE JAK”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Incyte Corporation, 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 diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 02 Feb 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

ALICIA LLOREDA RICAURTE, notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca
Revisó: Dayron Alexander Ramirez Reyes
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño Fernández