

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-030304

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 ante esta Superintendencia el 27 de marzo de 2008 con el N° 08-030304-00000-0000, por las sociedades ELAN PHARMACEUTICALS, INC. y WYETH, a través de apoderado, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTOS DE PIRIMIDINIL AMIDA QUE INHIBEN LA ADHESIÓN DE LEUCOCITO MEDIADA POR VLA-4", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2006/038009 del 28 de septiembre de 2006.

SEGUNDO: Que efectuado el examen de forma, con fundamento en el artículo 39 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, en concordancia con el Tratado de Cooperación en materia de patentes (PCT), el reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se ordenó publicar el extracto sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de patentabilidad con fundamento en lo dispuesto en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se requirió a las solicitantes mediante Oficio N° 18553, notificado el 1 de diciembre de 2011, para que se pronunciaran sobre las objeciones efectuadas a la solicitud, en cuanto a la carencia de nivel inventivo, conforme lo establece el artículo 18 de la Decisión 486 anteriormente mencionada.

CUARTO: Que las solicitantes mediante escrito radicado bajo el N° 08-030304-00006-0000 del 16 de febrero de 2012, respondieron oportunamente el requerimiento formulado, y presentaron nuevas reivindicaciones 1 a 8 (Fls. 376 a 378) que reemplazan 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 según lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina se 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 contenidas en los folios 376 a 378, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

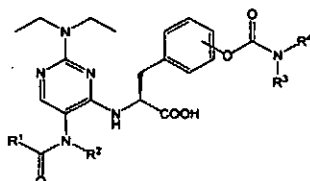
RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-030304

6.1. Objeto de la invención.

El objeto de la invención consiste en la necesidad de proporcionar compuestos útiles para tratar enfermedades mediadas por la integrina VLA-4. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I) y composiciones que los contienen:



I

6.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 29 de septiembre de 2005, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos anteriores a la fecha de reivindicación de prioridad, relacionados con la materia de la solicitud en estudio:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO03099809	Heterocyclic compounds which inhibit leukocyte adhesion mediated by alpha4 integrins.	04/12/2003

El documento D1¹ divulga compuestos bioisosteros de los compuestos de fórmula (I) de la presente solicitud, que inhiben la adhesión de leucocitos mediada por VLA-4 (descripción página 10 y capítulo reivindicatorio).

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

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20031204&CC=WO&NR=03099809A1&KC=A1)

[DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20031204&CC=WO&NR=03099809A1&KC=A1](http://worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20031204&CC=WO&NR=03099809A1&KC=A1)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

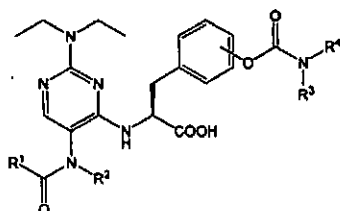
Rad. PCT/08-030304

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”.

“El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida”.

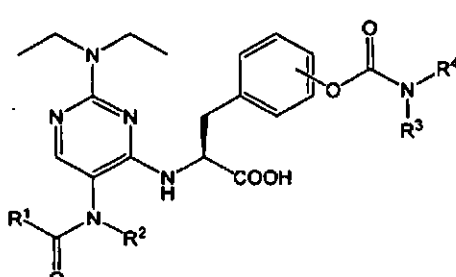
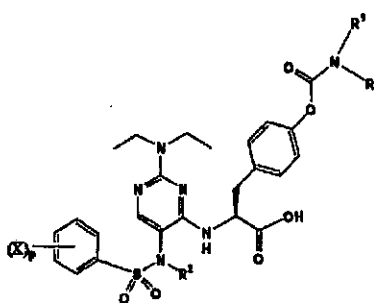
6.3.1 Del compuesto

En el presente caso, los compuestos reclamados en la solicitud no poseen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 está referida a: Un compuesto de fórmula (I):



I

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 documento D1 que representa el estado de la técnica:

Características esenciales	D1
 I	 (I)
R ¹ : alquilo C ₁ a C ₄ , haloalquilo C ₁ -C ₄ , furanilo, tienilo, entre otros.	Fenilo opcionalmente sustituido
R ² : Alquilo C ₁ -C ₄	p= 0 a 3.
(O=C)N	R ² : Alquilo inferior, alquenal inferior, cicloalquilalqueno inferior.
R ³ y R ⁴ : Junto con el átomo de nitrógeno colgante a este se une para formar un anillo	(O=S=O)N
	R ¹ y R ³ : Junto con el átomo de Nitrógeno al cual están unidos forman un azetidini,

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-030304

heterocíclico	pirrolidinil, pirrolil, 2,5-dihidropirrol-1-il, piperidinil, 1,2,3,6-tetrahidro-piridin-1-il.
---------------	--

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de estructura muy similar al compuesto de fórmula I, que inhibe la adhesión de leucocito mediada por VLA-4.

La diferencia entre el compuesto definido en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D1, consiste en la sulfonamida que está unida al anillo de pirimidina y el sustituyente fenilo que contiene dicha sulfonamida.

No se evidencia algún efecto técnico inesperado como resultado de este cambio en la estructura del compuesto.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo sería ¿cómo modificar el compuesto divulgado en D1 para obtener una alternativa farmacológica para inhibir la adhesión de leucocito mediada por VLA-4?

El estado de la técnica D1 revela un compuesto en el cual una sulfonamida está unida al anillo de pirimidina y dicha sulfonamida contiene un sustituyente fenilo. Es del conocimiento de una persona de nivel medio versada en la materia que el carboxamido y el sulfonamido son grupos bioisósteros, al igual que ciertos grupos heterocíclicos como el tiofeno y el furano son bioisósteros del fenilo², conservándose la actividad de los compuestos al intercambiar dichos grupos en la molécula. Por otro lado, el documento D1 revela que al intercambiar diferentes anillos heterocíclicos (como azetidina, pirrolidina, pirrol, 2,5-dihidropirrol, piperidina, 1,2,3,6-tetrahidro-piridina) sobre el grupo carboxi unido al anillo fenilo de la porción fenilalanina del compuesto, la actividad se conserva. De manera que el estado de la técnica sugiere a la persona del oficio normalmente versada en la materia la forma en que se resuelve el problema de obtener compuestos alternativos a los de D1, puesto que revela compuestos que contienen un grupo farmacofórico que permite diferentes sustituciones sin perderse la actividad como inhibidores de la adhesión de leucocito mediada por VLA-4. Por lo cual se considera que la reivindicación carece de nivel inventivo, más aún teniendo en cuenta que los compuestos de la anterioridad poseen la misma actividad o incluso mayor actividad que los compuestos de la presente solicitud.

Teniendo en cuenta que no se encuentra ninguna ventaja o efecto sorprendente de los compuestos reivindicados respecto a los compuestos revelados en el estado de la técnica, se considera que la invención carece de nivel inventivo.

Por su parte, las reivindicaciones dependientes 2 a 7 no mencionan alguna característica que le confiera nivel inventivo a los compuestos de la reivindicación 1, por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 18 de la Decisión 486.

La composición de la reivindicación 8 no se considera inventiva porque el componente que

2 Introducción a la química terapéutica 2ªEdición. Antonio Delgado, Cristina Minguillón y Jesús Joglar. Páginas 138 y 139.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-030304

las caracteriza no es inventivo.

Las solicitantes argumentan que *"De los 19 compuestos ejemplificados en D1, solo los compuestos 1-4, 11, 12, 15, 16 y 19 tienen el grupo pirrolidin-1-ilcarboniloxi en el anillo fenilo de la porción fenilalanina del compuesto, mientras que los otros compuestos ejemplificados tienen un grupo piperidin-1-ilcarboniloxi o azetidin-1-ilcarboniloxi"*.

Al respecto cabe decir que la mayoría (9) de los compuestos específicos revelados en el documento D1 contienen el grupo pirrolidin-1-ilcarboniloxi (comparado con 2 que contienen piperidin-1-ilcarboniloxi y 8 que contienen azetidin-1-ilcarboniloxi), lo cual sería suficiente motivación para una persona de nivel medio versada en la materia. Por otro lado, la presente solicitud en su reivindicación 1 reclama para R3 y R4 cualquier anillo heterocíclico formado junto con el átomo de nitrógeno y no específicamente el anillo de pirrolidina.

Las solicitantes también señalan que *"D1 no revela o sugiere compuestos que tengan una amida en la posición 5 del anillo de pirimidina, y mucho menos enseña o sugiere una amida que tiene los sustituyentes como se presentan en la invención"*

Es oportuno aclarar, que a pesar de que el documento D1 no revela específicamente el grupo amida en la posición 5 del anillo de pirimidina, una persona normalmente versada en la materia conoce que existen diferentes grupos que pueden ser intercambiables en una molécula conservando la actividad de dicha molécula, tal es el caso de los grupos carboxamido y sulfonamido o los anillos de fenilo y tiofeno o furano³. Por lo tanto, una persona interesada en encontrar compuestos alternativos a los divulgados en D1, haría modificaciones de los sustituyentes revelados en D1 por grupos conocidos, por ser bioisómeros de los mismos, con la expectativa razonable de conservar la actividad de los compuestos, más aún cuando el documento D1 revela un grupo farmacofórico que permite diferentes sustituciones conservándose la actividad de los compuestos obtenidos.

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de las solicitantes no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "COMPUESTOS DE PIRIMIDINIL AMIDA QUE INHIBEN LA ADHESIÓN DE LEUCOCITO MEDIADA POR VLA-4".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar personalmente el contenido de la presente resolución a la doctora Dilia María Rodríguez D'Aleman, en su calidad de apoderada de ELAN PHARMACEUTICALS, INC. y WYETH, o a quien haga sus veces, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el

3 Introducción a la química terapéutica 2ª Edición. Antonio Delgado, Cristina Minguillón y Jesús Joglar. Páginas 138 y 139.
Página 5 de 6

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 19394

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/08-030304

Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 29 Mar 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



JOSE MIGUEL DE LA CALLE RESTREPO

Doctora

DILIA MARÍA RODRÍGUEZ D'ALEMAN

Carrera 11 No. 86 – 53. Piso 6.

Bogotá D.C.

Elaboró: Juanita Catalina Rico Valbuena ✓
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza ✓
Revisó: Carlos Daniel Lemus Giraldo ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓