

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

EI 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 05 de agosto de 2015, la sociedad Gilead Sciences, Inc., presentó la división de solicitud radicada bajo el N° 15-182435-00000-0000, en relación con la solicitud inicial N° 14-093468-00000-0000, la cual corresponde a la solicitud internacional PCT/US2012/000441 del 03 de octubre de 2012.

SEGUNDO: Que de acuerdo con lo previsto en el artículo 36 de la Decisión 486 es posible dividir la solicitud en cualquier momento del trámite siempre y cuando no implique una ampliación de la divulgación comprendida en la solicitud inicial.

TERCERO: Que la mencionada solicitud se presentó como una división de la solicitud 14-093468, la cual fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 694 el 09 de mayo de 2014, sin que se hubiera presentado oposición por parte de terceros.

CUARTO: Que la materia contenida en el capítulo reivindicatorio de la solicitud divisional N° 15-182435-00000-0000, corresponde a aquella presentada en el capítulo reivindicatorio de la solicitud parental con radicado bajo el número 14-093468-00002-0000, como se enseña a continuación:

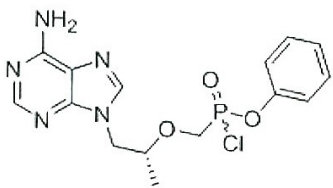
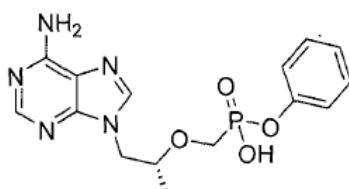
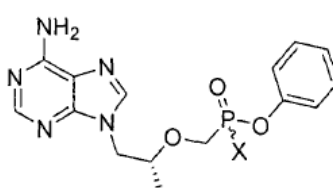
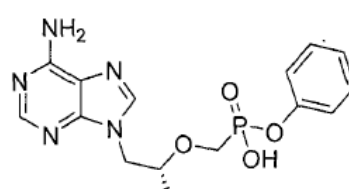
CAPITULO REIVINDICATORIO DIVISIONAL No. 15-182435-00000-0000	CAPITULO REIVINDICATORIO SOLICITUD PARENTAL No. 14-093468-00002-0000
Reiv. 1. Un método para preparar el compuesto 13a:	Reiv. 9. Un método para preparar el compuesto 13:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

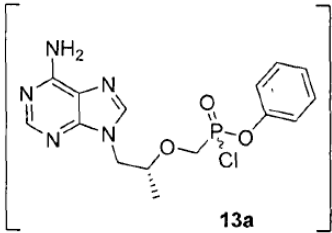
CAPITULO REIVINDICATORIO DIVISIONAL No. 15-182435-00000-0000	CAPITULO REIVINDICATORIO SOLICITUD PARENTAL No. 14-093468-00002-0000
 13a que es por lo menos 90% diastereoméricamente puro, que comprende: Tratar el compuesto 12:  12 Con cloruro de tionilo en tolueno a temperatura ambiente y calentando la reacción a 70°C por 48 a 96 horas hasta que el enriquecimiento del compuesto 13a a por lo menos 90% de diastereomérico puro está completo.	 13 donde X es halo, que es por lo menos aproximadamente 90% diastereoméricamente puro, que comprende: Tratar el compuesto 12:  12 con un agente halogenante adecuado hasta el enriquecimiento diastereomérico de compuesto 13 hasta que se alcanza por lo menos aproximadamente 90% de pureza diastereomérica. Reiv. 10. El método de acuerdo con la reivindicación 9, donde el agente halogenante es cloruro de tionilo (SOCl₂), cloruro de oxalilo (C₂O₂Cl₂), tricloruro de fósforo (PCl₃), una sal de clorotrifetilfosforano, bromuro de tionilo (SOBr₂), bromuro de oxalilo (C₂O₂Br₂), tribromuro de fósforo (PBr₃), o una sal de bromotrifetilfosforano. Reiv. 11. El método de acuerdo con la reivindicación 9 o 10, donde el compuesto 12 es tratado con el agente halogenante en un solvente que comprende tetrahidrofurano, 2-metiltetrahidrofurano, diclorometano, acetonitrilo, tolueno, clorobenceno, 1,2-dicloroetano, 1,4-dioxano, sulfolano, o tricloroetileno, o una mezcla

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

CAPITULO REIVINDICATORIO DIVISIONAL No. 15-182435-00000-0000	CAPITULO REIVINDICATORIO SOLICITUD PARENTAL No. 14-093468-00002-0000
	de los mismos. Reiv. 12. 12. El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 9-11, donde el compuesto 12 es tratado con el agente halogenante a una temperatura en el rango entre aproximadamente -2 0 °C y aproximadamente 110 °C. Reiv. 13. El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 9-12 donde el compuesto 12 es tratado con un agente halogenante por aproximadamente 48 a aproximadamente 96 horas. Reiv. 14. El método de acuerdo con la reivindicación 9, donde el compuesto 12 es tratado con cloruro de tionilo en tolueno a una temperatura de entre aproximadamente 22 °C y aproximadamente 110 °C para proporcionar el compuesto 13a:  13a que es por lo menos aproximadamente 90% diastereoméricamente puro.

QUINTO: Que la materia contenida en el capítulo reivindicatorio de la solicitud divisional N° 15-182435-00000-0000, corresponde a aquella presentada en el capítulo reivindicatorios de la solicitud parental con radicado bajo el número 14-093468-00002-0000, la cual ya había sido evaluada en:

- El capítulo reivindicatorio de la solicitud parental radicado bajo el N° 14-093468-00002-0000 mediante examen de fondo comunicado a través del Oficio 4579, en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, notificado por fijación en lista el 12 de mayo de 2015.

La sociedad Gilead Sciences, mediante escrito radicado bajo el N° 14-093468-00007-0000 el 05 de agosto de 2015, respondió oportunamente el requerimiento formulado y

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

junto con la solicitud divisional 15-182435-00000-0000 presenta nueva reivindicación 1 que reemplaza las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo, Oficio 4579.

Sin embargo, la nueva reivindicación 1 no es clara de acuerdo con lo establecido en el artículo 30 de la Decisión 486 porque señala que el compuesto 13a obtenido es por lo menos 90% diastereoméricamente puro, pero no establece cual es el enantiómero que se presenta en mayor cantidad y adicionalmente, la estructura o fórmula presentada tampoco permite determinar cuál es dicho enantiómero.

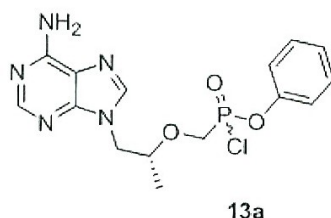
SEXTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *“Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial.”*

SÉPTIMO: Que la reivindicación 1, no cumple con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención

El problema técnico consiste en la necesidad de proporcionar métodos mejorados (métodos mejorados pueden proporcionar rendimientos más elevados, pueden ser más fáciles de llevar a cabo, o pueden utilizar reactivos menos costosos o menos tóxicos que los métodos actualmente disponibles) para preparar los compuestos 13, 15, y 16 con pureza diastereomérica elevada.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un método para preparar el compuesto 13a:



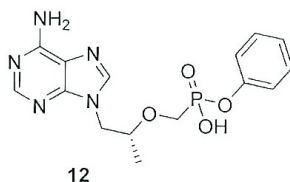
Que es por lo menos 90% diastereoméricamente puro, que comprende tratar el compuesto 12:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435



Con cloruro de tionilo en tolueno a temperatura ambiente y calentando la reacción a 70°C por 48 a 96 horas hasta que el enriquecimiento del compuesto 13a a por lo menos 90% de diastereomérico puro está completo.

7.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 07 de octubre de 2011, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de 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	US7390791	Prodrugs of phosphonate nucleotide analogues	24/Junio/2008

El documento D1¹ divulga un proceso de preparación del compuesto de fórmula (III), el cual comprende una etapa en la cual se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) con cloruro de tionilo (Ej. 2, esquema 1, col. 19, líns. 63 – 62).

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, método para preparar el compuesto 13a reclamado en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un método para preparar el compuesto 13a:

¹ URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=7390791B2&KC=B2&FT=D&ND=4&date=20080624&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

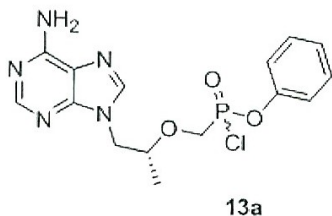
REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

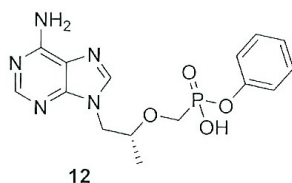
RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435



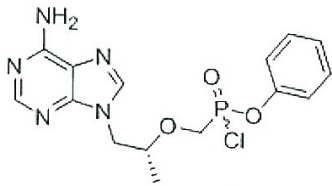
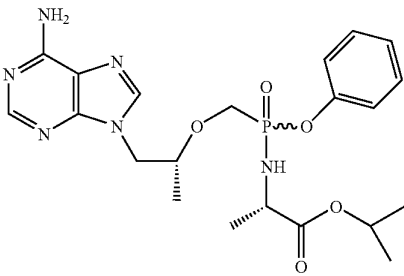
Que es por lo menos 90% diastereoméricamente puro, que comprende tratar el compuesto 12:



Con cloruro de tionilo en tolueno a temperatura ambiente y calentando la reacción a 70°C por 48 a 96 horas hasta que el enriquecimiento del compuesto 13a a por lo menos 90% de diastereomérico puro está completo.” (Ver radicado N° 15-182435-00000-0000)

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 (los) documento(s) D1 que representa(n) el estado de la técnica:

Tabla 1

Características esenciales	D1
Un método para preparar el compuesto 13a:  13a que es por lo menos 90% diastereoméricamente puro, que comprende:	Un método para preparar el compuesto  III GS-7171 Que comprende:

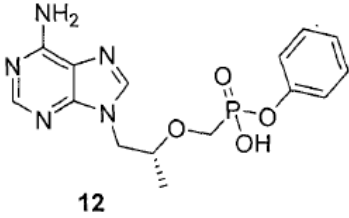
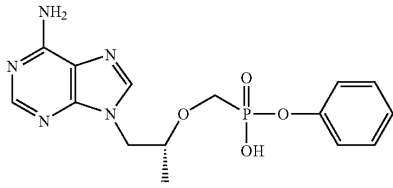
REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

Características esenciales	D1
Tratar el compuesto 12:  12 Con cloruro de tionilo en tolueno a temperatura ambiente y calentando la reacción a 70°C por 48 a 96 horas hasta que el enriquecimiento del compuesto 13a a por lo menos 90% de diastereomérico puro está completo.	Tratar el compuesto  Con cloruro de tionilo en acetonitrilo; posteriormente se adiciona una solución de éster isopropílico de (L)-alanina en diclorometano, seguido por la adición de trietilamina (Ej. 2, esquema 1, col. 19, líns. 63 – 62).

Como se dijo anteriormente, el documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D1 enseña un proceso de preparación del compuesto de fórmula (III), el cual comprende una etapa en la cual se hace reaccionar el compuesto de fórmula (II) con cloruro de tionilo (Ej. 2, esquema 1, col. 19, líns. 63 – 62).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el método divulgado en la anterioridad consiste en que el documento D1 no establece el tiempo de reacción, ni establece que el compuesto obtenido presente una pureza diastereomérica de al menos 90%.

No es posible determinar un efecto superior o ventaja del método reclamado frente al del estado de la técnica porque los dos métodos comprenden las mismas reacciones y la presente solicitud no demuestra que la selección específica de un tiempo de reacción de entre 48 a 96 horas genere resultados superiores a un tiempo de reacción diferente donde la reacción sea completa.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar el método divulgado en el documento D1 para obtener el compuesto 13a con una pureza diastereomérica de al menos 90%.”.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

Sin embargo, el documento D1 enseña las mismas reacciones del método de la presente solicitud, donde el compuesto 12 no es aislado, sino que la reacción con éster isopropílico de (L)-alanina se realiza de manera secuencial. Al verificar la descripción se encuentra que el compuesto 13 tampoco es aislado, sino que la suspensión del mismo en diclorometano se reserva para el proceso posterior de obtención del compuesto de fórmula 15. Adicionalmente, la descripción no demuestra que el tiempo específico de reacción genere resultados superiores a un tiempo de reacción diferente donde la reacción sea completa. Y es importante señalar que se encuentra dentro de las capacidades de la persona de nivel medio versada en la materia determinar el tiempo necesario para que una reacción se efectúe de manera completa.

En consecuencia, en vista de que las reacciones llevadas a cabo en el método de la presente solicitud y las del documento D1 son las mismas, y debido a que la presente solicitud no demuestra algún efecto técnico o ventaja se considera que el método reclamado es el mismo presentado en la anterioridad al cual simplemente se le especifican las condiciones de reacción, por lo tanto no presenta nivel inventivo.

La solicitante afirma que los inventores de la presente solicitud han encontrado que llevar a cabo la reacción de halogenación del compuesto 12 por un periodo suficientemente largo de tiempo dará lugar a formación del compuesto 13a que es al menos 90% diastereoméricamente puro. La solicitante señala que el documento D1 no describe que la reacción del compuesto 12 con cloruro de tionilo se lleve a cabo durante un periodo suficiente de tiempo para obtener el compuesto 13a que es al menos 90% diastereoméricamente puro. La solicitante señala que de acuerdo al documento D1 la halogenación del compuesto 12 dio como resultado el compuesto 13a como un intermediario implícito y que dicho intermediario fue reaccionado para dar el compuesto III que fue determinado como una mezcla de diastereoisómeros.

No se acepta el argumento de la solicitante porque el párrafo mencionado por ésta en el cual se hace referencia a una mezcla de diastereoisómeros se refiere al resultado de una separación cromatográfica de la mezcla racémica. Sin embargo, el documento D1 nunca señala que dicha mezcla provenga de la reacción del esquema 1. Por otro lado, tal como se mencionó en el examen de nivel inventivo, no es posible determinar un efecto superior o ventaja del método reclamado frente al del estado de la técnica porque los dos métodos comprenden las mismas reacciones y la presente solicitud no demuestra que la selección específica de un tiempo de reacción de entre 48 a 96 horas genere resultados superiores a un tiempo de reacción diferente donde la reacción sea completa.

OCTAVO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud, el título quedará de la siguiente manera: "PROCESO PARA LA OBTENCIÓN DEL COMPUESTO FENIL ({[1-(6-AMINO-9H-PURIN-9-IL)PROPAN-2-IL]OXI}METIL)(CLORO)FOSFINATO CON PUREZA

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:52481

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/15-182435

DIASTEREOMÉRICA DE POR LO MENOS 90% EL CUAL ES UN INTERMEDIARIO EN LA SÍNTESIS DE TENOFOVIR ALAFENAMIDA”.

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 solicitud divisional relacionada con la creación titulada “PROCESO PARA LA OBTENCIÓN DEL COMPUESTO FENIL ($\{[1-(6\text{-AMINO-9H-PURIN-9-IL})\text{PROPAN-2-IL}]\text{OXI}\}\text{METIL}$) (CLORO)FOSFINATO CON PUREZA DIASTEREOMÉRICA DE POR LO MENOS 90% EL CUAL ES UN INTERMEDIARIO EN LA SÍNTESIS DE TENOFOVIR ALAFENAMIDA”.

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Gilead Sciences, Inc., 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 26 Ago 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, sic@castellanosyco.co

Elaboró: Juanita Catalina Rico Valbuena
Revisó: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: Jose Luis Salazar Lopez