

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 39417

Ref. Expediente N° NC2016/0000696

Por la cual se resuelve un recurso de reposición

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

En ejercicio de sus facultades legales, en especial de las que se confirieron en el numeral 34 del artículo 3 del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO

PRIMERO: Que mediante Resolución No. 42658 del 27 de junio de 2016, la Superintendencia de Industria y Comercio denegó patente de invención a la creación denominada: “COMPUESTOS DERIVADOS DE 1-METIL-6-(PIRIDIN-3-IL)-3,4-DIHIDROQUINOLIN-2-ONA” (expediente 14040934), 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 05 de agosto de 2016, con el No. NC2016/0000696, la sociedad F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, encontrándose dentro del término establecido para el efecto, interpuso recurso de reposición contra la citada Resolución, con fundamento en los argumentos que a continuación se sintetizan:

Frente al documento D1, la recurrente señala, en primer lugar, que *“los ejemplos 2 y 6 del documento D1 son los más cercanos a la presente invención. En este sentido, si bien dichos ejemplos se caracterizan por tener un aclaramiento medio (30) y alto (103), los ejemplos 15 y 16 de la presente solicitud presentan un aclaramiento menor (respectivamente de 0 y 1) tal y como se observa en el Anexo III que corresponde al Ensayo Metabólico de Aclaramiento y los Resultados del mismo. Entonces, es claro que lo anterior enseña que introducir sustituyentes en el anillo piridinilo es un factor desfavorable para el aclaramiento (...) Por lo tanto, la diferencia entre los ejemplos del documento D1 y la presente invención son los sustituyentes amidosulfonilo. De esta manera es totalmente claro que no existe enseñanza alguna en el documento D1 que muestre que la adición de este sustituyente en la posición 5 del anillo de piridina produzca un mejor aclaramiento (...) a partir de las enseñanzas de D1, se evidencia que ninguno de los ejemplos descritos en tal documento, sobre todo aquel que presenta mejor actividad biológica, tiene un sustituyente en el anillo piridina, excepto un metoxi para los ejemplos 6 y 19, el cual no es ni remotamente parecido al sustituyente R⁶ de la fórmula (I) de los compuestos reclamados en la reivindicación 1 actualmente presentada. (...)”*

Con relación al problema técnico objetivo a resolver, la recurrente indica que consiste en *“en la obtención de inhibidores de la aldosterona sintasa alternativos que son selectivos hacia CYP11B1”*.

La recurrente indica que el documento D3 enseña *“(...) compuestos que son inhibidores contra CYP11B1, lo cual es totalmente contrario al compuesto del documento D1 el cual es selectivo hacia los inhibidores B1 y B2, Además, el documento D3 es totalmente silencioso sobre un*

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 39417

Ref. Expediente N° NC2016/0000696

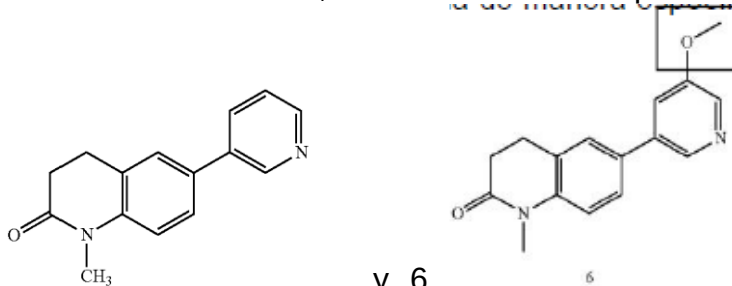
inhibidor de la aldosterona sintasa CYP11B2, lo que evidencia que las enseñanzas del documento D3 son totalmente lejanas en comparación con los compuestos de fórmula I descritos en la presente invención”.

Por lo que la recurrente concluye que “(...) la materia del capítulo reivindicatorio actualmente presentado tiene un inequívoco carácter inventivo frente a las enseñanzas de los documentos D3 y D1, cumpliendo por lo tanto a cabalidad con los requisitos de patentabilidad establecidos en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000”.

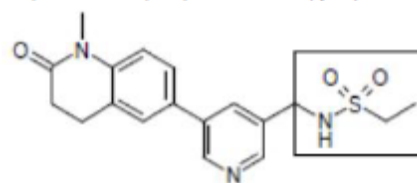
Finalmente la recurrente indica que a la presente solicitud de patente de invención le ha sido concedida patente por parte de la Oficina de Patentes de Estados Unidos de América y además, le ha sido reconocida novedad, nivel inventivo y aplicabilidad industrial por parte de la Oficina Europea de Patentes.

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

Con respecto al documento D1, esta Oficina encuentra que divulga (pág. 1, párr. [0001]) compuestos derivados de quinolinonas sustituidos con heteroarilos y compuestos relacionados que inhiben la aldosterona sintasa CYP11B2 humana. También se refiere al uso de otros derivados de quinolina sustituidos por heteroarilos para el tratamiento de hiperaldosteronismo y/o trastornos mediados por (CYP11B1). La citada anterioridad, revela de manera específica

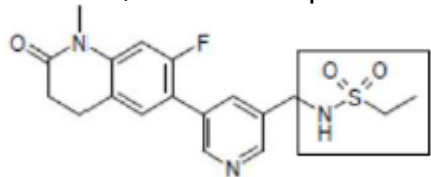


los compuestos de los ejemplos 2 y 6 (referenciados por la recurrente). Entonces, la diferencia entre los compuestos reclamados y los divulgados previamente en D1 radica en que la posición 5 de la piridina se encuentra sustituida por un radical R6 el cual es R8 definido como $-O_m-(CR^9R^{10})_n-(CR^{11}R^{12})_p-(CR^{13}R^{14})_q-$



$NR^{15}R^{16}$, tal como se puede evidenciar en los ejemplos 15

y 16



de invención (pág. 131).

divulgados en la descripción de la presente solicitud de patente

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° **39417**

Ref. Expediente N° NC2016/0000696

Para demostrar el nivel inventivo de los compuestos derivados de 1-metil-6-(piridin-3-il)-3,4-dihidroquinolin-2-ona reclamados, la recurrente refiere al Anexo III allegado con el recurso de reposición interpuesto en donde se realiza un ensayo metabólico de aclaramiento. En dicho ensayo se reporta el aclaramiento generado por los compuestos 2 y 6 reportados en D1 y se compara con el aclaramiento presentado con los ejemplos 15 y 16 divulgados en la presente solicitud de patente de invención:

Ejemplo 2 de D1	Ejemplo 6 de D1	Ejemplo 15 de la presente invención	Ejemplo 16 de la presente invención
Aclaramiento en $\mu\text{L}/\text{min}/\text{mg}$: 30	Aclaramiento en $\mu\text{L}/\text{min}/\text{mg}$: 103	Aclaramiento en $\mu\text{L}/\text{min}/\text{mg}$: 0	Aclaramiento en $\mu\text{L}/\text{min}/\text{mg}$: 1

A partir de los resultados obtenidos, se evidencia que la inclusión del sustituyente metoxi en la posición 5 de la piridina (ej. 6 de D1) presenta un aclaramiento mayor (103) en comparación con el aclaramiento obtenido cuando dicho anillo de piridina se encuentra insustituido (ejemplo 2 de D1). De acuerdo a los anteriores resultados, la persona medianamente versada en la materia esperaría que la inclusión de un sustituyente en la posición 5 de la piridina aumentara el valor de aclaramiento o depuración.

Sin embargo, para los compuestos de la presente solicitud de patente de invención la inclusión en la posición 5 del anillo de la piridina de un radical R^6 el cual es R^8 definido como $-O_m-(CR^9R^{10})_n-(CR^{11}R^{12})_p-(CR^{13}R^{14})_q-NR^{15}R^{16}$ logra un efecto contrario, es decir, una disminución en el valor de aclaramiento o depuración. Por lo tanto, D1 no enseña o sugiere que la adición de un sustituyente R^6 en la posición 5 de la piridina, tal como se define en la reivindicación 1, permitiría producir un mejor aclaramiento.

Así las cosas, el problema técnico objetivo que se plantea en la presente solicitud de patente de invención a partir de las divulgaciones del arte previo cercano (D1) consiste en ¿cómo lograr nuevos derivados de quinolinonas sustituidos con piridina selectivos sobre CYP11B1 con un efecto terapéutico mejorado?”.

Frente al documento D3, esta Oficina encuentra que divulga compuestos derivados de benzoxazolona como inhibidores de la sintasa aldosterona (CYP11B1) los cuales incluyen como sustituyente en la posición 5 de la piridina radicales tipo $CH_2NR^8(SO_2)-C_{1-7}\text{alquilo}$ o $CH_2NR_8(SO_2)-C_{3-7}\text{cicloalquilo}$ o $NHC(O)NR^8N^9$ o $NR^8(SO_2)-C_{1-7}\text{alquilo}$ o $NR_8(SO_2)-C_{3-7}\text{cicloalquilo}$. Sin embargo, es de resaltar que el núcleo estructural de los compuestos de D3 (benzoxazolona) es diferente al núcleo estructural reclamado (3,4- dihidroquinolin-2-ona). Además, no señala o sugiere que por la inclusión del sustituyente definido en la posición 5 de la piridina en los compuestos derivados de quinolinonas, divulgados previamente en D1, se lograría mantener la selectividad sobre CYP11B1 pero con un efecto mejorado en cuanto a producir un mejor aclaramiento o depuración.

Bajo este panorama del estado de la técnica la Oficina coincide con la recurrente en su conclusión, dado que la persona normalmente versada en la materia consideraría que los hallazgos derivados de los ejemplos descritos en la presente solicitud de patente de invención son inventivos frente al estado de la técnica citado (D1 con D3).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 39417

Ref. Expediente N° NC2016/0000696

Por lo anterior, esta Oficina encuentra que la materia reclamada en la presente solicitud de patente de invención definida en las reivindicaciones 1 a 48 presentadas con el radicado No. 14-040934-00006-0000 es novedosa desde el punto de vista estructural y presenta un efecto que se considera sorprendente frente a lo revelado en los documentos citados del estado de la técnica.

Por último, es importante aclarar a la recurrente que si bien para el presente caso esta Oficina reconoce la novedad, nivel inventivo y nivel industrial al igual que la Oficina Europea de Patentes y coincide en conceder patente, tal como lo realizó la Oficina de Patente de Estados Unidos de América, cabe indicar que imperan, en esta materia, los principios de territorialidad, autonomía e independencia, siendo cada país autónomo e independiente al momento de conceder o denegar un privilegio de patente de invención, en virtud de sus propios análisis, exámenes de patentabilidad, el caso particular y normatividad aplicable.

CUARTO: De acuerdo con lo anteriormente expuesto, en el presente caso las reivindicaciones 1 a 48 incluidas en el escrito radicado bajo el No 14-040934-00006-0000 cumplen con los requisitos de patentabilidad de que trata el artículo 14 de la Decisión 486 y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

QUINTO: Que de acuerdo con el objeto concedido el título de la invención quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS DERIVADOS DE 1-METIL-6-(PIRIDIN-3-IL)-3,4-DIHIDROQUINOLIN-2-ONA SUSTITUIDOS EN LA POSICIÓN 5 DE LA PIRIDINA, COMO INHIBIDORES SELECTIVOS HACIA CYP11B1”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Revocar la decisión contenida en la Resolución No 42658 del 27 de junio de 2016, por medio de la cual se denegó una patente de invención.

ARTÍCULO SEGUNDO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

“COMPUESTOS DERIVADOS DE 1-METIL-6-(PIRIDIN-3-IL)-3,4- DIHIDROQUINOLIN-2-ONA SUSTITUIDOS EN LA POSICIÓN 5 DE LA PIRIDINA, COMO INHIBIDORES SELECTIVOS HACIA CYP11B1”

Clasificación IPC: C07D 401/04; A61K 31/4709; A61P 9/12.

Reivindicación(es): 1 a 48, incluidas en el radicado N° 14-040934-00006-0000.

Titular(es): F. HOFFMANN-LA ROCHE AG.

Domicilio(s): Basilea, Suiza.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° **39417**

Ref. Expediente N° NC2016/0000696

Inventor(es): Johannes Aebi; Kurt Amrein; Benoit Hornsperger; Henner Knust; Bernd Kuhn; Yongfu Liu; Hans P. Maerki; Alexander V. Mayweg; Peter Mohr; Xuefei Tan; Mingwei Zhou.

Prioridad(es) N°: PCT/CN2011/079673 **Fecha:** 15 de septiembre de 2011 **País:** CN.

Solicitud internacional N°: PCT/EP2012/067744 **Fecha:** 12 de Septiembre de 2012.

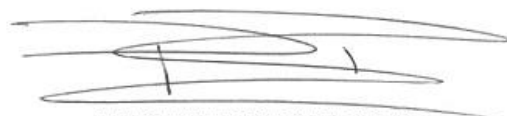
Vigente desde: 12 de Septiembre de 2012 **Hasta:** 12 de Septiembre de 2032

ARTÍCULO TERCERO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO CUARTO: Notificar el contenido de la presente resolución a las solicitante F. HOFFMANN-LA ROCHE AG, advirtiéndole que contra ella no procede recurso alguno, por encontrarse terminada la vía gubernativa.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., a los 5 de julio de 2017



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO
Superintendente de Industria y Comercio