

REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

Señor(a)  
GENENTECH, INC.  
notificacionespatentes@lloredacamacho.com

Asunto: PATENTE DE INVENCIÓN - PCT

|                                     |                        |                               |   |             |  |
|-------------------------------------|------------------------|-------------------------------|---|-------------|--|
| Patente de Invención                | PT                     | Patente de Modelo de Utilidad |   |             |  |
| Vía Nacional                        |                        |                               |   |             |  |
| Vía PCT (Fase Nacional)             | PCT                    | Capítulo I                    | X | Capítulo II |  |
| No. Solicitud Internacional         | PCT/US2014/068452      |                               |   |             |  |
| Fecha de Presentación Internacional | 3 de diciembre de 2014 |                               |   |             |  |

Como resultado del examen de fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

|                   |                                                                                            |                       |
|-------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| Descripción       | 16-175115-0000-0000                                                                        | 30 de junio de 2016   |
| Reivindicaciones: | 16-175115-0000-0000                                                                        | 30 de junio de 2016   |
|                   | 16175115                                                                                   | 14 de octubre de 2016 |
| Prioridad(es):    | País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA    Número: 61/912,905<br>Fecha: 6 de diciembre de 2013 |                       |

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

## 2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque ésta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

## 3. Modificaciones presentadas (Art. 34 D 486 y Art. 19, 22 y 34 PCT)

Se aceptan las modificaciones presentadas comoquiera que se ajustan a las prescripciones contenidas en el reglamento del PCT y en el Art 34 de la Decisión 486

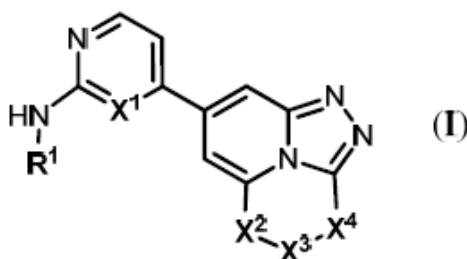
## 4. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por la solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a 33 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. 16175115 del 14 de octubre de 2016).

Título de la solicitud: “INHIBIDORES DE SERINA/TREONINA CINASA”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de agentes para tratar padecimientos relacionados con la actividad del receptor ERK, tal como melanoma, cáncer pancreático, cáncer de la tiroides, cáncer colorrectal, cáncer de pulmón, cáncer de mama, y cáncer de ovarios.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4353; C07D471/16; C07D498/16.

## 5. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 D 486)

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

La reivindicación 31 no es patentable toda vez que corresponde al uso de un compuesto de las reivindicaciones precedentes para tratar o generar una respuesta sobre una célula.

### 6. De la solicitud de patente

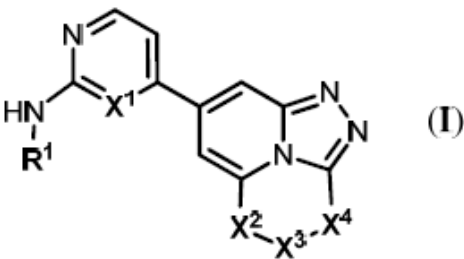
#### Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque no divulga el objeto de la materia pretendida por la solicitante, se sugiere incluir el grupo farmacofórico común a los agentes reivindicados.

#### Reivindicaciones (Art. 30 D 486, Art. 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de R2, Ra, Rb abarcan un elevado número de sustituyentes que no cumplen con las reglas de la reivindicación tipo Markush ya que no existe similitud estructural que permitan inferir que se conserva la actividad a pesar de las modificaciones propuestas, esto es evidente por el hecho de que la solicitante pretende que por ejemplo R2 pueda intercambiarse entre un simple alquilo C1 por un heteroarilo o fenilo, sin que exista evidencia de la eficacia de la intercambiabilidad entre estos radicales. Por lo tanto, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

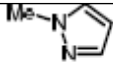
En este sentido, es importante señalar que, si bien es cierto que una invención no está limitada por los ejemplos allí ilustrados, el capítulo reivindicatorio actualmente presentado corresponde a una generalización de carácter especulativo, que además involucra una extrapolación a un elevado número de compuestos, de la evidencia técnica exhibida por un grupo muy pequeño de compuestos.



| Sustituciones                                   | Soporte de los ejemplos presentados                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|-------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| X <sup>1</sup>                                  | N                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| X <sup>2</sup> – X <sup>3</sup> -X <sup>4</sup> | -NR <sup>a</sup> -CH <sub>2</sub> -CR <sup>2</sup> R <sup>3</sup> -, - NR <sup>a</sup> –(CR <sup>4</sup> <sub>2</sub> ) <sub>1-3</sub> -CR <sup>2</sup> R <sup>3</sup> -, -OR <sup>a</sup> -CH <sub>2</sub> -CR <sup>2</sup> R <sup>3</sup> -, - SR <sup>a</sup> -CH <sub>2</sub> -CR <sup>2</sup> R <sup>3</sup> -, -OR <sup>a</sup> –(CR <sup>4</sup> <sub>2</sub> ) <sub>1-3</sub> -CR <sup>2</sup> R <sup>3</sup> |

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

|                                 |                                                                                   |
|---------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|
| R <sup>1</sup>                  |  |
| R <sup>3</sup>                  | H o alquil C <sub>1-3</sub> .                                                     |
| R <sup>4</sup>                  | H                                                                                 |
| R <sup>a</sup> y R <sup>b</sup> | H, alquil C <sub>1-3</sub>                                                        |

La imagen de la reivindicación 1 quedó superpuesta sobre el texto y no permite leer la caracterización de X1 y X2.

La expresión “opcionalmente sustituido” utilizada dentro del capítulo reivindicatorio es ambigua y no limita el alcance de la solicitud por lo cual se requiere a la solicitante para que realice una restricción apropiada de la misma.

7. 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: 6 de diciembre de 2013 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Ítem | Documento    | Título                                                  | Fecha de Publicación |
|------|--------------|---------------------------------------------------------|----------------------|
| D1   | EP2002836    | “Cyclocondensed azaindoles active as kinase inhibitors” | 17/diciembre/2008    |
| D2   | US2010093718 | “Compounds”                                             | 15/ abril/2010       |

El documento D1<sup>1</sup> divulga ciclocondensados de azaindol los cuales son útiles en el tratamiento del cáncer, presentando actividad sobre proteínas quinasas de tipo ERK2 (Resumen, Párr. 0018)

El documento D2<sup>2</sup> divulga derivados bicíclicos heterociclos que poseen actividad como inhibidores FGFR, VEGFR o PDGFR y fosfo ERK 1/2 para el tratamiento de enfermedades como el cáncer (Resumen, reiv. 1, Párrafo 0831).

8. Examen de Patentabilidad (Art. 14 D486)

1

<https://patents.google.com/patent/EP2002836A1/en>

2

<https://patents.google.com/patent/US20100093718A1/en>

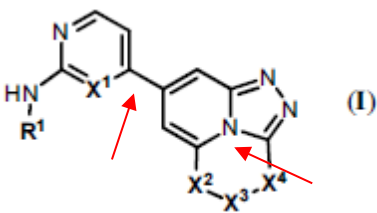
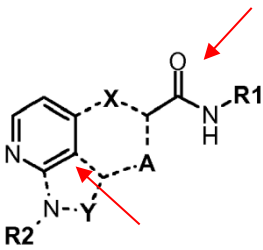
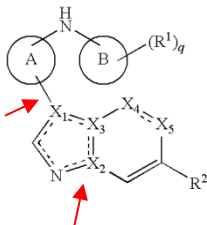
Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de fórmula (I) ...” (Radicado N°. 16175115 del 14 de octubre de 2016).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

| Características esenciales                                                                                            | D1                                                                                                                | D3                                                                                                            |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Un compuesto de la fórmula (I):<br> | Un compuesto de la fórmula:<br> | Agentes derivados de:<br> |

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga agentes tricíclicos poliinsaturados que incluyen uno o más heteroátomos derivados de azaindol ciclocondensado sustituidos (Reiv. 1), estos agentes son activos como moduladores de la actividad de múltiples enzimas quinasas entre las que se encuentra la ERK2 (Párr. 0018), por lo cual son activos en el tratamiento de diversos desórdenes relacionados con estas tales como el cáncer y otras enfermedades de tipo no maligno (párr. 0002).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en que la anterioridad incluye un grupo ligante o puente tipo –C(O)NH– entre el heteroaril y el complejo tricíclico. Adicionalmente, D1 no divulga la presencia de un átomo de N en la posición común entre los 3 anillos

El efecto que logra el incluir estas características no se puede determinar, toda vez que los ensayos presentados por la solicitante en la tabla I de la descripción se refieren a un grupo limitado de agentes con estructura común y no se puede trasladar a la amplia variabilidad estructural propuesta. De igual forma, no existen estudios comparativos que permitan determinar una ventaja o efecto inesperado frente a la solución propuesta por el arte previo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los agentes conocidos en D1 para obtener compuestos anticancerígenos alternativos.

Sin embargo, el documento D2 enseña que los agentes policíclicos fusionados pueden estar unidos a un anillo aromático “A” de manera directa, y adicionalmente enseña que los átomos que comparten los anillos fusionados pueden intercambiarse entre N y C

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

sin que esto afecte la actividad de los compuestos obtenidos (Reiv. 1, párrafos 0826 - 0831).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia implementaría las modificaciones estructurales sugeridas por el documento D2 en los compuestos policíclicos dados a conocer en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 28 y 30 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

## 9. Conclusión

Las reivindicaciones 1 – 28 y 30 son afectadas por Nivel Inventivo de acuerdo a lo mostrado en el numeral 8 de este Oficio.

Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

| Ítem | Documento    | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|--------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | EP2002836    | 1 - 28 y 30                | Nivel inventivo      |
| D2   | US2010093718 | 1 - 28 y 30                | Nivel inventivo      |

En cumplimiento del artículo 45, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Si como respuesta a este requerimiento el solicitante llegara a modificar: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presente un nuevo capítulo reivindicatorio, y desee que se realice un nuevo examen de patentabilidad a esta modificación, no deberá pagar la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente a la tasa de examen de patentabilidad. En todo caso, el número de requerimientos por no patentabilidad estará supeditado a que el término del estudio de patentabilidad no sea superior a 18 meses, contados desde la publicación de la solicitud de patente de invención. Adicionalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones deberá pagar la tasa por reivindicación adicional.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante para los sesenta (60) días.

Oficio N° 13323

Ref. Expediente N° 16175115

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el Título I, Actuaciones ante la Superintendencia de Industria y Comercio; Capítulo sexto, publicación, comunicación, notificación y ejecutoria de las decisiones de la Superintendencia de Industria y Comercio, informándoles que contra el mismo no procede el recurso de la vía gubernativa.

Atentamente,



**JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
**DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES (C)**

Elaborado: LEONARDO FERNANDEZ RODRIGUEZ  
Revisado: ANDRÉS GIL HELFFHRITZ  
Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ