

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 13-296752- -4	FECHA: 2014-10-29 08:55:26
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 11
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
ALICIA LLOREDA RICAURTE

Asunto: Radicación: 13-296752- -4
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 13618
 Folios: 11

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2012/043099				
Fecha de Presentación Internacional	19/06/2012				

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:	Radicado 13-296752-00000-0000	19/Diciembre/2013
Reivindicaciones:	Radicado 13-296752-00000-0000	19/Diciembre/2013
Prioridad:	US 61/498,942	20/Junio/2011
	US 61/591,094	26/Enero/2012

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.

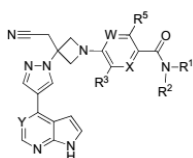
3. Objeto de la invención

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 el 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. Con relación a la presente solicitud se realizó el pago de las reivindicaciones adicionales y se estudiarán las reivindicaciones 1 a 49 de acuerdo con el radicado 13-296752-00000-0000.

Título de la solicitud: “Derivados de azetidin fenil, piridil o pirazin carboxamida como inhibidores JAK”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades como el cáncer y trastornos inflamatorios e inmunitarios.

Para resolver este problema técnico la solicitud n estudio proporciona compuestos de fórmula (I) caracterizado por:



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 471/04, 487/04; A61K 31/437, 31/519; A61P 29/00, 35/00, 37/02.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal(d))

El objeto de las reivindicaciones 34-49 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1, 17 y 21 no son claras porque el término “opcionalmente” es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término preciso.

Las reivindicaciones 1 no son concisas comoquiera que las definiciones de W,X, R1, R2,R3 y R5 son generales, se sugiere restringir la solicitud aquellos sustituyentes que han sido probados, es decir, que se encuentren sustentados mediante ejemplos concretos de acuerdo con lo presentado en la tabla No 1.

Sustituyente	Ejemplo concreto
W, Y, X, R1, R2, R3, R5	

La Reivindicación 33 define una composición que incluye a los compuestos reclamados incorporados en excipientes farmacéuticamente aceptables. Sin embargo, las composiciones deben definirse mediante la denominación común internacional de los ingredientes junto con el nombre común de los excipientes estableciendo las proporciones de cada uno de éstos. Además, dentro del capítulo descriptivo no se definen ni sustentan ejemplos concretos de composiciones, la mera mención de los ingredientes dentro de dicho capítulo no es suficiente sustento para el examen de patentabilidad, por lo que, se sugiere eliminar dichas cláusulas.

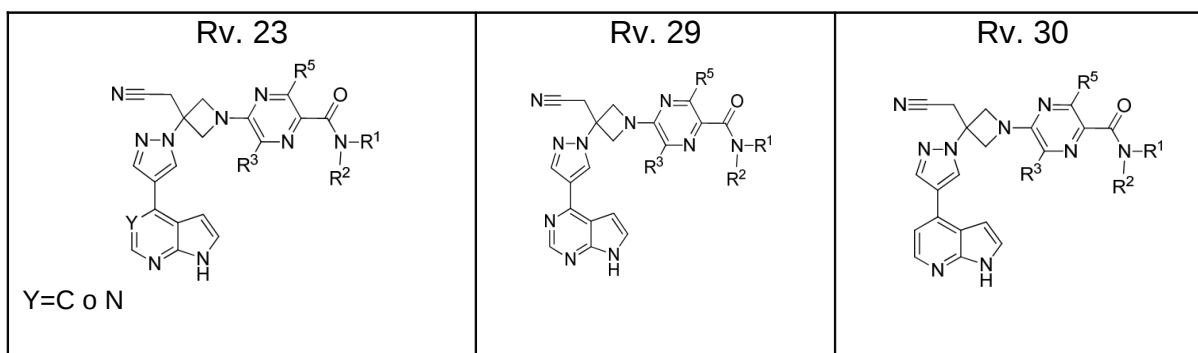
Las reivindicaciones independientes 22, 25 y 26 repiten materia de forma innecesaria de acuerdo a lo presentado en el siguiente cuadro, se sugiere sólo dejar una cláusula.

Rv. 22 Y=C o N	Rv. 25	Rv. 26
------------------------------	---------------	---------------

Las reivindicaciones independientes 23, 27 y 28 repiten materia de forma innecesaria de acuerdo a lo presentado en el siguiente cuadro, se sugiere sólo dejar una cláusula

Rv. 23 Y=C o N	Rv. 27	Rv. 28
------------------------------	---------------	---------------

Las reivindicaciones independientes 24, 29 y 30 repiten materia de forma innecesaria de acuerdo a lo presentado en el siguiente cuadro, se sugiere sólo dejar una cláusula



Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, junio 20 de 2011. 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
D1	WO2010039939	“Janus Kinase inhibitors for treatment of dry eye and other related diseases”	08/Abril/2010
D2	US20090233903	“Azetidine and cyclobutane derivatives as iak inhibitors”	17/Septiembre/2009

El documento D1⁽¹⁾ divulga compuestos derivados de pirazol-cianociclobutano como inhibidores de la actividad de los receptores JAK quinasa, útiles en el tratamiento de la resequedad, las inflamaciones y las enfermedades autoinmunes del ojo (Resumen).

El documento D2⁽²⁾ divulga compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

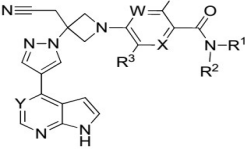
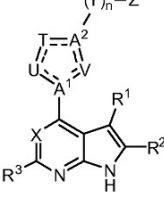
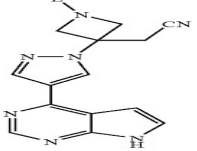
La reivindicación 1 consiste en “Un compuesto de fórmula (I) o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde $X=N$ o CR_4 ; (...)”.

1. www.google/patents/WO2010039939

2. www.google/patents/US20090233903

-Modalidad donde W y X son C

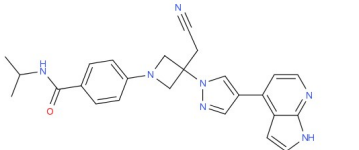
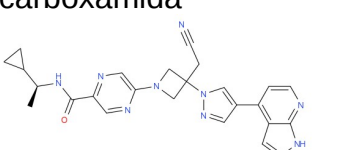
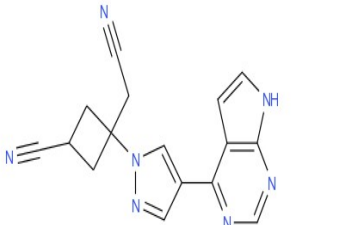
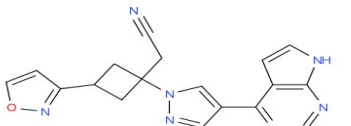
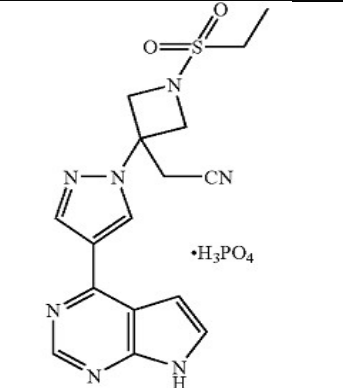
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I)  Y=C o N	Compuesto de fórmula (I)  X= C o N R1=H, R2=H, R3=H A1=C, U=CR5, V=CR5 T=N, A2=N, R5=H	Compuesto (I)  (Pág. 75, Rv.1)
W=C, X=C R1=Alquilo C1-C6 R2=H, R3=H, R5=H	(Y)n= n=1 -(CR11R12)p-(C1-C10heterocicloalqueno)- (CR11R12)q sustituido por D2 y D4 p=0 q=0 D2=Alquilenos sustituido por CN D4=Cy¹ Cy¹=Ariolos sustituido por C(O)NRc''Rd'' Rc=Hidrógeno Rd''=Alquilo C1-C10 Z=H (Págs. 214-220, Rv, 1)	L=CO R1=fenilo sustituido por alquilo (Pág. 75, Rv.1)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 en la modalidad W y X son C porque en el caso del documento D1 divulga compuestos derivados de pirazol-cianociclobutano como inhibidores de la actividad de los receptores JAK quinasa, útiles en el tratamiento de la sequedad, las inflamaciones y las enfermedades autoinmunes del ojo (Resumen). Por su lado, divulga compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

Los compuestos definidos en la solicitud guardan similitudes estructurales con los compuestos revelados en los documentos D1 y D2 de acuerdo con lo presentado en el siguiente cuadro:

Solicitud Rvs. 31-32	D1	D2
4- { 3 -(Cianometil)-3 - [4- (1 H-pirrolo [2,3 -b]piridin-4-il)- 1 H-pirazol-1-il]azetidin-1-il}-	3-(cianometil)-3-[4-(7H-pirrolo [2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]ciclobutancarbonitrilo	Ejemplo 69

N-isopropilbenzamida  5 - { 3 -(Cianometil)-3 - [4-(1 H-pirrolo [2,3 -b]piridin-4-il)- 1 H- pirazol- 1 - yl)azetidin- 1 -il} -N-[(1 S)- 1 -ciclopropyletil]pirazina-2- carboxamida 	 3-isoxazol-3-yl-1-[4-(7H- pirrolo[2,3-d]pyrimidin-4- il)-1H-pirazol-1- il]ciclobutyl acetoneitrile 	 •H₃PO₄
--	---	---

La diferencia entre el compuesto, definido en la reivindicación 1 en la modalidad W y X son C y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye dentro de su estructura un anillo azetidino, mientras el compuesto divulgado en el documento D1 incluye un anillo ciclobutano.

El efecto que logra el incluir el anillo azetidino en la estructura de los compuestos derivados de pirazol, consiste en que se mejora la actividad inhibitoria sobre los receptores JAK.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos derivados de pirazol más eficaces”.

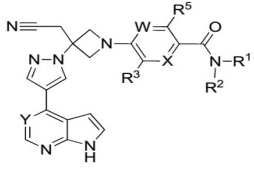
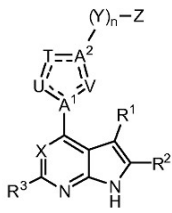
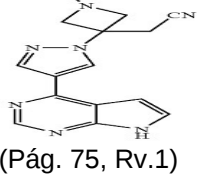
Sin embargo, la inclusión del anillo azetidino en estructuras de compuestos moduladores de la actividad JAK útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes autoinmunes y cáncer, está divulgado en el documento D2 que enseña compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el anillo azetidino de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro de la estructura de los compuestos revelados en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud en la modalidad W y X son C. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-21, 25-26 y 31-33 no mencionan características técnicas esenciales acerca del compuesto, tampoco se pueden considerar inventivas.

-Modalidad donde W es N o C o X es N o C

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I)  Y=C o N	Compuesto de fórmula (I)  X= C o N R1=H, R2=H, R3=H A1=C, U=CR5, V=CR5 T=N, A2=N, R5=H	Compuesto (I)  (Pág. 75, Rv.1)
W=C y X= N, o, W=N y X=C R1=Alquilo C1-C6 R2=H, R3=H, R5=H	(Y)n= n=1 -(CR11R12)p-(C1-C10cicloalqueno)- (CR11R12)q sustituido por D2 y D4 p=0 q=0 D2=Alquileo sustituido por CN D4=Cy¹ Cy¹=Heteroarilo sustituido por C(O)NRc "Rd" Rc=Hidrógeno Rd'=Alquilo C1-C10 Z=H (Págs. 214-220, Rv, 1)	L=CO R1=fenilo sustituido por alquilo (Pág. 75, Rv.1)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 en la modalidad W es N o C ,o, X es N o C porque en el caso del documento D1 divulga compuestos derivados de pirazol-cianociclobutano como inhibidores de la actividad de los receptores JAK quinasa, útiles en el tratamiento de la sequedad, las inflamaciones y las enfermedades autoinmunes del ojo (Resumen). Por su lado, divulga compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

La diferencia entre el compuesto, definido en la reivindicación 1 en la modalidad donde W es N o C, o, X es N o C y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye dentro de su estructura un anillo azetidino, mientras el compuesto divulgado en el documento D1 incluye un anillo ciclobutano.

El efecto que logra el incluir el anillo azetidino en la estructura de los compuestos derivados de pirazol, consiste en que se mejora la actividad inhibitoria sobre los receptores JAK.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos derivados de pirazol más eficaces”.

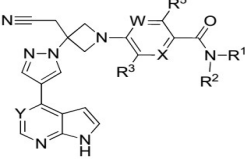
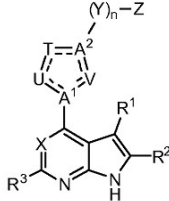
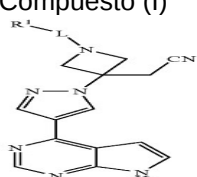
Sin embargo, la inclusión del anillo azetidino en estructuras de compuestos moduladores de la actividad JAK útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes autoinmunes y cáncer, está divulgado en el documento D2 que enseña compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el anillo azetidino de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro de la estructura de los compuestos revelados en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud en la modalidad W es N o C ,o, X es N o C. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 23 y 27-28 no mencionan características técnicas esenciales acerca del compuesto, tampoco se pueden considerar inventivas.

-Modalidad donde W es N y X es N

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

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I)  Y=C o N	Compuesto de fórmula (I)  X= C o N R1=H, R2=H, R3=H A1=C, U=CR5, V=CR5 T=N, A2=N, R5=H	Compuesto (I)  (Pág. 75, Rv.1)
W=N y X= N R1=Alquilo C1-C6 R2=H, R3=H, R5=H	(Y)n= n=1 -(CR11R12)p-(C1-C10cicloalqueno)- (CR11R12)q sustituido por D2 y D4 p=0 q=0 D2=Alquilenos sustituido por CN D4=Cy¹ Cy¹=Heteroarilo sustituido por C(O)NRc "Rd" Rc=Hidrógeno Rd''=Alquilo C1-C10 Z=H (Págs. 214-220, Rv, 1)	L=CO R1=fenilo sustituido por alquilo (Pág. 75, Rv.1)

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 en la modalidad W es N y X es N porque en el caso del documento D1 divulga compuestos derivados de pirazol-cianociclobutano como inhibidores de la actividad de los receptores JAK quinasa, útiles en el tratamiento de la sequedad, las inflamaciones y las enfermedades autoinmunes del ojo (Resumen). Por su lado, divulga compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

La diferencia entre el compuesto, definido en la reivindicación 1 en la modalidad donde W es N y X es N y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado incluye dentro de su estructura un anillo azetidino, mientras el compuesto divulgado en el documento D1 incluye un anillo ciclobutano.

El efecto que logra el incluir el anillo azetidino en la estructura de los compuestos derivados de pirazol, consiste en que se mejora la actividad inhibitoria sobre los receptores JAK.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos alternativos derivados de pirazol más eficaces”.

Sin embargo, la inclusión del anillo azetidino en estructuras de compuestos moduladores de la actividad JAK útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes autoinmunes y cáncer, está divulgado en el documento D2 que enseña compuestos derivados de pirazol-azetidina como moduladores de la actividad JAK, útiles en el tratamiento de enfermedades inflamatorias, desordenes inmunológicos y cáncer (Resumen).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el anillo azetidino de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 dentro de la estructura de los compuestos revelados en el documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud en la modalidad W es N y X es N. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 24 y 29-30 no mencionan características técnicas esenciales acerca del compuesto, tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2010039939	1-33	Nivel inventivo
D2	US20090233903	1-33	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 del día siguiente 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, 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, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2014-11-04

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon