

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

Señor(a)
GALAPAGOS NV
patmarksCO@ppulegal.com

Asunto: PATENTE DE INVENCION - 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/EP2015/050850				
Fecha de Presentación Internacional	19 de enero de 2015				

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	NC2016/0001075	23 de agosto de 2016
Reivindicaciones:	NC2016/0001075	23 de agosto de 2016
	NC2016/0001075	16 de diciembre de 2016
Prioridad(es):	País: GB, REINO UNIDO DE LA GRAN BRETAÑA Número: 1401086.2 Fecha: 23 de enero de 2014	

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

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

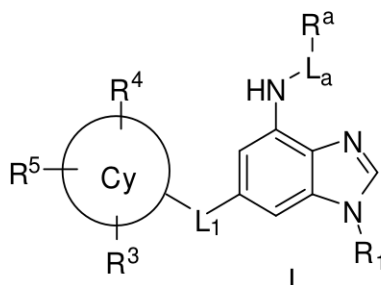
4. Objeto de la invención

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 11 del capítulo reivindicatorio (Radicado N°. NC2016/0001075 16 de diciembre de 2016).

Título de la solicitud: “DERIVADOS DE BENCIMIDAZOL Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS DE LOS MISMOS” (modificado Radicado N°. NC2016/0001075 del 16 de diciembre de 2016).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de diseñar compuestos adicionales con actividad inhibidora de JAK (Janus Cinasa) que puedan ser de utilidad en el tratamiento de enfermedades alérgicas, enfermedades inflamatorias, enfermedades autoinmunes, enfermedades proliferativas, rechazo de trasplantes, enfermedades que implican un deterioro del recambio de los cartílagos, malformaciones congénitas de los cartílagos, y/o enfermedades asociadas con la hipersecreción de IL6 o la hipersecreción de interferones (Pág. 8, líneas 15 - 24)

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula I que son inhibidores de JAK, así como métodos de su preparación y composiciones farmacéuticas que las contienen (Pág. 1, líneas 1 -2 y 14 – 17; Pág. 10, líneas 9 - 19).



Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/4184; A61K31/4439; A61P29/00; A61P35/00; A61P37/08; C07D235/08; C07D401/12; C07D401/14; C07D405/12.

5. De la solicitud de patente

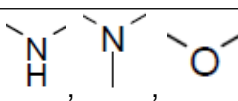
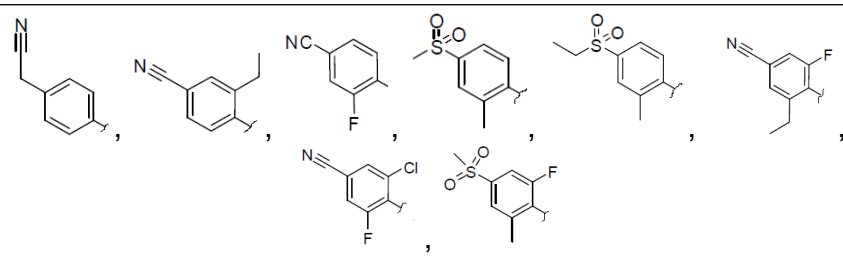
Reivindicaciones (Art. 30 D 486, Art. 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara toda vez que reclama solvatos y solvatos de sales, sin embargo, tales solvatos no se encuentran sustentados en el capítulo descriptivo, se sugiere retirarlo.

Las reivindicaciones 5 a 8 no son claras pues el término “cualquiera de las reivindicaciones” puede inducir a confusiones en la interpretación del objeto de la invención.

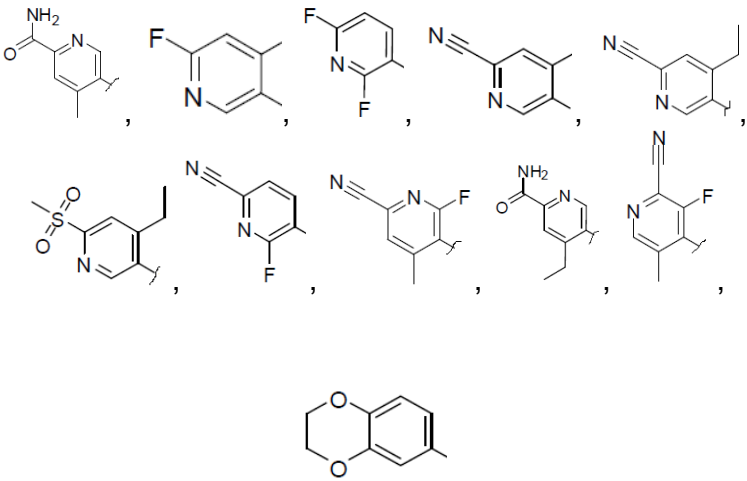
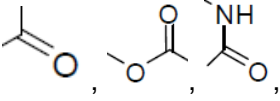
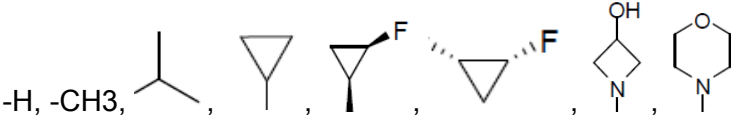
Las reivindicación 1 carece de los requisitos de concisión toda vez que abarca una amplia variabilidad estructural dentro de los radicales propuestos para cada uno de los sustituyentes del grupo farmacofórico, esto se evidencia en que el solicitante propone para los radicales R2, R3, R4, R5, R6, Ra y Rc diversos grupos funcionales tales como halógeno, alquilo C1-4, cicloalquilo C3-7, heterocicloalquilo monocíclico de 4 a 7 miembros los cuales no necesariamente guardan relación estructural que haga obvia para una persona versada en la materia la intercambiabilidad de los mismos; de tal manera, que la materia ejemplificada y ensayada no evidencia que todos los compuestos reivindicados sean una solución al problema técnico planteado.

Con fundamento en la materia ejemplificada y ensayada los compuestos favoritos corresponden a:

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
L1	
R1	-CH3
Cy R4, R5, R6	

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

	
La	Ausente, 
Ra	-H, -CH₃, 

Por lo tanto, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización acorde a los ejemplos.

En este punto se aclara al solicitante que, si bien es cierto que una invención no está limitada por los ejemplos ilustrados, el capítulo reivindicatorio actual corresponde a una generalización de carácter teórico, que puede involucrar una extrapolación a una cantidad mayor de moléculas con respecto a la evidencia técnica exhibida por el grupo de compuestos ensayados.

La reivindicación 11 no es concisa debido a que esta no se encuentra sustentada, porque agentes terapéuticos adicionales para ser combinados con los compuestos de fórmula I no se encuentran relacionados en ninguna formulación mencionada en la descripción; así mismo, tampoco se evidencian estudios que demuestren resultados derivados de una forma farmacéutica que incluya otro principio activo adicional a los compuestos de fórmula I. Por tal motivo la reivindicación 11 no se tendrá en cuenta, se sugiere retirarla.

Se requiere a la 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 prioridad: enero 23 de 2014, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 2013/117645	“IMIDAZO [4, 5 -C] PYRIDINE DERIVATIVES USEFUL FOR THE TREATMENT OF DEGENERATIVE AND INFLAMMATORY DISEASES”	15/Agosto/2013
D2	EP2226315	“2-AMINOQUINAZOLINE DERIVATIVE”	08/Septiembre/2010

El documento D1¹ divulga compuestos inhibidores de JAK, métodos de producción de estos compuestos y formas farmacéuticas que las contienen (Párrafo [0001]).

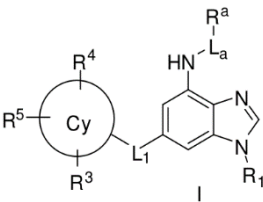
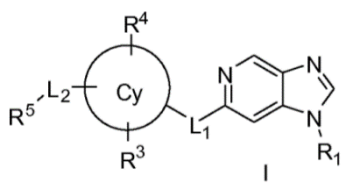
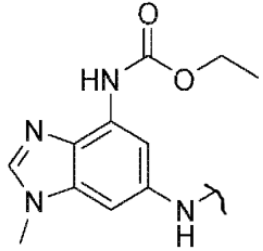
El documento D2² divulga compuestos derivados de 2-aminoquinazolinas los cuales son útiles como inhibidores de proteína quinasas (Párrafo [0001]).

7. Examen de Patentabilidad (Art. 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de conformidad con la Fórmula I: ...” (Radicado N°. NC2016/0001075 16 de diciembre de 2016).

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de conformidad con la Fórmula I:  donde: R1 = Me	Un compuesto de Fórmula I:  (Reiv. 1) R1 = Me (Reiv. 1)	 (Compuesto ejemplo 116, párrafo [0495]) -CH3 (Compuesto ejemplo 116, párrafo [0495])

1

https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2013117645A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20130815&DB=&locale=en_EP#

2

https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=2226315A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20100908&DB=&locale=en_EP#

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

L1 = -NR2-, -O- R2 = H, alquilo C1-4	L1 = -NR2-, -O- R2 = alquilo C1-2 (Reiv. 1)	-NH- (Compuesto ejemplo 116, párrafo [0495])
Cy = fenil , piridinil, benzodioxanil	Cy = fenil (Reiv. 1)	No divulga
R3 = H, halógeno , alquilo C1-4	R3 = H, halo , alquilo C1-4 (Reiv. 1)	No divulga
R4 = H, halógeno	R4 = H, halo (Reiv. 1)	No divulga
R5 = -CN, halógeno, -L2-R6 L2 = ausente , -C(=O)NR7-, -SO2- R6 = H, alquilo C1-6 sustituido opcionalmente con R8 R7 = H R8 = CN	R5 = -CN L2 = ausente , -W- W = -C(=O)NR6-, -SO2- R6 = H, alquilo C1-4 opcionalmente sustituido con CN (Reiv. 1)	No divulga
La = ausente, -C(=O)-, -C(=O)O-, - C(=O)NH- Ra = H, alquilo C1-4 , cicloalquilo C3- 7 monocíclico sustituido en forma opcional con uno o más Rc seleccionados en forma independiente, heterocicloalquilo monocíclico de 4 a 7 miembros que comprende uno o más heteroátomos seleccionados en forma independiente de O, N y S Rc = halógeno, OH.	No divulga	-C(=O)O- -etil (Compuesto ejemplo 116, párrafo [0495])
O una sal farmacéuticamente aceptable, o un solvato de la sal farmacéuticamente aceptable.	O una sal farmacéuticamente aceptable o un solvato, o un solvato de la sal farmacéuticamente aceptable (Reiv. 1)	Sales farmacéuticamente aceptables. (Reiv. 1)

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos inhibidores de JAK, métodos de producción de estos compuestos y formas farmacéuticas que las contienen (Párrafo [0001]). Igualmente, el documento D1 enseña que sus compuestos pueden encontrarse en forma de sales farmacéuticamente aceptables o solvatos o solvatos de las sales farmacéuticamente aceptables (Reiv. 1).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos divulgados en D1 consiste en la presencia de un grupo 1-metil-bencimidazol sustituido.

El efecto que logra el incluir la presencia de un grupo 1-metil-bencimidazol sustituido es obtener compuestos con actividad inhibidora de JAK alternativos.

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos conocidos en D1 para conseguir compuestos con actividad inhibidora de JAK alternativos?

Sin embargo, la incorporación de grupos 1-metil-bencimidazol sustituidos, ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a compuestos derivados de 2-aminoquinazolininas los cuales son útiles como inhibidores de proteína quinasas (Párrafo [0001]). De la misma manera, esta anterioridad enseña que estos compuestos pueden encontrarse en forma de sales farmacéuticamente aceptables (Reiv. 1).

En la descripción pueden observarse los ensayos realizados tales como análisis de JAK1 con sustrato poliGT, ensayo de péptido JAK1 Ulight-JAK1, ensayo de péptido JAK2 Ulight-JAK1, ensayo de péptido JAK3 Ulight-JAK1 y ensayo de péptido TYK2 Ulight-JAK1 los cuales demuestran la actividad inhibitoria de los compuestos de la presente invención, sin embargo, tales ensayos también se encuentran divulgados en el documento D1 y sus resultados son similares a los reportados en la presente solicitud.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo 1-metil-bencimidazol sustituido del documento D2 en el compuesto divulgado 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 – 7 y 10 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

Las reivindicaciones 1 – 7 y 10 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

8. Conclusión

Las reivindicaciones 1 – 7 y 10 son afectadas por Nivel Inventivo de acuerdo a lo mostrado en el numeral 7 de este Oficio.

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 2013/117645	1 – 7 y 10	Nivel Inventivo
D2	EP2226315	1 – 7 y 10	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

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

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.

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 FERNÁNDEZ RODRÍGUEZ

Oficio N° 16996

Ref. Expediente N° NC2016/0001075

Revisado: ANDRÉS GIL HELFFHRITZ

Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ