

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

Señor(a)
INCYTE CORPORATION
notificacionespatentes@lloredacamacho.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/US2015/015706				
Fecha de Presentación Internacional	12 de febrero 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:	Radicado N° NC2016/0001817	12/Septiembre/2016
Reivindicaciones:	Radicado N° NC2016/0001817	12/Septiembre/2016
	Radicado N° NC2016/0001817	26/Enero/2017
Secuencias	Radicado N° NC2016/0001817	12/Septiembre/2016
Prioridad:	País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Número: 61/939,488 Fecha: 13 de febrero de 2014. País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Número: 62/061,283 Fecha: 08 de octubre de 2014.	

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.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

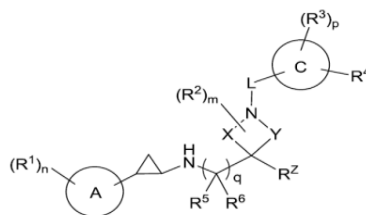
3. Objeto de la invención

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 40 de acuerdo con el radicado NC2016/0001817 del 26 de enero de 2017.

Título de la solicitud: "CICLOPROPILAMINAS COMO INHIBIDORES DE LA LSD1".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos inhibidores de la desmetilasa 1 específica de lisinas (LSD1) para tratar cánceres hematológicos, de pulmón, gastrointestinales, genitourinarios, sarcoma, de hígado, de huesos, del sistema nervioso, ginecológicos o de piel.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula (II)



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/06, 401/12, 471/10, 205/04; A61K 31/397, 31/438, 31/4427, 31/4439, 31/445, 31/4468, 31/454, 31/4545, 31/496, 31/501, 31/506.

4. De la solicitud de patente

Título

El título no permite identificar el alcance de la invención comoquiera que los compuestos derivados de ciclopropilaminas conforman un sinnúmero de posibilidades que no encuentran sustento en la memoria descriptiva, por lo que, se sugiere restringir el título a compuestos derivados de fenilciclopropilaminoazetidin/piperidin carbonilo.

Página 2 de 9

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3024

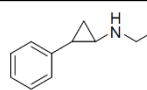
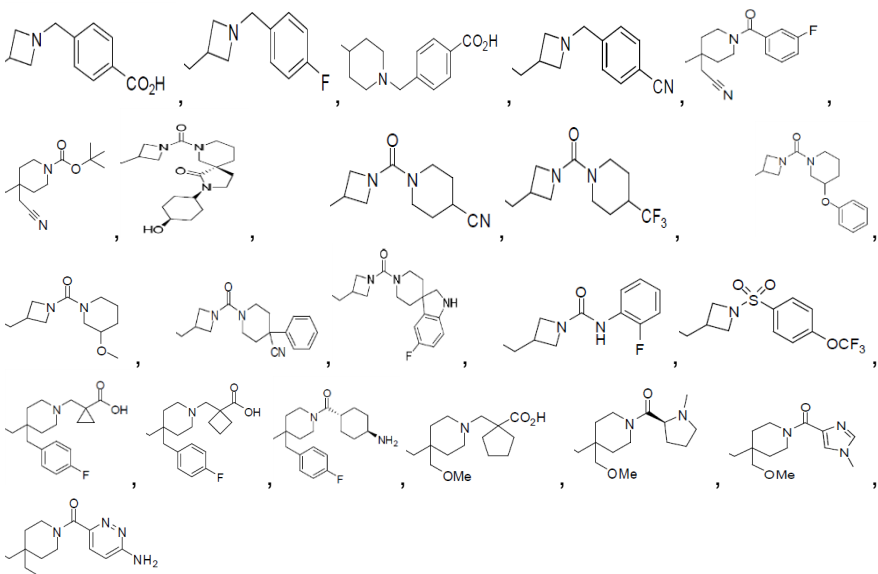
Ref. Expediente N° NC2016/0001817

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara, ya que no $(R^2)_{(m=0)}$ siempre estará ausente, comoquiera que $m=0$, razón por lo cual se sugiere eliminar R^2 de la estructura.

Las reivindicaciones 33-35 no son claras, porque la expresión “al menos” precediendo una característica no es limitativa, porque hace opcional a la característica y no precisa el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir una expresión concreta de acuerdo con los ejemplos sustentados.

Las reivindicaciones 1-4, no están sustentadas para todas las definiciones C, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , y R_z , se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de sustituyentes que han sido probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados. En el presente existente sustento para:

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
$(R^1)_n$, q, R^5 y R^6	
$(R^2)_n$, R_z , L, C, R^3 y R^4	

Descripción (Art 28 D 486)

La descripción no divulga la invención de manera clara ni suficiente para que una persona normalmente versada en la materia pueda ejecutarla o reproducirla, ya que

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

no desarrolla composiciones farmacéuticas por combinación que comprendan alguno de los compuestos reclamados y un segundo agente activo.

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

5. 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, febrero 13 de 2014. 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	WO2012135113	"Cyclopropylamines as LSD1 inhibitors"	04/Octubre/2012
D2	W2011035941	"Lysine specific demethylase-1 inhibitors and their use"	31/Marzo/2011

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de fenilciclopropilamina como inhibidores de la actividad demetilasa lisina específica, para el tratamiento del cáncer (Resumen).

El documento D2² divulga compuestos derivados de fenilciclopropilamina como inhibidores de la actividad de la demetilasa lisina específica, para el tratamiento del cáncer, que en su estructura presentan un anillo heterocíclico entre 4 a 6 miembros enlazados mediante un puente alquílico al radical fenilciclopropilamina (Resumen y Pág. 127, Rv. 1 y Pág. 128, Rv. 11).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en *"Un compuesto de la Fórmula II: o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, donde: X es -CH₂- o -CH₂-CH₂-; Y es -CH₂- o -CH₂-CH₂-; el anillo A es fenilo; (...)"* (Radicado NC2016/0001817 del 26 de enero de 2017).

¹www.google/patents/WO2012135113

² www.google/patents/W2011035941



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

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

Características esenciales	D1
Un compuesto de la Fórmula II:	Compuestos
q=1; (R²)_(m=0), (R¹)_{n=0}; (R³)_{p=0} A=Fenilo R⁵=H; R⁶=H R^Z=H L=CH₂ X=-CH₂-CH₂ Y=-CH₂-CH₂ C= Fenilo; R⁴=COOH	(Pág. 76, Ej.26) (Pág. 84, Ej. 30)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 2,4 no mencionan alguna característica que haga nuevo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel inventivo (Art18 D486)

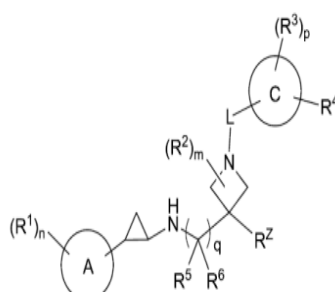
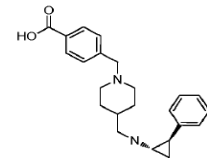
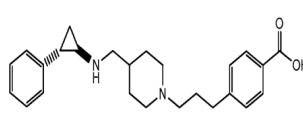
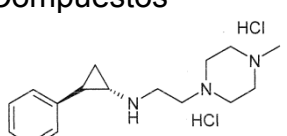
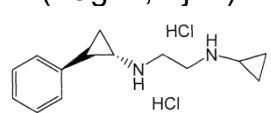
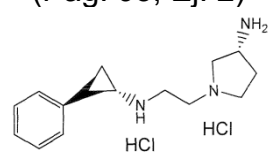
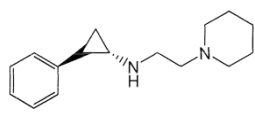
La reivindicación 3 consiste en “*El compuesto de la reivindicación 1 o 2, que tiene la Fórmula IIIa: o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo*”. (Radicado NC2016/0001817 del 26 de enero de 2017).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de la Fórmula IIIA:  q=1; (R²)ₘ=0; (R¹)ₙ=0; (R³)ₚ=0 A=Fenilo R⁵=H; R⁶=H R²=H L=CH₂ C= Fenilo; R⁴=COOH	Compuestos  (Pág. 76, Ej.26)  (Pág. 84, Ej. 30)	Compuestos  (Pág. 2, Ej. 1)  (Pág. 93, Ej. 2)  (Págs. 93-95, Ejs. 4-6)  (Pág. 96, Ej. 8) Este documento enseña compuestos de fórmula (A')ₓ-(A)-(B)-(Z)-(L)-(D) I En donde D es una anillo heterocíclico, seleccionado de azetidín, o pirrolidinil, o piperidinil, o morfolinil (Pág. 127, Rv. 1 y Pág. 128, Rv. 11)

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 3 porque divulga compuestos derivados de fenilciclopropilamina como inhibidores de la actividad demetilasa lisina específica, para el tratamiento del cáncer (Resumen).

La diferencia entre el compuesto, definida en la reivindicación 3 y el compuesto revelado en el documento D1 consiste en que el compuesto reclamado presenta enlazado mediante un puente alquílico al grupo fenilciclopropilamina un anillo de azetidina, mientras que el compuesto divulgado en el documento D1 en la misma posición presenta un anillo de piperidina.

El efecto que logra el incluir en la estructura un anillo de azetidina consiste en que la actividad inhibitoria IC50 de histona LSD1 está comprendida entre $\leq 100\text{nM}$ a $> 100\text{nM}$ y $\leq 500\text{nM}$.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar compuestos inhibidores de la desmetilasa 1 específica de lisinas (LSD1) para tratar cánceres hematológicos, de pulmón, gastrointestinales, genitourinarios, sarcoma, de hígado, de huesos, del sistema nervioso, ginecológicos o de piel.

Sin embargo, el documento D2 compuestos derivados de fenilciclopropilamina como inhibidores de la actividad de la demetilasa lisina específica, para el tratamiento del cáncer, que en su estructura presentan un anillo heterocíclico entre 4 a 6 miembros enlazados mediante un puente alquílico al radical fenilciclopropilamina, en donde dicho anillo es seleccionado de azetidín, pirrolidín, piperidín y morfolín (Resumen y Pág. 127, Rv. 1 y Pág. 128, Rv. 11).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, tendría la sugerencia de modificar el anillo piperidín presente en la estructura de los compuestos divulgados en el documento D1 por un anillo azetidín de acuerdo con lo revelado en el documento D2, para llegar así al objeto de la reivindicación 3 de la solicitud.

Por lo anterior, la reivindicación 1 de acuerdo con lo divulgado en los documentos D1 y D2, carece de Nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 5-26 y 39 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

**REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2012135113	1-2 y 4 3, 5-26 y 39	Novedad Nivel inventivo
D2	W2011035941	3, 5-26 y 39	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.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3024

Ref. Expediente N° NC2016/0001817

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,



[DirectorName]
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES

Elaborado: GERMAN ANTONIO CLAVIJO COHEN.
Revisado: GERMAN ANTONIO CLAVIJO COHEN
Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ