

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

Señor(a)
ELI LILLY AND COMPANY
patents@olartemoure.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/US2015/053098				
Fecha de Presentación Internacional	30 de septiembre 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	NC2017/0002233	10 de marzo de 2017
-------------	----------------	---------------------

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

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

Reivindicaciones:	NC2017/0002233	10 de marzo de 2017
	NC2017/0002233	17 de mayo de 2017
Prioridad(es):	07/10/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/060,724	

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido y el contenido técnico de esta solicitud 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 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. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 6 del capítulo reivindicatorio (NC2017/0002233 de 17 de mayo de 2017).

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

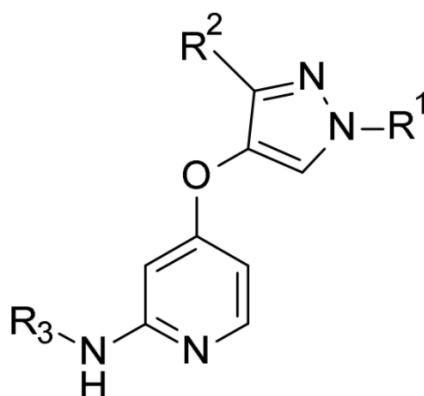
Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

Título de la solicitud: "COMPUESTOS DE AMINOPIRIDILOXIPIRAZOL"
(NC2017/0002233 10 de marzo de 2017).

El problema planteado en esta solicitud se refiere a la necesidad de compuestos novedoso de aminopiridoxiloxipirazol que inhiban la actividad del receptor 1 del factor del crecimiento transformante beta (TRFβR1), útiles en el tratamiento del cáncer.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de formula I o una sal de ellos aceptable desde el punto de vista farmacéutico



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/14, C07D 405/14, C07D 401/12, A61K 31/454, A61K 31/4545, A61P 35/00, A61P 43/00.

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

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
R ¹	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

R²	
R³	

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 especulativo, que además involucra una extrapolación a un elevado número de compuestos de aquella evidencia técnica exhibida por un grupo limitado de agentes ensayados.

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

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

Descripción

La descripción no soporta suficientemente la invención por que no contiene los resultados de los ensayos biológicos de todos los compuestos que se pretenden reclamar en la reivindicación independiente; si no que solo mencionan los resultados obtenidos con el ejemplo 1. Adicionalmente, los resultados mostrados con el ejemplo 1 no muestran alguna ventaja frente a los compuestos inhibidores de TRFβR1 del estado de la técnica.

En la descripción solo se encuentra soportados los resultados de difracción de polvo de rayos X para los ejemplos 77-79. No se encuentra evidencia del problema técnico que se pretende resolver a partir del uso del cristal del compuesto de fórmula I, ni de otros elementos característicos de un cristal como lo son la unidad de celda y hábito cristilino.

Se sugiere hacer las aclaraciones necesarias.

5. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de prioridad: 7 de octubre de 2014, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2009022171	PYRIDINYIIOXY PYRIDINES AS ALK5 INHIBITORS	19-02-2009

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

D2	WO2004026306	PYRAZOLE DERIVATIVES AS TRANSFORMING GROWTH FACTOR (TGF) INHIBITORS	01-04-2004
----	--------------	---	------------

El documento D1 divulga compuestos químicos y sus sales farmacéuticamente aceptables, que poseen actividad como inhibidores de ALK5 (TGFβR1) para uso en el tratamiento del cáncer. (Pág. 2, líneas 1 – 10).
<https://register.epo.org/documentView?number=GB.2008050689.W&documentId=id0000007783266>

El documento D2 divulga compuestos nuevos de pirazol como inhibidores potentes de TGFβR1 usados en el tratamiento del cáncer y enfermedades fibroticas (Pág. 1, líneas 1–9,).
<https://register.epo.org/documentView?number=IB.0303933.W&documentId=id0000000425866>

6. Examen de Patentabilidad (Art. 14 D486)

Nivel Inventivo (Art. 18 D486)

La reivindicación consiste en: “Un compuesto de fórmula I en el cual R1 es hidrógeno, isopropilo, difluorometilo, difluoroetilo o ciclopropilo; R2 es etilo, terc-butilo, piridin-2-ilo, tetrahidropiran-4-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, ciclopropilo o ciclobutilo; y R3 es carbamoilfenilo, piridin-2-ilo, (1-hidroxil-1-metiletil)piridinilo, 1-metil-2-oxo-1H-piridin-4-ilo, 1-metilpirazolilo, pirazin-2-ilo, 2-metoxipirimidin-4-ilo, 1-metil-2-oxo-1H-pirimidin-4-ilo, piridazin-3-ilo, 6-cloropiridazin-3-ilo, 6-metilpiridazin-3-ilo, o 6-metoxipiridazin-3-ilo;

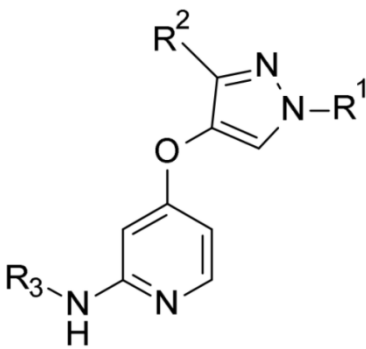
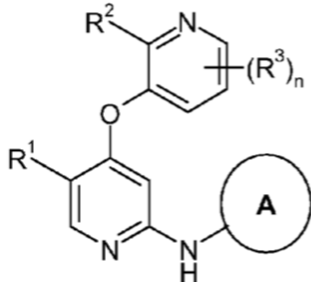
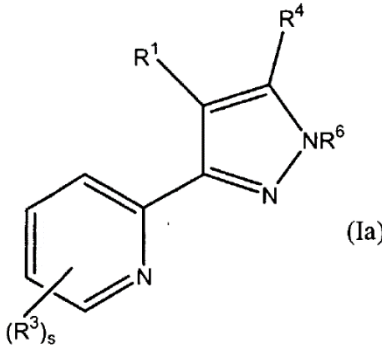
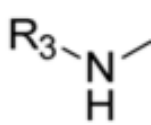
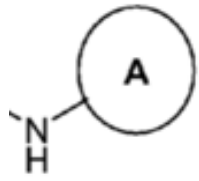
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

o una sal de ellos aceptable desde el punto de vista farmacéutico. (NC2017/0002233 de 17 de mayo de 2017).

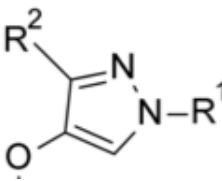
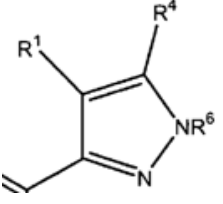
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
		 (Ia)
 R3=Carbamoil	 A=Carbociclo, heterociclo sustituido con R33 R33=Halo, ciano, nitro, mercapto, sulfo, hidroxí, carboxi	No divulga

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

 R2= piridin-2-ilo, tetrahidropiran-4-ilo, tetrahydrofuran-3-ilo, 5 ciclopropilo, o ciclobutilo R1= hidrógeno, isopropilo	No divulga	 R1=Heteroaril oxido C5-C10 R4=H R6=H, alquilo C1-C6
--	-------------------	--

El documento D1 se considera el estado de la técnica mas cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos químicos y sus sales farmacéuticamente aceptables, que poseen actividad como inhibidores de ALK5 (TGFβR1) para uso en el tratamiento del cáncer. (Pág. 2, líneas 1 – 10).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación X y el compuesto divulgado en D1 consiste en un anillo de pirazol sustituido por los radicales R1 y R2.

El efecto que se logra por el hecho de incluir un anillo de pirazol sustituido por los radicales R1 y R2 es que se obtienen compuestos alternativos para inhibir a TGFβR1 por lo cual es posible su uso para el tratamiento del cáncer.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos químicos y sus sales farmacéuticamente aceptables, que poseen actividad como inhibidores de ALK5 (TGFβR1) para uso en el tratamiento del cáncer?

Sin embargo, la utilización de un anillo de pirazol sustituido por los radicales R1 y R2 para su uso en el tratamiento del cancer, ya está divulgada en el documento D2 que se refiere a D2 divulga compuestos nuevos de pirazol como inhibidores potentes de TGFβR1 usados en el tratamiento del cancer y enfermedades fibroticas (Pág. 1, líneas 1–9,).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría un anillo de pirazol sustituido por los radicales R1 y R2 del documento D2 en el

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

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

compuesto químico divulgado en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2-6 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009022171	1-6	Nivel inventivo
D2	WO2004026306	1-6	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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3288

Ref. Expediente N° NC2017/0002233

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,



[DirectorName]
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES

Elaborado: Adriana Paola Camargo Rodriguez
Revisado: ANDRÉS GIL HELFFHRITZ
Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ