

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

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

Señor(a)
JANSSEN PHARMACEUTICA NV
notificaciones@clarkemodet.com.co

Asunto: PATENTE DE INVENCION - PCT

Patente de Invención	PT	Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional			
Vía PCT (Fase Nacional)	PCT	Capítulo I	X
No. Solicitud Internacional		Capítulo II	
Fecha de Presentación Internacional		PCT/US2015/058193	
		30 de octubre 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	NC2017/0005014	19 de mayo de 2017
Reivindicaciones:	NC2017/0005014	19 de mayo de 2017
	NC2017/0005014	23 de agosto de 2017
	NC2017/0005014	16 de enero de 2018
Dibujos:	NC2017/0005014	19 de mayo de 2017
Prioridad(es):	30/10/2014, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/072,563	

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

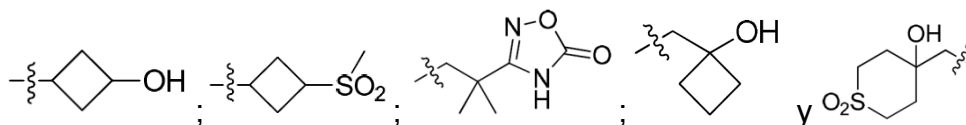
Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

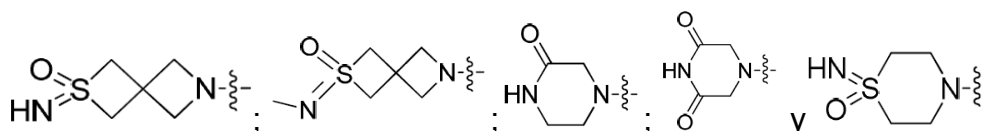
2. Análisis de la Prioridad

En primera instancia es oportuno aclarar el alcance de la solicitud internacional de patente PCT/US2015/058193 y de la prioridad invocada, es decir el documento US 62/072,563 del 30 de octubre de 2015 es distinto, puesto que en la solicitud internacional:

- para el anillo que conforman los radicales A¹ y A² conjuntamente con su nitrógeno unido se incluyeron como posibles sustituyentes: -CN y CH₂OH
- para el radical R¹ se incluyeron como posibles sustituyentes: CHF₂, OCHF₂, OCH₃, F, CH₃ o -CN.
- para el radical A⁴ se incluyeron como posibles sustituyentes:



- para el anillo que conforman los radicales A³ y A⁴ conjuntamente con su nitrógeno



Ahora bien, puesto que estas características técnicas no fueron divulgadas en el documento de prioridad US 62/072,563 invocada este Despacho concluye que para los compuestos que presentan los patrones de sustitución descritos la fecha para la determinación del estado de la técnica corresponde a la fecha de su primera divulgación, es decir la fecha de presentación internacional de la solicitud PCT/US2015/058193.

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

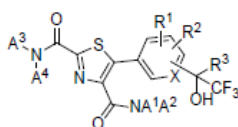
Ref. Expediente N° NC2017/0005014

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 32 del capítulo reivindicatorio (Radicado N° NC2017/0005014 del 16 de enero de 2018).

Título de la solicitud: “4-FENILTIAZOL-2-CARBOXAMIDA Y 4-(PIRIDIN-3-IL)TIAZOL-2-CARBOXAMIDA MODULADORES DEL RECEPTOR NUCLEAR ROR γ T” (Rad. N° NC2017/0005014 del 23 de agosto de 2017).

El problema planteado en esta solicitud consiste en obtener compuestos moduladores de ROR γ T

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la Fórmula I.



Fórmula I

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 417/06, C07D 417/14, C07D 487/08, C07D 277/56, A61K 31/427, A61P 3/10, A61P 17/06, A61P 19/02 y A61P 37/00.

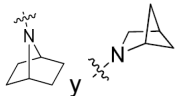
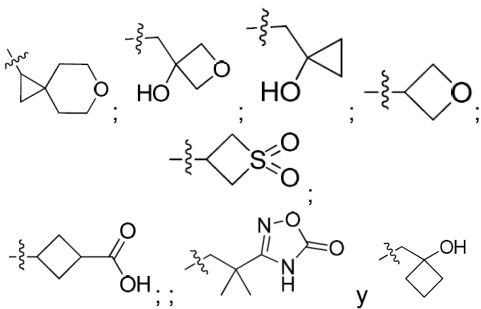
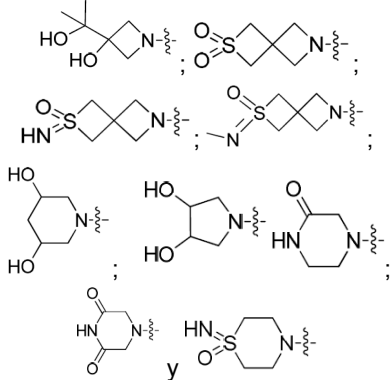
Reivindicaciones (Art. 30 D 486, Art. 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 a 2 no están debidamente sustentadas en la descripción porque de las definiciones de A¹, A², A³, A⁴, entre otros se obtiene un gran número de compuestos, muchos de los cuales no están ejemplificados en dentro del capítulo descriptivo, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados. El siguiente cuadro ejemplifica la afirmación anterior y presenta los sustituyentes que se encuentran soportados en la descripción.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

Sustituyentes de acuerdo con la reivindicación 1 de la solicitud	Sustituyentes soportados en la descripción
A¹ y A² se consideran conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo seleccionado del grupo que consiste en azetidino, piperidino, pirrolidino, 	piperidino (1) pirrolidino (2/2) 2-azabicyclo[2.1.1]hexan-2-il (2/4) azetidino (2/9) 7-azabicyclo[2.2.1]heptan-7-il (3/10)
A⁴ es H, alquilo de C₍₁₋₅₎,  en donde el alquilo de C₍₁₋₅₎ está sustituido, opcionalmente, con uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente de CONH₂, -CN y OH.	2-hidroxi-2-metilpropilo (1) Carbamilo-2-hidroxiopropan-2-ilo (3/2) 6-oxaspiro[2.5]octan-1-ilo (3/3) 3,5-dihidroxipiperidino (3/4) (3-hidroxioxetan-3-il)metilo oxetan-3-ilo (3/8) (1-hidroxiciclopropil)metil (3/9) 1,1-dioxidotietan-3-ilo (6/1) 3-hidroxi-3-metilbutilo (6/2) 2,3-dihidroxi-3-metilbutil (10/2) 2-(3-hidroxi-3-(2-hidroxiopropan-2-il)azetidino (10/3) carboxiciclobutano(12) (5-oxo-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il)propilo (17) (1-hidroxiciclobutil)metil (19/2) 3-hidroxiciclobutilo (26) Metanoato de 2,2-dimetilpropilo (27) 1,1-dioxidotietan-3-ilo (28) (3-hidroxioxetan-3-il)metilo (30) Carboxiciclopropilo(31) (metilsulfonil)ciclobutil (33) (4-hidroxi-1,1-dioxidotetrahidro-2H-tiopiran-4-il)metilo (34)
o A³ y A⁴ pueden considerarse conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo seleccionado del grupo que consiste en 	piperazin-2-ona (3/10) piperazin-2,6-diona (3/11) 3-hidroxi-3-(2-hidroxiopropan-2-il)azetidino (5) 2,2-dióxido-2-tia-6-azaespiro[3.3]heptano (6) 3,5-dihidroxipiperidino (8) 3,4-dihidroxipirrolidino-1-ilo (10/1) 1-imino-1-oxidotiormofolin (14) 2-imino-2-óxido-2-tia-6-azaespiro[3.3]heptan-6-ilo (14/1) 2-óxido-2-tia-6-azaespiro[3.3]heptan-6-ilo (14/2)

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

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

4. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de internacional: 30 de octubre de 2015, y se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2013178362	"Carboxamide or sulfonamide substituted thiazoles and related derivatives as modulators for the orphan nuclear receptor ror[gamma]"	05/diciembre/2013
D2	WO2014023367	"Carboxamide or sulfonamide substituted nitrogen-containing 5-membered heterocycles as modulators for the orphan nuclear receptor ror gamma"	13/febrero/2014

El documento D1¹ divulga un compuestos modulares de receptor nuclear huérfano RORY derivados de la 5-naftil-4-carbonil-tiazol-2-carboxamida (Págs. 199 a 204, Ejs 304a 304-27).

El documento D1² divulga un compuestos modulares de receptor nuclear huérfano RORY caracterizados por la presencia de sustituyente 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-ilo en el grupo fenilo o naftilo (R3) de la 1-(fenil o naftil)-4-carbonil-1H-pirrol-3-carboxamida (Págs. 40 y 166)

5. Examen de Patentabilidad (Art. 14 D486)

Nivel Inventivo (Art. 18 D486)

1 : <https://patents.google.com/patent/WO2013178362>
2 : <https://encrypted.google.com/patents/WO2014023367>

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

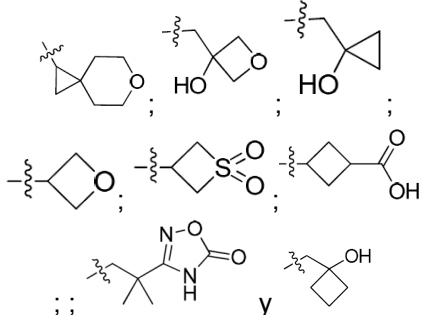
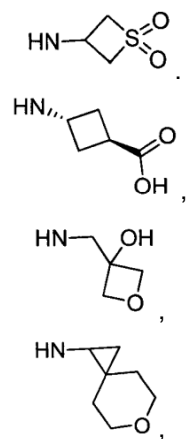
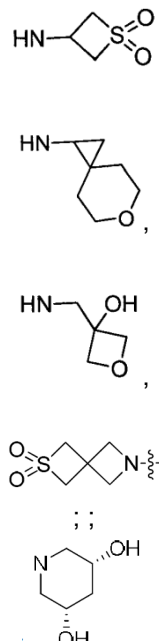
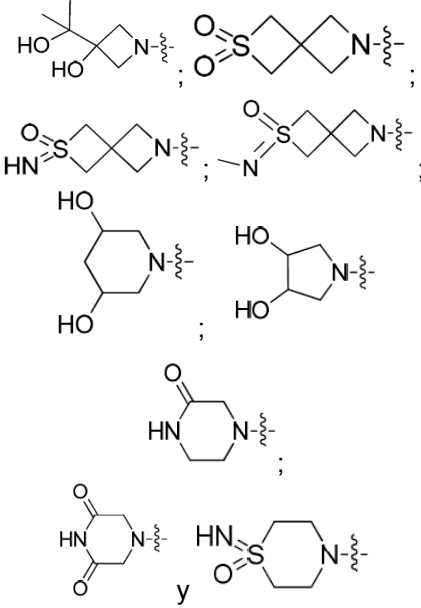
La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de la Fórmula I... (Radicado N° NC2017/0005014 del 16 de enero de 2018).

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de la Fórmula I. en donde	Un compuesto de la Fórmula I.	Un compuesto de la Fórmula I.
R¹ es Cl, C(CH₃)₃, CH₂CH₃, OCF₃, CF₃, OCH(CH₃)₂, CHF₂, OCHF₂, OCH₃, F, CH₃	R³ es (R²⁰⁴) seleccionado de	R³ es (Pág. 40) y (Pág. 41)
R¹ y R² pueden considerarse conjuntamente con su fenilo unido para formar un grupo naftalenilo o quinolinilo		
en donde R³ es CF₃ o CH₂CH₃		
A¹ es alquilo de C₍₁₋₂₎		
A² es ciclobutilo o alquilo de C₍₁₋₄₎, en donde el alquilo de C₍₁₋₄₎ está sustituido o no sustituido, con OCH₃ o hasta tres átomos de flúor		
A¹ y A² se consideran conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo seleccionado del grupo que consiste en azetidinio, piperidinilo, pirrolidinilo,	En donde R⁴ es (R²⁰³) seleccionado de CONR²¹²R²¹² o CONR²¹² y en donde R²¹² es H, alquilo C₁₋₆, halo-alquilo C₁₋₆ y cicloalquilo C₃₋₆	En donde R⁴ es C=ONR¹³R¹⁴ y en donde R¹³R¹⁴ juntos con el nitrógeno que atacan se consideran un anillo de 3 a 10 miembros
en donde R³ es CF₃ o CH₂CH₃		

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

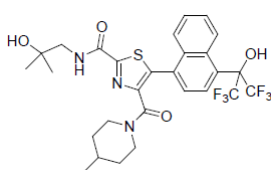
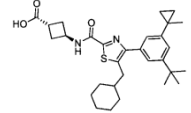
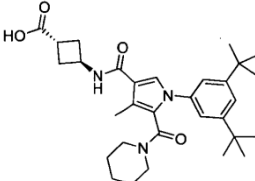
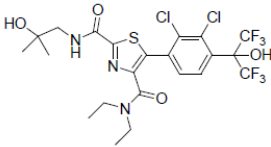
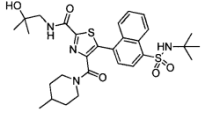
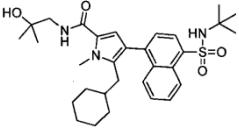
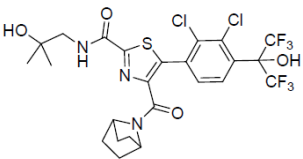
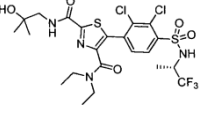
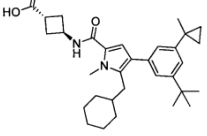
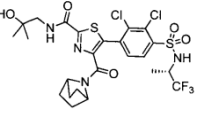
Ref. Expediente N° NC2017/0005014

A⁴ es H, alquilo de C₍₁₋₅₎,  en donde el alquilo de C₍₁₋₅₎ está sustituido, opcionalmente, con uno a dos sustituyentes seleccionados independientemente de CONH₂, –CN y OH.	En donde NR²⁰¹R²⁰² es H, alquilo C₁₋₁₀,  (Pág. 18)	En donde NR¹R² es alquilo de C₍₁₋₄₎  (reivindicación 5)
o A³ y A⁴ pueden considerarse conjuntamente con su nitrógeno unido para formar un anillo seleccionado del grupo que consiste en 		

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

Modalidades Preferidas	Ejemplos	Ejemplos
	 (Pág 157, Ej. 25)	 (Pág. 166)
	 (Pág 201, Ej. 304/3)	 (Pág. 166)
	 (Pág 212)	 (Pág. 166)
	 (Pág 212)	

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga modulares de receptor nuclear huérfano RORy derivados de la 5-naftil-4-carbonil-tiazol-2-carboxamida (Págs. 199 a 204, Ejs 304 a 304-27) y 5-fenil-4-carbonil-tiazol-2-carboxamida (Págs. 212 a 214)

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el producto divulgado en el documento D1 consiste en que la solicitud define un sustituyente 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxipropan-2-ilo o 1,1,1-trifluoro-2-hidroxibutan-2-ilo en los grupos fenilo o naftilo de la **5-(fenil o naftil)-4-carbonil-tiazol-2-carboxamida** mientras que el documento D1 revela para la misma posición como sustituyente preferido un N-(tert-butil)sulfamoilo.

No existe evidencia de un efecto técnico asociado reemplazo de un sustituyente N-(tert-butil)sulfamoilo por los sustituyente 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxipropan-2-ilo o 1,1,1-trifluoro-2-hidroxibutan-2-ilo en los grupo fenilo o naftilo de la **5-(fenil o naftil)-4-carbonil-tiazol-2-carboxamida**, puesto que los compuestos divulgados en el documento D1 presentan un IC₅₀ hasta 5 nanomolar (pIC₅₀ = 7.3) y tan solo uno de los compuestos de la solicitud (compuesto 17) presenta una IC₅₀ menor (0.9 nanomolar).

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

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “Comó obtener compuestos modulares de receptor nuclear huérfano RORy alternativos a los divulgados en el documento D1”.

Sin embargo, el documento D2 divulga compuestos modulares de receptor nuclear huérfano RORy que presentan un sustituyente 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-ilo en los grupos fenilo o naftilo del anillo 1-(**fenil o naftil**)-4-carbonil-1H-pirrol-3-carboxamida (Págs. 40 y 166). Adicional a ello, el documento D2 revela que compuestos que presentan un sustituyente N-(tert-butil)sulfamoilo en el grupo fenilo o naftilo (R3) de anillo 1-(**fenil o naftil**)-4-carbonil-1H-pirrol-3-carboxamida (Págs. 41), de manera análoga a lo divulgado en el documento D1, es decir, el documento revela implícitamente que los grupos 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-ilo y N-(tert-butil)sulfamoilo son series bioisósteras para los sustituyentes de los grupo fenilo o naftilo en los modulares de receptor nuclear huérfano RORy.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a reemplazar el sustituyente N-(tert-butil)sulfamoilo por un sustituyente 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-hidroxiopropan-2-ilo de acuerdo con lo divulgado en el documento D2 en los compuestos divulgados 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 a 16 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al producto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

6. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2013178362	1 a 16	Nivel inventivo
D2	WO2014023367	1 a 16	Nivel inventivo

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 3290

Ref. Expediente N° NC2017/0005014

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.

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: LENIN ROBERTO GUERRERO SUÁREZ.

Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ.

Página 10 de 10