

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

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

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/US2015/028224				
Fecha de Presentación Internacional	29 de abril 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° NC2016/0004392	22/Noviembre/2016
Reivindicaciones:	Radicado N° NC2016/0004392	22/Noviembre/2016
	Radicado N° NC2016/0004392	05/Abril/2017
Prioridad:	País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Número: 61/986,738 Fecha: 30 de abril de 2014. País: US, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA Número: 61/986,789 Fecha: 30 de abril de 2014.	

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta 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

Página 1 de 11

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

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 84 de acuerdo con el radicado NC2016/0004392 del 05 de abril 2017.

Título de la solicitud: "PROCESOS PARA PREPARAR UN INHIBIDOR DE JAK1 Y NUEVAS FORMAS DE ESTE".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar procesos de obtención de una forma anhidra y una monohidrato de 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un proceso que consiste en hacer reaccionar el compuesto de fórmula Ib con una base fuerte en presencia un solvente para obtener el compuesto de fórmula Ia.



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 495/14, A61K 31/437, A61P 25/00, A61P 35/00, A61P 37/00.

4. De la solicitud de patente

Título

El título no permite identificar el alcance de la invención comoquiera que los procesos de obtención de compuestos JAK1 conforman un sinfín de posibilidades que no encuentran sustento en la memoria descriptiva, por lo que, se sugiere restringir el título a procesos de obtención de formas cristalinas del compuesto 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es clara, toda vez que el proceso reclamado no presenta las etapas lógicas y secuenciales que permitan obtener el compuesto de fórmula Ia, más

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

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

cuando lo que se pretende es proteger una forma cristalina del compuesto 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo. Cabe recordar que sobre la reivindicación independiente recae el peso probatorio de la novedad y el nivel inventivo, en otras palabras, este tipo de reivindicaciones deben definir todas las características técnicas que permiten alcanzar el producto o el proceso, para este caso el proceso reclamado debe definir mediante sus nombre IUPAC o estructura química todos y cada uno de los reactivos o insumos o intermediarios que intervienen en las reacciones junto con la definición de las condiciones de reacción que permiten obtener la forma cristalina deseada del compuesto 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo. Se sugiere hacer las aclaraciones necesarias.

Las reivindicaciones 5, 7-8, 10, 12, 76 y 78-79 no son claras, comoquiera que definen al proceso en términos de la composición que comprende compuestos de fórmula Ia y Ib o IIIa y IIIb o, Va y Vb; se recuerda que los procesos se definen en términos de sus etapas y condiciones, mientras que las composiciones se definen en términos de sus ingredientes y proporciones; de acuerdo con lo definido en dichas reivindicaciones la reacciones se suceden al interior de la composición y no en un medio de reacción. Se sugiere hacer las aclaraciones necesarias.

La reivindicación 6 no es clara, ya que no define las etapas que permiten obtener el compuesto monohidrato 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo. Además, la materia definida en las cláusulas 1 a 5 no permiten que una persona normalmente versada en la materia a partir de la forma anhidra obtenga la forma monohidrato del 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo.

La reivindicación 55 no es clara, toda vez que no define adecuadamente a la forma cristalina anhidra del compuesto 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo, tan sólo lo definen a través de su estructura química; cabe recordar que la reivindicación independiente debe incluir todas las características técnicas de la invención que permiten no sólo diferenciarla del estado de la técnica, sino también establecer su novedad. En el caso de las formas cristalinas es necesario definirlas a través del patrón de rayos X en monocristal; en caso de no disponer de dicho patrón es posible definir la forma cristalina del compuesto reclamado mediante un patrón de difracción de rayos X en polvo (XRPD), estableciendo para este los parámetros de la celda unitaria y los picos correspondientes (al menos 20) y determinado para cada uno de estos sus ángulos e intensidades. Este XRPD en sí mismo no es suficiente para caracterizar la forma

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

cristalina del compuesto reclamado, es necesario incluir análisis térmicos como: TGA, y DSC y estructurales como RMN-C13. Por lo anterior, se sugiere hacer las aclaraciones necesarias.

La reivindicación 59 no es clara, comoquiera que el término pulir no permite entender que proceso sufre el compuesto reclamado dentro de la etapa (iii); se sugiere modificar el término por uno aceptado en el campo técnico.

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, abril 30 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	15097041	"Derivados tricíclicos fusionados de tiofeno como inhibidores de JAK"	28/Abril/2015*

*Fecha de prioridad: noviembre 01 de 2012.

El documento D1¹ divulga procesos de obtención de compuestos derivados tricíclicos fusionados de tiofeno, junto con sus compuestos intermediarios (Resumen, Págs. 90-91, Esquemas 10-11 y Págs. 143-146, Ej. 8, Pág. 169, Compuesto 20, Pág. 255, Compuesto Etapa 3 y Pág. 256, Compuesto Etapa 4).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en *"Un proceso para preparar un compuesto de fórmula Ia: que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula Ib con una primera base fuerte en presencia de un primer solvente que comprende en alcohol isopropílico, y en donde la primera base fuerte es una base de alcóxido o un alcóxido de metal alcalino"* (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

¹<http://sipi.sic.gov.co/sipi/Extra/IP/Mutual/Browse.aspx?sid=636607774652499439>

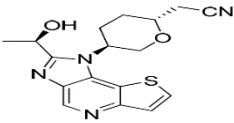
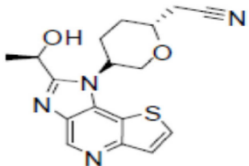
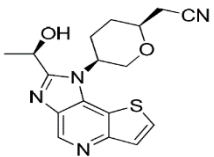
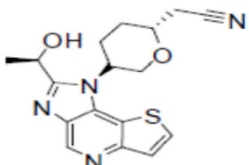


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

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

Características esenciales	D1
Un proceso para preparar un compuesto de fórmula Ia  que comprende:	Proceso para preparar el compuesto  (Pág. 169, Compuesto 20) que comprende:
Hacer reaccionar un compuesto de fórmula Ib:  Con una primera base de alcóxido o alcóxido de metal alcalino y alcohol isopropílico	Hacer reaccionar un compuesto de fórmula  Con terc-butóxido de potasio y alcohol isopropílico (Págs. 90-91, Esquemas 10-11 y Págs. 143-146, Ej. 8)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del proceso 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 2-54 y 76-84 no mencionan alguna característica que haga nuevo al proceso de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

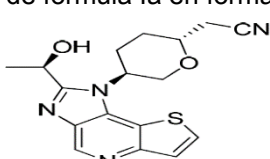
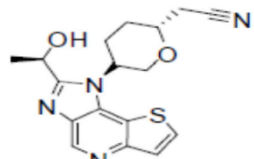
La reivindicación 55 consiste en “Una forma anhidra de un compuesto de fórmula Ia: (...)” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula Ia en forma anhidra 	Compuesto de fórmula  (Pág. 169, Compuesto 20)

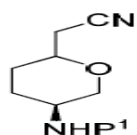
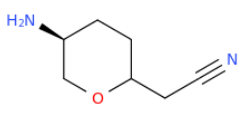
De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 55 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 55 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación dependiente 56 no menciona alguna característica que haga nuevo al compuesto de la reivindicación 55, por lo cual se considera que no es nueva.

La reivindicación 62 consiste en un “*Compuesto de fórmula VIII: en donde P1 es un grupo protector amina*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula VIII  P1= Grupo protector amina	Compuesto [(5S)-5-Aminotetrahidro-2H-piran-2-Il]acetónitrilo  y tercbutoxicarbonilo (Pág. 255, Compuesto Etapa 3)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 62 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

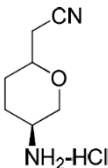
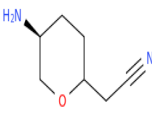
Ref. Expediente N° NC2016/0004392

En consecuencia, la reivindicación 62 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación dependiente 63 no menciona alguna característica que haga nuevo al compuesto de la reivindicación 62, por lo cual se considera que no es nueva.

La reivindicación 64 consiste en un “*Una sal de fórmula VIa*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula VIa 	Compuesto [(5S)-5-aminotetrahidro-2H-piran-2-Il]acetonitrilo HCl  (Pág. 256, Compuesto Etapa 4)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 64 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 64 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación 65 consiste en un “*Un compuesto de fórmula Va*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

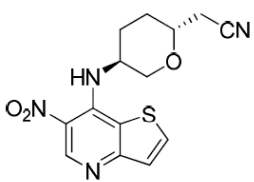
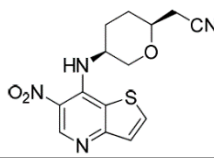
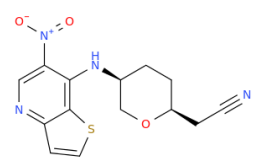
La reivindicación 66 consiste en un “*Un compuesto de fórmula Vb*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

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

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula Va  Compuesto de fórmula Vb 	Compuesto {(2S,5S)-5-[(6-nitrotieno[3,2-b]piridin-7-il)amino]tetrahidro-2H-piran-2-il} acetonitrilo  (Pág. 255, Ejemplo 73 etapa 4)

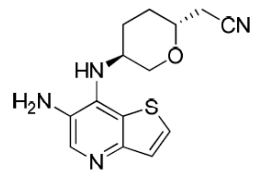
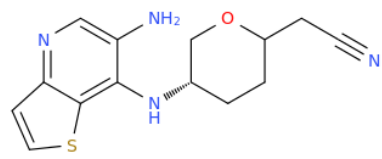
De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de las reivindicaciones 65 y 66 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, las reivindicaciones 65 y 66 carecen de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación 67 consiste en un “*Un compuesto de fórmula IIIa*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

La reivindicación 68 consiste en un “*Un compuesto de fórmula IIIb*” (Radicado NC2016/0004392 del 05 de abril de 2017).

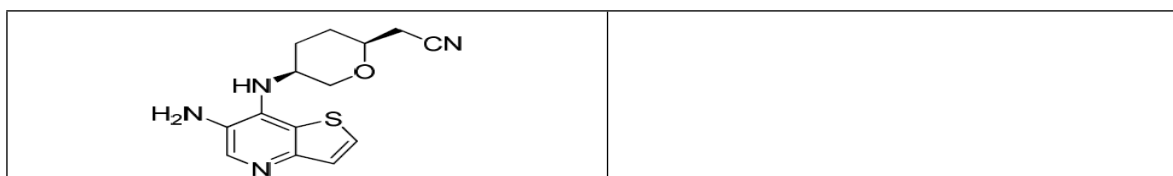
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
Compuesto de fórmula IIIa  Compuesto de fórmula IIIb	Compuesto {(5S)-5-[(6-aminotieno[3,2-b]piridin-7-il)amino]tetrahidro-2H-piran-2-il}acetonitrilo  (Pág. 274, Ejemplo 91)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

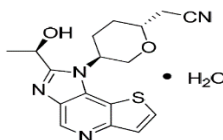
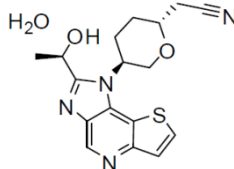


De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de las reivindicaciones 67 y 68 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, las reivindicaciones 67 y 68 carecen de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

La reivindicación 69 consiste en “Un proceso para preparar un compuesto de fórmula II: que comprenden suspender una forma anhidra de 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2-il) acetonitrilo en un componente solvente que comprende agua.

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

Características esenciales	D1
Un proceso para preparar un compuesto de fórmula II  que comprenden suspender una forma anhidra de 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2-il) acetonitrilo en un componente solvente que comprende agua	Proceso para preparar el compuesto  Cristalizar al 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2-il) acetonitrilo en una mezcla acetonitrilo/agua (Pág. 171, Compuesto 20a)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del proceso de la reivindicación 69 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 69 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

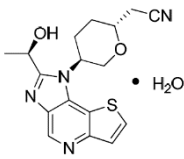
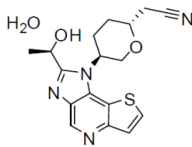
Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

Las reivindicaciones dependientes 70-71 no mencionan alguna característica que haga nuevo al proceso de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

La reivindicación 72 consiste en “Un proceso para preparar un compuesto de fórmula II: que comprenden aislar el compuesto de fórmula II de una primera mezcla que comprende 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il)tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo y un componente solvente que comprende isopropanol y agua.

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

Características esenciales	D1
Un proceso para preparar un compuesto de fórmula II  que comprenden aislar el compuesto de fórmula II de una primera mezcla que comprende 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b]piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo y un componente solvente que comprende isopropanol y agua	Proceso para preparar el compuesto  Cristalizar al 2-((2R,5S)-5-(2-((R)-1-hidroxietil)-1H-imidazo[4,5-d]tieno[3,2-b] piridin-1-il) tetrahidro-2H-piran-2il) acetonitrilo en una mezcla isopropanol/agua (Pág. 76, Líneas 1-3 y Pág. 171, Compuesto 20a)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del proceso de la reivindicación 72 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

En consecuencia, la reivindicación 72 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 73-75 no mencionan alguna característica que haga nuevo al proceso de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

7. Conclusión

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 5497

Ref. Expediente N° NC2016/0004392

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	15097041	1-56 y 62-84	Novedad

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: GERMAN ANTONIO CLAVIJO COHEN.

Revisado: GERMAN ANTONIO CLAVIJO COHEN

Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ