

Señor  
**Director de la Dirección de Nuevas Creaciones**  
Superintendencia de Industria y Comercio  
Ministerio de Comercio, Industria y Turismo  
E. S. D.

Re.: Expediente No. **NC2017/0002982**  
Solicitud de Patente PCT entrada en Fase Nacional, para:  
**“COMPUESTO DE PIRAZOLOOTIAZOL Y MEDICAMENTO QUE COMPRENDE EL MISMO”**  
Solicitante: **NIPPON SHINYAKU CO., LTD.**

## **RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO**

Yo, **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, obrando en mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante del asunto citado en la referencia, en atención a su oficio No. **4775** notificado el **24 de abril de 2018** atentamente me permito dar respuesta al mismo de la siguiente manera:

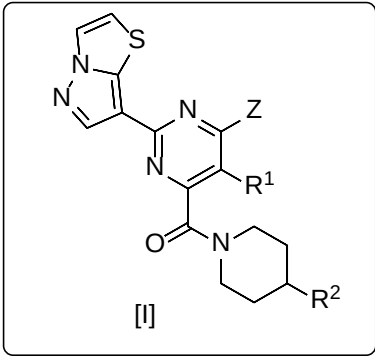
### **1. Reivindicaciones relativas a un uso**

- Indica el examinador que el objeto de las reivindicaciones 10 a 11 no es patentable, toda vez que se refiere a usos, los cuales no son patentables en Colombia. Si bien estas reivindicaciones se encabezan como *“un inhibidor de JAK1”* y *“un agente terapéutico para una enfermedad inflamatoria”* respectivamente, es evidente que las reivindicaciones en cuestión están referidas a la actividad o efecto técnico de los compuestos y a su utilidad como agentes terapéuticos para el tratamiento de una enfermedad.
  - o A fin de superar dicha objeción, en esta oportunidad no se incluyen las antiguas reivindicaciones 10 y 11.

### **2. Reivindicaciones**

- Indica el examinador que la reivindicación 1 carece de los requisitos de concisión y sustento descriptivo, ya que involucra una elevada variabilidad estructural dentro de sus radicales para la cual no existe evidencia técnica que permita establecer que se conserva la actividad atribuida a pesar de las drásticas modificaciones estructurales propuestas. En vista de ello el examinador ha sugerido restringir dicha reivindicaciones 1 a una generalización razonable del tipo de compuestos que han sido debidamente soportados en la descripción.

- o Teniendo en cuenta la solicitud del examinador, se ha modificado el pliego reivindicatorio con base en el soporte encontrado en la descripción. El soporte para las modificaciones introducidas se evidencia a continuación:



R<sup>1</sup>:

| Reiv. 1   | Soporte en los ejemplos | Generalización razonable               |
|-----------|-------------------------|----------------------------------------|
| Hidrogeno |                         | Hidrogeno                              |
| Alquilo   | <br>Metilo              | Alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> |
| Alcoxi    | <br>Etilo               | Alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>  |

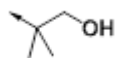
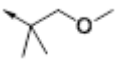
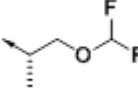
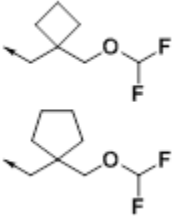
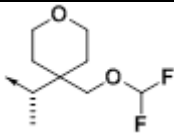
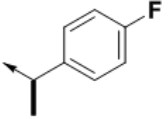
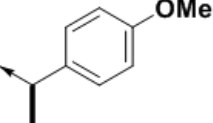
Z: -OR<sup>3</sup>  
R<sup>3</sup>:

| Reiv. 1                                             | Soporte en los ejemplos | Generalización razonable                                                                                          |
|-----------------------------------------------------|-------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Alquilo                                             |                         | Alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>                                                                            |
| Alquilo sustituido o no sustituido con cicloalquilo |                         | Alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> sustituido o no sustituido con cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> |
| Cicloalquilo                                        |                         | Alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>                                                                             |
| Arilo                                               |                         | Fenilo                                                                                                            |
| Heteroarilo                                         |                         | Piridilo                                                                                                          |

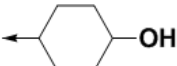
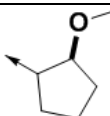
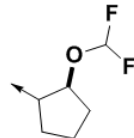
Z: -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>  
R<sup>4</sup>:

| Reiv. 1   | Soporte en los ejemplos | Generalización razonable               |
|-----------|-------------------------|----------------------------------------|
| Hidrogeno |                         | Hidrogeno                              |
| Alquilo   | <br>                    | Alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> |

R<sup>5</sup>: alquilo opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados de (1) a (6)

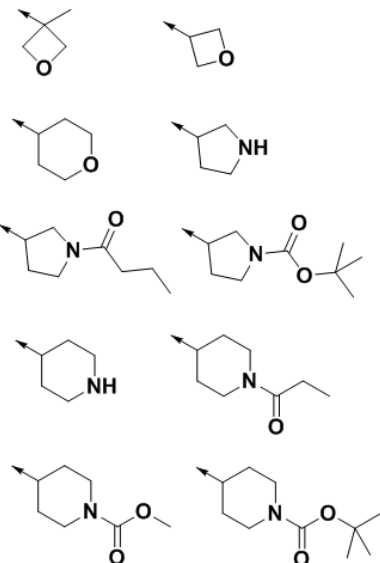
| Reiv. 1                                                                        | Soporte en los ejemplos                                                             | Generalización razonable                                                                                             |
|--------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (1)Hidroxi                                                                     |    | Hidroxi                                                                                                              |
| (2)Alcoxi                                                                      |    | Alcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                                                               |
| (2)Difloroalcoxi                                                               |    | Difloroalcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                                                        |
| (3)Cicloalquilo                                                                |    | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub>                                                                         |
| (3)Cicloalquilo sustituido con (difluoroalcoxi) alquilo                        |    | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub> sustituido con (difluoroalcoxi) alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |
| (3)Cicloalquilo sustituido con alcoxi alquilo                                  |    | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub> sustituido con alcoxi alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>            |
| (4)Grupo heterocíclico sustituido o no sustituido con (difluoroalcoxi) alquilo |   | Tetrahidropiraniil sustituido o no sustituido con (difluoroalcoxi) alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>            |
| (5)Arilo                                                                       | -                                                                                   | -                                                                                                                    |
| (5)Arilo sustituido con halogeno                                               |  | Fenilo sustituido con flúor                                                                                          |
| (5)Arilo sustituido con alcoxi                                                 |  | Fenilo sustituido con alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub>                                                          |
| (6)nitriilo                                                                    | -                                                                                   | -                                                                                                                    |

R<sup>5</sup>: cicloalquilo opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados de (1) a (6)

| Reiv. 1                        | Soporte en los ejemplos                                                             | Generalización razonable                      |
|--------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------|
| (1)Hidroxi                     |  | Hidroxi                                       |
| (2)Alcoxi                      |  | Alcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>        |
| (2)Difloroalcoxi               |  | Difloroalcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |
| (3)Cicloalquilo                | -                                                                                   | -                                             |
| (3)Cicloalquilo sustituido con | -                                                                                   | -                                             |

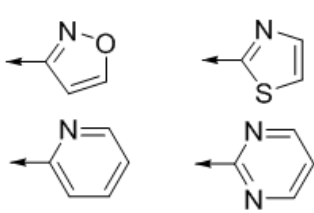
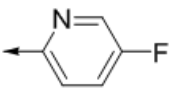
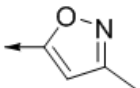
|                                                                                |                                                                                   |         |
|--------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|---------|
| (difluoroalcoxi) alquilo                                                       |                                                                                   |         |
| (3)Cicloalquilo sustituido con alcoxi alquilo                                  | -                                                                                 | -       |
| (4)Grupo heterocíclico sustituido o no sustituido con (difluoroalcoxi) alquilo | -                                                                                 | -       |
| (5)Arilo                                                                       | -                                                                                 | -       |
| (5)Arilo sustituido con halogeno                                               | -                                                                                 | -       |
| (5)Arilo sustituido con alcoxi                                                 | -                                                                                 | -       |
| (6)nitrilo                                                                     |  | nitrilo |

**R<sup>5</sup>: Grupo heterocíclico saturado opcionalmente sustituido con uno o dos grupos seleccionados de (1) a (3)**

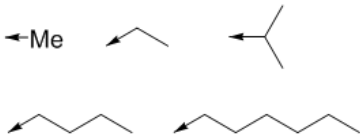
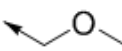
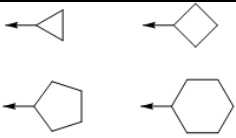
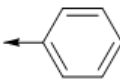
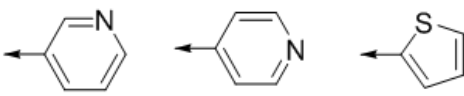
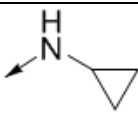
| Reiv. 1                                                                                                                                                                                                                                                            | Soporte en los ejemplos                                                            | Generalización razonable                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| dicho grupo heterocíclico saturado opcionalmente sustituido en R <sup>5</sup> está sustituido o no sustituido con uno o dos grupos seleccionados del grupo que consiste en siguientes (1) a (3):<br>(1) alquilo,<br>(2) alquilocarbonilo, y<br>(3) alcoxicarbonilo |  | tal oxetanil, tetrahidropiranilo, piperidinilo o pirrolidinilo en R <sup>5</sup> es sustituido o no sustituido con cualquier un grupo seleccionado a partir de los siguientes (1) a (3):<br>(1) alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ,<br>(2) alquilcarbonilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> , y<br>(3) alcoxicarbonilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> ; |

**R<sup>2</sup>: -NHR<sup>8</sup>**

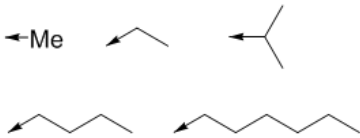
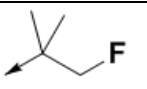
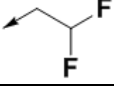
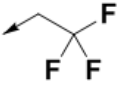
**R<sup>8</sup>:**

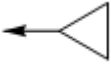
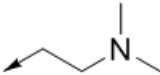
| Reiv. 1                           | Soporte en los ejemplos                                                             | Generalización razonable                                                                                                        |
|-----------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Heteroaril                        |  | isoxazolilo, tiazolilo, piridilo o pirimidinilo, sustituido o no sustituido con flúor o alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |
| Heteroaril susituido con halógeno |  |                                                                                                                                 |
| Heteroaril sustituido con alquilo |  |                                                                                                                                 |

R<sup>8</sup>: -COL<sup>1</sup>  
L<sup>1</sup>: Un grupo seleccionado del grupo que consiste en los siguientes (1) a (5)

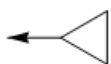
| Reiv. 1                          | Soporte en los ejemplos                                                              | Generalización razonable                                                                      |
|----------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------|
| (1)alquilo                       |     | alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                                       |
| (1)monoalquilo                   | -                                                                                    | -                                                                                             |
| (1)dialquilo                     |     | Difluoroalquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                               |
| (1)trialquilo                    | -                                                                                    | -                                                                                             |
| (1)alquilo sustituido con alcoxi |     | Alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> sustituido con alcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |
| (2)cicloalquilo                  |     | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub>                                                  |
| (3)arilo                         |    | Fenilo                                                                                        |
| (4)heteroarilo                   |  | Piridil, tienil                                                                               |
| (5)dialquilamino                 |   | Dialquilamino C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                                 |
| (5)cicloalquilamino              |   | Cicloalquilamino C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub>                                              |

R<sup>8</sup>: -COOL<sup>2</sup>  
L<sup>2</sup>: Un grupo seleccionado del grupo que consiste en los siguientes (1) a (3)

| Reiv. 1                          | Soporte en los ejemplos                                                             | Generalización razonable                                                                      |
|----------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------|
| (1)alquilo                       |  | alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                                       |
| (1)monoalquilo                   |  | Monofluoro de alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                         |
| (1)dialquilo                     |  | Difluoroalquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                               |
| (1)trialquilo                    |  | Trifluoroalquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>                                              |
| (1)alquilo sustituido con alcoxi |  | Alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> sustituido con alcoxi C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |

|                        |                                                                                   |                                                                                          |
|------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------|
| (2)cicloalquilo        |  | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub>                                             |
| (3)dialquilaminoalquil |  | Dialquilamino C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub><br>alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub> |

R<sup>8</sup>: -COOL<sup>2</sup>  
L<sup>3</sup>:

| Reiv. 1         | Soporte en los ejemplos                                                                                                                                             | Generalización razonable                     |
|-----------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------|
| (1)alquilo      |   | alquilo C <sub>1</sub> - C <sub>6</sub>      |
| (2)cicloalquilo |                                                                                    | Cicloalquilo C <sub>3</sub> - C <sub>6</sub> |

- El examinador también considera que la descripción carece de información que permita obtener los solvatos como se reivindican y también carece de una caracterización adecuada de los mismos.
  - A este respecto se llama la atención del examinador que en general, la producción de un compuesto, particularmente un compuesto orgánico como en la presente invención, implica la reacción(es) de reactivo(s) en un disolvente apropiado y, a continuación aislamiento del producto de la mezcla de reacción por medio de procedimiento(s) apropiado(s), incluida la cristalización. A este respecto, un compuesto generalmente se solvata con un disolvente en una solución, y tal disolvente se puede eliminar posteriormente mediante secado de la etapa a presión reducida para aislar un producto en forma libre. Sin embargo, dependiendo del tipo de compuesto orgánico, el producto puede obtenerse como un hidrato o un solvato, tal como monohidrato, dihidrato y similares, como se describe en el la página 67 líneas 9 a 16. 71 y 72.

De hecho, algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron como un hidrato (véase el análisis elemental en los Ejemplos 24, 25 y 27). También se observa que tal hidrato puede obtenerse, sin utilizar agua como disolvente, debido a la humedad en la atmósfera o la humedad contenida en el reactivo, como en los Ejemplos 24, 25, y 27.

En vista de lo anterior, y para superar la objeción, se ha modificado la expresión "solvato" por "hidrato" en el pliego reivindicatorio. Se enfatiza que la descripción proporciona información suficiente que hace posible obtener el hidrato basándose en la descripción como en la página 67 líneas 9 a 16 y los ejemplos como se discutió anteriormente.

3. Determinación del Estado de la Técnica

El examinador ha determinado el estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 2 de septiembre de 2014, y no se encontraron documentos que anticipan el objeto de esta solicitud.

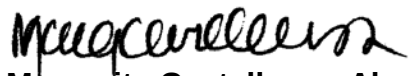
#### 4. Conclusión

Teniendo en cuenta las modificaciones introducidas en esta oportunidad y los argumentos que se presentan, es posible establecer que las reivindicaciones del nuevo pliego reivindicatorio cumplen con los requerimientos de la Decisión 486.

#### 5. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por nueve (9) reivindicaciones.

Señor Director,



**Margarita Castellanos Abondano**

C.C. No. **39.779.654** de Bogotá

T.P.A. No. **70.819** del C.S.J.

Calle 94A No. 7A-09 - Bogotá, D.C.

Teléfono: 7560770

Bogotá, D.C.  
MCA/lt  
P4577  
RESPUESTA EXAMEN DE FONDO