

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

Oficio N° **9141**

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

Señor(a)
NUEVOLUTION A/S
mjaramillo@gpzlegal.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/EP2015/067713				
Fecha de Presentación Internacional	31 de julio 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	NC2017/0002160	3 de marzo de 2017
Reivindicaciones:	NC2017/0002160	3 de marzo de 2017
	NC2017/0002160	4 de mayo de 2017
Respuesta del solicitante:	NC2017/0002160	4 de mayo de 2017
Prioridad(es):	País: SE, SUECIA Número: 1450920-2 Fecha: 4 de agosto de 2014 País: SE, SUECIA Número: 1451406-1 Fecha: 21 de noviembre de 2014	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9141

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

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 al capítulo reivindicatorio presentadas bajo el Radicado No. NC2017/0002160 del 4 de mayo de 2017, 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 10 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 62 del capítulo reivindicatorio (Radicado NC2017/0002160 del 4 de mayo de 2017).

Título de la solicitud: “DERIVADOS DE PIRIMIDINA SUSTITUIDOS CON HETEROCICLILO OPCIONALMENTE CONDENSADOS ÚTILES PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES INFLAMATORIAS, METABÓLICAS, ONCOLÓGICAS Y AUTOINMUNITARIAS” (Radicado NC2017/0002160 del 3 de marzo de 2017).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar agentes que modulen la actividad de ROR α y/o ROR γ para el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunitarias en seres humanos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de la Fórmula (I):

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **9141**

Ref. Expediente N° NC2017/0002160



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 403/12, C07D 401/14; C07D 405/14; C07D 413/14; C07D 403/04; C07D 409/12; C07D 409/14; C07D 413/04; C07D 417/14; C07D 471/10; C07D 487/04; A61K 31/506; A61K 31/519; A61P 3/00; A61P 37/00.

5. De la solicitud de patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de sustento descriptivo porque reclama los solvatos y polimorfos, la solicitud carece de información que permita determinar el verdadero desarrollo de estos sólidos, no existe evidencia del tipo de solvato formado, la cantidad de moléculas de solvente integradas al fármaco ni de la identidad del solvente, tampoco se caracterizan apropiadamente los polimorfos a través de la celda unitaria y su espectro de difracción de rayos X y no se divulga el procedimiento que permite su obtención.

Las reivindicaciones 1, 9, 12, 17, 25, 33, 36, 37, 38, 41 y 47 carecen de concisión debido a la amplia variabilidad estructural propuesta dentro de los radicales R₁, R₂, R₃, R_{6a}, R_{6b}, B y C. Adicionalmente, estos radicales incluyen la expresión “sustituido”, pero no se divulga en la reivindicación cuáles son los sustituyentes seleccionados. Del mismo modo para B la solicitante indica que este corresponde a un arilo, heteroarilo y heteroarilcilo, pero no limita el tamaño de cada uno de estos ciclos.

Se aclara a la solicitante que una invención no está limitada por los ejemplos allí ilustrados, sin embargo, lo que se observa como evidencia técnica es proporcionada por un grupo muy limitado de agentes evaluados con solo algunas modalidades de los sustituyentes propuestos. Por lo anterior, lo reivindicado corresponde a una extrapolación para un elevado número de compuestos reclamados.

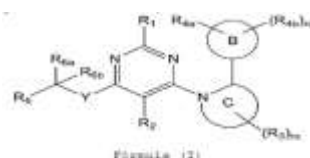
De acuerdo con la materia ejemplificada, los sustituyentes principales preferidos para la presente solicitud corresponden a:

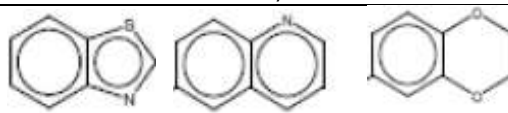
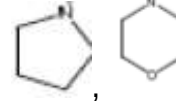


REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9141

Ref. Expediente N° NC2017/0002160



Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
Y	NR u O;
B	Fenil,  , 
C	
R	H,
R ₁	H,
R ₂	H, Halógeno, alquil C1-6,
R ₁ y R ₂	Junto con la pirimidina se ciclan para formar: 

En consecuencia, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizados y probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

6. Unidad de invención (Art 25 D 486)

La solicitud no cumple con el requisito de unidad de invención porque se refiere a 2 grupos inventivos.

Los grupos inventivos están definidos por las siguientes características esenciales:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9141

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

Grupo inventivo 1: compuestos de la fórmula I donde R₁ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄ sustituido o no sustituido, alcoxi C₁₋₄ sustituido o no sustituido, y alquileo C₂₋₄ sustituido o no sustituido; Y es NR (R es H) derivados de pirimidina, de acuerdo con las reivindicaciones 1 y 3 a 62 (en parte).

Grupo inventivo 2: compuestos de la fórmula I donde R₁ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, OH, halógeno, alquilo C₁₋₄ sustituido o no sustituido, alcoxi C₁₋₄ sustituido o no sustituido, y alquileo C₂₋₄ sustituido o no sustituido; Y es NR, donde R y R₂ forman un ciclo para obtener un núcleo de pirrolo [2,3-d]pirimidina, de acuerdo con las reivindicaciones 1(en parte), 2 y 3 a 62 (en parte).

No se guarda un concepto común inventivo porque no existe un grupo farmacofórico común por lo tanto los compuestos de cada grupo no comparten una estructura esencial para la actividad común. Adicionalmente, el estado de la técnica US2013231519 junto con Yao Ma et al. "Combinatorial Synthesis of Substituted Biaryls and Heterocyclic Arylamines". *J. Comb. Chem.*, 2004, 6 (3), pp 426–430, sugieren los compuestos del grupo inventivo 1.

Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 4 de agosto de 2014, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2013231519	"1H-pyrrolo[2,3-b]pyridine derivatives"	5/septiembre/2013
D2	Art. 1*	"Combinatorial Synthesis of Substituted Biaryls and Heterocyclic Arylamines"	4/abril/2004

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9141

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

* Yao Ma et al. "Combinatorial Synthesis of Substituted Biaryls and Heterocyclic Arylamines". *J. Comb. Chem.*, 2004, 6 (3), pp 426–430

El documento D1¹ enseña compuestos derivados de 1H-pirrolo[2,3-b] activos como inhibidores de la proliferación celular (Resumen).

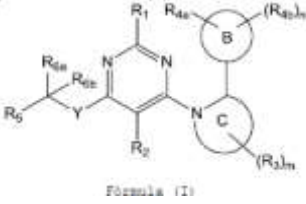
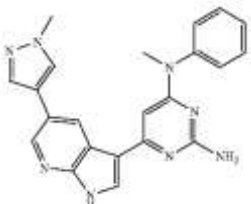
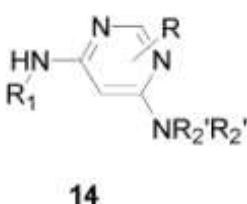
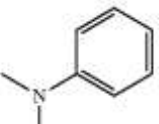
El documento D2² divulga compuestos terapéuticamente activos análogos a los de la presente solicitud (Pág. 429, Ingreso 14q).

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

Grupo inventivo 1

La reivindicación 1 consiste en: "Un compuesto de Fórmula (I)..." (Radicado N°. NC2017/0002160 del 4 de mayo de 2017).

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto derivado de Fórmula (I):  Fórmula (I)	Compuestos de las fórmulas:  (Pág. 2)	Un compuesto de fórmula:  14 (Pág. 428)
Y es NH R5 es -(CR8R9)p-CR13R14R15; donde p es 0; R14 y R15 forman un anillo fenil.		R1 es 4-MeC6H4CH2NH2 (Pág. 428)

¹https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=2013231519A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20130905&DB=EPODOC&locale=en_EP

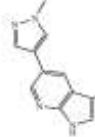
²<https://pubs.acs.org/doi/pdf/10.1021/cc0340731>



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **9141**

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

R _{6a} y R _{6b} son H.	(Pág. 2)	
R ₁ y R ₂ son entre otros halógeno cada uno.	H y NH ₂ (Pág. 2)	La dicloropirimidina es 4,6-dicloropirimidina (Pág. 428)
C es heterociclilo C ₂₋₉ B es un sistema de anillo seleccionado entre el grupo que consiste en arilo, heteroarilo, y heteroalíclicilo bicíclico.	 (Pág. 2)	NR ₂ R ₂ " es 2 fenil pirrolidina (Pág. 428)

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque D1 enseña compuestos derivados de pirimidina inhibidores de la proliferación celular empleados en el tratamiento de tumores (Resumen). De manera específica, el compuesto A11 enseña varios de los sustituyentes seleccionados en la presente solicitud.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D1 consiste en que la solicitante incluye un grupo metil como puente entre el grupo amino y el fenil, adicionalmente, la presente solicitud no indica que R₁ pueda ser NH₂.

El efecto técnico que logra esta diferencia consiste en proveer compuestos con actividad biológica sobre receptores huérfanos relacionados con el receptor del ácido retinoico nuclear (ROR). Sin embargo, la presente solicitud carece de información técnica que permita determinar un efecto inesperado o sorprendente que pueda ser atribuido al elevado número de variables propuestas toda vez que la solicitud carece de una apropiada limitación. De igual forma, los resultados presentados por la solicitante no pueden trasladarse al amplio rango de compuestos con marcadas diferencias estructurales.

El problema técnico objetivo de esta solicitud consiste en la necesidad de modificar compuestos terapéuticos como los divulgados en D1 para obtener agentes activos alternativos sobre ROR.

Sin embargo, el documento D2 da a conocer aril aminas (incluyendo pirimidinas) con estructuras de relevancia medicinal (Resumen). De manera específica el documento D2 revela el compuesto de fórmula 14 donde R₁ es 4-MeC₆H₄CH₂NH₂, la dicloropirimidina es 4,6-dicloropirimidina y NR₂R₂" es 2 fenil pirrolidina (Tabla 2). Como se puede apreciar en la tabla comparativa, el compuesto de D1 es análogo a



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

Oficio N° 9141

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

los compuestos de la presente solicitud y comparte el mismo grupo farmacofórico. Adicionalmente, en D2 se divulga el grupo metil como puente entre la amina y el grupo fenilo y también enseña que el sustituyente R (R2 de la presente solicitud) puede ser H.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría las modificaciones en los radicales del 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.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y en las reivindicaciones 2 – 60 y 62 es obvia y no tiene nivel inventivo.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US2013231519	1-60 y 62	Nivel inventivo
D2	Art. 1*	1-60 y 62	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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° **9141**

Ref. Expediente N° NC2017/0002160

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,



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES

Elaborado: EDWARD BAUDILIO SUESCA QUINTERO
Revisado: DAYRON ALEXANDER RAMIREZ REYES
Aprobado: JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ