

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

Señor(a)
Idorsia Pharmaceuticals Ltd
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		Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2016/050645				
Fecha de Presentación Internacional	14 de enero de 2016				

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° NC2017/0008156	11/Agosto/2017
Reivindicaciones:	Radicado N° NC2017/0008156	11/Agosto/2017
	Radicado N° NC2017/0008790	29/Agosto/2017
	Radicado N° NC2017/0008156	14/Septiembre/2017
Prioridad:	EP Número: PCT/EP2015/050696 Fecha: 15 de enero de 2015.	

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. Modificaciones aceptadas (Art 34 D. 486)

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

La modificación realizada al capítulo reivindicatorio mediante escrito NC2017/0008156 del 14 de septiembre de 2017 se acepta, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

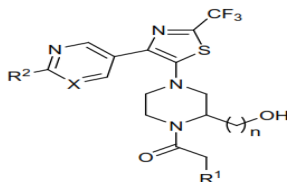
4. Objeto de la invención

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. Con relación a la presente solicitud se realizó el pago de las reivindicaciones adicionales y se estudiarán las reivindicaciones 1 a 13 de acuerdo con el radicado NC2017/0008156 del 14 de septiembre de 2017.

Título de la solicitud: “DERIVADOS DE 1-(4-(4-(PIRIMIDIN-5-IL)TIAZOL-5-IL)PIPERAZIN-1-IL)ETAN-1-ONA Y ANÁLOGOS DE PIRIDINA DE LOS MISMOS COMO MODULADORES DEL RECEPTOR CXCR3, COMPOSICIONES QUE LOS COMPRENDEN Y MÉTODOS DE ELABORACIÓN” (modificado mediante escrito NC2017/0008156 del 14 de noviembre de 2017).

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos moduladores del receptor CXCR3 para el tratamiento de cáncer, enfermedades neurodegenerativas, autoinmunes, inflamatorias, infecciosas, rechazo de trasplante y fibrosis.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I)



El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 417/14, A61K 31/427, A61P 37/00.

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

5. De la solicitud de patente

Título

El título incluye la expresión “(...) y métodos de elaboración”, pero de acuerdo con el capítulo reivindicatorio presentado mediante escrito NC2017/0008156 del 14 de septiembre de 2017 no se están reclamando métodos de elaboración. En virtud de lo anterior, se sugiere retirar la mencionada expresión.

En cuanto a la expresión “(...) análogos de piridina (...)” se sugiere incluir la posición de la piridina dentro de la estructura de los compuestos de fórmula I, porque esta expresión sugiere que hay presente otro grupo de compuestos moduladores del receptor CXCR3 derivados de la piridina.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 4 y 10 no son claras, comoquiera que repiten materia de forma innecesaria, dado que ambas reivindicaciones reclaman que R^2 es CF_3 o sus sales; se sugiere dejar una de estas dentro del capítulo reivindicatorio.

La reivindicación 13 no es clara, por cuanto la expresión “al menos” precediendo una característica no es limitativa, porque hace opcional a la misma y no precisa el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir una expresión concreta de acuerdo con los ejemplos sustentados.

Las reivindicaciones 1-3 y 5-9 no están sustentadas enteramente, en razón a que dentro de la memoria descriptiva sólo se desarrollan compuestos de fórmula I cuyas definiciones de R^1 y R^2 corresponden a:

Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
R^1	3-ter-butil-[1,2,4]triazol-1-il, 3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-ciclopropil-[1,2,4]triazol-1-il 3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il, 5-fluoro-indol-1-il, 5-metoxi-indol-1-il, 3-metil-[1,2,4]triazol, 3-metoximetil-[1,2,4]triazol, 3-(5-metil-[1,2,4]oxadiazol-3-il, 3-fenil-[1,2,4]triazol-1-il,

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

	3-acetil-[1,2,4]triazol-1-il, 1-hidroxi-etil)-[1,2,4]triazol-1-il, 3-metil-pirazol-1-il, 3-piridin-2-il-[1,2,4]triazol-1-il, 2-Benzoimidazol-1-il, 3-etil-5-metil-[1,2,4]triazol-1-il, 5-etil-3-metil-[1,2,4]triazol-1-il, 2-imidazo[4,5-b]piridin-3-il, 3-ciclobutil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-etil-[1,2,4]triazol-1-il, 5-etil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il, (5-metil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-difluorometil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-etil-pirazol-1-il, 3-ciclopropil-pirazol-1-il
R ²	2-trifluorometil, 2-etoxi, 2-ciclopropil

Descripción (Art 28 D 486)

La descripción no divulga la invención de manera clara ni suficiente para que una persona normalmente versada en la materia pueda ejecutarla o reproducirla, debido a que dentro de la memoria descriptiva sólo se desarrollan compuestos cuyas definiciones de R¹ y R² corresponden a:

R ¹	3-ter-butil-[1,2,4]triazol-1-il, 3,5-dimetil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-ciclopropil-[1,2,4]triazol-1-il 3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-trifluorometil-[1,2,4]triazol-1-il, 5-fluoro-indol-1-il, 5-metoxi-indol-1-il, 3-metil-[1,2,4]triazol, 3-metoximetil-[1,2,4]triazol, 3-(5-metil-[1,2,4]oxadiazol-3-il, 3-fenil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-acetil-[1,2,4]triazol-1-il, 1-hidroxi-etil)-[1,2,4]triazol-1-il, 3-metil-pirazol-1-il, 3-piridin-2-il-[1,2,4]triazol-1-il, 2-Benzoimidazol-1-il, 3-etil-5-metil-[1,2,4]triazol-1-il,
----------------	--

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

	5-etil-3-metil-[1,2,4]triazol-1-il, 2-imidazo[4,5-b]piridin-3-il, 3-ciclobutil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-etil-[1,2,4]triazol-1-il, 5-etil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-isopropil-[1,2,4]triazol-1-il, (5-metil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-difluorometil-[1,2,4]triazol-1-il, 3-etil-pirazol-1-il, 3-ciclopropil-pirazol-1-il
R ²	2-trifluorometil, 2-etoxi, 2-ciclopropil

Se requiere al solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

6. 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, enero 15 de 2015. 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	WO2007064553	"Thiazole derivatives as CXCR3 receptor modulators"	07/Junio/2007
D2	WO2013114332	"4-(benzoimidazol-2-yl)-thiazole compounds and related aza derivatives"	08/Agosto/2013

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de tiazol-piperidina-etanona como moduladores de los receptores CXCR3; los compuestos divulgados presentan una actividad IC₅₀ de unión al receptor CXCR3 entre 1 a 800nM (Resumen; Pág. 139 y Pág. 141, Rv. 1).

El documento D2² divulga compuestos derivados de tiazol-piperazina-etanona como moduladores de los receptores CXCR3; los compuestos divulgados presentan una

¹[www.google/patents/ WO2007064553](http://www.google/patents/WO2007064553)

² [www.google/patents/ WO2013114332](http://www.google/patents/WO2013114332)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

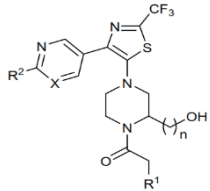
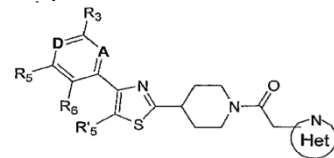
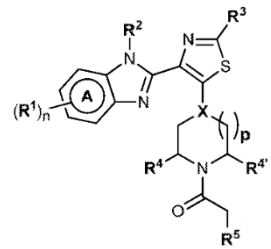
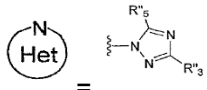
actividad FLIPR IC₅₀ comprendida entre 0,1nm-1070nm y de internalización IC₅₀ comprendida entre 12nM-5880nM (Resumen; Págs. 157-162, Tabla 1 y Rvs. 1).

7. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en “Un compuesto de fórmula I, en donde n representa un número entero 1 o2, (...)” (Radicado NC2017/0008156 del 14 de septiembre de 2017).

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I):  n= 1 o 2 X= N o CH	Compuesto de fórmula I  D=N; A=CH o N R'5=CH3 R4=H; R5=H (Págs. 141-142)	Compuesto de fórmula I  R2=H (R1n)= Alquilo C(1-4) X=N: p=1 R4=R4'=Alquilo C(1-4) (Págs. 161-162, Rv. 1)
R1=Heteroarilo monociclo de 5 miembros con tres heteroátomos de N, no sustituido	 R''3=R''5=H (Págs. 141-142)	R5=Heteroarilo de 5 miembros no sustituido (Págs. 161-162, Rv. 1)
R2=Flouroalquilo(C1-2)	R3=CF3 (Págs. 141-142)	R3= Flouroalquilo(C1-3) (Págs. 161-162, Rv. 1)

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos derivados de tiazol-piperidina-etanona como moduladores de los receptores CXCR3; los compuestos divulgados presentan una actividad IC₅₀ de unión al receptor CXCR3 entre 1 a 800nM (Resumen; Pág. 139 y Pág. 141, Rv. 1).

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

La diferencia entre el compuesto, definido en la reivindicación 1 y el compuesto revelado en el documento D1 consisten en que el compuesto reclamado presenta un anillo de piperazina sustituido en la posición 2 con un alquil_(C1-C2)-alcohol.

No se evidencia efecto técnico asociado a la diferencia expuesta, debido a que las pruebas biológicas presentadas en la solicitud definen que la actividad FLIPR IC₅₀ está comprendida entre 0,38nm-510nm y de internalización IC₅₀ comprendida entre 74,2nM-6500nM, mientras que el documento D2 enseña que los compuestos divulgados presentan una actividad FLIPR IC₅₀ comprendida entre 0,1nm-1070nm y de internalización IC₅₀ comprendida entre 12nM-5880nM (Tabla 1 y Rvs. 1)

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo proporcionar un compuesto alternativo con actividad moduladora del receptor CXCR3 a partir del compuesto divulgado en el documento D1”

Sin embargo, el documento D2 revela compuestos derivados de tiazol-piperazina-etanona como moduladores de los receptores CXCR3, donde la piperazina está sustituida en la posición 2; estos compuestos presentan una actividad FLIPR IC₅₀ comprendida entre 0,1nm-1070nm y de internalización IC₅₀ comprendida entre 12nM-5880nM (Resumen; Págs. 157-162, Tabla 1 y Rvs. 1).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia tendría la motivación de modificar el anillo piperidina presente en la estructura del compuesto de fórmula I revelado en el documento D1 por un anillo de piperazina 2-sustituido, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud.

Por lo anterior, la reivindicación 1 de acuerdo con lo divulgado en los documentos D1 y D2, carece de Nivel inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-13 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco se pueden considerar inventivas.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2007064553	1-13	Nivel inventivo
D2	WO2013114332	1-13	Nivel inventivo

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

Oficio N° 12244

Ref. Expediente N° NC2017/0008156

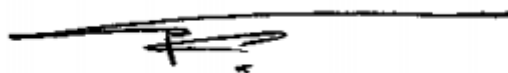
En cumplimiento del artículo 45, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si 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 numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede el recurso de la vía gubernativa.

Atentamente,



**JOSE LUIS SALAZAR LOPEZ
DIRECTOR DE NUEVAS CREACIONES**

Elaborado: GERMÁN CLAVIJO COHÉN.
Revisado: GERMAN ANTONIO CLAVIJO COHEN