

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

Señor(a)
DAEWOONG PHARMACEUTICAL CO. LTD.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“DERIVADOS DE PIRAZOLOPIRIMIDINA COMO INHIBIDOR DE QUINASA”.**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/KR2017/006980.

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 30 de junio de 2017.

PRIORIDAD(ES): KR 10-2016-0083050, 30 de junio de 2016.

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. 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, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 14 del radicado N° NC2018/0013293, del 07 de diciembre de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de derivados de pirazolopirimidinas, que tienen actividad de inhibición de quinasas.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto representado por la siguiente fórmula química 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

2. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 Decisión 486)

El uso de la reivindicación 14 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14, teniendo en cuenta que aunque tiene preámbulo de una composición, se está caracterizando únicamente por el uso que se le da a los compuestos de la invención.

3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 30 de junio de 2016, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Estado de la técnica			
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2010129053	“EGFR Inhibitors and methods of treating disorders”	11/Noviembre/2010
D2	WO2015083028	“Pyrrolo[2,3-D]pyrimidinyl, pyrrolo[2,3-B]pyrazinyl AND pyrrolo[2,3-D]pyridinyl	11/Junio/2015

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

		acrylamides"	
--	--	--------------	--

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de pirrolo-pirimidina, pirrolo-piridina, piridina, purina y triazina, que tienen actividad sobre EGFR y sobre diferentes tipos de Quinasas, como quinasas Janus y Btk.

El documento D2² divulga derivados de pirrolo[2,3-d]pirimidinil y pirrolo[2,3-d]piridinil acrilamidas, los cuales presentan actividad sobre quinasas Janus.

4. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

4.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Compuesto representado por la siguiente fórmula química 1, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo...” (Radicado N° NC2018/0013293, del 07 de diciembre de 2018).

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

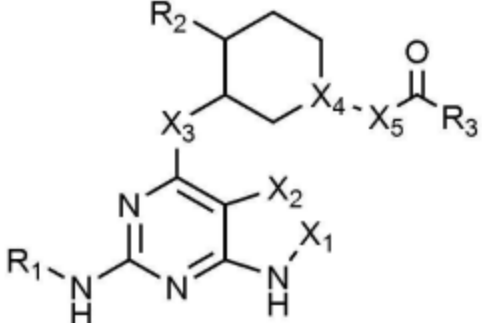
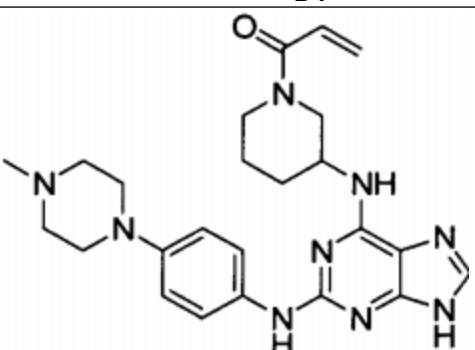
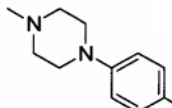
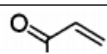
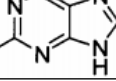
Características esenciales	D1
	 (página 42, compuesto 1-10) (ver además la reivindicación 1)
R ¹ es arilo C ₆ sustituido con piperazinilo sustituido con C1	
R ² es H	H
R ³ es alquenilo C ₂ sin sustituir	
X ₁ es CR ⁴ , donde R ⁴ es H	
X ₂ es N	
X ₃ es NR ⁶ donde R ⁶ es H	NH
X ₄ es N	N
X ₅ es	enlace

Tabla 2. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

Características esenciales	D2
----------------------------	----

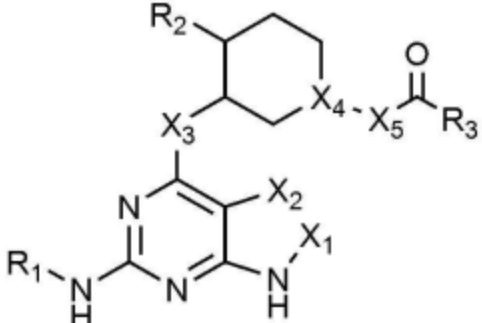
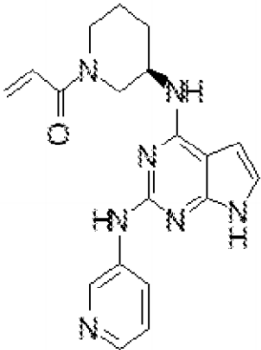
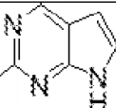
¹URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?CC=WO&NR=2010129053A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20101111&DB=&locale=en_EP

²URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2015083028&KC=&locale=en_EP&FT=E

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

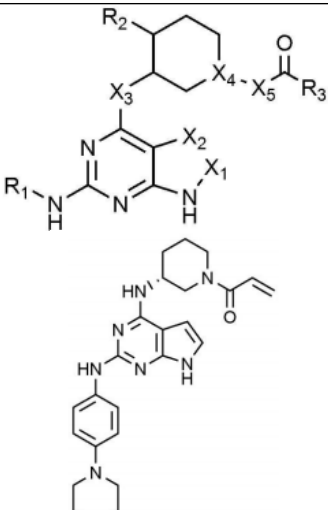
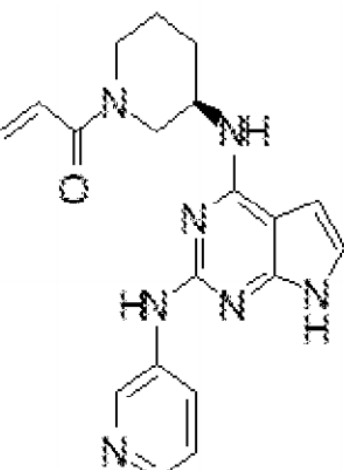
	 (página 221, compuesto 63)
R ¹ es heteroarilo C ₆ que contiene un N	
R ² es H	H
R ³ es alqueno C ₂ sin sustituir	
X ₁ es CR ⁴ , donde R ⁴ es H	
X ₂ es CR ⁵ , donde R ⁵ es H	
X ₃ es NR ⁶ donde R ⁶ es H	NH
X ₄ es N	N
X ₅ es	enlace

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales de los compuestos de fórmula química I de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en los documentos D1 y D2, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

4.2. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 2 consiste en: “*Compuesto o sal farmacéuticamente aceptable del mismo según la Reivindicación 1, donde R1 es benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo o piridinilo*” (Radicado N° NC2018/0013293, del 07 de diciembre de 2018).

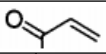
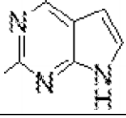
Tabla 3. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2
 (Ejemplo 1)	 (página 221, compuesto 63)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

R ¹ es benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo.	
R ² es H	H
R ³ es alqueno C ₂ sin sustituir	
X ₁ es CR ⁴ , donde R ⁴ es H	
X ₂ es CR ⁵ , donde R ⁵ es H	
X ₃ es NR ⁶ donde R ⁶ es H	NH
X ₄ es N	N
X ₅ es	enlace

D2 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 2, porque enseña derivados de pirrolo[2,3-d]pirimidinil y pirrolo[2,3-d]piridinil acrilamidas, los cuales presentan actividad sobre quinasas Janus, particularmente actividad sobre quinasas tipo JAK3.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 2 y lo revelado en D2, consiste en R¹ cuando es benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo.

No obstante dicha diferencia no parece conceder un efecto técnico a la presente invención.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos revelados en D2, para proveer derivados de pirrolo[2,3-d]pirimidina y pirazolo[3,4-d]pirimidina alternativos a los conocidos en el estado del arte?

Sin embargo, D2 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. En dicho documento se enseñan compuestos que son estructuralmente muy similares a los de la presente invención, en donde a la única diferencia consiste en las posibles variables del sustituyente R¹ que pueden ser benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo y pirazolilo (esto teniendo en cuenta que cuando R¹ es piridinilo ya se estudió por novedad). Tales diferencias en este tipo de sustituciones sobre R¹ no obstante no le otorgan un nivel inventivo a la presente invención, porque al revisar los ensayos del capítulo descriptivo de la presente invención, no se nota que los resultados de inhibición sobre JAK3 sean superiores a los ya conocidos y reportados en D2. Lo anterior puede comprobarse cuando revisamos el IC₅₀ del compuesto 63 de D2, el cual reportó un valor de 9.1 nM sobre JAK 3, pero existen otros inclusive inferiores como el compuesto 18, (0.2nM), el compuesto 44 (0.3 nM), el compuesto 19 (0.6 nM), entre otros, los demuestran actividad del mismo orden y estadísticamente similares a los encontrados en la tabla 1 del capítulo descriptivo. Por lo anterior, no se observa una superioridad técnica de los compuestos de la presente invención, sobre los ya conocidos en D2 y por ello no se puede reconocer el requisito de nivel inventivo.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los compuestos de D2, habría podido modificar alguno de los sustituyentes, de manera alternativa, para llegar así al objeto de la reivindicación 2 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 3 a 13 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

5. Conclusión

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

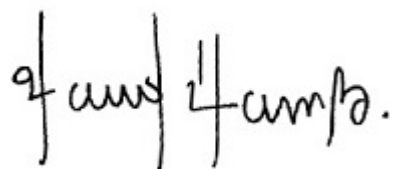
Los requisitos de Patentabilidad de la presente solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2010129053	1	Novedad
D2	WO2015083028	1 2 a 13	Novedad Nivel inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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 modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

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 recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0013293		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/KR2017/006980		30 de junio de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
30 de junio de 2016				X					
Solicitante									
DAEWOONG PHARMACEUTICAL CO. LTD.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	14	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 13
Palabras clave utilizadas	Pirazolopyrimidine; kinase inhibitor; JAK, JAK3; BTK; pyrrolo[2,3-d]pyrimidinyl ; Pyrrolo[2,3-B]Pyrazinyl ; Pyrrolo[2,3-D]Pyridinyl.
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 487/04, C07D 403/12, C07D 403/14, C07D 401/14, A61K 31/519, A61K 31/496.
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
EPO	WO2010129053	11/Noviembre/2010	1	(página 42, compuesto 1-10) (ver además la reivindicación 1)	X,Y
	WO2015083028	11/Junio/2015	1 a 13	(página 221, compuesto 1-13)	X,Y
	US2016002243	07/Enero/2016	N/A	N/A	A
	WO2009131687	29/Octubre/2009	N/A	N/A	A
Patbase	WO08039218	03/Abril/2008	N/A	N/A	A
Orbit	WO2009054941	21/Octubre/2008	N/A	N/A	A
	WO2007007919	13/Julio/2006	N/A	N/A	A
	WO2011068899	01/Diciembre/2010	N/A	N/A	A
	WO2009012283	16/Julio/2008	N/A	N/A	A
	CA2849357	21/Septiembre/2012	N/A	N/A	A
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.					
O					

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2765 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.	
(2) Categorías de documentos citados	
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.
Fecha del reporte de búsqueda: (29/Abril/2019)	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ	