

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9950 de 12 de septiembre 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 del 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. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 14 de agosto de 2019, bajo el número NC2018/0013293, por ajustarse a los requisitos legales.

2. 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 12 del radicado N° NC2018/0013293 del 14 de agosto de 2019.

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.

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
D2	WO2015083028	“Pyrrolo[2,3-D]pyrimidinyl, pyrrolo[2,3-B]pyrazinyl AND pyrrolo[2,3-D]pyridinyl	11/Junio/2015

Oficio N° 9950 de 12 de septiembre de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y lo revelado en el documento D2, consiste en R¹ cuando es benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo.

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 el documento D2. Lo anterior puede comprobarse cuando revisamos el IC₅₀ de la tabla 1 (pág. 207 en adelante), cuyos valores de inhibición sobre JAK 3, son de entre <0.1 nM y 3254 nM, para los compuestos del documento D2, y en la presente invención se muestran datos de actividad en el mismo rango entre 0.1 nM (comp. 136, pág. 193) y >400 nM (comp. 117, pág. 192). Es decir que se demuestra actividad del mismo orden y estadísticamente similar entre los compuestos de la presente invención y los ya conocidos del documento D1. Por lo anterior, no se observa una superioridad técnica de los compuestos de la presente invención, sobre los ya conocidos en el documento D2 y por ello no se puede reconocer el requisito de nivel inventivo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos revelados en el documento 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, el documento 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.

En este punto vale la pena anotar, que dichas modificaciones en los anillos conocidos, son variaciones de rutina para cualquier persona medianamente versada en la materia, quien reconoce las variaciones relacionadas con isómeros clásicos y los bioisómeros, en donde una fracción –N= de un anillo se puede reemplazar por un –CH=, como es el caso del benceno por una piridina, y como se puede comprobar en la bibliografía básica².

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los compuestos del documento D2, habría podido modificar alguno de los sustituyentes, de manera alternativa, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 2 a 12 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

5. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D2	WO2015083028	1 a 12	Nivel inventivo

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

² URL: <https://www.fbioyf.unr.edu.ar/evirtual/pluginfile.../Isosterismo%20Alumnos.pdf>

Oficio N° 9950 de 12 de septiembre de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

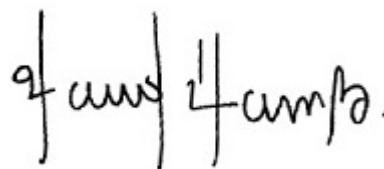
El solicitante menciona que con las modificaciones propuestas se superaría el requisito de novedad, puesto que ahora X_2 es CR^5 , donde R^5 es H y por tanto no debe considerarse el documento D1 como estado del arte que afecte dicho requisito. En cuanto a nivel inventivo, el solicitante manifiesta que D2 no menciona ni sugiere en ningún momento la introducción de un grupo benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo o pirazolilo en la posición correspondiente a R^1 de la pirrolo[2,3-d]pirimidina, que a partir de D2 se obtendrían compuestos con actividad inferior a la reportada cuando el sustituyente R^1 es benzotiazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, fenilo, pirazolilo, que es contrario a la sugerencia de piridina en el documento D2. Por lo anterior, señala que dicho requisito de nivel inventivo se encontraría afectado.

Como respuesta a dichos argumentos, esta Oficina considera que en efecto, con las modificaciones propuestas, el requisito de novedad se considera superado sobre el documento D1. Pero no sucede lo mismo con el requisito de nivel inventivo, ya que como se mencionó anteriormente, en el examen de patentabilidad, la actividad de los compuestos de la presente invención es prácticamente la misma que la reportada previamente en los compuestos del documento D2 y la modificación sobre R^1 no le está aportando ningún efecto técnico sorprendente o inesperado a los compuestos de la presente solicitud. Ahora bien, no es cierto el argumento del solicitante según el cual no habría motivación suficiente para llegar a los compuestos de la presente invención, a partir de los compuestos del documento D2, ya que como también se mencionó anteriormente, los cambios de anillos que son considerados isómeros clásicos, pueden ser realizados a partir de la bibliografía básica, o los conocimientos del técnico medio, sin que eso constituya en sí un avance técnico o sorprendente que sustente el nivel inventivo. Más aún como en el presente caso, que ni siquiera mostraron actividad superior a la reportada en el documento D2.

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



Oficio N° 9950 de 12 de septiembre de 2019

Ref. Expediente N° NC2018/0013293

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0013293		1°		2°	X	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	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 12
Palabras clave utilizadas	Pyrazolopyrimidine; 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	N/A	N/A	A
	WO2015083028	11/Junio/2015	1 a 13	(página 221, compuesto 1-13)	X
	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					

Oficio N° 9950 de 12 de septiembre 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: 10-09-2019	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ	