

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

Señor(a)
PFIZER INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“DERIVADOS DE PIRAZOLO[1,5-A]PIRAZIN-4-IL O COMO INHIBIDORES DE JAK”**.

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/IB2017/050748

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 10 de febrero de 2017.

PRIORIDAD(ES): US62/299,130 del 24 de febrero 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 29 del radicado N° NC2018/0008799 del 23 de agosto de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos inhibidores de proteínas tirosina quinasas celulares.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona Un compuesto que tiene la siguiente estructura (I) y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

2. Excepción de Patentabilidad (Art. 20 Decisión 486 literal (d))

El objeto de la reivindicaciones 25 a 29 no es patentable de acuerdo con el artículo 20 de la Decisión 486, literal d, toda vez que hacen referencia a métodos de tratamiento de una enfermedad o afección para la cual se indica un inhibidor de Tyk2.

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La reivindicación 1 no es concisa cuando allí se encuentran los siguientes términos: “heteroarilo” y “heterocíclico”, con los cuales se podrían presentar múltiples opciones de diferentes composiciones que no tienen sustento en la descripción. Se requiere señalar la cantidad y el tipo de heteroátomos en cada uno de los casos.

La anterior objeción aplica para las reivindicaciones 2, 3, 5, 7 y 9.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

4. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de patente de la cual se invoca prioridad: 24 de febrero de 2016, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2011130146	"5,7-substituted-imidazo[1,2-c]pyrimidines as inhibitors of JAK kinases"	20/Octubre/2011

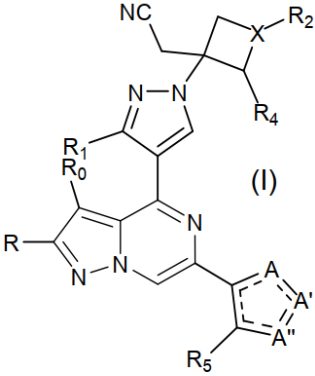
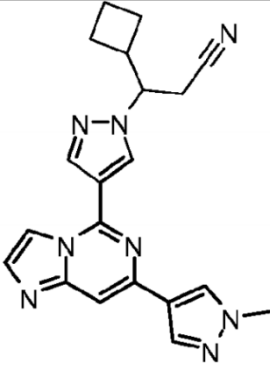
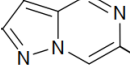
D1¹ enseña (resumen) compuestos heterocíclicos derivados de imidazo[1,2-c]pirimidinas 5,7-sustituidas, que actúan como inhibidores de quinasas JAK.

5. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

4.1. Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 reclama *"Un compuesto que tiene la siguiente estructura (I):"*... (Radicado No. NC2018/0008799 del 23 de agosto de 2018)

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

Características esenciales	D1
 (I)	 (ejemplo 20)
R ⁰ es H	H
R ¹ es H	H
R es H	H
X es C-R ³ donde R ³ es H	
A es C-R' donde R' es H	CH
A' es N-R'' donde R'' es alquilo C ₁	>N-CH ₃
A'' es N	N
R ⁵ es H	H
Anillo central 	---

1URL:https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/description?CC=WO&NR=2011130146A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20111020&DB=&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, porque divulga compuestos heterocíclicos derivados de imidazo[1,2-c]pirimidinas 5,7-sustituidas, que actúan como inhibidores de quinasas JAK.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y lo revelado en D1, consiste en el anillo central, el cual es una pirazolo[1,5-a]pirazina y en la posición del anillo de ciclobutano.

No obstante dichas diferencias no parecen conceder un efecto técnico a la presente invención, porque a partir de la información de la descripción no es posible determinarlo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos revelados en D1, para proveer inhibidores de proteínas tirosina quinasas celulares, alternativos a los conocidos en el estado del arte?

Sin embargo, D1 ya realizaba sugerencias para llegar a la presente invención. D1 revela compuestos con actividad inhibidora de quinasas JAK1, JAK2, JAK3 y TYK2, por tanto adecuados contra patologías tales como proliferativas, inflamatorias, autoinmunes, metabólicas, entre otras, cuya estructura corresponde a derivados de pirazol -imidazo[1,2-c]pirimidinas 5,7-sustituidas. Si bien existe diferencia en la posición en la que se encuentra el nitrógeno del anillo central y en la posición del anillo de ciclobutano, cuando revisamos los datos de actividad de los compuestos de la presente invención, no se puede comprobar que sean mejores a los reportados en D1.

Adicionalmente, tal como se puede comprobar a partir de la bibliografía básica², la variación de los nitrógenos en los anillos bicíclicos del tipo imidazo-pirimidinas sustituidas en inhibidores de tirosinas quinasas, son variaciones que ya se conocían en el estado del arte, en donde puede encontrarse diferentes posiciones de los heteroátomos de nitrógeno, sin que ello constituya en sí un efecto técnico sorprendente o inesperado.

Lo anterior puede comprobarse, cuando se analizan los datos de IC₅₀ de TYK2, JAK1, JAK2 y JAK3 de la tabla I de la descripción, cuyos resultados se encuentran en la misma escala de los compuestos de la tabla A de D1 y no puede observarse que exista superioridad o ventaja alguna sobre dichas quinasas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia al observar los compuestos de D1, habría podido modificar alguno de sus heteroátomos o 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 24 no contemplan características que hagan inventiva la invención, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

6. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2011130146	1 a 24	Nivel Inventivo

2 HankeJ et al. "Discovery of a Novel, Potent, and Src Family-selective Tyrosine Kinase Inhibitor". 1996. THE JOURNAL OF BIOLOGICAL CHEMISTRY. Fig. 1

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

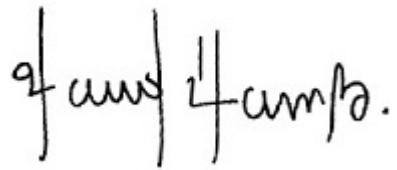
Oficio N° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

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° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0008799		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/IB2017/050748		10 de febrero de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
24 de febrero de 2016				X					
Solicitante									
PFIZER INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	25 a 29	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 24
Palabras clave utilizadas	JAK1, JAK2, JAK3 AND TYK2; IMIDAZO [1,2-C] PYRIMIDINES; INHIBITORS OF JAK KINASES; NEURODEGENERATIVE DISEASES; AUTOIMMUNE OR INFLAMMATORY DISEASES; CANCERS OR TUMORS; (CYANOMETHYL)-3-(4-(6-(1-ALKYL-1H-PYRAZOL-4-YL)PYRAZOLO[1,5-A]PYRAZIN-4-YL)-1H-PYRAZOL-1-YL)CYCLOBUTANE-1-CARBONITRILE.
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 487/04, A61K 31/4985, A61P 37/02, A61P 29/00, A61P 25/28
	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	WO2011130146	20/Octubre/2011	1 a 24	N/A	X,Y
	WO2016090285	09/Junio/2016	N/A	N/A	A,P
USPTO	KISSELEVA et al	2014	N/A	N/A	A
ORBIT	WO2009/062258	13/Noviembre/2008	N/A	N/A	A
	WO2009/035575	07/Septiembre/2008	N/A	N/A	A
	CA2875990	22/Mayo/2013	N/A	N/A	A
	WO2007/077435	28/Diciembre/2006	N/A	N/A	A
	CA3000973	08/Junio/2009	N/A	N/A	A
	WO2012/139930	02/Abril/2012	N/A	N/A	A
Patbase	WO07070514	21/Junio/2007	N/A	N/A	A
	WO11068881	09/Junio/2011	N/A	N/A	A
STN	HankeJj et al.	1996	1 a 24	N/A	X,Y

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1158 de 22 de enero de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0008799

(¹) Cita completa literatura no patente (LNP)	
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen</i> (Número), pp-pp.	
O	
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: 20/Junio/2019	
Examinador: NELSON RICARDO VELASCO GONZALEZ	