

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

Señor(a)
INCYTE CORPORATION

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“COMPUESTOS HETEROCÍCLICOS COMO INMUNOMODULADORES”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2017/038120

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 19 de junio de 2017.

PRIORIDAD(ES): US 62/352,485 20 de junio de 2016.

US 62/396,353 19 de septiembre 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 25 del radicado N° NC2019/0012111 del 29 de octubre de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar moduladores de la interacción proteína/proteína de PD-1/PD-L1 para el tratamiento de cáncer y enfermedades infecciosas.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I) derivados de fenil sustituido-heterociclil-piridin-2-carboxamida como moduladores de la interacción proteína/proteína de PD-1/PD-L1.

2. De la solicitud de patente

2.1. Título

El nombre de la invención de que se trata en el artículo 27 literal d) de la Decisión 486 deberá reflejar el objeto y el campo industrial con el cual se relaciona la misma y ser concordante con la materia descrita y las reivindicaciones de la solicitud. El nombre no podrá referirse a nombres personales, marcas de productos o nombres de fantasía.

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0012111 el 20 de octubre de 2019, tituló la invención como: “COMPUESTOS HETEROCÍCLICOS COMO INMUNOMODULADORES”. Este título no se relaciona con el objeto de la solicitud contenido en la descripción y las reivindicaciones, por lo cual se sugiere el título siguiente: “COMPUESTOS DERIVADOS DE FENIL SUSTITUIDO-HETEROCICLIL-PIRIDIN-2-CARBOXAMIDA Y UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE LOS CONTIENE”.



Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

3. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- Las reivindicaciones 1, 2, 17, 18, 21-23 no son claras porque menciona el término “*opcionalmente*”, el cual no es limitativo porque hace opcional la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere eliminar el término “*opcionalmente*”.
- Las reivindicaciones 1, 2, 9-25 no son concisas porque las definiciones para R1, R2, R3, R4, R5, R6, R7, R8, R9, R11, Ra, Rb, Rc, Rd, Re, Rg, Rh, Ri, Rk, Ro, Rr, Rq tienen un número indefinido de posibilidades en sus significados. Se sugiere restringir a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentren debidamente sustentados.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 20 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:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2009039397	“Certain substituted amides, method of making, and method of use thereof”	26 de marzo de 2009
D2	US2004018986	“Inhibitors of serine proteases, particularly HCV NS3-NS4A protease”	29 de enero de 2004

El documento D1¹ divulga compuestos derivados de amida sustituida que inhiben Btk y/o la actividad de la célula B, se utilizan para el tratamiento de enfermedades alérgicas y/o autoinmunes y/o inflamatorias tales como: SLE, artritis reumatoidea, vasculitis múltiple, trombocitopenia idiopática, miastenia gravis, rinitis alérgica y asma, cáncer, linfoma y leucemia (Resumen, pág. 2, Párr. [0008]; reivindicación 1).

El documento D2² divulga compuestos de carboxamida que inhiben la actividad de la serina proteasa, particularmente la actividad de la proteasa NS3-NS4A del virus de la hepatitis C. Como tales, actúan interfiriendo con el ciclo de vida del virus de la hepatitis C y también son útiles como agentes antivirales (Resumen; Pág. 12, Párr. [0389]-pág. 13, Párr. [0390]; Reivindicaciones).

¹<http://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/040377565/publication/WO2009039397A2?q=WO2009039397>

²<http://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/029250748/publication/US2004018986A1?q=us2004018986>

Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

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

5.1. Nivel inventivo (Art. 18 Decisión 486)

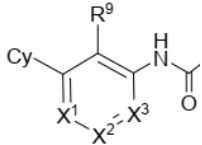
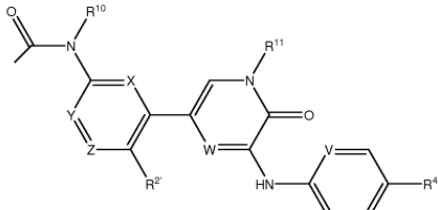
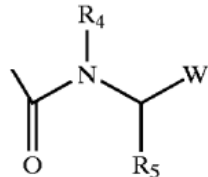
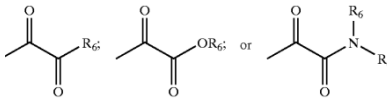
La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto representado por la siguiente Fórmula Química 1 (...)” (Radicado N° NC2019/0007834 del 22 de julio de 2019).

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

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula I:	Un compuesto de fórmula: (Resumen, pág. 2, Párr. [0008]; reivindicación 1)	Un compuesto de fórmula: (Resumen, Pág. 12, Párr. [0389]-pág. 13, Párr. [0390]; reivindicaciones)
	R1= (Reivindicación 1):	
G1= NR6 y G2= CR7R7 o G1= CR6R6 y G2= NR7 Donde R6 y R7= H, halo, alquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, haloalquilo C1- 6, haloalcoxi C1-6, arilo C6-10 (...) Corresponde a:		

Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

 $X^1 = N \text{ o } CR^1$ $X^2 = N \text{ o } CR^2$ $X^3 = N \text{ o } CR^3$ Cy= fenilo, 2-tiofenilo, 3-tiofenilo, 2-piridilo, 3-piridilo, 4-piridilo, 3,6-dihidro-2H-piran-4-ilo, ciclohexilo, ciclohexenilo, 2,3-dihidro-1, 4-benzodioxin-6-ilo, (...) R^9= halo, alquilo C_{1-6}, alquenilo C_{2-6}, alquinilo C_{2-6}, haloalquilo C_{1-6}, haloalcoxi C_{1-6}, arilo C_{6-10}, cicloalquilo C_{3-10}, heteroarilo de 5-14 miembros, (...)	 (Reivindicación 1)	 R^4= Arilo C_{6-10}-alifático C_{1-12} $W =$  R^5= alifático C_{1-12}, donde algún hidrógeno se puede reemplazar por halógeno
---	--	---

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 amida sustituida que inhiben Btk y/o la actividad de la célula B, se utilizan para el tratamiento de enfermedades alérgicas y/o autoinmunes y/o inflamatorias tales como: SLE, artritis reumatoidea, vasculitis múltiple, trombocitopenia idiopática, miastenia gravis, rinitis alérgica y asma, cáncer, linfoma y leucemia (Resumen, pág. 2, Párr. [0008]; reivindicación 1).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado de D1 consiste en que el anillo fusionado con el anillo de 5 miembros tiene nitrógeno y el anillo de 5 miembros tiene nitrógeno en lugar de azufre.

No se evidencia un efecto asociado al incluir el nitrógeno en el anillo fusionado con el anillo de 5 miembros puesto que la descripción revela datos de IC50 de PD-1/PD-L1 de los ejemplos 1-42, pero no hay datos comparativos y que demuestren un efecto sorprendente o mejorado frente al estado de la técnica.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 con el fin de obtener un compuesto alternativo?

Sin embargo, el incluir el nitrógeno en el anillo fusionado con el anillo de 5 miembros y un azufre en el anillo de 5 miembros para obtener el compuesto de fórmula I, ya está divulgado en el documento D2 que se refiere a compuestos de carboxamida que inhiben la actividad de la serina proteasa, particularmente la actividad de la proteasa NS3-NS4A del virus de la hepatitis C, también son útiles como agentes antivirales (Resumen; Pág. 12, Párr. [0389]-pág. 13, Párr. [0390]; Reivindicaciones).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un nitrógeno en el anillo fusionado con el anillo de 5 miembros y un azufre en el anillo de 5 miembros del documento D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Oficio N° **11986** de **25 de septiembre de 2020**

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

Las reivindicaciones dependientes 2 a 24, así como la reivindicación 25 tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 24 y 25 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

6. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2009039397	1 a 25	Nivel inventivo
D2	US2004018986	1 a 25	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.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0000386		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2017/038120		19 de junio de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
20/06/2016				X					
Solicitante									
INCYTE CORPORATION									
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	1-25
Palabras clave utilizadas	CARBOXAMIDE, IMIDAZO-CARBOXAMIDE, CANCER, PD1, INHIBITOR KINASE
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 487/04, C07D 513/04, A61P 35/00
	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⁾
ISA	WO2009039397	26/03/2009	1-25	Resumen, pág. 2, Párr. [0008]; reivindicación 1	Y
	WO2013157021	24/10/2013	-	-	A
Patbase	US2003191115	9/10/2003	-	-	A
	US2004018986	29/01/2004	1-25	Resumen; Pág. 12, Párr. [0389]-pág. 13, Párr. [0390]; Reivindicaciones	Y
STNext	US7691870	6/04/2010	-	-	A
	EP0361069	15/06/1994	-	-	A
	EP1644370	12/04/2006	-	-	A
	WO2008114002	25/09/2008	-	-	A
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(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.			“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		
“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.					

Oficio N° 11986 de 25 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0000386

“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.	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: (8/08/2020)	
Examinador: LINA PATRICIA FORERO TOBARIA	