

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 12193 de 28 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0006473

Señor
TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “COCRISTAL DEL COMPUESTO (S)-3-(1-((1-ACRILLOILPIRROLIDIN-3-IL)OXI) ISOQUINOLIN-3-IL)-1H-1,2,4-TRIAZOL-5(4H)-ONA Y ACIDO GENTÍSICO, MÉTODO DE PRODUCCIÓN DEL MISMO Y FORMULACIONES QUE CONTIENEN DICHO COCRISTAL”

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/JP2016/089224

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 22 de diciembre de 2016.

PRIORIDAD: 24/12/2015, JP (JAPON), 2015-252658

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 07 de julio de 2020, bajo el número NC2018//0006473, 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 15 del radicado N° NC2018//0006473 del 07 de julio de 2020.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de diseñar compuestos derivados de triazolona de piridinilo con mejores propiedades de disolución y capacidad de absorción oral inhibidores de inhibidor de la tirosina quinasa de Bruton (BTK) para el tratamiento de enfermedades, trastornos o afecciones pueden implicar el sistema inmune y la inflamación.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto cocrystal (S)-3-(1-((1-acriloilpirrolidin-3 il)oxi)isoquinolin-3-il)-1H-1,2,4-triazol-5(4H)-ona y un método de producción del mismo, con mejores propiedades de disolución y absorción oral.

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- Las reivindicaciones 1, 4 y 7 no son claras, ya que el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP), medido entre 5°,2θ hasta 90°,2θ, debe complementarse con otras técnicas como las siguientes: las espectroscopías Raman e IR, la espectroscopía



Oficio N° 12193 de 28 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0006473

RMN-C13 o los métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC. Se sugiere incluir alguna de las técnicas complementarias mencionadas al DRXP para caracterizar y diferenciar la forma polimórfica, según lo sustentado en la descripción.

- La reivindicación 4 no es clara, ya que reclama otro cocrystal, pero los picos 13,06+/-0,2 y 5,24 +/-0,2 se solapan con los picos 13,04 +/-0,2 y 5,28+/-0,2, lo que no permite identificar que se trate de un cocrystal distinto del reclamado en las reivindicaciones 1 y 7. Esto también afecta sus reivindicaciones dependientes 5 y 6. Se sugiere caracterizar y diferenciar cada forma polimórfica adecuadamente.
- La reivindicación 7 reclama otro cocrystal pero el picos 5,98+/-0,2 se solapa con el pico 5,96+/-0,2, lo que no permite identificar que se trate de un cocrystal distinto al reclamado en las reivindicaciones 1 y 4. Esto también afecta sus reivindicaciones dependientes 8 y 9. Se sugiere caracterizar y diferenciar cada forma polimórfica adecuadamente.
- La reivindicación 11 no es clara, ya que el método reclamado depende de la composición reclamada en la reivindicación 1, sin embargo, el procedimiento debe ser caracterizado por una secuencia de etapas técnicas que inciden sobre una materia y que se encaminen a la obtención de la composición. Se sugiere que dicho método no dependa de la reivindicación uno y solo se caracterice por su secuencia lógica de etapas.
- De la descripción se desprende que las características: velocidad de agitación, temperatura de agitación, tiempo de agitación, volumen de solventes, cantidad de cristal de siembra son esenciales para la invención, puesto que forman parte de la solución al problema a resolver, pero estas características no se mencionan en las reivindicaciones, de tal manera, las reivindicaciones no definen la materia que se desea proteger. Se sugiere incluir estas características esenciales en las reivindicaciones 11-15.

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 24 de diciembre de 2015, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad. Sin embargo, consultadas las fuentes de información con las que se cuenta hasta la fecha, no se encontraron documentos que anticipen el objeto de la solicitud tal y como se encuentra reivindicado.

5. Respuesta a los argumentos del solicitante

Argumentos respecto a claridad del pliego reivindicatorio

El solicitante argumenta que *“las modificaciones introducidas, de forma que las reivindicaciones que definen el cocrystal se encuentran debidamente caracterizadas por el patrón de rayos X relativo a los ángulos 2θ correspondientes a 9 picos. Tal como se indicó anteriormente, la Descripción solamente provee soporte para un máximo de 9 picos, por lo que no es posible adicionar más. En todo caso, el cocrystal se encuentra definido de forma suficientemente clara y concisa, conforme a la práctica aplicable”*.

Al respecto, este Despacho manifiesta que, el patrón de difracción de rayos X en polvo (DRXP), medido entre 5°,2θ hasta 90°,2θ, debe complementarse con otras técnicas como las siguientes: las espectroscopías Raman e IR, la espectroscopía RMN-C13 o los



Oficio N° 12193 de 28 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0006473

métodos de análisis térmico: TGA, DTA y DSC. Se sugiere incluir alguna de las técnicas complementarias mencionadas al DRXP para caracterizar y diferenciar la forma polimórfica. Así mismo, la reivindicación 4 no es clara, ya que, aunque reclama otro cocrystal los picos 13,06+/-0,2 y 5,24 +/-0,2 se solapan con los picos 13,04 +/-0,2 y 5,28+/-0,2, lo que no permite identificar que se trate de un cocrystal distinto del reclamado en las reivindicaciones 1 y 7. Esto también afecta sus reivindicaciones dependientes 5 y 6. De igual forma la reivindicación 7 reclama otro cocrystal pero el picos 5,98+/-0,2 se solapa con el pico 5,96+/-0,2, lo que no permite identificar que se trate de un cocrystal distinto al reclamado en las reivindicaciones 1 y 4. Esto también afecta sus reivindicaciones dependientes 8 y 9. Se sugiere caracterizar y diferenciar cada forma polimórfica adecuadamente.

Argumentos respecto a Nivel inventivo

El solicitante sostiene “el documento D2 revela: *“Sin embargo, en general, la predicción de si ocurrirá la cocrystalización aún no es posible y, en la actualidad, debe responderse empíricamente”* (página 362, columna izquierda, líneas 14-17). Como puede establecer una persona experta, ni D1 ni D2 realmente revelan la formación de un cocrystal del compuesto (A) y ácido gentísico (...). Además, como se enseña en D2 (...) la solubilidad de los cristales puede disminuir. Por el contrario, la solubilidad del cocrystal del compuesto (A) y el ácido gentísico de la presente invención se mejora con respecto a la del compuesto (A) (véase la Tabla 21 de la presente solicitud). Dicha solubilidad mejorada del cocrystal del compuesto (A) y el ácido gentísico es impredecible a partir de las enseñanzas de D1, D2, o su combinación, incluso para una persona experta. Consecuentemente, la presente invención es inventiva sobre D1 y D2”.

Al respecto, este Despacho manifiesta que, de acuerdo al capítulo reivindicatorio modificado radicado N° NC2018//0006473 del 07 de julio de 2020, al solicitante le asiste la razón.

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° **12193** de **28 de septiembre de 2020**

Ref. Expediente N° NC2018/0006473



Oficio N° 12193 de 28 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0006473

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.			Examen de patentabilidad							
NC2018/0006473			1°		2°	X	3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.			Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/JP2016/089224			22 de diciembre de 2016							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO) 24/12/2015					Prioridad X			Presentación		
Solicitante										
TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED										
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 - 15					
Palabras clave utilizadas					Chemical structure, cocrystal, pyridinyl triazolone derivative, inhibitor of Bruton' s tyrosine kinase.					
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda					CIP:	C07D 401/14, A61K 31/4725, A61P 35/00, C07C 65/05, C07C 65/10, C07C 55/08, C07C 57/145, C07C 59/245, C07C 59/265, C07C 59/54				

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	WO2014164558	09/10/2014	-	-	A
	YADAV A V., ET AL	01/07/2009	-	-	A
		Yadav, A. V., Shete, A. S., Dabke, A. P., Kulkarni, P. V., & Sakhare, S. S. (2009). Co-crystals: a novel approach to modify physicochemical properties of active pharmaceutical ingredients. <i>Indian Journal of Pharmaceutical Sciences</i> , 71(4), 359.			
Espacenet	US 2007/0026078	01/02/2007	-	-	A
STNext	WO 2011/067571	09/06/2011	-	-	A
	Stilinovic, V. et al. <i>Crystal growth & design</i>	01/10/2012	-	-	A
		Stilinovic, V., & Kaitner, B. (2012). Salts and co-crystals of gentisic acid with pyridine derivatives: the effect of proton transfer on the crystal packing (and vice versa). <i>Crystal growth & design</i> , 12(11), 5763-5772. Recuperado de: https://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/cg301267h .			
Googlepatents	US 7,718,662	18/05/2010	-	-	A
	US 9,138.436	22/09/2015	-	-	A
	US 2009/031844	24/12/2009	-	-	A

(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.	“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
---	---

Oficio N° 12193 de 28 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2018/0006473

“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.	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: (03/08/2020)	
Examinador: Diana Patricia Rey Padilla	