

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

Señor(a)
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

TÍTULO DE LA SOLICITUD: ***“COMPUESTOS 8-(AZETIDÍN-1-IL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINILO, COMPOSICIONES Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS”***

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2017/072034

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 2 de septiembre de 2017.

PRIORIDAD: CN PCT/CN2016/098215 6 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. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 8 de mayo de 2019, bajo el número NC2019/0002171, 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 26 del radicado N° NC2019/002171 del 8 de mayo de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar inhibidores de quinasas de Janus tal como JAK1 para el diagnóstico o tratamiento de enfermedades autoinmunitarias, inflamatorias y cáncer.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto 8-(azetidín-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-A]piridinilo como inhibidor de JAK, así como sus composiciones, para el manejo de enfermedades autoinmunitarias, inflamatorias y cáncer.

3. De la solicitud de patente

3.1. 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.



Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

El solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2019/0002171 el 8 de marzo de 2019, tituló la invención como: “COMPUESTOS 8-(AZETIDÍN-1-IL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINILO, COMPOSICIONES Y MÉTODOS DE UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS”. 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 8-(AZETIDÍN-1-IL)-[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PIRIDINILO Y UNA COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA QUE LOS CONTIENE”.

4. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- Las reivindicaciones 1, 3, 5, 6, 8, 9, 10, 14, 16, 17, 18, no son claras toda vez que mencionan el término “*opcionalmente*” el cual no es limitativo porque hace opcional la característica y no limita el alcance de las reivindicaciones. Se sugiere eliminar el término “*opcionalmente*” de la reivindicación independiente o reemplazarlo por un término preciso.
- La reivindicación 1 no es concisa porque el significado de los grupos funcionales R2, R1a, R1b, R1c, Ra, Rb, Rc no definen con precisión el objeto que se está reivindicando. Se sugiere restringir estos grupos de acuerdo con los compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentren debidamente sustentados. De otro lado, la reivindicación 1 no es clara por cuanto menciona en la definición de Ra y Rb: “*alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente*”. Se sugiere retirar el término “*opcionalmente*” de la reivindicación independiente, pero puede ir en reivindicaciones dependientes.
- En las reivindicaciones 1, 2, 13, 26, no tienen sustento en la descripción los siguientes términos: “*estereoisómero, tautómero, solvato, profármaco*”. Se sugiere eliminarlos de dichas reivindicaciones.
- La reivindicación 25 no es clara porque hace referencia a la descripción según la expresión “*seleccionado de la Tabla 1*”. Se sugiere eliminar la referencia a la descripción.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 6 de septiembre 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	WO2009155551	“Triazolopyridine JAK inhibitor compounds and methods”	23 de diciembre de 2009
D2	WO2014186706	“Bipyrazole derivatives as JAK inhibitors”	20 de noviembre de 2014

El documento D1¹ divulga compuestos de triazolopiridina de Fórmula I, que son inhibidores de las quinasas Janus, así como composiciones que contienen estos compuestos y métodos de uso que incluyen, entre otros, diagnóstico o tratamiento in

¹<http://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/041434469/publication/WO2009155551A1?q=WO2009155551>

Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

vitro, in situ e in vivo de células de mamífero donde el método para tratar o disminuir la gravedad de una enfermedad o afección responde a la inhibición de una o más actividades de la quinasa Janus, seleccionadas entre JAK1, JAK2, JAK3 y TYK2, en un paciente (Resumen; Pág. 4, Párr. [0010]-[0013]; Reivindicaciones 1, 44).

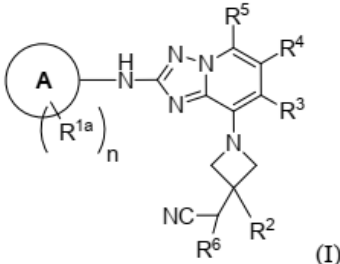
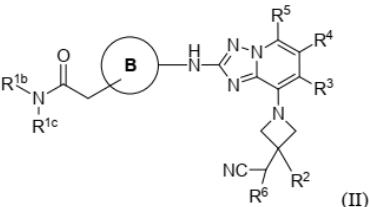
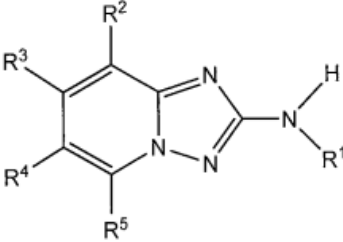
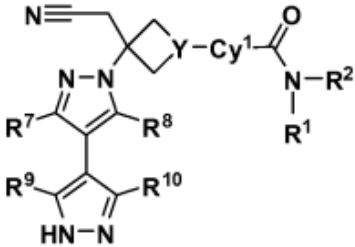
El documento D2² divulga compuestos derivados de bipirazol, así como sus composiciones y métodos de uso, que modulan la actividad de la quinasa de Janus (JAK) y son útiles en el tratamiento de enfermedades relacionadas con la actividad de JAK que incluyen, por ejemplo, trastornos inflamatorios, trastornos, cáncer y otras enfermedades (Resumen; Pág. 4, lín. 1-21; Pág. 105-106, Ej. A; Reivindicaciones: 1-4, 42).

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

6.1. Nivel inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “*Un compuesto de fórmula (I) o (II) (...)*” (Radicado N° NC2019/002171 del 8 de mayo de 2019).

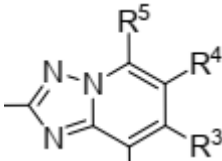
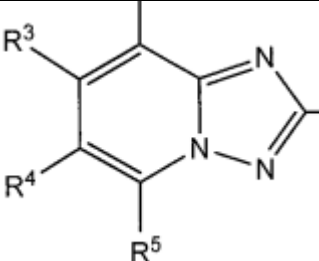
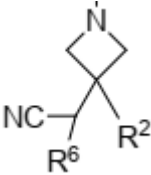
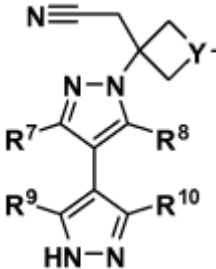
Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula (I) o (II):	Un compuesto de fórmula: (Resumen; Pág. 4, Párr. [0010]-[0013]; Reivindicaciones 1, 44).	Un compuesto de fórmula: (Resumen; Pág. 4, lín. 1-21; Pág. 105-106, Ej. A; Reivindicaciones: 1-4, 42).
 (I)  (II)		 I
Anillo A es: fenilo, piridinilo, pirazolilo, isoquinolinilo (R1a)n es halógeno, alquilo C1-C6 sustituido opcionalmente con halógeno, CN o OH, alcoxi C1-C6, cicloalquilo de 3 a 10 elementos, heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos, -C(O)-	H, COORa, fenil, heterociclil, heteroaril C1-9, donde dicho fenil y heteroaril están opcionalmente sustituidos por 1 a 5 R6 Donde R6 es H, alquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo, (...) halo, ciano, CF ₃ , C(O)Ra (...)	R1 es: alquilo C1-6, haloalquilo C1-6, cicloalquilo C3-7, heterocicloalquilo 4 a 7 miembros,, fenilo, fenil-alquil C1-3, hetreoarilo de 5 a 6 miembros o heteroaril-alquil C1-3 (...) (Reiv. 1)

²<http://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/050983151/publication/WO2014186706A1?q=WO2014186706>

Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

NRaRb, -C(O)- (heterocicloalquilo de 3 a 10 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C1- C6, heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos o -C(O)- heterocicloalquilo de 3 a 7 elementos sustituido opcionalmente con alquilo C1- C6) Anillo B es: Fenilo, heteroarilo de 5-6 elementos	(Reiv. 1).	
NH	NH (Reiv. 1).	CO-NR2, donde R2 es H (Reiv. 1)
 Donde R3, R4, R5= H, CH3, CH2CH3, OCH3, CF3, F, Cl	 Donde: R3, R4, R5= H, CH3, CH2CH3, OCH3, CF3, F, Cl (Reiv. 1).	Cy= fenil, piridil, pirimidinil, pirazinil, piridazinil, cada uno sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos seleccionados de R3, R4, R5, R6 (Reiv. 1)
 Donde R7 es: H, alquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, (C0-6 alquil)Ora, (...) halo, C(O)NRaRb, NRaC(O)Rb, SO2(alquil C1-6), CN, CF3, CH2CF3, nitro, (...) (Reiv. 1).	R2 es fenilo, heteroarilo C1-9, heterociclilo C1-9, opcionalmente sustituidos por 1 a 5 R7 Donde R7 es: H, alquilo C1-6, alquenilo C2-6, alquinilo C2-6, (C0-6 alquil)Ora, (...) halo, C(O)NRaRb, NRaC(O)Rb, SO2(alquil C1-6), CN, CF3, CH2CF3, nitro, (...) (Reiv. 1).	 (Reiv. 1).

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos de triazolopiridina de Fórmula I, que son inhibidores de las quinasas Janus, así como composiciones que contienen estos compuestos y métodos de uso que incluyen, entre otros, diagnóstico o tratamiento in vitro, in situ e in vivo de células de mamífero donde el método para tratar o disminuir la gravedad de una enfermedad o afección responde a la inhibición de una o más actividades de la quinasa Janus, seleccionadas entre JAK1, JAK2, JAK3 y TYK2, en un paciente (Resumen; Pág. 4, Párr. [0010]-[0013]; Reivindicaciones 1, 44).

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado de D1 consiste en el 8-azetidinil unido al núcleo de 1,2,4-triazolo[1,5-a]piridinilo.

El efecto que se logra al incluir el 8-azetidinil unido al núcleo de 1,2,4-triazolo[1,5-a]piridinilo es la inhibición de JAK1 y JAK2 (Descripción: Pág. 171-179).

Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

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 compuestos inhibidores de JAK1 y JAK2?

Sin embargo, el incluir el 8-azetidínil unido al núcleo de 1,2,4-triazolo[1,5-a]piridinilo para obtener el compuesto de fórmula I y II, ya está divulgado en el documento D2 que se refiere a compuestos que modulan la actividad de la quinasa de Janus (JAK) y son útiles en el manejo de enfermedades relacionadas con la actividad de JAK que incluyen, por ejemplo, trastornos inflamatorios, trastornos, cáncer y otras enfermedades (Resumen; Pág. 4, lín. 1-21; Pág. 105-106, Ej. A; Reivindicaciones: 1-4, 42).

De otro lado, el documento D2 también revela datos de IC50 de JAK1 y JAK2 que son muy similares a los mostrados por los compuestos de la presente solicitud (Pág. 105-106, Ej. A). Además, tanto el documento D1 como el D2 mencionan composiciones farmacéuticas que contienen los compuestos de fórmula (I).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir un 8-azetidínil unido al núcleo de 1,2,4-triazolo[1,5-a]piridinilo del documento D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 25 así como la reivindicación 26 tampoco cumplen con el requisito de nivel inventivo.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 25 así como la reivindicación 26 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.

7. 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	WO2009155551	1 a 26	Nivel inventivo
D2	WO2014186706	1 a 26	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 el 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 de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.



Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

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° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

**INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD**

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0002171		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2017/072034		2 de septiembre de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
6/09/2016				X					
Solicitante									
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG									
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	1-26
Palabras clave utilizadas	KINASE JANUS, JAK, CANCER, IMMFLAMATORY, AZETIDINE, PIRINIDILO, [1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PYRIDINYL
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 471/04, A61K 31/437, A61P 29/00
	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/Patbase	WO2009155551	23/12/2009	1-26	Resumen; Pág. 4, Párr. [0010]-[0013]; Reivindicaciones 1, 44	Y
	WO2014186706	20/11/2014	1-26	Resumen; Pág. 4, lín. 1-21; Pág. 105-106, Ej. A; Reivindicaciones: 1-4, 42	Y
Googlepatent	CA2718271	6/05/2014	-	-	A
	EP2288610	31/08/2016	-	-	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 incorrectos.
“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.	“X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.
“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.	“Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el
“O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique	

Oficio N° 14872 de 27 de noviembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0002171

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: (14/11/2020)	
Examinador: LINA PATRICIA FORERO TOBARIA	