

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

Señor(a)
GENENTECH INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“COMPUESTOS QUÍMICOS COMO INHIBIDORES DE LA ACTIVIDAD DE LA INTERLEUQUINA-1”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2018/014728

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 22 de enero de 2018.

PRIORIDADES: US 62/449,431 23 de enero de 2017

US 62/492,813 01 de mayo de 2017

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 99 del radicado N° NC2019/0009036 del 21 de agosto de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos de sulfonilurea y sulfonil tiourea que provean una alternativa útil a los compuestos conocidos como inhibidores de la actividad de interleuquina-1.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (Ie-Ih) y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

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

El objeto de las reivindicaciones 70 a 97 no es patentable de acuerdo con el artículo 20 de la Decisión 486, toda vez que estas se refieren a: un método de tratamiento o prevención de una enfermedad, trastorno, o condición que es sensible a la inhibición del inflamasoma, un método para modular la actividad de un blanco biológico y un método para inhibir la activación de un inflamasoma; que comprenden la administración o exposición de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (Ie), (If), (Ig) y/o (Ih), para de esa manera tratar o prevenir la enfermedad, el trastorno o la condición en un sujeto que lo requiere.

3. Reivindicaciones relativas a un uso (Art. 14 Decisión 486)

El uso de las reivindicaciones 98 y 99 no es patentable, de acuerdo con el artículo 14, teniendo en cuenta que aunque tiene preámbulo un compuesto de las reivindicaciones 1-



Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

68, se está caracterizando únicamente por su uso como un medicamento en el tratamiento de una enfermedad, trastorno o condición que es sensible a la inhibición del inflamasona.

4. De la solicitud de patente

4.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- Las reivindicaciones 1 a 5, 27, 28, 34. 35, 38, 41, 44, 53, 58 y 63 no son claras cuando mencionan la expresión "*opcionalmente*", la cual precediendo una característica no es limitativa, porque hace opcional la característica y no limita el alcance de las reivindicaciones. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.
- La reivindicación 1 describe una sustitución en R1 cuando el anillo comprende A y/o A¹, sin embargo, A¹ no se encuentra divulgado en las estructuras previamente señaladas. Se sugiere eliminar dicha referencia.
- La reivindicación 69 no es clara ya que menciona un vehículo farmacéuticamente aceptable, lo cual no se considera una característica esencial porque no se define mediante sus condiciones técnicas esenciales (proporciones, cantidades). Se sugiere aclaración sobre los componentes de la composición que se desea proteger.
- El capítulo reivindicatorio no es claro, ya que presenta 99 reivindicaciones donde en cada una de éstas reclaman un elemento diferente de la invención. Lo anterior se fundamenta en que el capítulo descriptivo ilustra que todos los elementos de las reivindicaciones independientes hacen parte de la misma invención que corresponde a compuestos de fórmula (I) con pequeñas variaciones en los sustituyentes. De acuerdo con lo anterior, el solicitante debe replantear el capítulo reivindicatorio, de manera que en la reivindicación independiente se incluyan las características esenciales de la invención que el solicitante desea proteger, y en las reivindicaciones dependientes se describan características particulares de algún elemento de la reivindicación independiente. Las reivindicaciones dependientes se distinguen porque en su preámbulo hacen referencia a alguna reivindicación que la precede, de la siguiente manera: "Dispositivo para control de plagas y malezas de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por...".
- El capítulo reivindicatorio contiene un excesivo número de reivindicaciones independientes que repiten materia, en consecuencia, presentan el mismo alcance.

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 23 de enero de 2017 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO/2016/131098	"Sulfonylureas and related compounds and use of same"	25 de agosto de 2016

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

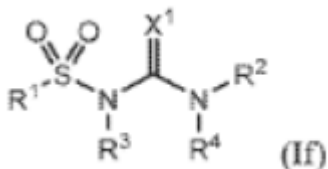
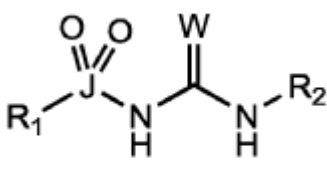
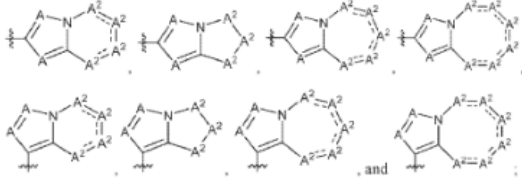
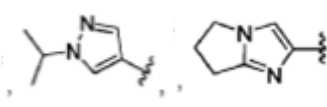
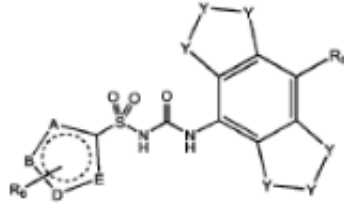
D1¹ divulga ciertas sulfonilureas y compuestos relacionados que tienen propiedades ventajosas y muestran una actividad útil en la inhibición de la activación del inflamasoma NLRP3. Dichos compuestos son útiles en el tratamiento de una amplia gama de trastornos en los que el proceso de inflamación, o más específicamente el inflamasoma NLRP3, ha sido implicado como un factor clave (Resumen).

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

6.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de la Fórmula If o una sal, fármaco, solvato, hidrato, isómero, o tautómero farmacéuticamente aceptable de este, donde (...)” (Radicado N°NC2019/0009036 del 21 de agosto de 2019).

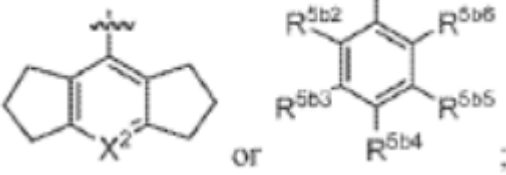
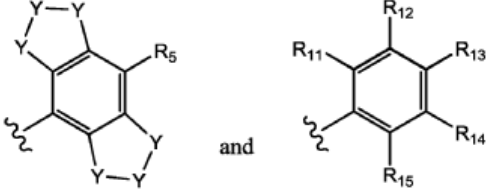
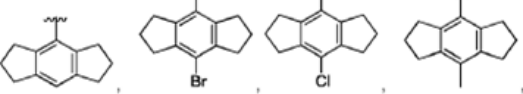
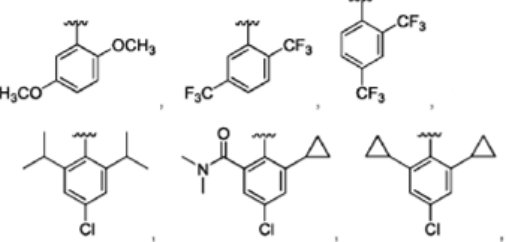
Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica

Características esenciales	DX
Un compuesto de la Fórmula If:	Un compuesto de fórmula (I),
 (If) o una sal, fármaco, solvato, hidrato, isómero, o tautómero farmacéuticamente aceptable de este, donde: R3 y R4 son H	 Formula (I) o una sal o profármaco solvato farmacéuticamente aceptable del mismo: J es S (Reiv. 1)
X1 es O o S;	W es O o S (Reiv. 1)
R1 se selecciona entre el grupo que consiste en:  donde — representa una unión simple o una unión doble siempre que el anillo que comprende uno o más A2 sea un anillo no aromático. cada A es en forma independiente CR5a1 o N; cada A2 es en forma independiente CR5a2, C(R5a2)2, N, NR5a2, O, S, o S(O)2 cada R5a1 es en forma independiente H,.. cada R5a2 es en forma independiente H,..	R1 es pirazol, pirrol, imidazol, los cuales pueden estar opcionalmente sustituidos según sea apropiado.(Reivindicación 3) R1 es (Reiv. 9):  El compuesto es:  Formula (IIb) en donde A, B, D y E son N ó C y al menos dos de A, B, D y E son N; y R6 es C3 -C6 cicloalquilo (Reiv. 20).
R2 es:	R2 es:

¹<https://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2016131098&tab=PCTBIBLIO>

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

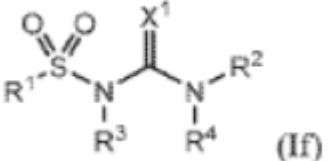
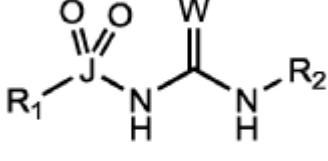
 X2 es N o CR5b1; R5b1 es H, D, halógeno,... cada R5b2, R5b3, R5b4, R5b5, y R5b6 es en forma independiente H, D, halógeno, OH, -CN, -NO2, -SR6, -OR6, -NHR6, -NR6R7, C1-C6alquilo, C2-C6alquenilo, C4-C8cicloalquenilo, C3-C8cicloalquilo, o C2-C6alquinilo; donde C1-C6alquilo, C2-C6alquenilo, C4-C8cicloalquenilo, C3-C8cicloalquilo, y C2-C6alquinilo están opcionalmente sustituidos con D, halógeno, -CN, -OR6, -NH2, -NH(C1-C6alquilo), o -N(C1-C6alquilo)2; o dos R5b2, R5b3, R5b4, R5b5, y R5b6 adyacentes pueden formar un ciclo.	 R2 es:  R2 es:  (Reiv. 9)
--	--

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la Fórmula (If) de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

Dado que la reivindicación dependiente 2 no contempla características que aporten novedad, se considera que tampoco cumple el requisito de novedad.

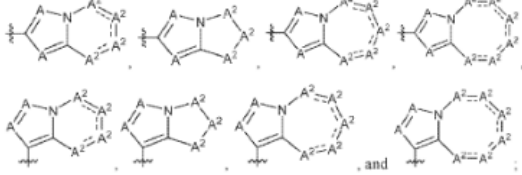
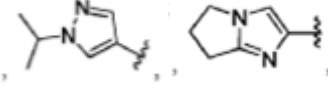
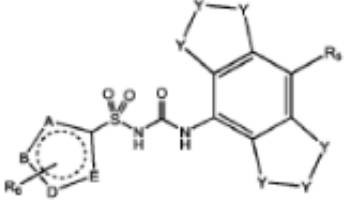
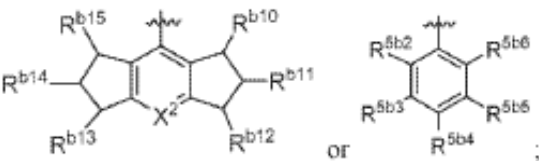
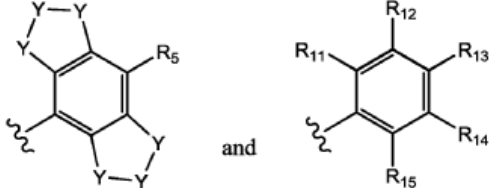
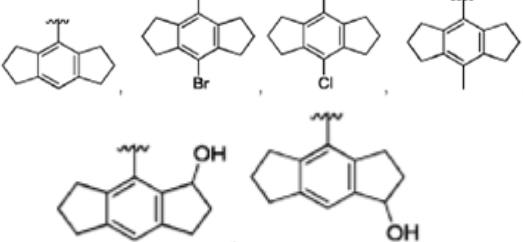
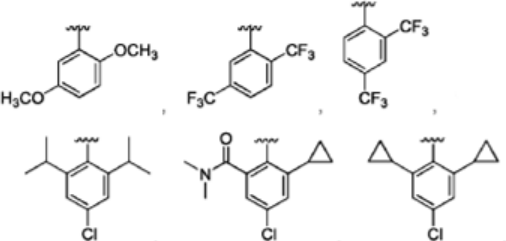
La reivindicación 5 consiste en: “Un compuesto de la Fórmula Ie o una sal, fármaco, solvato, hidrato, isómero, o tautómero farmacéuticamente aceptable de este, donde (...)” (Radicado N°NC2019/0009036 del 21 de agosto de 2019).

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

Características esenciales	DX
Un compuesto de la Fórmula Ie:	Un compuesto de fórmula (I),
 (If) o una sal, fármaco, solvato, hidrato, isómero, o tautómero farmacéuticamente aceptable de este, donde: R3 y R4 son H	 Formula (I) o una sal o profármaco solvato farmacéuticamente aceptable del mismo: J es S (Reiv. 1)
X1 es O o S;	W es O o S (Reiv. 1)
R1 se selecciona entre el grupo que consiste en:	R1 es pirazol, pirrol, imidazol, los cuales pueden estar opcionalmente sustituidos según sea apropiado.(Reivindicación 3) R1 es (Reiv. 9):

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

 donde $\equiv$ representa una unión simple o una unión doble siempre que el anillo que comprende uno o más A2 sea un anillo no aromático. cada A es en forma independiente CR5a1 o N; cada A2 es en forma independiente CR5a2, C(R5a2)2, N, NR5a2, O, S, o S(O)2 cada R5a1 es en forma independiente H,... cada R5a2 es en forma independiente H,...	 El compuesto es:  Formula (IIb) en donde A, B, D y E son N ó C y al menos dos de A, B, D y E son N; y R6 es C3 -C6 cicloalquilo (Reiv. 20).
R2 es:  X2 es N o CR5b1; R5b1 es H, D, halógeno,... Cada Rb10, Rb11, Rb12, Rb13, Rb14, y Rb15 es en forma independiente H, -OH cada R5b2, R5b3, R5b4, R5b5, y R5b6 es en forma independiente H, D, halógeno, OH, -CN, -NO2, -SR6, -OR6, -NHR6, -NR6R7, C1-C6alquilo, C2-C6alquenilo, C4-C8cicloalquenilo, C3-C8cicloalquilo, o C2-C6alquinilo; donde C1-C6alquilo, C2-C6alquenilo, C4-C8cicloalquenilo, C3-C8cicloalquilo, y C2-C6alquinilo están opcionalmente sustituidos con D, halógeno, -CN, -OR6, -NH2, -NH(C1-C6alquilo), o -N(C1-C6alquilo)2; o dos R5b2, R5b3, R5b4, R5b5, y R5b6 adyacentes pueden formar un ciclo.	R2 es:  R2 es:  R2 es:  (Reiv. 9)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la Fórmula (Ie) de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

Adicionalmente, D1 menciona que el compuesto divulgado, o su sal, solvato o profármaco farmacéuticamente eficaz, es un inhibidor del inflammasoma NLRP3 que es útil para el

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

tratamiento de un trastorno o afección de enfermedad inflamatoria o un trastorno o afección de enfermedad autoinmune (Reiv. 37 a 43).

Dado que las reivindicaciones dependientes 6 a 64 no contemplan características que aporten novedad, se considera que tampoco cumplen el requisito de novedad.

6.2. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 65 consiste en: *“Un compuesto, o una sal, fármaco, solvato, hidrato, isómero, o tautómero farmacéuticamente aceptable de este, caracterizado por que se selecciona entre el grupo que consiste en (..)”* (Radicado N° NC2019/0009036 del 21 de agosto de 2019).

Sin embargo, en D1 se enseñan compuestos con el mismo núcleo farmacofórico de sulfonilurea y sulfonil tiourea, en donde también se contemplan diferentes sustituyentes sobre ese núcleo principal: un benceno sobre el extremo N', con una sustitución de dos ciclopentil y opcionalmente grupos halo o hidroxil; y un anillo pirazol, pirrol, o imidazol sobre el extremo S', sustituido con un cicloalquilo. Los compuestos de la reivindicación 65 no aluden alguna característica que aporte nivel inventivo a lo divulgado en la solicitud puesto que incluyen variaciones en R1 y R2 y combinaciones de los mismos sin aportar un efecto técnico sorprendente o inesperado a la presente invención.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia con sus conocimientos en química orgánica habría podido variar el tipo de sustituciones específicas en R1 y R2 de los compuestos de D1, para llegar de manera alternativa al objeto de la reivindicación 65 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia

Dado que las reivindicaciones independientes 66 a 68 no contemplan características que aporten nivel inventivo, se considera que tampoco cumplen el requisito de nivel inventivo.

La reivindicación dependiente 69 tampoco cumple con el requisito de 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	WO/2016/131098	1 a 64	Novedad
		65 a 69	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

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

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° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

**INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD**

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0009036		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2018/014728		22 de enero de 2018							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
23 de enero de 2017				X					
Solicitante									
GENENTECH INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	98 y 99	Art. 15	-	Art. 20	70 a 97	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 69
Palabras clave utilizadas	Sulfonylurea, sulfonyl thiourea, interleukin-1 inhibitor, inflammasome, NLRP3, autoimmune disease
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 231/56, A61K 31/416, A61K 31/4162, A61K 31/424, A61K 31/429, C07D 487/04, C07D 263/52, C07D 265/12, C07D 498/04, C07D 498/20, C07D 513/04, A61P 1/00, A61P 5/00, A61P 11/00, A61P 13/00, A61P 17/00, A61P 25/00, A61P 31/00, 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	WO2016131098	25/08/2016	1 a 69	Reiv. 1, 3, 9, 20, 37 a 43	X
	WO1998032733	30/07/1998	-	-	A
ISA Espacenet	WO2001019390	22/03/2001	-	-	A
Espacenet	WO2006046492	04/05/2006	-	-	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.					
“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.			“X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.		

Oficio N° 9796 de 24 de junio de 2021

Ref. Expediente N° NC2019/0009036

“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.	“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: (16/05/2021)	
Examinador: Gineth Lorena Lopez Parra	