

**REPÚBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Resolución N° 70586

Ref. Expediente N° NC2018/0011249

*Por la cual se otorga una Patente de Invención*

**EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

**CONSIDERANDO:**

Que INCYTE CORPORATION, presentó petición de divisional, la cual fue aceptada para trámite mediante N° NC2018/0011249 para la invención titulada "FORMAS DE DOSIFICACIÓN DE LIBERACIÓN PROLONGADA PARA UN INHIBIDOR DE JAK1", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2014/049940 del 6 de agosto de 2014.

Que la mencionada solicitud se presentó como una división de la solicitud 16051256, la cual fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 776 el 10 de noviembre de 2016, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 14164, notificado el 20 de noviembre de 2020, se requirió al solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° NC2018/0011249 el 29 de enero de 2021, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 13 que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se acepta este último capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina "*Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial.*"

Que en el presente caso las reivindicaciones 1 a 13 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0011249 el 29 de enero de 2021, cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior, toda vez que refieren a comprimidos de liberación prolongada, que difieren del estado de la técnica más cercano, WO2011112662, en que las composiciones de la solicitud comprenden dos tipos de hipromelosa que confieren dos valores de viscosidad diferentes en solución (80-120cP y 3000-5600cP respectivamente), mientras que las composiciones del documento D1 comprenden celulosa microcristalina y en que los comprimidos de la presente invención presentan concentraciones y excipientes específicos reivindicados. Adicionalmente, estas diferencias no se encuentran sugeridas en el estado de la técnica y, como consecuencia de ello, se evidencia el efecto relacionado con valores medios de  $C_{max}$  significativamente reducidos de las formulaciones de liberación prolongada en comparación con la formulación de liberación instantánea después de la



Resolución N° 70586

Ref. Expediente N° NC2018/0011249

administración de dosis única en ayunas. Dado que el  $C_{max}$  es más bajo y el  $t_{1/2}$  de disposición más prolongada, las relaciones  $C_{max}/C_{12h}$  fueron significativamente más bajas para las tabletas de liberación prolongada en comparación con la cápsula de liberación instantánea para los mismos sujetos estudiados. Finalmente, además de las ventajas en la biodisponibilidad, también se evidencia una ventaja relacionada con el régimen una sola dosis diaria, frente a regímenes anteriores de dos veces al día. Sumado a lo anterior, la materia reivindicada, es susceptible de aplicación industrial.

En consecuencia, las reivindicaciones 1 a 13 cumplen los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial establecidos en la normatividad citada en precedencia y este Despacho encuentra procedente conceder para la misma la patente solicitada.

De acuerdo con la modificación presentada por el solicitante en el escrito radicado bajo el N° NC2018/0011249 el 8 de mayo de 2020 y teniendo en cuenta el objeto de la invención, se acepta el título siguiente: “COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE LIBERACIÓN MODIFICADA QUE COMPRENDE EL COMPUESTO {1-{1-[3-FLUORO-2-(TRIFLUOROMETIL) ISONICOTINOIL] PIPERIDIN-4-IL}-3-[4-(7H)-PIRROLO[2,3-D]PIRIMIDIN-4-IL]-1HPIRAZOL-1-IL}AZETIDIN-3-IL}ACETONITRILO E HIPROMELOSA”.

Con fundamento en las anteriores consideraciones, el Superintendente de Industria y Comercio,

**RESUELVE**

**ARTÍCULO 1:** Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

**“COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA DE LIBERACIÓN MODIFICADA QUE COMPRENDE EL COMPUESTO {1-{1-[3-FLUORO-2-(TRIFLUOROMETIL) ISONICOTINOIL] PIPERIDIN-4-IL}-3-[4-(7H)-PIRROLO[2,3-D]PIRIMIDIN-4-IL]-1HPIRAZOL-1-IL}AZETIDIN-3-IL}ACETONITRILO E HIPROMELOSA”**

**Clasificación IPC:** A61P 35/00, A61K 9/20, A61K 31/4045.

**Reivindicaciones:** 1 a 13 incluidas en el radicado bajo el N° NC2018/0011249 el 29 de enero de 2021, de acuerdo con el Anexo 1.

**Titular:** INCYTE CORPORATION.

**Domicilio:** EXPERIMENTAL STATION, ROUTE 141 & HENRY CLAY ROAD, BUILDING E336/207, WILMINGTON, DELAWARE 19880, ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA.

**Inventores:** Krishnaswamy YELESWARAM, Bhavnish PARIKH, Dilip P. MODI y Trupti SHETH.

**Prioridades N°:** 7/08/2013, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 61/863,325.  
6/12/2013, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 61/913,066.

**Solicitud internacional N°:** PCT/US2014/049940. **Fecha:** 6 de agosto de 2014.

**Vigente desde:** 6 de agosto de 2014. **Hasta:** 6 de agosto de 2034.



Resolución N° 70586

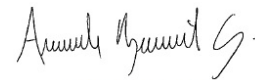
Ref. Expediente N° NC2018/0011249

**ARTÍCULO 2:** El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

**ARTÍCULO 3:** Notificar el contenido de la presente resolución a INCYTE CORPORATION, advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los diez (10) días hábiles siguientes a ella.

**NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE**

Dada en Bogotá D.C., el 2 de noviembre de 2021



ANDRÉS BARRETO GONZÁLEZ  
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Firmado digitalmente  
por: ANDRÉS  
BERNARDO BARRETO  
GONZÁLEZ  
Fecha: 2021.11.04  
09:00:37 COT  
Razón: Validez jurídica.  
Ubicación: Bogotá,  
Colombia.



**ANEXO 1**

**REIVINDICACIONES CONCEDIDAS**

1. Un comprimido de liberación prolongada que comprende
  - (i) {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;
  - (ii) una primera hipromelosa caracterizada por tener una viscosidad aparente a una concentración de 2% en agua de 80 cP a 120 cP;
  - (iii) una segunda hipromelosa, caracterizada por tener una viscosidad aparente a una concentración de 2% en agua de 3000 cP a 5600 cP,
  - (iv) en donde la forma de dosificación comprende 8% a 20% de la primera y segunda hipromelosas;
  - (v) 16% a 22% en peso de celulosa microcristalina; y
  - (vi) 45% a 55% en peso de monohidrato de lactosa.
2. El comprimido de liberación prolongada de la reivindicación 1, en donde el comprimido comprende del 10% al 15% en peso de la primera y segunda hipromelosas.
3. El comprimido de liberación prolongada de la reivindicación 1 o 2, en donde la tableta comprende además de 0,3% a 0,7% en peso de estearato de magnesio.
4. Un comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el comprimido comprende 25 mg en base a una base libre de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
5. El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el comprimido comprende 100 mg en una base libre de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
6. El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el comprimido comprende 200 mg en base a una base libre de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
7. El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el comprimido comprende 300 mg en base a una base libre de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidín-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
8. El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde el comprimido comprende 600 mg en base a una base libre de 1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrolo[2,3-d]pirimidin-4-il)-



Resolución N° 70586

Ref. Expediente N° NC2018/0011249

- 1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.
- 9.** El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde la sal es la sal del ácido adípico de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo.
- 10.** Un comprimido de liberación prolongada, que comprende:
- (i) 25 mg a 100 mg en base a una base libre de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo, o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo;
  - (ii) una primera hipromelosa caracterizada por tener una viscosidad aparente a una concentración del 2% en agua de 80 cP a 120 cP;
  - (iii) una segunda hipromelosa, caracterizada por tener una viscosidad aparente a una concentración del 2% en agua de 3000 cP a 5600 cP, en donde la tableta comprende 10% a 15% en peso de la primera y segunda hipromelosas;
  - (iv) 16% a 22% en peso de celulosa microcristalina; y
  - (v) 45% a 55% en peso de lactosa monohidrato;
- 11.** El comprimido de liberación prolongada de la reivindicación 10, en donde la tableta comprende además de 0,3% a 0,7% en peso de estearato de magnesio.
- 12.** El comprimido de liberación prolongada de la reivindicación 10 u 11, en donde el peso total del comprimido es de 600 mg.
- 13.** El comprimido de liberación prolongada de cualquiera de las reivindicaciones 10 a 12, en donde dicha sal es sal de ácido adípico de {1-{1-[3-fluoro-2-(trifluorometil)isonicotinoil]piperidin-4-il}-3-[4-(7H-pirrol[2,3-d]pirimidin-4-il)-1H-pirazol-1-il]azetidin-3-il}acetonitrilo.

