

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

Señores
INCYTE CORPORATION

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “FORMAS SÓLIDAS DE UN INHIBIDOR DE FGFR Y PROCESOS PARA PREPARARLAS”

NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2019/030633

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 3 de mayo de 2019.

PRIORIDAD: 4/05/2018, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/667,166
8/03/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/815,539.

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

Revisada la modificación a la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada el 7 de octubre de 2021 bajo el número NC2021/0004568, y teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 34 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, esta oficina acepta las modificaciones presentadas por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de nuevas formas sólidas de moléculas inhibidoras de FGFR para preparar formas de dosificación y formulaciones farmacéuticamente útiles con propiedades adecuadas relacionadas, por ejemplo, el facilitar la producción de productos farmacéuticos seguros, eficaces y de alta calidad.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea formas sólidas del compuesto 3-(2,6-difluoro-3,5-dimetoxifenil)-1-etil-8-(morfolin-4-ilmetil)-1,3,4,7-tetrahidro-2H-pirroló [3',2': 5,6]pirido[4,3-d]pirimidin-2-ona de fórmula 1.

3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado en el radicado NC2021/0004568 el 7 de octubre de 2021.

4. Reivindicaciones relativas a un uso

De conformidad con lo señalado en el artículo 14 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina solo son patentables las invenciones de producto o de procedimiento.

En consecuencia, las reivindicaciones 10, 11 y 80 a 124 no se consideran patentables, teniendo en cuenta que reclaman un uso.

Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

5. De la solicitud de patente

5.1. Reivindicaciones

Teniendo en cuenta lo establecido en el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina:

"Las reivindicaciones definirán la materia que se desea proteger mediante la patente. Deben ser claras y concisas y estar enteramente sustentadas por la descripción. (...)"

Las reivindicaciones 1 a 7 no cumplen con el requisito de claridad porque para la caracterización de un cristal no es suficiente mencionar que el compuesto es un cristal y mencionar al menos un valor de pico de DRX; para la correcta caracterización de una forma cristalina se hace necesario incluir la información completa de los picos del espectro de difracción de Rayos X en mono cristal o en polvo de modo tal que pueda distinguirse de sus equivalentes. Además, se hacen necesarios datos de caracterización adicionales, como, por ejemplo, picos de espectroscopías Raman e IR, datos de espectroscopía RMN-C¹³, resultados de análisis térmico: TGA, DTA y DSC entre otros.

Las reivindicaciones 1 a 7 no cumplen con el requisito de claridad porque no se sabe cuantas formas cristalinas diferentes se están reclamando, se le recomienda al solicitante que utilice una nomenclatura diferencial (forma cristalina I, II, III, etc.) para poder distinguir cada forma cristalina reivindicada. Se aclara además que la reivindicación 7 no es concisa porque aparentemente reclama múltiples formas cristalinas diferentes y en ese sentido dicha reivindicación también se considera una generalización sin sustento en la descripción. Se le recomienda al solicitante que limite el alcance de la materia reclamada y que, si desea reclamar diferentes formas cristalinas, éstas sean presentadas en solicitudes divisionales, tal como se encuentra indicado en el siguiente numeral.

La reivindicación 9 por su parte, no se encuentran enteramente sustentada en la descripción. No hay ningún sustento técnico en la descripción que demuestre el desarrollo de alguna composición, se le recomienda al solicitante retirar dicha reivindicación.

Adicionalmente, sírvase suprimir los términos y expresiones *"-al menos, un solvente, una temperatura elevada, un primer período de tiempo, una temperatura reducida, un segundo período de tiempo, es mayor de, grupo protector amino, un ácido, primer solvente orgánico, primer sólido, segundo solvente orgánico, segundo sólido, primera mezcla, segunda mezcla, ácido de Lewis, agente reductor, una base, un solvente, agente de oxidación, agente de cloración, agente de bromación, agente de yodación-*". ya que son ambiguos e imprecisos y no permiten definir específicamente el alcance de la materia reclamada.

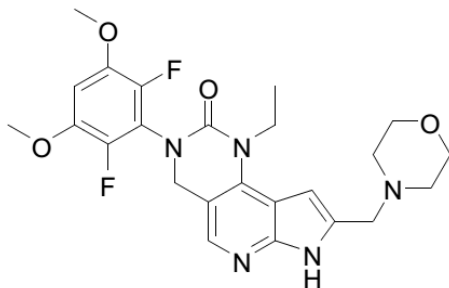
En consecuencia, es necesario que allegue las aclaraciones o modificaciones correspondientes para dar cumplimiento a lo establecido en el citado artículo.

6. Unidad de invención

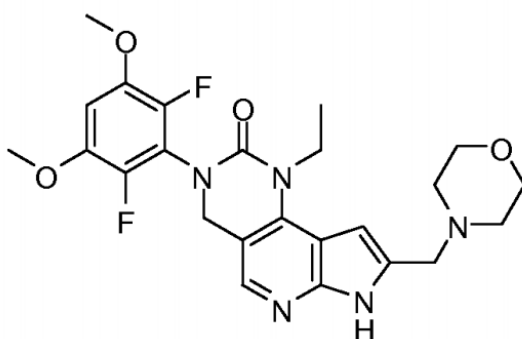
Conforme a lo establecido por el artículo 25 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, teniendo en cuenta que el concepto común es el compuesto de formula I

Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226



y dado que este se encuentra divulgado en el estado de la técnica, específicamente en el documento WO2014007951, ejemplo 126



la solicitud carece de unidad de invención debido a que reclama más de un grupo inventivo sin la presencia de características o elementos técnicos nuevos e inventivos que sean comunes a todas las invenciones.

Por lo tanto, la invención presenta diferentes conceptos técnicos inventivos así:

Grupo inventivo 1: Compuesto de fórmula 1 amorfo (reivindicación 8 y 9).

Grupo inventivo 2: Forma sólida cristalina del compuesto de fórmula 1 y proceso de obtención (reivindicaciones 1 a 6, 9 y 12 a 18).

Grupo inventivo 3: Forma sólida cristalina del compuesto de fórmula 1 (reivindicación 7 y 9). Tenga en cuenta que cada apartado desde el a) hasta el y) podría representar un grupo inventivo diferente si cada uno de ellos representan formas cristalinas diferentes.

Grupo inventivo 4: Proceso de síntesis para preparar el compuesto de fórmula 1 (reivindicaciones 19 a 41).

Grupo inventivo 4: Proceso de síntesis para preparar el compuesto de fórmula 1 y compuestos intermediarios (reivindicaciones 42 a 79).

De acuerdo con lo anterior, se sugiere restringir la materia a patentar en un solo concepto común inventivo especificando el avance tecnológico sobre el estado de la técnica. Esto se logra, entre otras formas, definiendo las características esenciales de la invención y mostrando las otras características particulares como dependientes, pero sin perjuicio de la concisión de las nuevas reivindicaciones tanto independientes como dependientes.

Así mismo, se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, o limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones. En este último caso, de seleccionar un grupo inventivo diferente al estudiado en este Oficio, se aclara al solicitante que debe realizar el pago del examen de patentabilidad.

Por consiguiente, la presente búsqueda del estado de la técnica y el examen de patentabilidad fueron realizados para el primer grupo inventivo citado.

Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

7. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 4 de mayo de 2018, 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	WO2014007951	SUBSTITUTED TRICYCLIC COMPOUNDS AS FGFR INHIBITORS	9 de enero de 2014

D1¹ divulga compuestos tricíclicos y composiciones farmacéuticas de los mismos, que son inhibidores de una o más enzimas FGFR (resumen).

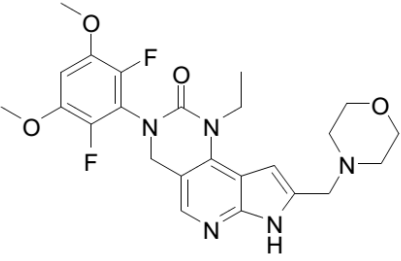
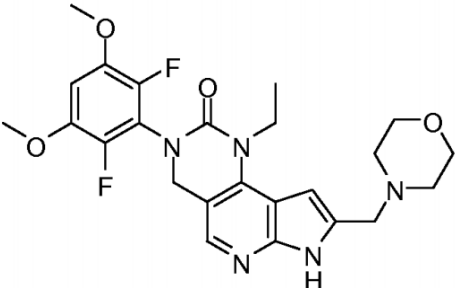
8. Examen de Patentabilidad

De acuerdo con lo establecido en el artículo 14 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, en el cual se establecen los requisitos de patentabilidad objeto de la solicitud en estudio, esta Oficina presenta a continuación el análisis de los requisitos de patentabilidad.

8.1. Novedad

Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 16 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 8 (NC2021/0004568 el 7 de octubre de 2021) refiere a:

“Una forma sólida del Compuesto 1 (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Forma sólida amorfa del compuesto 1 	Forma sólida amorfa del compuesto  Ejemplo 126

De acuerdo con la comparación realizada anteriormente se concluye que la materia de la reivindicación 8 no es nueva.

Igualmente, la composición de la reivindicación 9 tampoco es novedosa frente al documento 1 porque allí ya se habían divulgado composiciones farmacéuticas (paginas 73 a 77).

¹<https://patents.google.com/patent/WO2014007951A2/en?q=WO2014007951>
Página 4 de 7

Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2014007951	8 y 9	Novedad

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.

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° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2020/0015226		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional:							
PCT/US2019/030633		3 de mayo de 2019							
Fecha de determinación estado de la técnica				Prioridad		Presentación			
4-may-2018				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	8
Palabras clave utilizadas	3-(2,6-difluoro-3,5-dimetoxifenil)-1-etil-8-(morfolin-4-ilmetil)-1,3,4,7-tetrahidro-2H-pirroló [3',2': 5,6]pirido[4,3-d]pirimidin-2-ona
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 471/14, A61K 31/519, 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⁾
SIPI	NC2020/0015228	03-12-2020	-	-	L
EPO	WO2014007951	09-01-2014	8	Ejemplo 126	X
Patbase	US9611267 US8183248 WO2009/148887 US20110118230 WO2015/095492	04-04-2017 22-05-2012 10-12-2009 19-05-2011 25-06-2015	-	-	A
Orbit	WO2007134259 US7589101 US7846923 US8461328	22-11-2007 15-09-2009 07-12-2010 11-06-2013	-	-	A
STNext	US7868018 US7589101 US8426411 US8119655 US9440976 US20110178053	11-01-2011 15-09-2009 23-04-2013 21-02-2012 13-09-2016 21-07-2011	-	-	A
(1) Cita completa literatura no patente (LNP)		Harry G. Brittain. Polymorphism in Pharmaceutical Solids, Center for Pharmaceutical Physics Milford, New Jersey, USA, 2009.			
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.		N. Blagden, M. de Matas, P.T. Gavan, P. York, Crystal engineering of active pharmaceutical ingredients to improve solubility and dissolution rates, Advanced Drug Delivery Reviews, Volume 59, Issue 7, 2007, Pages 617-630, ISSN 0169-409X, https://doi.org/10.1016/j.addr.2007.05.011 .			
O		Vijaykumar K. Parmar & Shailesh A. Shah (2013) Hydrochloride salt co-crystals: preparation, characterization and physicochemical studies, Pharmaceutical Development and Technology, 18:2, 443-453, DOI: 10.3109/10837450.2012.696270			
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx .		Bhatia, A., Chopra, S., Nagpal, K., Deb, P. K., Tekade, M., & Tekade, R. K. (2018). Polymorphism and its Implications in Pharmaceutical Product Development. Dosage Form Design Parameters, 31–65. doi:10.1016/b978-0-12-814421-3.00002-6			
		Thakuria, R., & Thakur, T. S. (2017). Crystal Polymorphism in Pharmaceutical Science. Comprehensive Supramolecular Chemistry II, 283–309. doi:10.1016/b978-0-12-409547-2.12570-3			



Oficio N° 16296 de 6 de octubre de 2023

Ref. Expediente N° NC2020/0015226

	Pindelska, E., Sokal, A., & Kolodziejski, W. (2017). Pharmaceutical cocrystals, salts and polymorphs: Advanced characterization techniques. Advanced Drug Delivery Reviews, 117, 111–146. doi:10.1016/j.addr.2017.09.014 [Y] - TIMO HEINRICH ET AL, "Fragment-Based Discovery of New Highly Substituted 1 H - Pyrrolo[2,3- b]- and 3 H -Imidazolo[4,5- b]-Pyridines as Focal Adhesion Kinase Inhibitors", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, US, (20130108), vol. 56, no. 3, doi:10.1021/jm3016014, ISSN 0022-2623, pages 1160 - 1170, XP055543295 [Y] 51-56 * see scheme 2, preparation of compound 15 * DOI: http://dx.doi.org/10.1021/jm3016014 [A] - BAZYL' I T ET AL, "The selective ortho-methoxylation of pentafluorobenzoic acid - a new way to tetrafluorosalicilyc acid and its derivatives", JOURNAL OF FLUORINE CHEMISTRY, ELSEVIER, NL, (19990211), vol. 94, no. 1, doi:10.1016/S0022-1139(98)00316-9, ISSN 0022-1139, pages 11 - 13, XP004159035 [A] 65,66 * the whole document * DOI: http://dx.doi.org/10.1016/S0022-1139(98)00316-9
(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. "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. "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 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: (02-10-2023)	

