

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

Señores
CHIESI FARMACEUTICI S.P.A.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “DERIVADOS DE AMINOQUINAZOLINA COMO INHIBIDORES DEL PURINORECEPTOR 3 DE P2X (P2X3)”
NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2020/064913.
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 28 de mayo de 2020.
PRIORIDADES: EP, 19177604.6, 31 de mayo de 2019.
EP, 19201168.2, 02 de octubre de 2019.

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 al capítulo reivindicatorio y a la descripción de la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada el 08 de junio de 2022 bajo el número NC2022/0008130, 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 la descripción modificada y las modificaciones presentadas en el capítulo reivindicatorio por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de nuevos compuestos para el tratamiento de enfermedades asociadas con receptores P2X3 en muchas áreas terapéuticas tal como en particular las enfermedades respiratorias, preferentemente que tienen una acción selectiva en el receptor P2X3.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea compuestos que son derivados de aminoquinazolina, métodos para preparar estos compuestos y composiciones farmacéuticas que los contienen.

3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 08 de junio de 2022 bajo el radicado N° NC2022/0008130.

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

4. De la solicitud de patente

4.1. 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. (...)"

Esta oficina informa que, las reivindicaciones 1, 3, 5, 6, 8 y 11 no son concisas porque reclaman sustituyentes como *"alquilo, arilo, heteroarilo"* que son muy generales y comprenden un número muy extenso de alternativas, ya que no se mencionan la cantidad de átomos o los heteroátomos que pueden comprender dichos grupos, lo que impide establecer claramente el alcance de la protección. Se sugiere agrupar dichas alternativas teniendo en cuenta que exista una razonable generalización y que cada una de dichas alternativas tenga soporte en la descripción.

Esta oficina informa que, las reivindicaciones 1, 3, 5, 6, 8 y 11 no son concisas porque las definición de Z cuando reclama que puede ser heteroarilo y arilo comprenden un número muy extenso de alternativas, ya que no se mencionan la cantidad de átomos o los heteroátomos que pueden comprender dichos grupos, lo que impide establecer claramente el alcance de la protección. Se sugiere agrupar dichas alternativas teniendo en cuenta que exista una razonable generalización y que cada una de dichas alternativas tenga soporte en la descripción.

Esta oficina informa que, la reivindicación 1 no es clara cuando menciona *"(...) Z se selecciona del grupo que consiste de (C₃-C₈)heterocicloalquilo, (R^AR^B)N-, heteroarilo, arilo, en donde cualquiera de estos alquilo, heteroarilo, heterocicloalquilo y arilo puede estar opcionalmente sustituido (...)"*, porque hace referencia al grupo *"alquilo"* pero dicho grupo no hace parte de las definiciones de Z. Por lo que no es coherente la redacción de dicha reivindicación. Se sugiere dar claridad a las definiciones de los radicales y sus posibles sustituciones.

Esta oficina informa que, las reivindicaciones 3, 5, 6 y 8 no son claras porque repiten mucha de la información contenida en la reivindicación independiente 1, por lo que su redacción es redundante y no permite distinguir las características preferentes que se desean reclamar. Se sugiere reclamar en las reivindicaciones dependientes sólo las características específicas sin ser redundante en la redacción frente a las anteriores reivindicaciones.

Esta oficina informa que, la reivindicación 10 no es concisa porque la definición de *"uno o más ingredientes activos"*, hace referencia a términos funcionales que son imprecisos, puesto que no se define un componente como tal, lo cual dificulta entender el alcance de la invención, se sugiere restringir a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentren debidamente sustentados.

Esta oficina informa que, la reivindicación 11 no es clara porque define el radical R⁶, no obstante, dicho radical no se encuentra ejemplificado en la fórmula Markush que se ilustra. Se sugiere dar coherencia a las definiciones de los radicales que se reclaman y que se encuentren contemplados por las estructuras Markush.

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

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

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 31 de mayo de 2019, 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	WO2017091661	“Bicyclic bet bromodomain inhibitors and uses thereof”	01 de junio de 2017
D2	WO2018035061	“Certain chemical entities, compositions, and methods”	22 de febrero de 2018

D1¹ divulga compuestos que se unen y modulan de otro modo la actividad de proteínas que contienen bromodominios, a procesos para preparar estos compuestos, a composiciones farmacéuticas que contienen estos compuestos y a métodos de uso de estos compuestos para tratar una amplia variedad de afecciones y trastornos (Resumen).

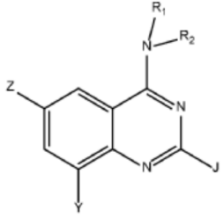
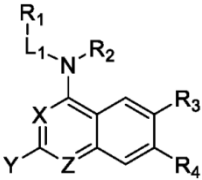
D2² divulga entidades químicas que son inhibidores de quinasas, composiciones farmacéuticas y métodos de tratamiento del cáncer (Resumen).

6. 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.

6.1. 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 1 (NC2022/0008130 del 08 de junio de 2022) refiere a: “Un compuesto de la fórmula (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y el documento encontrado en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Un compuesto de la fórmula 	Un compuesto de Fórmula I  X y Y = N (Reiv. 1)

¹ <https://patentimages.storage.googleapis.com/11/d7/9e/e9bfc563a29521/WO2017091661A1.pdf>

² <https://patentimages.storage.googleapis.com/00/99/1b/2f58500ab47b73/WO2018035061A1.pdf>



Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

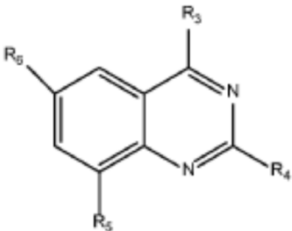
Ref. Expediente N° NC2021/0017031

$Z = (C_3-C_8)$ heterocicloalquilo, heteroarilo, arilo	$R_3 = C_{6-10}$ arilo, heteroarilo de 5-10 miembros, heterocicloalquilo de 4-10 miembros (Reiv. 1)
$R_1 = H$	$R_2 = H$ (Reiv. 1)
$R_2 = (C_1-C_6)$ alquil-, heteroaril-(C_1-C_4)alquil-, heteroaril-(C_1-C_6)hidroxialquil-, (C_3-C_8) heterocicloalquilo, (C_3-C_8)cicloalquil-(C_1-C_6)alquil-, aril-(C_1-C_4)alquil- (...) en donde cualquiera de estos alquilo, alquilenos, arilo, heteroarilo y heterocicloalquilo puede estar opcionalmente sustituido por heteroarilo, arilo	L_1-R_1 $L_1 = -(CR_9R_{10})_n$, donde n es 0, 1, 2, 3; R_9 y $R_{10} = H$ $R_1 = C_{6-10}$ arilo, heteroarilo de 5-10 miembros, que pueden estar sustituidos con R_8 $R_8 = C_{1-6}$ alquil, C_{1-6} aril, heteroarilo de 5-10 miembros (Reiv. 1)
$Y = H$ $J = H$	$\approx H$ $Y = H$ (Reiv. 1)

De acuerdo con la comparación realizada anteriormente se concluye que la materia de la reivindicación 1 no es nueva.

De igual modo, la reivindicación dependiente 3 tampoco cumple con el requisito de 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 11 (NC2022/0008130 del 08 de junio de 2022) refiere a: “Un compuesto de la fórmula (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y el documento encontrado en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D2
Un compuesto de la fórmula  (Ib)	 (Descripción, pág. 201, párr. [0412])
$R_3 = OH$ $R_4 = H$ $R_5 = \text{halo o } -OMe$	$\approx OH$ $\approx H$ $\approx Br$ y $-OMe$ (Descripción, pág. 201, párr. [0412])

De acuerdo con la comparación realizada anteriormente se concluye que la materia de la reivindicación 11 no es nueva.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2017091661	1 y 3	Novedad
D2	WO2018035061	11	Novedad

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

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.



Sandra Isabel Calderon Rodriguez
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2021/0017031		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2020/064913		28/05/2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
31/05/2019				X					
Solicitante									
CHIESI FARMACEUTICI S.P.A.									
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 a 11
Palabras clave utilizadas	S "P2X3 PURINOCEPTORS" AND "COMPOUNDS"; S "P2X3" AND "COMPOUNDS", AND "ANTAGONIST"; p2x3 and cough and pyrimidine
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A61P 11/00, A61P 11/14, C07D 239/94, C07D 401/12, C07D 403/12, C07D 405/12, C07D 409/12, C07D 413/04, C07D 413/12, C07D 413/14, C07D 417/12, C07D 487/04, A61K 31/517, A61K 31/519, A61K 31/5355, A61K 31/5377

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	WO2015027212	26/02/2015	-	-	A
SIPI Patbase	WO2005095359	13/10/2005	-	-	A
ISA	WO2016053794	07/04/2016	-	-	A
	⁽¹⁾ Pan Y. <i>et al</i>	16/03/2013	-	-	A
	⁽²⁾ Finlay H. <i>et al</i>	08/09/2016	-	-	A
	US5707998	13/01/1998	-	-	A
	⁽³⁾ Zhang Q. <i>et al</i>	01/11/2017	-	-	A
	WO2017091661	01/06/2017	1 y 3	Reivindicación 1	X
ISA STNext	RN 1700636-78-7	07/05/2015	-	-	A
	RN 1616828-53-5	24/07/2014	-	-	A
	RN 1602300-56-0	11/05/2014	-	-	A
	RN 1566729-83-6	12/03/2014	-	-	A
	RN 106319-77-1	24/01/1987	-	-	A
	RN 100949-33-5	22/03/1986	-	-	A
	RN 19815-13-5	16/11/1984	-	-	A
ISA	WO2018005435	04/01/2018	-	-	A

Oficio N° 17852 de 1 de octubre de 2024

Ref. Expediente N° NC2021/0017031

ISA STNext	(⁴) Szántó G. <i>et al.</i>	15/08/2016	-	-	A
ISA	WO2017058645	06/04/2017	-	-	A
	WO2014102233	03/07/2014	-	-	A
	WO2018204775	08/11/2018	-	-	A
JPO	WO2018035061	22/02/2018	11	Descripción, pág. 201, párr. [0412]	X
Orbit	WO2003040109	15/05/2003	-	-	A
Patbase	WO2018064135	05/04/2018	-	-	A
	WO2006119504	09/11/2006	-	-	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.		(¹) Pan Y. <i>et al.</i> (16/03/2013). Pharmacophore and 3D-QSAR Characterization of 6-Arylquinazolin-4-amines as Cdc2-like Kinase 4 (Clk4) and Dual Specificity Tyrosine-phosphorylation-regulated Kinase 1A (Dyrk1A) Inhibitors. <i>Journal of Chemical Information and Modeling</i>. Volumen 53 (4). Páginas 938-947 (²) Finlay H. <i>et al.</i> (08/09/2016). Discovery of 5-Phenyl-N-(pyridin-2-ylmethyl)-2-(pyrimidin-5-yl)quinazolin-4-amine as a Potent I_{Kur} Inhibitor. <i>ACS Medical Chemistry Letters</i>. Volumen 7 (9). Páginas 831–834 (³) Zhang Q. <i>et al.</i> (01/11/2017). Design, synthesis and biological evaluation of novel histone deacetylase inhibitors incorporating 4-aminoquinazolinyl systems as capping groups. <i>Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters</i>. Volumen 27 (21). Páginas 4885-4888 (⁴) Szántó G. <i>et al.</i> (15/08/2016). New P2X3 receptor antagonists. Part 2: Identification and SAR of quinazolinones. <i>Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters</i>. Volumen 26 (16). Páginas 3905-3912			
		(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: 25/09/2024					