

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Resolución N° 30776

Ref. Expediente N° NC2021/0010415

Por la cual se deniega una Patente de Invención

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 24 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 9 de agosto de 2021 con el N° NC2021/0010415, por FELICAMED BIOTECHNOLOGY CO., LTD., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "INHIBIDOR JAK Y MÉTODO DE PREPARACIÓN DEL MISMO", que corresponde a la solicitud internacional PCT/CN2019/127494 del 23 de diciembre de 2019.

Que la solicitud fue publicada en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 936 el 19 de agosto de 2021, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

Que realizado el examen de fondo mediante Oficio No. 15405 de 02 de septiembre de 2024, 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° NC2021/0010415 el 29 de noviembre de 2024, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó las reivindicaciones 1 a 8 que reemplazan las originalmente presentadas. 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 8 incluidas en el radicado N° NC2021/0010415 el 29 de noviembre de 2024 no cumplen los requisitos indicados. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

Objeto de la invención

El problema planteado consiste en la necesidad de proporcionar una serie de compuestos como inhibidores de la Quinasa de Janus (JAK) y así prevenir y/o tratar ciertas enfermedades inflamatorias o cáncer en humanos y/o animales.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea proporcionar una serie de compuestos de fórmula general I y su sal farmacéuticamente aceptable para la prevención de algunas enfermedades inflamatorias y el cáncer en humanos y/o animales.

Ref. Expediente N° NC2021/0010415

Reivindicaciones

En virtud de lo dispuesto en el artículo 30, de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina que señala:

“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 podrán ser independientes o dependientes. Una reivindicación será independiente cuando defina la materia que se desea proteger sin referencia a otra reivindicación anterior. Una reivindicación será dependiente cuando defina la materia que se desea proteger refiriéndose a una reivindicación anterior. Una reivindicación que se refiera a dos o más reivindicaciones anteriores se considerará una reivindicación dependiente múltiple”.

Las reivindicaciones presentan las siguientes observaciones:

La reivindicación 1, no es clara ya que no establece la presencia o ausencia del enlace entre los sustituyentes R1 y R2, lo que impide establecer claramente el alcance de la protección.

La reivindicación 1 no es clara porque la definición de R7 y R8 está ausente.

Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 30 de enero 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	WO2011075334	“PYRROLO[2,3-D]PYRIMIDINE COMPOUNDS”	23 de junio de 2011
D3	CN108341820	“JAK (Janus kinase) inhibitor and preparation method and use thereof”	31 de julio de 2018

D1¹ divulga compuestos de pirrolo[2,3-d]pirimidina, su uso como inhibidores de la Janus Kinase (JAK), composiciones farmacéuticas que contienen estos compuestos y métodos para su preparación. La fórmula (I) representa estos compuestos (Reiv. 1 Pág. 55-56).

D3² divulga un nuevo inhibidor selectivo de JAK (Janus quinasa), así como un método de preparación y uso del mismo. (Reiv. 1-6 Pág. 2-9).

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.

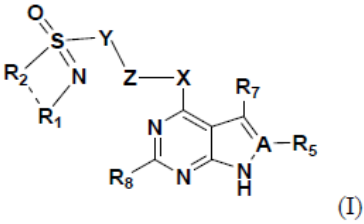
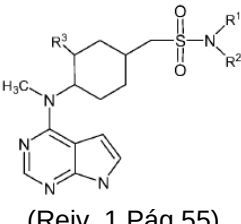
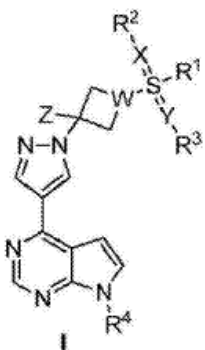
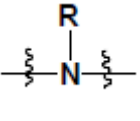
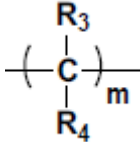
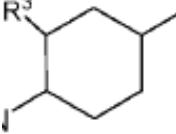
Nivel Inventivo

¹<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/043618844/publication/WO2011075334A1?q=WO2011075334>

²<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/062908336/publication/CN108341820A?q=CN108341820>

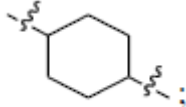
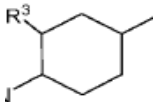
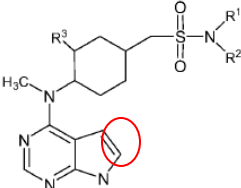
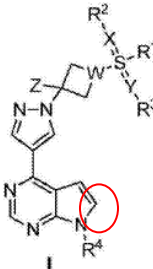
Ref. Expediente N° NC2021/0010415

Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la reivindicación independiente 1 (NC2021/0010415 del 29 de noviembre de 2024) refiere a: “Un compuesto representado por una Fórmula general I o su sal, estereoisómero, éster o metabolito farmacéuticamente aceptable (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1	D2
Un compuesto representado por una fórmula general I:  (I)	Un compuesto de fórmula I  (Reiv. 1 Pág 55)	Compuesto de fórmula I  Reivindicación 1
A es C,	-CH-	-CH-
X se selecciona a partir de  ;	C-N-C (Reiv. 1 Pág 56)	No menciona
R se selecciona a partir de C1-6 alquilo lineal;	R3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo (C1-C6). (Reiv. 1 Pág 56)	No menciona
Y se selecciona a partir de 	 (Reiv. 1 Pág 55) (Reiv. 1 Pág 55)	No menciona
R3 y R4 se seleccionan independientemente a partir de: H, halógeno, -CN, C1-6 alquilo lineal; la porción alquilo puede estar sustituida opcionalmente por uno o más de los siguientes grupos: hidroxilo, - OC1-10 alquilo o -N(C0-10 alquilo)(C0-10 alquilo); m se selecciona a partir de 0, 1, 2, 3 o 4;	H (Reiv. 1 Pág 55)	No menciona



Ref. Expediente N° NC2021/0010415

 Z es	 (Reiv. 1 Pág 55)	No menciona
R5 se selecciona de H y C1-3 alquilo	H  (Reiv. 1 Pág 55)	H  Reivindicación 1
R1 se selecciona a partir de: H o C1-10 alquilo lineal o ramificado,	SO₂NR₁R₂ R1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y (C1-C6)alquilo; y cuando R1 es hidrógeno, entonces R2 se selecciona del grupo que consiste en alquilo (C5-C6), haloalquilo (C3-C6), cicloalquilo (C1-C6), hidroxialquilo (C5-C6), alquenilo (C1-C6), haloalquenilo (C1-C6), fenilo, fenilalquilo (C1-C6), cicloalquilo (C3-C6), heterociclilo y heterocicilalquilo (C1-C6). (Reiv. 1 Pág 55-56)	 R2 es H Reivindicación 1
R2 se selecciona a partir de: C1-10 alquilo lineal o ramificado o -OC0-10 alquilo, en donde, H unido a átomos de carbono puede estar sustituido por los siguientes grupos: deuterio, halógeno, -CN, -OCH2F, -OCHF2, -OCF3, C1-6 alquilo lineal, -N(C0-10 alquilo)(C0-10 alquilo), -OC0-10 alquilo, C3-10 cicloalquilo o fenilo, en donde H en fenilo puede estar sustituido por uno o más de los siguientes grupos: halógeno, C1-4 alquilo lineal, -CN, -OCH2F, -OCHF2, -OCF3, -N(C0-10 alquilo)(C0-10 alquilo) o -OC0-10 alquilo.	Cuando R1 es alquilo (C1-C6), entonces R2 se selecciona del grupo que consiste en alquilo (C1-C6), haloalquilo (C1-C6), cicloalquilo (C1-C6), hidroxialquilo (C6), alquenilo (C6), fenilo, fenilalquilo (C1-C6), cicloalquilo (C3-C6), heterociclilo y heterocicilalquilo (C1-C6). (Reiv. 1 Pág 55-56)	-H

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga un compuestos de pirrolo[2,3-d]pirimidina, su uso como inhibidores de la quinasa de Janus (JAK) (Reiv. 1 Pág 55-56).

La diferencia entre la invención definida entre la reivindicación 1 y los compuestos de pirrolo[2,3-d]pirimidina divulgados en D1, consiste en que los compuestos de la invención comprenden un grupo sulfoniliminio, mientras que los compuestos divulgados en D1 comprende en la misma posición un grupo sulfomilamino.



Ref. Expediente N° NC2021/0010415

No hay evidencia de que incluir específicamente un grupo sulfoniliminio sobre la estructura de los compuestos de pirrolo[2,3-d]pirimidina logre un efecto técnico diferente al ya proporcionado por el objeto de D1. Si bien el Anexo A aportado por el solicitante en la respuesta al oficio 15405 de 2 de septiembre de 2024 radicado bajo el No. NC2021/0010415 del 29 de noviembre de 2024 muestra ensayos comparativos de actividad inhibitoria (IC_{50}), para los compuestos reivindicados, esta actividad no supera en eficacia a oclacitinib (fármaco aprobado), para todos los compuestos reclamados, adicionalmente los compuestos de D1 (Páginas 44 a 53) muestran una actividad inhibitoria más potente para JAK1 en comparación con los compuestos del Anexo A.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar los compuestos derivados de pirrolo[2,3-d]pirimidina conocidos en D1 con actividad inhibitoria de las citoquinas Janus JAK, para proporcionar otros compuestos alternativos derivados de pirazolopirimidina y pirrolopirimidina?

Sin embargo, el incluir un sustituyente sulfoximino para mejorar la actividad inhibitoria de citoquinas de Janus JAK, ya está divulgado en D3 que se refiere a una serie de inhibidores de JAK (Reivindicación 1 y 6 Pág. 2 a 9). Adicionalmente D3 sugiere la inclusión del grupo sulfoximina en su estructura (Reivindicación 1 y 6 Pág. 2 a 9).

Adicionalmente los compuestos de D3, también reclama compuestos (Páginas 22 a 25) que muestran una actividad inhibitoria más potente para JAK1 en comparación con los compuestos del Anexo A.

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir los sustituyentes y ligandos en el anillo de pirimidina del D3 en derivados de pirrolo[2,3-d]pirimidina de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 8 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo a los compuestos derivados de pirazolopirimidina y pirrolopirimidina de la reivindicación 1, por lo cual se considera que carecen de nivel inventivo.

Respuesta a los argumentos del solicitante

En cuanto a los argumentos del solicitante respecto a la falta de claridad el solicitante menciona en la respuesta al tercer examen de patentabilidad que supera las objeciones técnicas del tercer examen de fondo con una serie de modificaciones y aclaraciones estructuradas principalmente en torno a los siguientes aspectos relevantes:

Modificaciones al Capítulo Reivindicatorio, eliminación de la Reivindicación 2 y limitación drástica de los sustituyentes en la Reivindicación 1: A, R5, X, Y, R1 y R2, reduciendo significativamente el número de alternativas, lo que responde a la objeción de falta de claridad y concisión.

Ajuste de numeración y dependencias: Se reorganizan las Reivindicaciones 2 a 8 para reflejar la nueva estructura, en cumplimiento con el Artículo 34 de la Decisión 486, sin ampliar el alcance de la solicitud original.

El solicitante proporciona una tabla detallada de sustituciones y sus respectivos compuestos representativos, demostrando que todos los sustituyentes ahora tienen respaldo en los ejemplos incluidos en el Capítulo Descriptivo.

Ref. Expediente N° NC2021/0010415

Argumenta que la materia reclamada representa una generalización razonable de lo divulgado, comprensible por un técnico en la materia, cumpliendo con el Artículo 30 de la Decisión 486.

Por lo anterior, esta Oficina indica que el solicitante no tiene razón, ya que al revisar el nuevo pliego reivindicatorio se encontraron términos que no cumplen con el requisito de claridad. En algunos casos, la materia reclamada no está correctamente delimitada y, en otros, el lenguaje es ambiguo e impreciso, lo que impide comprender el objeto de la solicitud. Por ejemplo, la reivindicación 1 no es clara ya que no establece la presencia o ausencia del enlace entre los sustituyentes R1 y R2, lo que impide establecer claramente el alcance de la protección.

La reivindicación 1 no es clara porque la definición de R7 y R8 está ausente. Asimismo, el Anexo A no aporta información válida sobre el efecto de los compuestos respecto a la inhibición de la proteína JAK, ya que al compararlo con el control (Oclacitinib), los resultados de los compuestos evaluados son superiores. Por esta razón, se mantienen las objeciones con base en el artículo 30 de la Decisión 486 de 2000.

En lo referente a la falta de nivel inventivo y lo que se relaciona con los documentos D1 y D3, el solicitante manifiesta lo siguiente:

Se defiende que, aunque D1 y D3 son citados como arte previo relevante, sin embargo, la estructura química de la invención es significativamente distinta, sobre todo por la introducción del grupo sulfoximina en lugar del sulfonamida divulgado en D1.

D3 no enseña cómo integrar sus grupos sustituyentes al marco estructural de D1, y además presenta diferencias importantes en el esqueleto molecular.

Los efectos biológicos derivados de los cambios estructurales son impredecibles, especialmente en química farmacéutica, la persona técnica en la materia no tendría motivación ni certeza razonable para combinar los documentos citados y llegar a la solución técnica propuesta.

Incluso si se hiciera tal combinación, los compuestos resultantes serían estructuralmente diferentes.

Se aporta un Anexo A con ensayos comparativos de actividad inhibitoria (valores IC₅₀), donde los compuestos reivindicados superan en eficacia a oclacitinib (fármaco aprobado), indicando una ventaja técnica inesperada.

Se enfatiza que D1 y la solicitud utilizan metodologías distintas para calcular IC₅₀, por lo que no son directamente comparables.

El solicitante sostiene que las modificaciones realizadas, el respaldo técnico de los ejemplos, las diferencias estructurales con el estado del arte, y la evidencia experimental presentada demuestran que la invención no es obvia, cumple con los requisitos de patentabilidad y debe ser concedida.

Frente a los anteriores argumentos, para superar la falta de nivel inventivo, esta Oficina se permite responder respectivamente lo siguiente: es necesario resaltar que la estructura de los compuestos pirrolo[2,3-d]pirimidina divulgados en D1 son similares a los de la solicitud, como se observa en el examen de patentabilidad la diferencia entre estos compuestos y los de la solicitud radica en la presencia del grupo sustituyente sulfoximino el cual ya está divulgado en D3 para mejorar la actividad inhibitoria de citoquinas de Janus

Ref. Expediente N° NC2021/0010415

JAK, que se refiere a una serie de inhibidores de JAK (Reivindicación 1 y 6 Pág. 2 a 9). Adicionalmente D3 sugiere la inclusión del grupo sulfoximina en su estructura (Reivindicación 1 y 6 Pág. 2 a 9).

El solicitante presenta un Anexo A con ensayos comparativos de actividad inhibitoria (IC50), donde los compuestos reivindicados no superan en eficacia a oclacitinib (fármaco aprobado), adicionalmente los compuestos de D1 WO2011075334 (Páginas 44 a 53) y D3 CN108341820 (Páginas 22 a 25), muestran una actividad inhibitoria más potente para JAK1 en comparación con los compuestos del Anexo A.

Ambas patentes tienen compuestos con valores de IC50 en el rango (0.1–10 nM), lo que indica una alta actividad inhibitoria, los compuestos de las patentes muestran alta selectividad hacia JAK1 en comparación con JAK2 y JAK3, lo que es un factor crítico para minimizar efectos secundarios.

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

RESUELVE

ARTÍCULO 1: Denegar la 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:

“COMPUESTOS DERIVADOS DE PIRAZOLOPIRIMIDINA Y PIRROLOPIRIMIDINA INHIBIDORES JAK ÚTILES CONTRA ENFERMEDADES INFLAMATORIAS Y EL CÁNCER EN HUMANOS Y/O ANIMALES”

ARTÍCULO 2: Notificar el contenido de la presente resolución a FELICAMED BIOTECHNOLOGY CO., LTD. advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante la 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 22 de mayo de 2025

LA SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



Firmado digitalmente
por: CIELO ELAINNE
RUSINQUE URREGO
Fecha: 2025.05.22
12:05:12 COT
Razón: Validez jurídica.
Ubicación: Bogotá,
Colombia.