

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

Señores
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “COMPUESTOS DE 1,8-NAFTIRIDIN-2-ONA PARA EL TRATAMIENTO DE UNA ENFERMEDAD AUTOINMUNITARIA”

NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2020/083113

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 24 de noviembre de 2020.

PRIORIDAD: CN 2019/120996 de 26 de noviembre 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 a la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada el 04 de octubre de 2022 bajo el número NC2022/0014211, 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 contar con compuestos orgánicos útiles para el tratamiento y/o profilaxis de enfermedades autoinmunitarias, en particular, del lupus eritematoso sistémico o la nefritis lúpica, mediante la inhibición de TLR7 y/o TLR8 y/o TLR9.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea el desarrollo de compuestos de 1,8-naftiridin-2-ona que actúan como antagonistas de TLR7 y/o TLR8 y/o TLR9, útiles para tratar lupus eritematoso sistémico o nefritis lúpica.

3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 04 de octubre de 2022 bajo el número NC2022/0014211.

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. (...)"

Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

Esta oficina informa que las reivindicaciones 1 y 2 no cumplen con el requisito de concisión, ya que ambas definen esencialmente el mismo compuesto químico, variando únicamente en la representación de la estereoquímica entre las fórmulas I y Ia. Esta diferencia no implica una distinción técnica clara que justifique su tratamiento como reivindicaciones independientes, lo que genera una redacción redundante que dificulta la comprensión del alcance de la protección. Se sugiere unificar o reformular dichas reivindicaciones para evitar duplicidad y cumplir con una redacción clara y precisa, conforme al requisito de concisión establecido en la normativa aplicable.

Adicionalmente, esta oficina informa que, la reivindicación 9 hace mención a un procedimiento, pero este no se define mediante una secuencia lógica de etapas y/o mediante sus condiciones técnicas esenciales (como solventes, temperaturas, catalizadores o tiempos de reacción). En consecuencia, se sugiere modificar dicha reivindicación para definir las etapas que caracterizan el procedimiento y proporcionar las condiciones técnicas necesarias que permitan delimitar con claridad el alcance de la protección solicitada.

Finalmente, esta oficina informa que la reivindicación 11 no cumple con el requisito de claridad, ya que se refiere a un compuesto fabricado mediante el proceso definido en la reivindicación 9, lo cual no permite delimitar de manera precisa el alcance de la protección solicitada, ya que un compuesto debe definirse por sus características estructurales y no por su proceso de obtención. Por lo tanto, se sugiere reformular la reivindicación 11 para describir el compuesto por su estructura o, en su defecto, eliminarla.

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 26 de noviembre 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	WO2017106607	“POLYCYCLIC TLR7/8 ANTAGONISTS AND USE THEREOF IN THE TREATMENT OF IMMUNE DISORDERS”	22 de junio de 2017
D2	WO2009111337	“COMPOUNDS AND COMPOSITIONS AS TLR ACTIVITY MODULATORS”	11 de septiembre de 2009

D1¹ divulga compuestos de fórmula (I) que actúa como antagonista de los receptores tipo Toll 7 y 8 (TLR7/8), así como su uso en el tratamiento de trastornos inmunitarios y otras enfermedades asociadas a la sobreexpresión de TLR7/8 (Pág. 1).

D2² divulga moduladores de los receptores tipo Toll (TLRs) y métodos para el uso de dichos compuestos (Pág. 1).

¹<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/058191545/publication/WO2017106607A1?q=WO2017106607>

²<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/040677604/publication/WO2009111337A1?q=WO2009111337>



Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

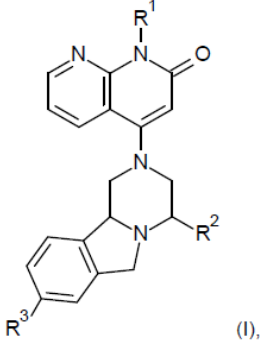
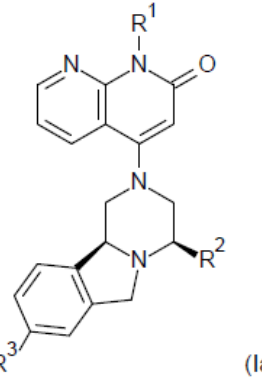
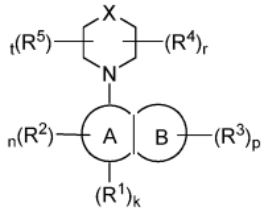
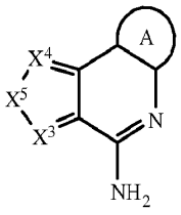
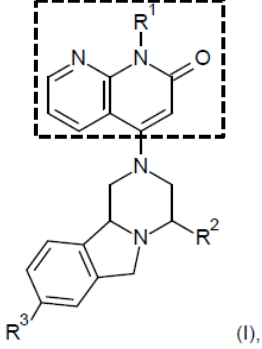
Ref. Expediente N° NC2022/0006942

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. Nivel Inventivo

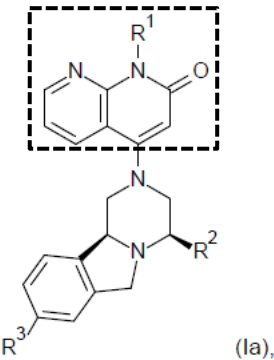
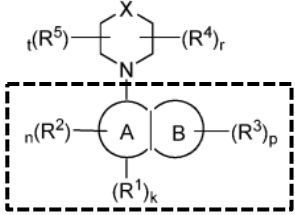
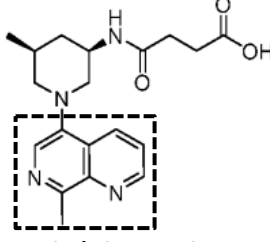
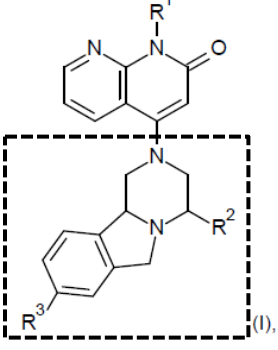
Teniendo en cuenta lo señalado en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, las reivindicaciones independientes 1 y 2 (NC2022/0014211 del 04 de octubre de 2022) refieren a: “Un compuesto de la Fórmula (I), (...)” y “Un compuesto de la Fórmula (Ia), (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1	D2
(Reiv. 1) Un compuesto de la Fórmula (I):  (I), (Reiv. 2) Un compuesto de la Fórmula (Ia):  (Ia),	(Reiv. 1) Un compuesto de Fórmula I:  (Página 534)	(Reiv. 1) Un compuesto de Fórmula I-A:  (Página 337)
En donde R1 es C1-6 alquilo  (I),	(Reiv. 1) Donde el anillo A es arilo o heteroarilo con 1-4 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno o azufre; cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido. El anillo B es arilo o heteroarilo con 1-4 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno o azufre;	No menciona



Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

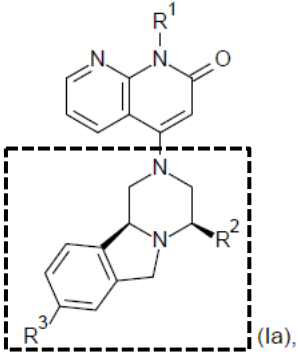
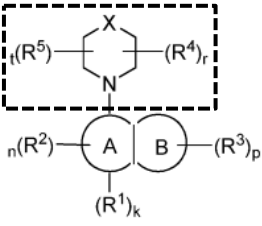
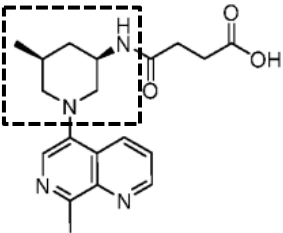
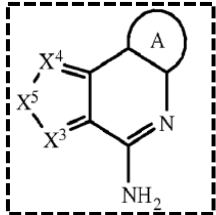
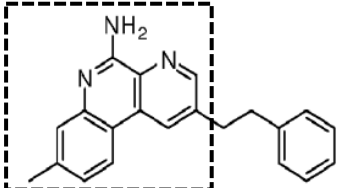
Ref. Expediente N° NC2022/0006942

 (Ia),	cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido. R1 está ausente, -H, -CHF2, -CF3, -OMe o -CN; Cada R2 es independientemente -H, -R, halógeno, -haloalquilo, -OR, -SR, -CN, (...) R3 es independientemente -H, -R, halógeno, -haloalquilo, -OR, -SR, -CN, - NO2 k es 0 o 1; n es 0, 1 o 2; p es 0, 1 o 2  (Página 534-535) Ejemplo 138 de la descripción:  (Página 160)	
En donde R2 es C1-6 alquilo; R3 es (C1-6alcoxiC1-6 alquil) piperazinilo; (C1-6 alquil)2aminoC1-6alcoxi; 2,5-diazabicyclo[2.2.1]heptanilo; 3,4,4a,5,7,7a-hexahidro-2H-pirrollo[3,4-b][1,4]oxazinilo; 3,8-diazabicyclo[3.2.1]octanilo; 3-oxa-9-azabicyclo[3.3.1]nonanilo; (...)  (I),	(Reiv. 1) En donde X es C(R4)₂, O, NR4, S, S(R4) o S(R4)₂; Cada R4 es independientemente -H, -R, halógeno, -haloalquilo, -OR, (...) Cada R5 es independientemente -H, -R, halógeno, -haloalquilo, -OR, -SR, -CN, - NO2, -SO2R, -SOR, -C(O)R, (...) Cada R es independientemente hidrógeno, un alifático C1-6, un arilo C3-10, un anillo carbocíclico saturado o parcialmente insaturado de 3-8 miembros, un anillo heterocíclico de 3-7 miembros que tiene 1-4 heteroátomos seleccionados independientemente entre nitrógeno, oxígeno o azufre, (...)	(Reiv. 1) Donde X3 es N; X4 es N o CR3; X5 es -CR4=CR5; R1 y R2 son H; R3 es H; R4 y R5 se seleccionan independientemente entre H, halógeno, -C(O)OR7, -C(O)R7, (...) El anillo A es un arilo o un heteroarilo, en donde los grupos arilo y heteroarilo del anillo A están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 grupos RA, en donde cada RA se selecciona independientemente de -R8, -R7, (...) R7 se selecciona entre H, alquilo C1-C6, arilo, (...), C1-C6 haloalcoxi y C3-C8 heterocicloalquilo, (...)



Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

 (Ia),	 (Página 534-535) Ejemplo 138 de la descripción:  (Página 160)	Cada R8 se selecciona independientemente de H, (...), heterocicloalquilo C2-C8, (...)  (Página 337-339) Ejemplo 34 de la descripción:  (Página 293)
--	---	---

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en las reivindicaciones 1 y 2, ya que divulga una serie de compuestos para actuar como antagonistas duales de la actividad de TLR7 y TLR8, siendo adecuados para el tratamiento y/o prevención de trastornos relacionados con dichos receptores en mamíferos, especialmente en humanos (Pág. 3).

La diferencia entre la invención definida entre las reivindicaciones 1-2 y los compuestos divulgados en D1, consiste en que los compuestos de la invención presentan un anillo 1,3,4,10b-tetrahidro-pirazino-[2,1-a]isoindol, mientras que los compuestos de D1 poseen un anillo de piperazina sustituido mediante cadenas laterales.

No hay evidencia de que el incluir específicamente un anillo tetrahidropirazino [1,2-a] isoindol proporcione compuestos con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el objeto de D1, puesto que la actividad como antagonistas de TLR7 y TLR8 y su utilidad en el tratamiento de trastornos inmunitarios y otras enfermedades asociadas a la sobreexpresión de dichos receptores, ya había sido prevista en dicho documento (Pág. 1, 3).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el producto conocido en D1 con el fin de mantener la actividad como antagonista de TLR7 y TLR8 para proporcionar otro producto alternativo?

Sin embargo, el incluir un sistema policíclico de anillos condensados para la inhibición de receptores tipo Toll (Toll-like receptors), ya está divulgado en D2 que se refiere a compuestos y composiciones farmacéuticas útiles como moduladores de la actividad de dichos receptores (Pág. 1-2).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir el sistema policíclico de anillos condensados del D2 en el compuesto de D1, para así llegar al objeto de las reivindicaciones 1 y 2. Por lo cual se considera obvia.

Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

Las reivindicaciones dependientes 3 a 8 y 10 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo a los compuestos de las reivindicaciones 1 y 2, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2017106607	1-8, 10	Nivel inventivo
D2	WO2009111337	1-8, 10	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 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° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2022/0006942		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2020/083113		24/11/2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
26/11/2019				X					
Solicitante									
F. HOFFMANN-LA ROCHE AG									
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	1-8, 10	
Palabras clave utilizadas	TLR Antagonist, TLR7 Antagonist, TLR8 Antagonist, TLR9 Antagonist, Toll-Like Receptor, 1,8-naphthyridin-2-one, Naphthyridine, Lupus Nephritis, Autoimmune Disease, Systemic Lupus Erythematosus	
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP:	C07D 519/00, A61P 37/00, A61K 31/4985
	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	10122816	21/06/2011	-	-	A
	NC2020/0014677	10/12/2020	-	-	A
	NC2021/0013166	10/12/2021	-	-	A
ISA-EPO	US4273773	16/06/1981	-	-	A
	WO2017106607	22/06/2017	1-8, 10	Reiv. 1	Y
USPTO	WO2019238616	19/12/2019	-	-	A
Patbase	WO200142244	14/06/2001	-	-	A
	WO2004074218	02/09/2004	-	-	A
	WO2005021546	10/03/2005	-	-	A
	WO198700752	12/02/1987	-	-	A
	WO2016182036	17/11/2016	-	-	A
	WO2009111337	11/09/2009	1-8, 10	Reiv. 1	Y
	WO2011049677	28/04/2011	-	-	A
	WO2015088045	18/06/2015	-	-	A
	WO2011057148	12/05/2011	-	-	A
STN	WO2019233941	12/12/2019	-	-	A
Orbit	WO2019089648	09/05/2019	-	-	A
Googlepatent	WO2020207991	15/10/2020	-	-	A

Oficio N° 13370 de 19 de agosto de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0006942

	WO2020064792	02/04/2020	-	-	A
	WO2021099406	27/05/2021	-	-	A
(¹) Cita completa literatura no patente (LNP) Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. <i>Nombre de la revista. Volumen</i>(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. “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: (14/07/2025)					