

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

Señores
PRINCIPIA BIOPHARMA INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “FORMAS SÓLIDAS DE 2-[3-[4-AMINO-3-(2-FLUORO-4-FENOXI-FENIL)PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIDIN-1-IL]PIPERIDINA-1-CARBONIL]-4-METIL-4-[4-(OXETAN-3-IL)PIPERAZIN-1-IL]PENT-2-ENENITRILO”

NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2020/065689

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 17 de diciembre de 2020.

PRIORIDAD: 20/12/2019, US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 62/951,958

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:

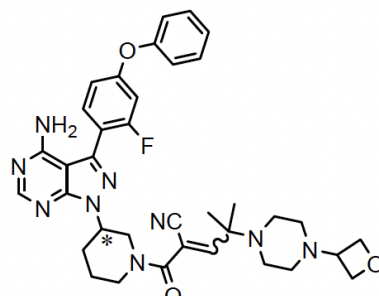
1. Modificaciones presentadas

Revisada la modificación a la solicitud objeto de estudio, la cual fue radicada bajo el número NC2023/0002809 del 7 de marzo de 2023, 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, que sean útiles para tratar desórdenes y condiciones mediadas por la actividad de la BTK, tal como p. ej., el Compuesto (I) y sales farmacéuticamente aceptables de este, y métodos reproducibles y escalables para preparar el mismo.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea una forma solida del compuesto (I)



Fórmula estructural compuesto (I)

3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 7 de marzo de 2023 bajo radicado No. NC2023/0002809.

Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

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. (...)"

Las reivindicaciones 1 a 7 no son claras porque caracterizan la forma sólida del compuesto (I) por parámetros como la densidad aparente, la densidad de compactación, relación de Hausner, tamaño de partícula, pérdida de masa y nivel de solventes residuales, sin embargo, tales caracterizaciones no son aceptables para caracterizar un sólido, ya que tales características dependen de como sea preparado el material y no de la naturaleza sólida del compuesto. Se recomienda caracterizar el sólido del compuesto (I) mediante técnicas bien conocidas y comunes en el ámbito de las ciencias farmacéuticas, principalmente pero no limitado a difracción de rayos X.

1, 3 a 7 no son claras porque las expresiones *"menor que"* y *"mayor que"* son inexactas y no permiten entender cuál es el alcance que se desea lograr con las reivindicaciones. Se sugiere eliminar las expresiones inexactas que precedan características técnicas de la invención.

La reivindicación 36 no es concisa porque la definición de "excipientes", comprenden un número muy extenso de alternativas, 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.

La reivindicación 36 no es clara porque menciona una composición, pero esta no está definida por las proporciones que comprenden cada uno de los elementos que la conforman. Se sugiere caracterizar las composiciones por el nombre químico de sus componentes y las proporciones en las que se encuentran.

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

4.2. Descripción

Revisado el capítulo descriptivo de la solicitud, este no divulga la invención de manera suficientemente clara y completa, para que una persona capacitada en la materia pueda ejecutarla, incumpliendo de esta forma lo establecido en el artículo 28 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, particularmente el literal (c).

c) incluye una descripción de la invención en términos que permitan la comprensión del problema técnico y de la solución aportada, exponiendo diferencias y eventuales ventajas con respecto a la tecnología anterior.

En este sentido la descripción no evidencia el desarrollo de composiciones que comprenden los cristales del compuesto (I) y excipientes.

Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

Se debe tener en cuenta que, de acuerdo con el artículo 34 de la citada Decisión, dicha modificación no podrá ampliar la divulgación inicial; por lo que, en caso de agregar nuevos elementos en la solicitud, la descripción modificada no será aceptada.

5. Unidad de invención

Conforme a lo establecido por el artículo 25 de la Decisión 486 de 2000 de la Comisión de la Comunidad Andina, la solicitud no cumple con el requisito 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 son comunes a todas las invenciones, lo anterior, teniendo en cuenta que el concepto común es el compuesto -[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo que se encuentra divulgado en el estado de la técnica, específicamente en el documento WO2014039899 que divulga el compuesto inhibidor de BTK 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (ejemplo 31).

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

Grupo inventivo 1: Una forma solida del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo caracterizado por una densidad aparente promedio mayor que 300 kg/m³ (0,3 g/cc). (reiv. 1 a 7 completas, 36 parcialmente)

Grupo inventivo 2: Una forma solida del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo caracterizado por una distribución del tamaño de partícula húmeda que tiene un valor de D10 menor que 10 µm (reiv. 9 a 14 completas, 36 parcialmente).

Grupo inventivo 3: Una forma amorfa del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (reiv. 8, 15 y 36 parcialmente).

Grupo inventivo 4: Proceso para producir una forma sólida del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (reiv. 16 a 26 completas).

Grupo inventivo 5: Proceso para producir una forma sólido del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (reiv. 27 a 28 completas).

Grupo inventivo 6: Proceso para producir una forma amorfa del compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (reiv. 29 a 35 completas).

De acuerdo con lo anterior, 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.

Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

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

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 20 de diciembre de 2019, 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	WO2014039899	"Pyrazolopyrimidine compounds as kinase inhibitors"	13 de marzo de 2014

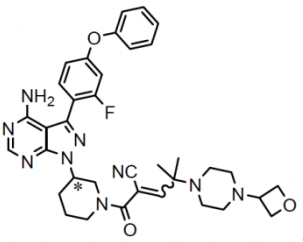
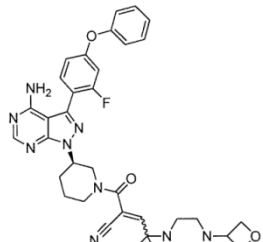
D1¹ divulga inhibidores de BTK, específicamente el compuesto 2-[3-[4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxi-fenil)pirazolo[3,4-D]pirimidin-1-il]piperidina-1-carbonil]-4-metil-4-[4-(oxetan-3-il)piperazin-1-il]pent-2-enenitrilo (ejemplo 31).

7. 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.

7.1. 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 (NC2023/0002809 del 7 de marzo de 2023) refiere a: *"Una forma sólida del Compuesto (I) (...)".* A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Una forma sólida del Compuesto (I) 	Compuesto ejemplo 31 

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

El documento D1 menciona también las composiciones que comprenden el compuesto del ejemplo 31 (pág. 22)

Las reivindicaciones dependientes 2 a 7 tampoco cumplen con el requisito de novedad.

¹<https://patents.google.com/patent/WO2014039899A1>



Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

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 36 (NC2023/0002809 del 7 de marzo de 2023) refiere a: “Una composición farmacéutica que comprende: (...)”. A continuación, se presenta la tabla comparativa entre el objeto reivindicado y los documentos encontrados en el estado de la técnica:

CARACTERÍSTICAS ESENCIALES	D1
Una composición farmacéutica que comprende:	Composición del compuesto ejemplo 31 (ejemplo 31 y pág. 22)
una forma sólida del Compuesto (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15;	Forma solida (ejemplo 31 y pág. 22)
y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable	Excipientes (ejemplo 31 y pág. 22)

De acuerdo con la comparación realizada anteriormente se concluye que la materia de la reivindicación 36 no es nueva.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO201403989	1 a 7 y 36	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.



Sandra Isabel Calderon Rodriguez

Oficio N° **19291** de **30 de octubre de 2025**

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

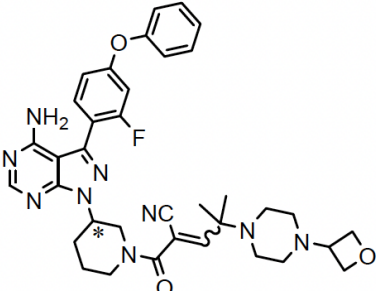


Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2022/0008023		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2020/065689		17/12/2020							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
20/12/2019				X					
Solicitante									
PRINCIPIA BIOPHARMA INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)			8 a 35

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 7 y 36
Palabras clave utilizadas	BTK, Rilzabrutinib, pyrazolo, piperidine, pyrimidin, kinase inhibitor, crystal, amorphus, tapped,
Por estructura	
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A61P 37/00, C07D 487/04, A61K 31/519
	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	NC2022/0005949	09/10/2019	-	-	A
	NC2022/0009916	30/09/2022	-	-	A
STN/JPO/ISA	WO2014039899	13/03/2014	1 a 7 y 36	Ejemplo 31	Y
ISA	WO2015127310	27/08/2015	-	(reiv. 1)	Y
	CN110483521	22/11/2019	-	-	Y
	Shekunov & York	01/04/2000	-	-	Y
	Ghoroi <i>et al.</i>	22/05/2012	-	-	Y
STN	CO 2022009916	30/09/2022	-	-	T
	WO2015/127310	27/08/2015	-	-	Y
PATBASE	WO2017063103	20/04/2017	-	-	A
	WO2015127310	27/08/2015	1 a 7 y 36	(reiv. 1)	Y
	US 2004/0006237	08/01/2004	-	-	A



Oficio N° 19291 de 30 de octubre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0008023

(1) Cita completa literatura no patente (LNP)	Shekunov, B. Y., & York, P. (2000). Crystallization processes in pharmaceutical technology and drug delivery design. Journal of crystal growth, 211(1-4), 122-136.
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.	Ghoroi, C., Gurumurthy, L., McDaniel, D. J., Jallo, L. J., & Davé, R. N. (2013). Multi-faceted characterization of pharmaceutical powders to discern the influence of surface modification. Powder Technology, 236, 63-74.
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: (29/10/2025)	

