

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

Señores
PRINCIPIA BIOPHARMA INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS TÓPICAS QUE COMPRENDEN 2-[3-[4-AMINO-3-(2-FLUORO-4-FENOXI-FENIL)-1H-PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIDIN-1-IL]PIPERIDINA-1-CARBONIL]-4,4-DIMETILPENT-2-ENONITRILLO”
NUMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2021/012507
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 7 de enero de 2021.
PRIORIDAD: 62/958,616 US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 08 de enero de 2020
63/003,536 US (ESTADOS UNIDOS DE AMÉRICA), 01 de abril de 2020.

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 24 de mayo de 2023 bajo el número NC2023/0006715, 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 formulaciones tópicas que comprendan el compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo.

Para resolver dicho problema técnico, la solicitud en estudio plantea composiciones farmaceuticas tópicas que comprenden el compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo.

3. Reivindicaciones estudiadas

El presente estudio se basa en el capítulo reivindicatorio presentado el 24 de mayo de 2023 bajo el número NC2023/0006715.

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:

Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

"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, la reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de "un agente gelificante dependiente del pH", "un emoliente o humectante", "un conservante", "un agente lubricante", "un agente humectante" 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. Igual observación aplica para la reivindicación 14 cuando menciona "un hidrocarburo saturado" y para la reivindicación 24 cuando menciona "un agente de disolución", "un gelificante-emulsionante", "un alcohol", "un emoliente o humectante"

Esta oficina informa que, el capítulo reivindicatorio no es claro, toda vez que la forma cristalina mencionada en las reivindicaciones 44 a 47 no se encuentra debidamente definida ya que esta se debe caracterizar por sus parámetros fisicoquímicos tales como:

1. El patrón de difracción de Rayos X en mono cristal, que es específico de cada polimorfo, por lo cual, si la reivindicación caracteriza el polimorfo mediante este patrón, no se exigirá otro dato.
2. El patrón de difracción de Rayos X en polvo (DRXP), este debe caracterizarse por sus ángulos de difracción del espectro XRPD cuyas intensidades relativas sean iguales o mayores a 30%. Adicionalmente, le debe acompañar otra técnica, como las obtenidas por los métodos de análisis térmico o métodos espectroscópicos, que permita caracterizar el determinado polimorfo, tales como:

Métodos de análisis térmico:

- (a) Calorimetría diferencial de barrido (DSC), o
- (b) Análisis térmico diferencial (DTA), o
- (c) Análisis termogravimétrico (TGA), o
- (d) Microscopía de fase caliente (HSM);

Métodos espectroscópicos:

- (a) Raman, o
- (b) Infrarrojo (IR), o
- (c) Resonancia magnética nuclear Carbono-13 (RMN-C₁₃).

Las reivindicaciones 4 5 y 47 definen al compuesto 1 utilizando un número limitado de picos de rayos X. Una selección aleatoria de un número limitado de picos XRPD, no caracterizan adecuadamente el compuesto cristalino. Para distinguir entre varios polimorfos, deben caracterizarse con precisión y no seleccionando de manera aproximada un grupo de picos, sino especificando los picos principales de las intensidades más altas que caracterizarían el cristal de forma clara y sin ambigüedades (preferiblemente seleccionando los picos específicos que tienen la intensidades más altas). La caracterización por un número limitado de picos en el espectro XRPD no es suficiente para caracterizar el compuesto cristalino por un experto en la materia y distinguirlo de diferentes formas cristalinas. Por lo tanto, se sugiere caracterizar de forma adecuada el material que se desea proteger.

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

5. Unidad de invención

Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

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 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo, y dado que este se encuentra divulgado en el estado de la técnica, específicamente en el documento WO2015127310 (Pág. 2, Ej. 7, Págs. 52 y 53), 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: Una composición farmacéutica tópica que comprende: un compuesto elegido entre 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo y sales farmacéuticamente aceptables del mismo; y un agente gelificante dependiente del pH, un emoliente o humectante, un conservante, un agente lubricante, un agente humectante, y en donde la composición farmacéutica está en la forma de un gel. (reivindicaciones 1 a 13 y parcialmente 34 a 47).

Grupo inventivo 2: Una composición farmacéutica tópica que comprende: un compuesto elegido entre 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo y sales farmacéuticamente aceptables del mismo; y un hidrocarburo saturado, en donde la composición farmacéutica está en la forma de una pomada. (reivindicaciones 14 a 23 y parcialmente 34 a 47).

Grupo inventivo 3: Una composición farmacéutica tópica que comprende: un compuesto elegido entre 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo y sales farmacéuticamente aceptables del mismo; y un agente de disolución, un gelificante-emulsionante, un alcohol, un emoliente o humectante, y en donde la composición farmacéutica está en la forma de una crema. (reivindicaciones 24 a 33 y parcialmente 34 a 47).

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.

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 08 de enero de 2020, 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:

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2015127310	“SALTS AND SOLID FORM OF A BTK INHIBITOR”	27 de agosto de 2015
D2	US10206868	“TOPICAL COMPOSITION”	19 de febrero de 2019

D1¹ divulga el compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo (Pág. 50, Ej. 7) y las composiciones tópicas en gel que comprenden los compuestos inhibidores de BTK divulgados en este documento (Págs. 52 y 53).

D2² divulga los componentes y la preparación de una formulación farmacéutica tópica (Columnas 1 a 33)

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. Nivel Inventivo

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 (NC2023/0006715 del 24 de mayo de 2023) refiere a: *“Una composición farmacéutica tópica que comprende: un compuesto elegido entre 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo (...)”*. 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
Una composición farmacéutica tópica que comprende:	Composiciones farmaceuticas tópicas de los compuestos divulgados (Páginas 52 y 53)	Composición farmacéutica tópica que comprende: (Columna 2, líneas 25 a 40)
un compuesto elegido entre 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo y sales farmacéuticamente aceptables del mismo; y	Compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo (Página 50, Ejemplo 7)	No menciona
un agente gelificante dependiente del pH,	Hidroxipropil celulosa (Página 53)	Agentes gelificantes (Columna 17, línea 5 a Columna 18, línea 2)
Un agente emoliente o humectante	Propilen glicol, miristato de isopropilo (Página 53)	Agentes emolientes (Columna 1, línea 65 a Columna 2, línea 11, Columna 12, línea 9)
un conservante,	No menciona	Agentes conservantes (Columna 18, líneas 4 a 11)

¹<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/053879073/publication/WO2015127310A1?q=WO2015127310>
²<https://worldwide.espacenet.com/patent/search/family/059224695/publication/US10206868B2?q=US10206868>



Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

un agente lubricante,	No menciona	Agentes lubricantes (Columna 1, línea 65 a Columna 2, línea 11, Columna 12, línea 8)
un agente humectante	Propilenglicol (Página 53)	Agentes humectantes (Columna 13, línea 1 a Columna 14, línea 46)

D1 es considerado como el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga el compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo y las composiciones farmacéuticas tópicas que comprenden compuestos inhibidores de BTK como lo es el compuesto mencionado (Págs. 50, 52 y 53).

La diferencia entre la invención definida entre la reivindicación 1 y la formulación divulgada en D1, consiste en que los expedientes específicos que comprenden la composición, en particular los agentes conservantes y lubricantes.

El efecto que se logra al incluir específicamente estos excipientes es que facilita la aplicación tópica del compuesto 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar la formulación divulgada en D1 para proporcionar una formulación que facilite la aplicación tópica de 2-(3-(4-amino-3-(2-fluoro-4-fenoxifenil)-1Hpirazolo[3,4-d]pirimidin-1-il)piperidina-1-carbonil)-4,4-dimetilpent-2-enonitrilo.

Sin embargo, el incluir diversos excipientes para proporcionar una formulación tópica, ya está divulgado en D2 que se refiere a la preparación de formulaciones tópicas que comprenden agentes gelificantes, emolientes, conservantes, lubricantes y emolientes (Columnas 1 a 33).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir los excipientes divulgados en D2 en la composición de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 13 y 34 a 47 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2015127310	1 a 13 y 34 a 47	Nivel inventivo
D2	US10206868	1 a 13 y 34 a 47	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.

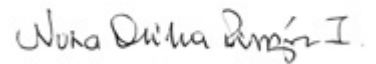


Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

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.



Nubia Milena Pinzon Ibañez
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES (E)

Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2022/0009437		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2021/012507		07/01/2021							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
08/01/2020				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)			14 a 33

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 13 y 34 a 47
Palabras clave utilizadas	Topical composition Gelling agents Emollients Moisturizers Humectantes Lubricant Preservatives gel
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A61K 9/00, A61K 9/06, A61K 47/14
	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	15/04/2021	-	-	A
	NC2022/0006087	22/04/2021	-	-	A
	NC2022/0008023	24/06/2021	-	-	A
ISA EPO CNIPA	WO2016100914	23/06/2016	-	-	A
	WO2014022569	06/02/2014	-	-	A
ISA EPO	WO2014039899	13/03/2014	-	-	A
	US2017224688	10/08/2017	-	-	A
	US2019231784	01/08/2019	-	-	A
USPTO	US8962635	24/02/2015	-	-	A
	WO2015127310	27/08/2015	1 a 13 y 34 a 47	Págs. 50, 51 y 53	Y
	US20080058669	06/03/2008	-	-	A
	US20090186943	23/07/2009	-	-	A
STN	-	-	-	-	A
ORIGIN	US20180256570	13/09/2018	-	-	A
PATBASE	US2008075776	27/03/2008	-	-	A



Oficio N° 20545 de 20 de noviembre de 2025

Ref. Expediente N° NC2022/0009437

	US2011052517	03/03/2011	-	-	A
	US2017208827	27/07/2017	-	-	A
ORBIT	US20090221625	03/09/2009	-	-	A
	US7700076	20/04/2010	-	-	A
	US11616207	28/03/2023	-	-	A
	US10206868	19/02/2019	1 a 13 y 34 a 47	Col. 1 a 33	Y
	EP2854802	08/04/2015	-	-	A
	US20090048296	19/02/2019	-	-	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.			“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.		
“E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior.			“X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado.		
“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.			“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.		
“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.					
Fecha del reporte de búsqueda: (19/11/2025)					

