

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 3
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

COMERCIO

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011 Evento : 379 Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 04.020.062
Asunto : Solicitud de Patente para **TIENO [2,3-D]
PIRIMIDINAS CON ACTIVIDAD AGONISTA
COMBINADA DE LH Y FSH**
Solicitante : **N.V. ORGANON**
Fecha de Solicitud : 4 de marzo de 2004

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. No. **16813** notificado por fijación en lista del 28 de diciembre de 2007.

2. Mediante mi memorial de fecha 26 de marzo de 2008 solicité un plazo de 30 días para atender el Oficio No. **16813**.

3. Mediante el Oficio No. **16813** se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente.

Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

3.1. CLARIDAD Y NOVEDAD DE LA SOLICITUD

Ese Despacho afirma que a partir de la información revelada en la descripción, no es posible concluir si los compuestos reivindicados son activos a no. Adicionalmente, el Despacho afirma que el documento **D1** afecta la novedad de la presente invención, con lo cual continuamos en desacuerdo por los argumentos expuestos a continuación. Veamos:



A este respecto, respetuosamente ponemos de presente que de acuerdo con los conocimientos del estado del arte, los pacientes que sufren de infertilidad son tratados con hormonas FSH y LH, mediante un mecanismo de acción que comprende la modulación de sus receptores respectivos. Así, los compuestos de la presente solicitud de patente por medio de los ejemplos de la descripción han demostrado que se unen a ambos receptores. Adicionalmente, la mitad de los compuestos han sido probados en campo con resultados y efectos positivos en cuanto a la formación de óvulos. A este respecto, es importante mencionar que si no existiera un activador del receptor, el resultado obtenido, teniendo en cuenta el mecanismo de acción, sería nulo, lo cual indica que los compuestos aquí reivindicados, si bien varían en su efecto, si son activos y actúan sobre ambos receptores.

Por consiguiente, toda vez que la invención de mi representada trata nuevos compuestos que tienen una actividad sorprendente e inesperada sobre ambos receptores y que la estandarización u optimización de los niveles de actividad comprenderían un estudio posterior relacionado con la posible selección de un compuesto o la adaptación de un protocolo, lo cual no compete a la presente solicitud; es adecuado concluir que la actividad de los compuestos aquí reivindicados esta debidamente sustentada en el pliego descriptivo.

Adicionalmente, respetuosamente reiteramos al Despacho que *El Manual Para El Examen De Solicitudes De Patentes de la Comunidad Andina*¹, ha sostenido lo siguiente:

"Una formula general no destruye la novedad de un compuesto o un subgrupo de compuestos incluidos en ella. Compuestos específicos en un documento destruyen la novedad de un formula general.

¹ IEPI, BID. **"MANUAL PARA EL EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION EN LAS OFICINAS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL DE LOS PAISES DE LA COMUNIDAD ANDINA"**. Quito, Ecuador 2004. Pág. 71.

3

Si una formula tiene sustituyentes específicos listados, se considera que la selección de una de las posibilidades cuando solo hay una lista de alternativas para un sustituyente que carece de novedad. Es decir, se considera una formula general con variación en un solo sustituyente y en el que todas las alternativas para este sustituyente estén listadas es equivalente al listado de todos los compuestos específicos. Sin embargo, si hay que hacer una selección en dos listas o más de sustituyentes para llegar al objeto de la reivindicación, entonces se considera que hay novedad." (Subrayado y negrita fuera de texto).

A este respecto y teniendo en cuenta lo anterior, solicitamos que a partir del análisis de novedad en áreas específicas de la tecnología planteado por el Manual Andino de Patentes, se evalúe la patentabilidad de la presente invención, toda vez que los compuestos generales descritos en D1 no destruyen la novedad de los compuestos específicos reivindicados por mi representada pues con el fin de obtener las posibles combinaciones de compuestos reivindicados, fue necesario hacer una selección de mas de dos listas de sustituyentes.

Así, el análisis realizado por el señor Examinador es desafortunado, toda vez que se implementan valores preferidos para Y, X, B y A. Sin embargo, al escoger dichos valores preferidos adicionalmente se incluye el valor para R1. A este respecto, el examinador establece que el valor preferido para R1 es R7, mas aún en la formula II preferida no se establece el valor para dicho sustituyente.

Por lo tanto, a partir de lo anterior, es evidente que fue necesario hacer selección de más de dos listas de sustituyentes. Así, respetuosamente reiteramos al Despacho que los compuestos de la presente invención constituyen una selección de los compuestos generales revelados en D1.

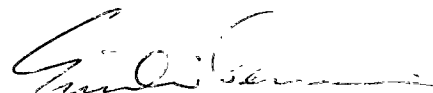


Adicionalmente, los compuestos tienen una actividad LH/FSH combinada, de la cual no se hace mención o derivación alguna en la anterioridad citada. A este respecto, se debe tener en cuenta que esta actividad es una característica fundamental de la presente invención como quiera que es lo que demuestra que la misma resuelve el problema técnico planteado.

Así entonces, si bien puede llegar a existir un solapamiento entre la solicitud de mi representada y la anterioridad citada, es claro que D1 no anticipa todas las características técnicas de los compuestos de la presente invención ni tiene enseñanza alguna que permita derivar estas de manera obvia y/o evidente, se debe concluir que dicho documento no afecta ni la novedad ni el nivel inventivo de la presente solicitud.

4. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá,
Señora Jefe,


EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

COLO-00299-843-006-6
COLO-11214-841-014-8
NNJ\NNJ\ID-125208\WPCL0299
No. M-2008-125208\NNJ

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

Radicación No. 04020062

Clasificación Internacional (IPC): A61K31/505, C07D495/04, A61P15/08.

Concepto Técnico No.

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados

Descripción: Folios: 49 a 90 (como se radicó inicialmente)

Reivindicaciones: Folios: 91 a 93 (como se radicó inicialmente)
Folio: 133 Modificado.

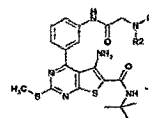
Respuesta del solicitante: Folios: 127 a 131 Primera respuesta.
Folios: 147 a 150 Segunda respuesta.

Prioridad: Folio 1 (4 de septiembre de 2001, EP01203327.0).

Objeto de la invención

- Título de la solicitud: Tieno [2,3D] pirimidinas con actividad agonista combinada de LH y FSH.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:
Compuestos derivados de Thieno [2,3D] pirimidinas



Reivindicaciones 1– 2 : Compuestos de la fórmula general (I)

Reivindicación 3 : Una Composición farmacéutica que lo contiene.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de compuestos que tienen actividad agonista de la hormona luteinizante(LH) como de la hormona estimulante del folículo (FSH), útiles en el control de la fertilidad.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula (I), procedimientos para su preparación y composiciones farmacéuticas que emplean dichos compuestos.

Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 04-09-2001, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud :

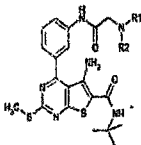
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación*
D1	WO00/61586	BICYCLIC HETEROAROMATIC COMPOUNDS USEFUL AS LH AGONIST	19-10-2000

Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

Respecto a la solicitud en estudio:

La reivindicación 1 reclama :

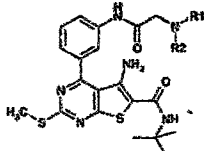
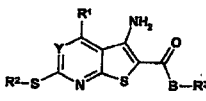
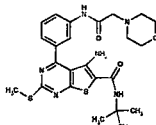
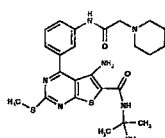
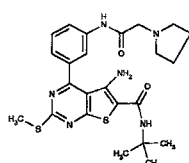
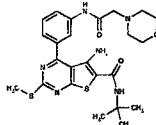
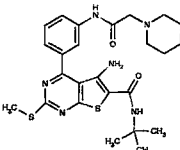
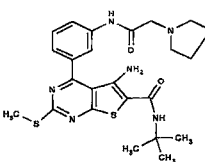


Compuestos de la fórmula general (I)

Respecto al estado de la Técnica:

D1 (Folio 117 a Folio 126 y Folios 135-137) enseña compuestos de bicíclicos heteroaromáticos caracterizados por ser agonistas LH ,útiles en terapias regular la fertilidad.

Al comparar elemento por elemento el objeto de la presente solicitud con el estado de la técnica, esta oficina encuentra

SOLICITUD		ANTERIORIDAD D1	
 Según la reivindicación 1 al realizar las respectivas sustituciones encontramos.		 Según la descripción para el compuesto de fórmula II y al realizar las respectivas sustituciones encontramos.	
  	R1 y R2 se unen para formar un anillo de 2 a 6 átomos de carbono que contiene opcionalmente uno o más heteroátomos seleccionados de N,O y/o S. (morfolinil, piperidinil, pirrolidinil)	  	En donde : Y es N . B es NH. R ¹ es arilo C ₆₋₁₄ . (Fenilo) el cual se encuentra sustituido en la posición meta por un grupo NR ⁸ y R ⁸ es alquilcarbonilo (C ₁₋₈), en el cual el grupo alquil se encuentra sustituido por un grupo heterocicloalquilo C ₂₋₇ (morfolino, piperidina o pirrolidina)
			R ² es alquilo C ₁₋₈ (metilo) R ³ es terbutilo.

Que D1 (folio 135, página 4 , compuesto de fórmula II, líneas 12-13,21-29; Folio 136, líneas 1-2, 14-15,24-27;Folio 137, líneas 9,14; Folio 120, líneas 9-14,16,21-23) ya encierra compuestos reclamados bajo la fórmula I enseñada en la solicitud, tal como se expone en el cuadro comparativo. En consecuencia, dichos compuestos reclamados y la composición farmacéutica que lo contiene, se encuentran ya cubiertos por el alcance de D1 y no son nuevos.

Respuesta a los argumentos del solicitante.

El solicitante expone los siguientes argumentos a favor de la novedad de la presente solicitud:

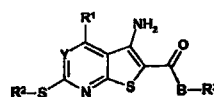
1. Argumenta el solicitante en cuanto a la novedad que los compuestos generales descritos en D1 no destruyen la novedad de los compuestos específicos reivindicados, pues con el fin de obtener las posibles combinaciones de compuestos reivindicados, fue necesario hacer una selección de más de dos listas de sustituyentes.
2. El solicitante afirma no estar de acuerdo con el análisis realizado por este Despacho toda vez que se implementan valores preferidos para Y, X, B, A. ya que al escoger dichos valores preferidos adicionalmente se incluye el valor para R1. A este respecto se establece que el valor preferido para R1 es R7, más sin embargo en la fórmula II preferida no se establece el valor para dicho sustituyente.
3. Los compuestos de la presente invención constituyen una selección de los compuestos generales revelados en D1.
4. El documento D1 no puede ser considerado como una anterioridad válida capaz de afectar la novedad de la presente invención. Por lo tanto la invención cumple con los requisitos de novedad.
5. Adicionalmente los compuestos tienen una actividad LH/FSH combinada de la cual no se hace mención o derivación alguna en la anterioridad citada, lo que demuestra que se resuelve el problema técnico planteado.
6. D1 no anticipa todas las características técnicas de los compuestos de la presente invención, por lo tanto dicho documento no afecta ni la novedad, ni el nivel inventivo de la presente solicitud.

En cuanto a estos argumentos este despacho expone lo siguiente

Para los puntos 1 , 4 y 6

Se le aclara nuevamente al solicitante que el documento D1 según el análisis de patentabilidad realizado a la presente solicitud muestra de manera clara e inequívoca que dicho documento si afecta la novedad . Según la normativa vigente (artículo 16 de la decisión 486) el estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio. En este caso así una persona experta tenga que hacer diferentes selecciones para llegar a los compuestos reclamados en la presente solicitud se debe tener en cuenta que en D1 en la descripción se encuentran descritos de manera concreta los compuestos objeto de la presente invención tal y como se demuestra a continuación:

D1 enseña compuestos de fórmula II



(Ver folio 135, página 4, líneas 21-23).

En los que .

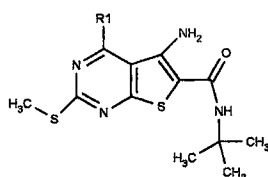
El R^2 más preferido es alquilo C_{1-4} (folio 135, página 4, líneas 28-29). Donde alquilo es metilo (Ver folio 136, página 5, líneas 14-15).

Y más preferido es N (folio 135, página 4, línea 29).

B más preferido es NH (folio 135, página 4, línea 28).

El R^3 más preferido es el radical ter-butilo (Folio 136, página 5, líneas 1-2).

Si realizamos estas sustituciones encontramos.

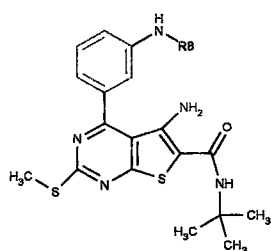


Ahora para definir a R^1 sobre esta estructura encontramos:

R^1 es arilo C_{6-14} (Ver folio 135, página 4, línea 12) .y el arilo preferido es fenilo (Ver folio 137, página 6, líneas 9,14).

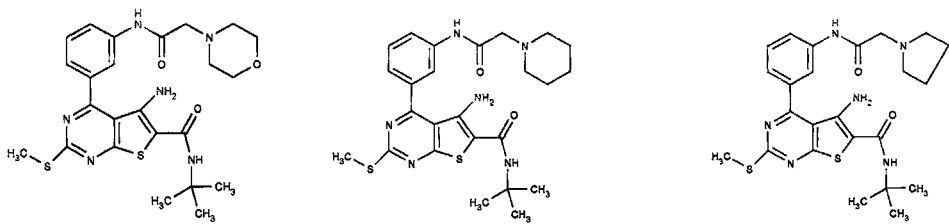
Los sustituyentes para el grupo arilo en R^1 son como se encuentran definidos para R^7 de preferencia NHR^8 y el cual se encuentra en posición meta (Ver folio 135, página 4, línea 26; Folio 120, página 3, línea 9-10,21) .

Hasta este punto tendríamos la siguiente estructura:



R^8 se define de manera preferida como un grupo alquilo (C_{1-8}) carbonilo (Ver folio 120, página 3, línea 22) , en donde dicho grupo alquilo, se encuentra preferiblemente sustituido por un grupo heterocicloalquilo de C_{2-7} (Ver folio 120, página 3, línea 23) y heterocicloalquilo se define como los más preferidos (morfolina, piperidina y pirrolidina, Ver folio 121, página 5, líneas 24-27).

Y finalmente se tendrían las siguientes estructuras.



Por lo tanto las características técnicas esenciales de los compuestos reclamados en la reivindicación 1 si se encuentran divulgadas de manera clara en D1.

Para el punto 2

En cuanto a que se establece que el valor preferido para R¹ es R⁷ y en la fórmula II preferida no se establece el valor para dicho sustituyente, este Despacho está de acuerdo con el solicitante en que en los compuestos preferidos de fórmula II el sustituyente R⁷ no se encuentra desglosado, ya que R¹ se define específicamente como arilo o heteroarilo. Sin embargo al hablar de los sustituyentes para R¹, si se hace referencia a que estos son como se encuentran definidos para R⁷ (Ver folio 135, página 4, línea 26)

Y por último para los puntos 3 y 5 .

Asimismo el solicitante afirma que los compuestos reclamados corresponden a una selección de los compuestos generales revelados en D1. Sin embargo el hecho que seleccionen compuestos que ya son conocidos en el estado del arte y se les determine otro tipo de función no le confiere novedad.

Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO00/61586	1-3	Novedad

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Negar** las reivindicaciones: 1 a 3 (folio: 133).

Bogotá, D.C.,

CONCEPTO TECNICO No.1040	EXAMINADOR TECNICO Código No.202075
------------------------------------	---