

JOSE LLORED A CAMACHO & CO.

ABOGADOS

Calle 72 No. 5-83 Piso 3, Bogotá, D.C. Tel: 6069700 Fax 6069701

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y C
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

Superintendencia de Industria y Comercio



No. 05-000582-00015-0000

Valor: 2010-09-20 17:52:29 Day: 2010-09-20 17:52:29
País: PAZUNJUYU Lvs: 379 FASE: NACIONAL
Act: 444 10-SPULSTARQUE Folios: 11

Re: P1.-WYETH Y ARQUE, INC.-Solicitud de Patente de Invención en Fase Nacional PCT para "FENILSULFONAMIDAS SUSTITUIDAS COMO INHIBIDORES DE LA PRODUCCIÓN DE BETA AMILOIDES".-Clase A61K 31/18.-Expediente número 05-000.582.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista el 9 de Abril de 2010, así como a mi solicitud de plazo de 30 de Junio de 2010 para dar respuesta al auto antes mencionado.

2. Con el fin de responder a las objeciones expuestas por el señor Examinador en su Concepto Técnico No. 1073 bajo los acápites de claridad y novedad, atentamente me permito presentar los siguientes argumentos técnicos y las siguientes modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio de la solicitud, mediante lo cual no sólo se superan dichas objeciones, sino que además se demuestra en forma contundente la patentabilidad de la presente invención.

3. **CLARIDAD DE LA SOLICITUD**

El señor Examinador argumenta lo siguiente en su Concepto Técnico:

"La reivindicación 1 se refiere a dos estructuras químicas (a) y (b), encontrándose que la fórmula (b) se encuentra contenida en la fórmula (a), se sugiere al solicitante emplear una sola Markush en la reivindicación y colocar las respectivas dependencias"

Atendiendo a lo anterior me permito señalar que el solicitante ha decidido modificar el capítulo reivindicatorio de tal manera que ahora la reivindicación 1 se encuentra dirigida a proteger únicamente compuestos de conformidad con la fórmula 1a.

Adicionalmente me permito manifestar ante ese Despacho que el solicitante también ha decidido realizar las siguientes modificaciones en el capítulo reivindicatorio de la invención:

- Limitar los posibles significados de la variable T, eliminado la posibilidad de que la variable R₉ sea H y la variable R₁₀ represente un grupo seleccionado entre alquiloC₁-C₆, alqueniloC₂-C₆, alquenilo sustituido con metilo, alquiniloC₂-C₆, cicloalquiloC₃-C₈, fenilo sustituido, 1-naftilo y CH₂-CH₁-1,3-dioxolano;

- Eliminar la reivindicación 5 actualmente presentada; y,

- Modificar la lista de compuestos específicamente revelados en la reivindicación 6 actualmente presentada (nueva reivindicación 5), de manera que ahora dicha reivindicación se encuentra dirigida a proteger 128 compuestos que encuentran pleno sustento, por ejemplo, en las páginas 16 a 24 de la descripción.

Visto lo anterior, es claro que el nuevo capítulo reivindicatorio de la presente invención cumple a cabalidad con los requisitos de patentabilidad establecidos en el artículo 30 de la Decisión Andina 486 de 2000, toda vez que es claro, conciso y presenta pleno sustento en la descripción de la solicitud de patente en cuestión.

4. ANÁLISIS DE LA NOVEDAD

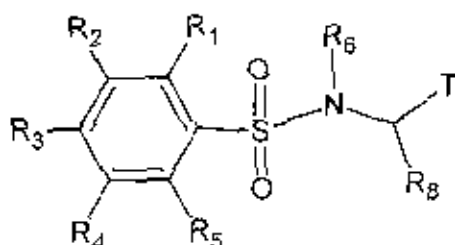
El señor Examinador ha objetado la novedad de la presente solicitud con base en las enseñanzas de los siguientes documentos:

(D3) → EP 0081425

En este sentido, el señor Examinador argumenta básicamente que luego de realizar determinados reemplazos dentro de la fórmula Markush divulgada en el documento D3, es posible obtener los compuestos de la solicitud en cuestión, razón por la cual dicha invención carece de novedad.

Visto lo anterior y con el ánimo de demostrar ante ese Despacho el inequívoco carácter novedoso de la presente invención frente a D3, a continuación me permito presentar las siguientes consideraciones técnicas:

a) La solicitud de patente en cuestión se encuentra dirigida a proteger compuestos que presentan la siguiente estructura química general:



- El anillo de fenilo únicamente puede estar sustituido por átomos de hidrógeno o átomos de elementos halógenos (variables R_1 a R_5);
- El átomo de nitrógeno del grupo sulfonamida solo puede estar sustituido por un átomo de hidrógeno (variable R_6);
- El átomo de carbono en posición α con respecto al nitrógeno de la sulfonamida está enlazado a un átomo de nitrógeno;
- El átomo de carbono en posición α con respecto al nitrógeno de la sulfonamida está enlazado a un grupo alquilo de cadena corta (variable R_8); y,
- El átomo de carbono en posición α con respecto al nitrógeno de la sulfonamida es NO quiral.

$$\begin{array}{c} \text{SO}_2 \\ | \\ \text{C}_6\text{H}_2(\text{R}_3, \text{R}_4, \text{R}_5, \text{R}_6) \\ | \\ \text{N}(\text{R}_7) - (\text{CH}_2)_n - \text{C}(\text{R}_8)(\text{R}_9) - (\text{CH}_2)_m - \text{C}(\text{R}_1)(\text{R}_2)(\text{OR}_{10}) \end{array} \quad [11]$$

Ahora, como es claro del atento análisis de la fórmula general (I) enseñada en D3, los átomos de carbono enlazados a:

- Son átomos quirales.

3

R_1 y R_2 = H, alquilo C_1 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_6 ó arilo opcionalmente sustituido;

R_3 - R_6 = H, NO_2 , NH_2 , CF_3 , halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , SO_2R ó $SO_2R'R$;

R_7 - R_9 = H, alquilo C_1 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , arilalquilo, fenilalquilo ó naftilalquilo;

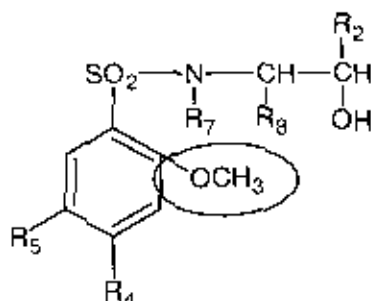
R_{10} = H ó alquilo C_1 - C_{12} ;

n y m = 0 - 10

Así mismo, las fórmulas generales (II) a (XV) divulgadas en D3 también requieren la presencia de dos carbonos quirales dentro de la estructura.

Lo anterior demuestra que los compuestos revelados en la solicitud de patente en cuestión son novedosos frente a aquellos compuestos que caen dentro del alcance de las fórmulas generales I a XV divulgadas en el documento D3, toda vez que es absolutamente claro que ninguno de los átomos de la estructura general Ia revelada en la presente invención es quiral.

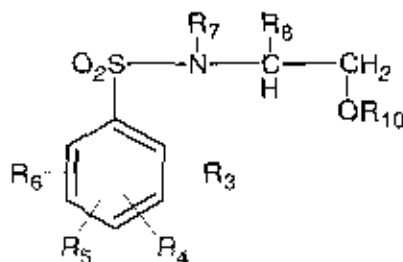
c) De otra parte, los compuestos que caen dentro del alcance de la fórmula general (XVII) enseñada en D3 se caracterizan porque requieren explícitamente la presencia de un grupo metoxi en la posición 2 del anillo fenilo:



Fórmula general (XVII)
enseñada en el documento D3

Hecho que demuestra la novedad de los compuestos de la presente invención frente a tal fórmula general XVII, toda vez que de acuerdo con el capítulo reivindicatorio de la solicitud el anillo de fenilo únicamente puede estar sustituido por hidrógeno o halógeno.

d) Ahora bien, con respecto a la fórmula general (XVI) divulgada en D3:



en donde:

$R_3 - R_6 = H, NO_2, NH_2, CF_3$, halógeno, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , SO_2R o $SO_2R'R$;

R_7 y $R_8 = H$, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , arilalquilo, fenilalquilo o naftilalquilo; y,

$R_{10} = H$ o alquilo C_1-C_{12} ,

Me permito manifestar que si bien el carbono enlazado al grupo OR_{10} no es quiral, a lo largo del documento D3 únicamente se enseñan de manera explícita compuestos en los que las variables R_1 , R_4 , R_5 y R_6 corresponden a grupos metoxi ($-OCH_3$), nitro ($-NO_2$) o amino ($-NH_2$), más de ninguna manera se enseñan compuestos en los que, -tal como ocurre en la presente invención-, dichas variables correspondan a hidrógeno o halógeno. Ahora bien, de acuerdo con las enseñanzas del Manual Andino de Patentes, -una guía práctica que no constituye un marco normativo para el estudio y análisis de patentabilidad de una solicitud en trámite, pero que es una herramienta valiosa para la unificación de la interpretación y la aplicación de la Decisión 486 dentro de los países miembros de la Comunidad Andina, y que por lo tanto permite evaluar de manera razonable e imparcial los requisitos de patentabilidad requeridos para la concesión de una patente-;

"Una fórmula 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 una fórmula general."

Razón por la cual, a la luz de las disposiciones brindadas en el Manual Andino de Patentes es absolutamente claro que el documento D3 no destruye la novedad de la presente invención, la cual por ende cumple a cabalidad con las disposiciones de patentabilidad establecidas en el artículo 16 de la Decisión Andina 486 de 2000.

e) Finalmente, considero de gran importancia destacar que si bien es posible llegar a la estructura química de algunos compuestos de la presente invención a partir de la amplia gama de posibles significados dados a las variables que hacen parte de las fórmulas generales enseñadas en el documento D3, **es absolutamente claro que en dicha anterioridad no se enseña y tampoco se sugiere** la selección de los significados necesarios para llegar a tales compuestos. En otras palabras, de la atenta lectura de D3 es evidente que en dicha anterioridad no existe enseñanza alguna que motive la selección de los significados de las variables R_1 a R_6 y R_8 que hacen parte de la estructura química general revelada en la presente invención, razón por la cual es claro que únicamente es posible llegar a tales novedosos compuestos a partir de una práctica inventiva o empleando un análisis técnico en retrospectiva o del

tipo "hindsight" a partir de las mismas enseñanzas de la solicitud de patente en cuestión.

A éste respecto considero de gran importancia resaltar una vez más ante ese Despacho que a lo largo del documento D3, y en especial en los ejemplos allí divulgados, se hace énfasis en la importancia de que el grupo fenilo esté sustituido por grupos NH_2 , NO_2 u OCH_3 , razón por la cual resulta improbable que la persona experta en la materia hubiera sugerido eliminar tales grupos de la estructura química de los compuestos (tal como ocurre en la presente invención), sin pensar que su actividad como inhibidores β -amiloideos se podría ver seriamente afectada.

Visto lo anterior, es absolutamente claro que las enseñanzas del documento D3 tampoco afectan de manera alguna el nivel inventivo de la materia técnica revelada en el nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud de patente en cuestión, razón por la cual tal invención cumple a cabalidad con las disposiciones de patentabilidad establecidas en el artículo 18 de la Decisión 486 de 2000.

5. CONCLUSIÓN

De conformidad con lo mencionado en el presente memorial, me permito manifestar que el capítulo reivindicatorio de la solicitud en cuestión, tal como ha sido modificado, es claro, conciso y presenta pleno sustento en la descripción de la solicitud.

Así mismo, es claro que los compuestos revelados en la presente invención presentan un inequívoco carácter novedoso e inventivo frente a las enseñanzas del documento D3, toda vez que en dicha anterioridad no se enseña de manera explícita algún compuesto que caiga dentro del alcance del nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud en cuestión y la persona medianamente experta no encuentra en D3 alguna indicación técnica que le sugiera la estructura química de los compuestos revelados en la presente invención.

Por lo tanto, en vista de las modificaciones realizadas en el capítulo reivindicatorio de la presente solicitud, y teniendo en cuenta los argumentos técnicos presentados para demostrar el inequívoco nivel inventivo de la invención en cuestión, resulta completamente claro que se han superado las objeciones expuestas por el señor Examinador en su Concepto Técnico, y por lo tanto, dicha invención es merecedora del privilegio de patente solicitado.

6. Anexo al presente memorial me permito presentar una copia del nuevo capítulo reivindicatorio de la solicitud (compuesto por 5 reivindicaciones), el cual reemplaza al presentado actualmente y en el que se han realizado las modificaciones previamente mencionadas.

33

Señor Superintendente,

T. P. 53.215

- 9 AGO. 200

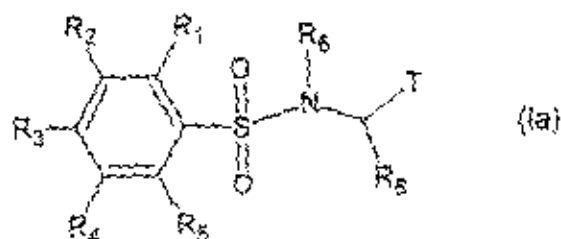
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén



REIVINDICACIONES

Wipac y Argente, Inc.
Exp. 85-000.562

1. Un compuesto de fórmula Ia:



en donde

R_1 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_2 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_3 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

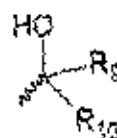
R_4 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de H y halógeno;

R_6 es H;

R_5 es seleccionado del grupo consistente de n-propilo, iso-propilo, iso-butilo, n-butilo, t-butilo, s-butil, hexilo y heptilo;

T es



R_9 y R_{10} son H; o

R_9 y R_{10} son independientemente seleccionados del grupo consistente de alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , fenilo, fenilo-4-sustituido, y 1-naftilo;

en donde:

(i) uno o más de R_1 a R_5 es un halógeno, y,

1
3
3-
2-c
3,5-
2,4-c
4-fluc
2-fluor
4-brom

397

393

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 05-000582

Clasificación Internacional (IPC): C07D307/14; A61K31/18

Concepto Técnico No: 03337

Patente de Invención ☐ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☐ Cap. I ☐ Cap. II ☐

No. Sol. Internacional PCT/US03/18198

Fecha de Presentación Interna: 09 de Junio de 2003

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios: 37 a 141 como se radicó inicialmente

Reivindicaciones: Folios 142 a 170 como se radicó inicialmente
Folios 230 a 253 modificadas
Folios 260 a 283 modificadas
Folios 319 a 342 modificadas
Folios 353 a 373 modificadas
Folios 386 a 392 modificadas

Prioridad: Folios: 1
11 de Junio de 2002, US, 60/387,690

Respuesta del solicitante: Folios 314 a 318; Folios 357 a 362; Folios 382 a 385

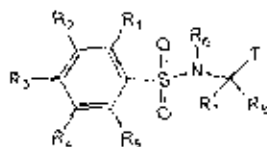
2. Análisis de la Prioridad

La fecha de prioridad del 11 de Junio de 2002 y su correspondiente documento, son aceptados para el estudio de patentabilidad.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "FENILSULFONAMIDAS SUSTITUIDAS COMO INHIBIDORES DE LA PRODUCCIÓN DE BETA AMILOIDES" Folio 1.

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en compuestos moleculares pequeños que inhiben la producción de beta amiloide, sus usos y métodos de tratamiento de fórmula I:



El problema planteado en esta solicitud es obtener compuestos útiles como inhibidores de la producción β amiloides.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula I, Ia y Ib y sus composiciones farmacéuticas.

Clasificación Internacional de Patentes (IPC): C07D307/14; A61K31/18; A61K31/335; A61K31/34; A61K31/341; A61K31/357; A61K31/4045; A61K31/4245; A61K31/655

4. De la solicitud de Patente

Descripción (artículo 28 D. 486)

La descripción cumple con el requisito de claridad o comprensión de acuerdo al art. 28 de la Decisión 486.

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Realizadas las modificaciones por el solicitante al capítulo reivindicatorio, se encuentra que es claro y conciso y está lo suficientemente sustentado por la descripción, cumpliendo con el requisito de claridad, concisión y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.

5. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La solicitud presentada cumple con el requisito de unidad de invención.

6. No es una invención (artículo 15 D 486 literal a)-f))

El capítulo reivindicatorio presentado por el solicitante corresponde a una invención.

7. Excepción a la patentabilidad (artículo 20 D486 literal a)-d))

El capítulo reivindicatorio presentado por el solicitante, es patentable.

8. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

El capítulo reivindicatorio presentado por el solicitante, es patentable.

9. Análisis de la(s) Oposición(es): (artículo 43 D. 486):

No se presentaron oposiciones durante el estudio de patentabilidad de la solicitud presentada

10. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha que se ha tenido en cuenta para determinar el Estado de la Técnica es:

- Fecha de presentación de la solicitud prioritaria: 11 de Junio de 2002

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es: 11/06/2002, no se encontraron documentos que divulguen los compuestos de la solicitud presentada

11. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)**Novedad (artículo 16 D486)**

Los compuestos presentados en la solicitud se consideran novedosos de acuerdo con las enseñanzas del estado de la técnica, puesto que revela fenilsulfonamidas sustituidas con hidrógeno y una cadena hidroalquílica sustituida..

Nivel Inventivo (Art18 D486)

No se encontró dentro del estado de la técnica, tal como lo estipulado en el numeral 10, documento alguno que afecte el nivel inventivo.

La solicitud presentada posee nivel inventivo pues el solicitante resuelve el problema de obtener compuestos inhibidores de β -amiloide, útiles en el tratamiento de Alzheimer, colocando en la sulfonamida un hidrógeno y una cadena lateral hidroxialquílica sustituida con una función alcohólica terminal, siendo esta modificación no obvia para el experto en la materia.

La actividad biológica obtenida con los compuestos de la solicitud presentada es diferente a la de las estructuras químicamente cercanas, ya que eran conocidas para el tratamiento de hiperlipidemias, mientras que los compuestos objeto de invención evidenciaron un efecto técnico inesperado como inhibidores de la β -amiloide, útiles para el tratamiento de Alzheimer.

El problema técnico planteado en esta solicitud como es "obtener compuestos útiles como inhibidores de la producción β amiloides", no sería solucionado fácilmente por el Experto en la Materia y queda plenamente resuelto en la solicitud presentada, demostrando que posee nivel inventivo de acuerdo con el artículo 18 de la Decisión 486.

6. Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Conceder** la reivindicación: 1 a 5 (folios: 386 a 392).

Bogotá, D.C.,

CONCEPTO TÉCNICO No. 03337	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202070
----------------------------	---