

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 700 4814
Fax in U.S.A.: (1-305) 675 7743

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-038137- -00006-0000

Fecha: 2011-08-17 16:40:10 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 523 RESPUESTA Folios: 13

Señor Director

DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

Trámite : 011

Evento : 379

Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 06.038.137

Asunto : Solicitud de Patente para

DERIVADOS DE 1,1,1-TRIFLUOR-4-FENIL-4-METIL-2-(1H-PIRROLO'2,3-C! PIRIDIN-2-ILMETIL)PENTAN-2-OL Y COMPUESTOS RELACIONADOS COMO LIGANDOS GLUCOCORTICOIDES PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES INFLAMATORIAS Y DIABETES

Solicitante : BOEHRINGER INGELHEIM PHARMACEUTICALS INC.

Fecha de Solicitud : 21 de abril de 2006

1. Yo, Luz Clemencia de PAEZ, obrando como apoderada del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 06111 notificado por fijación en lista del 08 de Abril de 2011.

2. Mediante memorial radicado el día 05 de Julio de 2011 solicité plazo de treinta (30) días para atender el oficio No. 06111.

3. Mediante el Oficio No. 06111 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente.

4. De la solicitud de patente

El Examinador considera que existen múltiples posibilidades de sustitución a nivel del compuesto de la fórmula I para los sustituyentes R^1 a R^6 , obteniendo así un número indefinido de compuestos, los cuales no permiten determinar aquellos que presentan la actividad reclamada.

De la misma manera, el Examinador expresa que los términos "profármaco" y "solvato" no son claros, y por lo tanto no permiten definir el alcance de la invención.

5. Excepción a la patentabilidad

El Examinador afirma que las reivindicaciones 31 a 38 hacen referencia a métodos de tratamiento, por lo que la materia reivindicada no se considera como materia patentable.

1. Novedad

De acuerdo con el Examinador, el compuesto reclamado en la presente solicitud carece de novedad a partir de la anterioridad D1, ya que dicho documento enseña compuestos moduladores de la función del receptor de glucocorticoide.

2. Respuesta a las objeciones

De este modo y con el objeto de atender las objeciones arriba mencionadas, se pone de presente al Despacho las siguientes modificaciones, aclaraciones y argumentos:

2.1. Modificación a una Solicitud en Trámite

De conformidad con lo establecido en el artículo 34 de la Decisión 486, que permite modificar la solicitud en cualquier momento del trámite, siempre y cuando no se amplíe la protección correspondiente a la divulgación de la solicitud inicial, me permito presentar un nuevo capítulo reivindicatorio que comprende 5 reivindicaciones. De esta manera las objeciones formuladas relacionadas con la claridad y concisión de las reivindicaciones, quedan superadas respectivamente con las modificaciones realizadas de la manera como se expone a continuación:

2.1.1. La reivindicación 1 ha sido redactada nuevamente, restringiendo el alcance de la presente solicitud de patente, tal que el soporte dado por la descripción, y específicamente por las tablas resulta suficiente. De esta forma, el capítulo reivindicatorio corresponde a una generalización apropiada basada en la información presentada en las especificaciones, en la que se define un compuesto seleccionado de:

4-Pirimidin-5-il-2-[4,4,4-trifluor-3-hidroxi-1,1-dimetil-3-(1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)butil]fenol

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metoxifenil)-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metoxifenil)-4-metil-2-tieno[2,3-d]piridazin-2-ilmetilpentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5*H*-pirrolo[3,2-*c*]piridazin-6-ilmetil)pentan-2-ol

4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2-(5-dimetilamino-1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)-1,1,1-trifluor-4-metilpentan-2-ol

4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-1,1,1-trifluor-4-metil-2-pirrolo[3,2-*b*]piridin-1-ilmetilpentan-2-ol

2-(5-Cloro-1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)-1,1,1-trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metilpentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-metil-2-(5-morfolin-4-il-1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)-4-(3-pirimidin-5-ilfenil)pentan-2-ol

2-[4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2-hidroxi-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1*H*-pirrolo[3,2-*b*]piridin-5-carbonitrilo

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5*H*-pirrolo[3,2-*d*]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol

4-Fluor-2-[4,4,4-trifluor-3-hidroxi-1,1-dimetil-3-(5*H*-pirrolo[3,2-*d*]pirimidin-6-ilmetil)butil]fenol

4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-1,1,1-trifluor-4-metil-2-(5*H*-pirrolo[3,2-*d*]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-4-metil-2-(5*H*-pirrolo[3,2-*d*]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-(2-metoxi-5-pirimidin-5-ilfenil)-4-metil-2-(1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-(2-metoxi-5-piridin-3-ilfenil)-4-metil-2-(1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol

1,1,1-Trifluor-4-metil-4-(3-morfolin-4-ilmetilfenil)-2-(1*H*-pirrolo[3,2-*c*]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol

2-[2-Hidroxi-4-(5-metansulfonil-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1*H*-indol-6-carbonitrilo

1,1,1-Trifluor-4-metil-4-(3-morfolin-4-ilmetilfenil)-2-(5-morfolin-4-il-1*H*-pirrolo[2,3-*c*]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol

5-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2,5-dimetil-3-(1*H*-pirrolo[3,2-*c*]piridin-2-ilmetil)hexan-3-ol

5-(5-Fluor-2-metilfenil)-2,2,5-trimetil-3-(1*H*-pirrolo[3,2-*c*]piridin-2-ilmetil)hexan-3-ol

o un tautómero, ester, amida, solvato o sal del mismo.

2.1.2. Con relación a la afirmación por medio de la cual el Examinador expresa que los términos “profármaco” y “solvato” no son claros, se quiere poner de presente que dichos términos se encuentran debidamente definidos en la descripción.

En este sentido, de acuerdo a las líneas 13 a 40 de la página 219 de la memoria descriptiva, los términos “profármaco” o “derivado de profármaco” hacen referencia a un derivado o vehículo unido covalentemente del compuesto progenitor o la sustancia farmacéutica activa que se somete al menos a alguna biotransformación previo a presentar su efecto farmacológico.

Por otro lado, el término “solvato” hace referencia a una asociación física de un compuesto con una o más moléculas de solvente o un complejo de estequiometría variable formado por un soluto y un solvente, en donde dicha asociación física puede incluir diferentes grados de unión iónica y covalente, como puede observarse en las líneas 16 a 24 de la página 221 de la descripción.

Con base en las anteriores definiciones, y la restricción hecha a la solicitud sobre los 20 compuestos previamente enunciados, consideramos que una persona medianamente versada en la materia está en la capacidad de comprender e identificar los derivados y tipos de asociaciones físicas reclamadas en la presente solicitud mediante los términos previamente mencionados.

2.1.3. Por último, deseamos poner de presente que el título de la presente solicitud se modifica a:

“DERIVADOS DE 1,1,1-TRIFLUOR-4-FENIL-4-METIL-2-(1H-PIRROLO’2,3-C! PIRIDIN-2-ILMETIL)PENTAN-2-OL Y COMPUESTOS RELACIONADOS COMO LIGANDOS GLUCOCORTICOIDES PARA EL TRATAMIENTO DE ENFERMEDADES INFLAMATORIAS Y DIABETES”

De acuerdo al título de la solicitud internacional.

2.1.4. Consideramos entonces que las modificaciones introducidas al capítulo reivindicatorio dan respuesta a las diferentes objeciones formuladas por el Examinador, de manera que las mismas se ven superadas. Solicitamos atentamente tener en cuenta el nuevo capítulo reivindicatorio que se presenta, el cual cumple con las disposiciones de la Decisión 486.

2.2. Excepción a la patentabilidad

El Examinador afirma que el objeto de las reivindicaciones 31 a 38 no es patentable de acuerdo con el artículo 20. Al tener en cuenta que el nuevo pliego reivindicatorio no hace referencia alguna a un método de tratamiento, damos por superada la objeción del Examinador.

2.3. Argumentos a favor de la novedad de la solicitud

El Examinador cita el documento D1, y manifiesta que este afecta la novedad de la presente invención, ya que reclaman compuestos modulares de la función del receptor del glucocorticoide.

En este sentido, mi Representada desea poner de presente que, siguiendo las recomendaciones realizadas por su Despacho, se ha limitado el alcance de la presente solicitud a 20 compuestos presentes en las tablas de la memoria descriptiva, las cuales como es afirmado por el Señor Examinador, no se encuentran específicamente divulgados dentro del alcance del documento citado, y son bastante representativos del objeto de la invención.

De esta manera, consideramos que el documento D1 ya no se considera una anterioridad válida que pueda afectar la novedad de la presente solicitud por no revelar todas y cada una de las características técnicas del compuesto reivindicado.

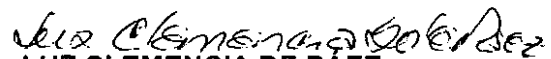
6. Conclusiones

Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación. Sin embargo, en el evento que el Despacho considere que una modificación adicional es necesaria, respetuosamente le solicito hacer uso de la facultad que le otorga el artículo 45 inciso 2 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

7. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por cinco (05) reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.

Señor Director,


LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555

COLO-07612-841-012-3
LLGILLGVID-198825WPCL7612
No. M-2011-198825\LLG



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1

SOLICITUD DE:

☐

Corrección de Error Material

☒

Modificación a una solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: BOEHRINGER INGELHEIM
PHARMACEUTICALS INC.

Sociedad constituida y existente bajo las leyes del Estado de Delaware, Estados Unidos de América.

Dirección: 900 Ridgebury Road,
P.O. Box 368, Ridgefield,
Connecticut 06877-0368,
Estados Unidos de América

Domicilio: Ridgefield,
Connecticut,
Estados Unidos de América

Teléfono: 546 09 70 **Fax:** 249 40 70
E-mail: clientes@cavelier.com

IDENTIFICACION

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número: _____

3

REPRESENTANTE O APODERADO

Nombre: Luz Clemencia de PAEZ

Dirección: Carrera 4ª No. 72-35

Teléfono: 347 36 11 **Fax:** 217 92 11

E-mail: cavelier@cavelier.com

IDENTIFICACION

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número: 35.456.344 TP 23.555

4

Número de expediente: 06.038.137

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 5 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.

6

Comprobante de pago No. _____ **Fecha:** _____

7

Anexos

- ☐ Comprobante de pago de la tasa por \$118.000, por concepto de modificaciones.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por.
- ☐ Poderes, si fuere el caso
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.
- ☐ Copia auténtica de la sustitución que del poder otorgado por la Sociedad Solicitante hizo el Doctor EMILIO FERRERO a mi favor, y para lo cual solicito me sea reconocida personería para continuar con el trámite del asunto de la referencia.

8

NOMBRE: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

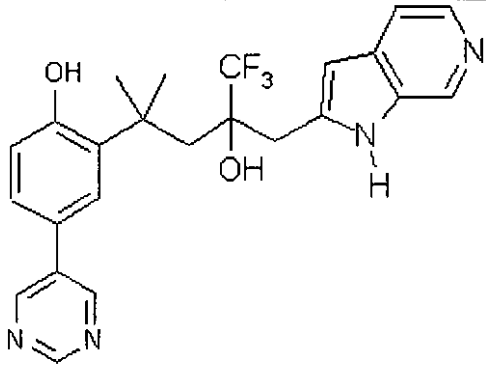
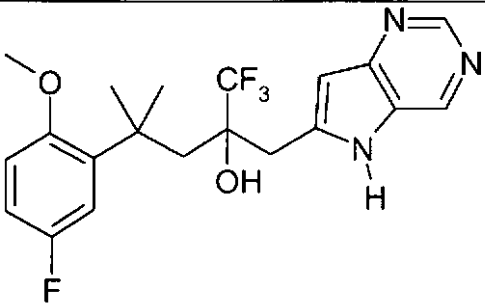
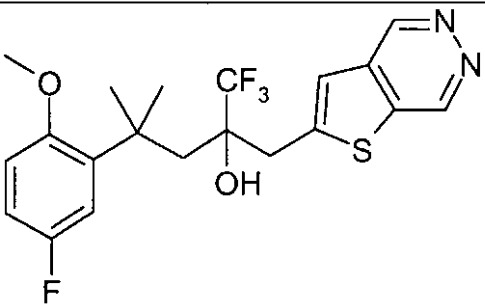
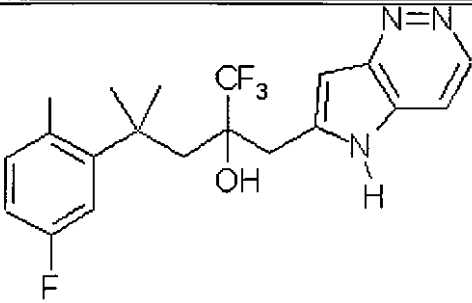
FIRMA: *Luz Clemencia de Paez*

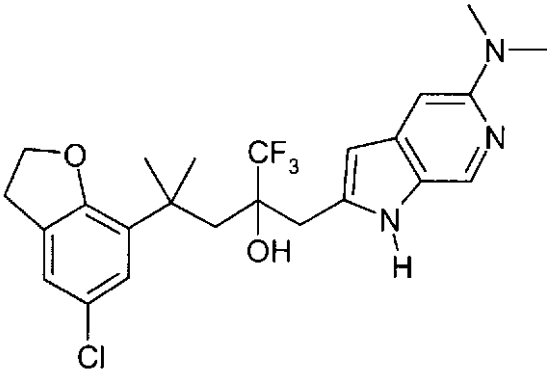
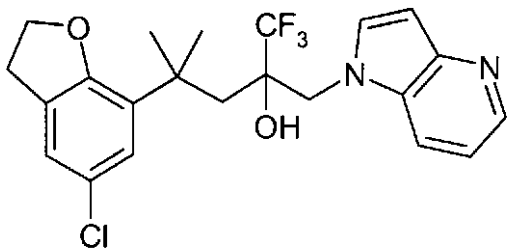
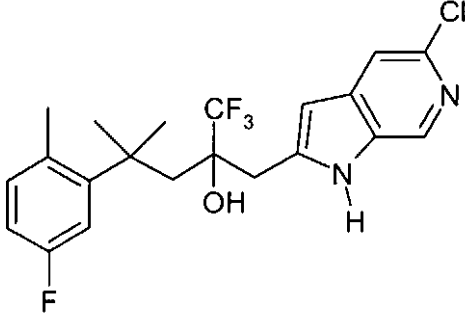
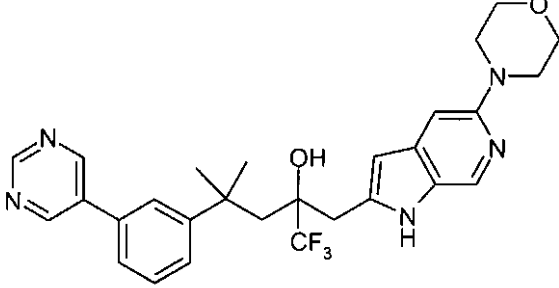
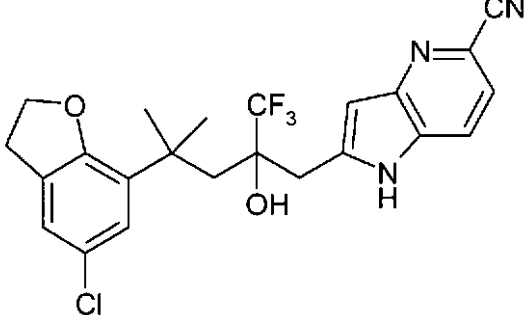
C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P.A. 23.555

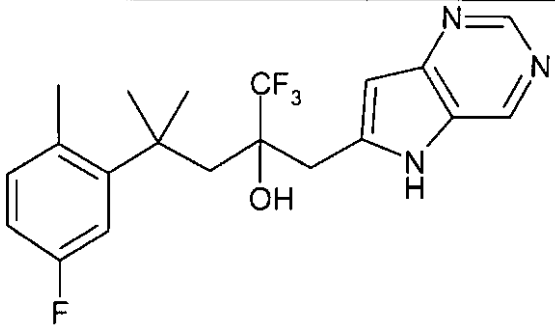
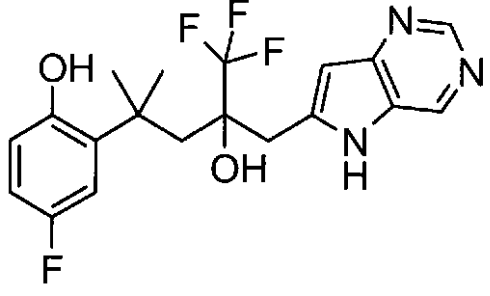
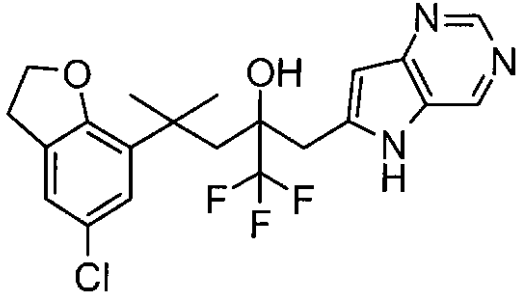
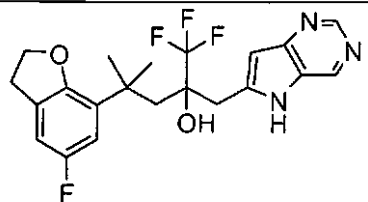
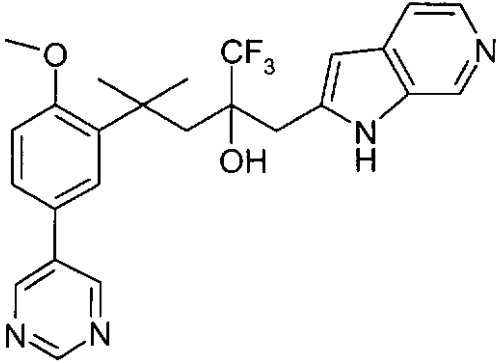
LLG

Reivindicaciones

1. Un compuesto seleccionado de:

4-Pirimidin-5-il-2-[4,4,4-trifluor-3-hidroxi-1,1-dimetil-3-(1<i>H</i>-pirrolo[2,3-<i>c</i>]piridin-2-ilmetil)butil]fenol	
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metoxifenil)-4-metil-2-(5<i>H</i>-pirrolo[3,2-<i>d</i>]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metoxifenil)-4-metil-2-tieno[2,3-<i>d</i>]piridazin-2-ilmetilpentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5<i>H</i>-pirrolo[3,2-<i>c</i>]piridazin-6-ilmetil)pentan-2-ol	

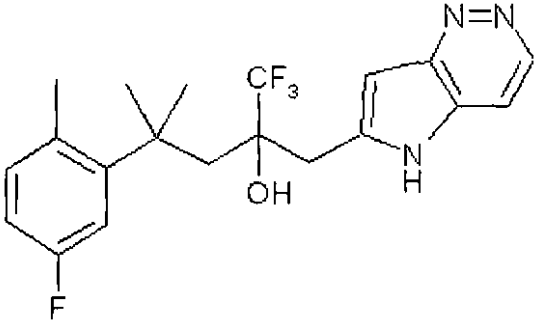
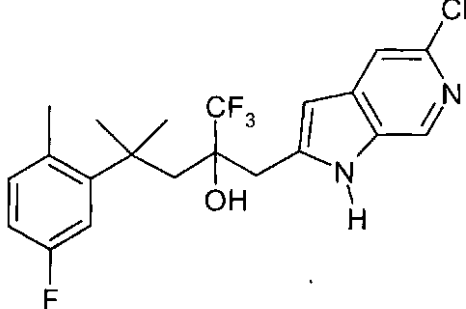
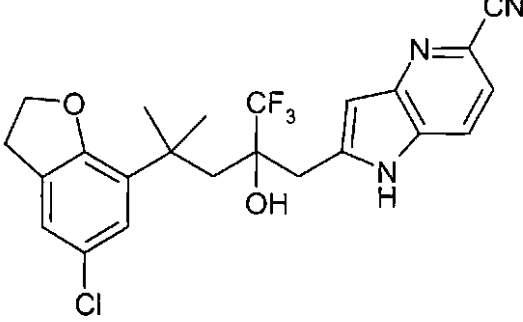
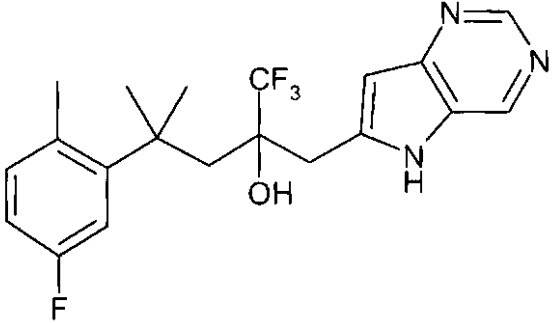
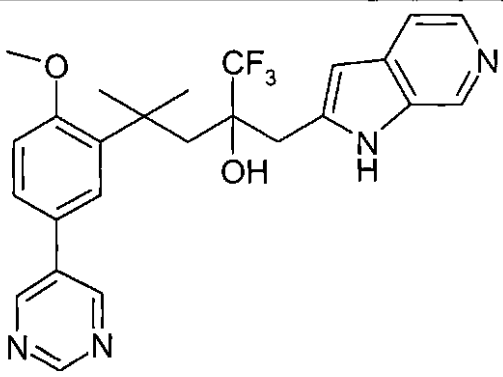
4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2-(5-dimetilamino-1<i>H</i>-pirrolo[2,3-<i>c</i>]piridin-2-ilmetil)-1,1,1-trifluor-4-metilpentan-2-ol	
4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-1,1,1-trifluor-4-metil-2-pirrolo[3,2-<i>b</i>]piridin-1-ilmetilpentan-2-ol	
2-(5-Cloro-1<i>H</i>-pirrolo[2,3-<i>c</i>]piridin-2-ilmetil)-1,1,1-trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metilpentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-metil-2-(5-morfolin-4-il-1<i>H</i>-pirrolo[2,3-<i>c</i>]piridin-2-ilmetil)-4-(3-pirimidin-5-ilfenil)pentan-2-ol	
2-[4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2-hidroxi-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1<i>H</i>-pirrolo[3,2-<i>b</i>]piridin-5-carbonitrilo	

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
4-Fluor-2-[4,4,4-trifluor-3-hidroxi-1,1-dimetil-3-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)butil]fenol	
4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-1,1,1-trifluor-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-(2-metoxi-5-pirimidin-5-ilfenil)-4-metil-2-(1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol	

1,1,1-Trifluor-4-(2-metoxi-5-piridin-3-ilfenil)-4-metil-2-(1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-metil-4-(3-morfolin-4-ilmetilfenil)-2-(1H-pirrolo[3,2-c]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol	
2-[2-Hidroxi-4-(5-metansulfonil-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1H-indol-6-carbonitrilo	
1,1,1-Trifluor-4-metil-4-(3-morfolin-4-ilmetilfenil)-2-(5-morfolin-4-il-1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol	
5-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2,5-dimetil-3-(1H-pirrolo[3,2-c]piridin-2-ilmetil)hexan-3-ol	
5-(5-Fluor-2-metilfenil)-2,2,5-trimetil-3-(1H-pirrolo[3,2-c]piridin-2-ilmetil)hexan-3-ol	

o un tautómero, ester, amida, solvato o sal del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, seleccionado de:

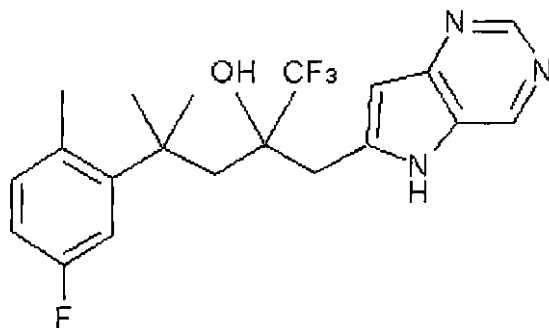
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-c]piridazin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
2-(5-Cloro-1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)-1,1,1-trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metilpentan-2-ol	
2-[4-(5-Cloro-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-2-hidroxi-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1H-pirrolo[3,2-b]piridin-5-carbonitrilo	
1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5H-pirrolo[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol	
1,1,1-Trifluor-4-(2-metoxi-5-pirimidin-5-ilfenil)-4-metil-2-(1H-pirrolo[2,3-c]piridin-2-ilmetil)pentan-2-ol	

2-[2-Hidroxi-4-(5-metansulfonil-2,3-dihidrobenzofuran-7-il)-4-metil-2-trifluormetilpentil]-1H-indol-6-carbonitrilo	
5-(5-Fluor-2-metilfenil)-2,2,5-trimetil-3-(1H-pirrol[3,2-c]piridin-2-ilmetil)hexan-3-ol	

o un tautómero, ester, amida, solvato o sal del mismo.

3. Un compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, donde dicho compuesto es:

1,1,1-Trifluor-4-(5-fluor-2-metilfenil)-4-metil-2-(5H-pirrol[3,2-d]pirimidin-6-ilmetil)pentan-2-ol



o un enantiómero, tautómero, ester, amida, solvato o sal del mismo.

4. Una composición farmacéutica que comprende una cantidad efectiva de un compuesto de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 3, o un tautómero, amida, ésteres, solvato o sal del mismo, y un excipiente o vehículo aceptable farmacológicamente.

5. Un kit para la determinación diagnóstica *in vitro* de la función del receptor glucocorticoide en una muestra, que comprende:

- Una cantidad diagnósticamente efectiva del compuesto de acuerdo a la reivindicación 1, o un tautómero, amida, ésteres, solvato o sal del mismo; y
- Instrucciones de uso para el kit de diagnóstico.