

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Dirección de Nuevas Creaciones

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-158655- -00005-0000

Fecha: 2015-08-26 10:00:42 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

REF. PCT- PATENTE DE INVENCION

Invención: "NOVEDOSAS DIHIDROPIRIMIDINOISOQUINOLINONAS Y COMPOSICIONES FARMACEUTICAS DE LAS MISMAS PARA EL TRATAMIENTO DE TRASTORNOS INFLAMATORIOS".

Expediente: 14-158.655

TITULAR: GALAPAGOS NV

Asunto: RESPUESTA ACCIÓN OFICIAL DE FONDO

MAURICIO PATIÑO BONNET, mayor de edad, vecino de esta ciudad, identificado como aparece al pie de mi firma, en mi calidad de apoderado de **GALAPAGOS NV**, por medio del presente memorial y dentro del término legal correspondiente, presento respuesta a la acción oficial notificada mediante el oficio No. **5324 del 16 de mayo de 2015**, en los siguientes términos:

I. MODIFICACIONES A LAS REIVINDICACIONES

Se presenta junto a este memorial un nuevo capítulo reivindicatorio que consta de once reivindicaciones (11) reivindicaciones, las cuales han sido enmendadas de la siguiente manera:

- Se eliminaron las reivindicaciones originales 2 , 4 , 5, 7-11 y 16-20.

- Se modificó la Reivindicación 1 para incorporar las limitaciones de la reivindicación original 3 y ahora se refiere a la Fórmula IIIa. El soporte para esta enmienda se puede encontrar en la descripción de la solicitud, página 44, líneas 9 a 15. Conforme a lo solicitado por el examinador, el alcance de la variable G se ha limitado de la siguiente manera :
 - L1 ha sido limitada a la alternativa en que L1 está ausente. El soporte para esta opción se encuentra en la página 45, líneas 4 a 6.
 - La definición de R2 se ha limitado a R2 es un cicloalquil C₃₋₇ opcionalmente sustituido con uno a tres grupos R5 seleccionados independientemente, la base para esta modificación está en el último párrafo de página 51 y el primero de la página 52.
- Se modificó la antigua reivindicación 6, nueva reivindicación 2, para adaptarla a que dependa de la reivindicación 1 enmendada.
- La antigua reivindicación 13, ahora reivindicación 7, ha sido adaptada para que haga referencia solamente a los compuestos que caen dentro del alcance de la nueva reivindicación 1.
- La antigua reivindicación 15, ahora reivindicación 9, ha sido modificada para que especifique la naturaleza de los agentes terapéuticos adicionales. El soporte de este cambio se encuentra en la página 119, líneas 22 a 24.
- La nueva reivindicación 4 está basada en el contenido de la línea 25 de la página 51 y la línea 1 de la página 52.
- La nueva reivindicación 5 está basada en las fórmulas encontradas al final de la página 60.
- La nueva reivindicación 6 está basada en las fórmulas encontradas al final de la página 60.
- La nueva reivindicación 10 está basada en el contenido de la página 133, línea 10.
- La nueva reivindicación 11 está basada en el contenido de la página 133, líneas 12 a 18.

- Se ajustaron y renumeraron las reivindicaciones dependientes conforme a las enmiendas antes indicadas.

Las modificaciones antes precisadas se ajustan a las disposiciones del artículo 34 de la Decisión 486 toda vez que ellas no implican una ampliación a la materia divulgadas en la solicitud tal como fue presentada inicialmente.

Basándonos en el alcance de las nuevas reivindicaciones, me permito proceder a dar respuesta a cada una de las objeciones realizadas por el examinador en el oficio antes citado.

II. EXCEPCIÓN PARA PATENTABILIDAD

El Examinador ha considerado que el objeto de las reivindicaciones 18 y 19 no es patentable, debido a que éste se refiere a un método de tratamiento en humanos. En procura de superar esta objeción, las reivindicaciones en cuestión han sido eliminadas.

III. REIVINDICACIONES DE USO

El Examinador rechaza las reivindicaciones 16, 17 y 20 por tratarse de reivindicaciones de uso. El solicitante ha retirado del capítulo reivindicatorio esta materia, con lo cual se considera superada la objeción.

IV. TÍTULO DE LA INVENCION

Según el Examinador, el título de la invención se considera genérico, ambiguo e impreciso porque no menciona el grupo farmacofórico particular que contiene los compuestos reclamados y hace referencia a un método de tratamiento que se realiza con los compuestos de la invención.

En procura de dar respuesta a este requerimiento el solicitante modifica el título y somete a consideración de ese Despacho el siguiente título:

“6,7- DIHIDRO-PIRIMIDO[6,1- A] ISOQUINOLIN-4-ONAS ANTAGONISTAS DE GPR84 Y COMPOSICIONES FARMACÉUTICAS DE LAS MISMAS”

V. CLARIDAD DE LA SOLICITUD

- El Examinador considera que la Reivindicación 1 no es clara porque la definición de G es demasiado amplia dificultando entender el alcance de la solicitud. Por tal motivo se obtienen un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. El examinador sugiere a la solicitante restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción.

Aunque el solicitante manifiesta su total desacuerdo con la conclusión del examinador en relación con la claridad y la concisión de las reivindicaciones, dado que cada grupo se encuentra claramente definido por su tamaño, los átomos del anillo, sustituyentes o el número de sustituyentes, lo cual es entendible por cualquier técnico versado en la materia, en procura de acelerar el proceso de concesión, ha decidido limitado el alcance de la invención a los compuestos de la fórmula IIIa, que ahora se definen en la nueva reivindicación 1.

- La reivindicación 12 no es clara ni concisa porque tan solo señala “el compuesto se selecciona de cualquiera de los compuestos de la Tabla 1”, haciendo referencia al capítulo descriptivo y no mencionando los compuestos de interés. Se sugiere eliminar dicha referencia y en su lugar reivindicar cada uno de los compuestos bien sea por su nombre IUPAC o su estructura.

Con todo respeto, el solicitante encuentra que la afirmación relativa a la reivindicación 12 no es correcta, pues dicha reivindicación establece: *“Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 3-8, caracterizado porque R2 es cicloalquilo de 3 a 7 átomos de carbono.”* Como el examinador puede confirmar, dicha reivindicación no hace alusión alguna a la tabla 1 que se menciona en la acción oficial.

- Adicionalmente el examinador cuestiona la claridad de la reivindicación 15, porque menciona: *“caracterizada porque comprende un agente terapéutico adicional”* porque de esta manera se podrían presentar múltiples opciones de posibles combinaciones que no permiten entender el alcance de la solicitud. Se sugiere eliminarla del pliego reivindicatorio.

El solicitante ha modificado esta reivindicación para precisar que el agente terapéutico adicional es un agente para el tratamiento y/o prevención de una afección inflamatoria, con lo cual se limita el alcance de la invención pues la materia cubierta sería la combinación del compuesto de la reivindicación 1 con un agente para el tratamiento y/o prevención de una afección inflamatoria. Dado que la nueva reivindicación 1 es clara y concisa y abarca un número limitado de compuestos, que el mismo examinador declara que son novedosos e inventivos pues no encuentra en el estado de la técnica un documento que afecte su patentabilidad, no hay razones para considerar que una composición que comprende dicho compuesto, que constituye el concepto inventivo de la presente

solicitud, junto a un agente para el tratamiento y/o prevención de una afección inflamatoria, no sea claro para una persona versada en la materia, pues dicha persona está en capacidad de determinar si una composición comprende o no el compuesto de la reivindicación¹ y además, tiene un agente para el tratamiento y/o prevención de una afección inflamatoria. De por sí, con la reivindicación 1 el solicitante es titular del derecho sobre el compuesto de la reivindicación 1 y cualquier composición que lo contenga. No hay razón para que la reivindicación 9, antigua reivindicación 15, que es un subconjunto de la reivindicación 1, no se considere clara.

Sea esta la oportunidad para respetuosamente recordarle a ese Despacho que la "GUÍA PARA EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTE DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD"¹ de la Superintendencia de Industria y Comercio señala: *"Una reivindicación dependiente es patentable, si la reivindicación independiente de la cual se deriva es patentable, por lo cual, en este caso, no hay que hacer búsqueda para la reivindicación dependiente."* Siendo así, la reivindicación en cuestión es clara, aun cuando abarque varias alternativas de la invención, y cumple con la totalidad de los requisitos de patentabilidad.

VI. NOVEDAD Y NIVEL INVENTIVO

De acuerdo con el contenido de la acción oficial de la referencia, no existen documentos que afecten la patentabilidad de la presente solicitud.

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 30, 14, 16 y 18 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se proceda con la concesión de la presente solicitud.

¹ Guía para Examen de Solicitudes de Patentes de Invención y Modelo de utilidad. Superintendencia de Industria y Comercio. 2012. Sección 2.6.4.2 Páginas 37. Relativo a las *Reivindicaciones Dependientes* (disponible electrónicamente en http://api.sic.gov.co/Documentos/Guia_Examen_Patentes.pdf)

VII. ANEXOS

Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 6 reivindicaciones.

VIII. PETICIÓN

Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador han sido superadas, que el nuevo capítulo reivindicatorio es claro y conciso, y que la invención reivindicada cumple con los requisitos de patentabilidad. Por consiguiente, solicito respetuosamente que el Despacho proceda a conceder el privilegio de patente para la solicitud de la referencia.

IX. NOTIFICACIONES

Recibiré notificaciones en la Carrera 9 # 74-08, Oficina 305, en la ciudad de Bogotá D.C.

Del Señor Jefe de la Dirección de Nuevas Creaciones,



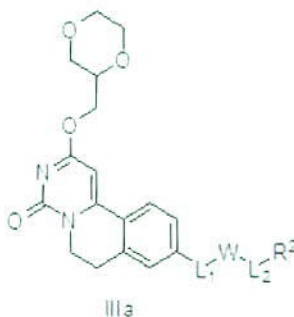
MAURICIO PATIÑO BONNET

C.C. 11.342.699 de Zipaquirá

T.P. 73.583 del C.S. de la J.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto según la fórmula IIIa:



caracterizado porque

L_1 está ausente;

W es alquileo C_{1-4} , alquenileno C_{2-4} que tiene un enlace doble o alquinileno C_{2-4} que tiene un enlace triple;

L_2 está ausente o es -O-;

R^2 es un cicloalquil C_{3-7} opcionalmente sustituido con uno a tres grupos R^5 seleccionados independientemente,

R^5 es oxo o R^6 ;

R^6 es

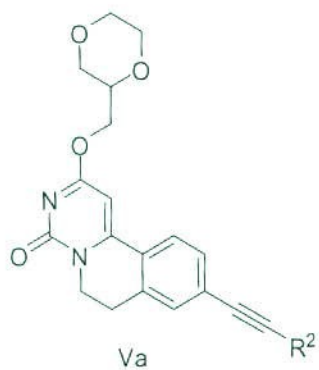
- OH,
- halo,
- NO_2 ,
- alquilo C_{1-6} , opcionalmente sustituido con uno a tres grupos seleccionados independientemente entre halo y OH,
- alcoxi C_{1-6} , opcionalmente sustituido con uno a tres grupos seleccionados independientemente entre halo y OH,

- cicloalquilo C₃₋₇,
 - -C(=O)OR⁸,
 - -C(=O)NR⁹R¹⁰,
 - -NHC(=O)-alquilo C₁₋₄,
 - -CN,
 - fenilo,
 - -O-fenilo,
 - heterocicloalquilo de 4-7 miembros que comprende de uno a tres heteroátomos seleccionados independientemente entre N, O y S, o
 - heteroarilo de 5-6 miembros que comprende de uno a tres heteroátomos seleccionados independientemente entre N, O y S, opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados independientemente entre alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, CN, halo y -C(=O)OR¹¹; y
- cada uno de R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹ se selecciona independientemente entre H y alquilo C₁₋₄,

o una sal farmacéuticamente aceptable, o un solvato, o un solvato de la sal farmacéuticamente aceptable.

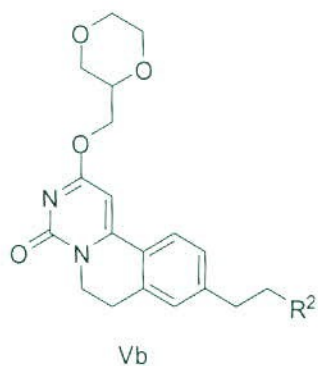
2. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque W es alquínico C₂₋₄ que tiene un enlace triple.
3. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1 o 2, caracterizado porque R² es cicloalquilo C₃₋₇.
4. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R² es ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.
5. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la

reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto corresponde a la fórmula Va:



Donde R^2 es como se describe en la reivindicación 1.

6. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto corresponde a la fórmula Vb:



Donde R^2 es como se describe en la reivindicación 1.

7. Un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable, de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque el compuesto es seleccionado de:

9-ciclopentiletinil-2-([1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7-dihidro- pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona,

2-([1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-9-(1-hidroxi-ciclopentiletinil)-6,7-dihidro-pirimido[6,1-a]

isoquinolin-4-ona,
 9-ciclopentiletinil-2-([1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7-dihidro- pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclohexiletinil-2-([1,4] dioxan-2-ilmetoxi)-6,7-dihidro- pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclopentiloximetil-2-([1,4] dioxan-2-ilmetoxi)-6,7-dihidro- pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclopropiletinil-2-((R)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9- (2-ciclopropil-etil)-2-((R)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1- a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclopentiloximetil-2-((R)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclopropiletinil-2-((S)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9-(2-ciclopropil-etil)-2-((S)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 9-ciclohexiloximetil-2-((S)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-6,7- dihidro-pirimido[6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 2-((S)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-9-[2-(1-hidroxi-ciclopentil)-etil] -6,7-dihidro-pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona,
 2-((R)-1-[1,4]dioxan-2-ilmetoxi)-9-[2-(1-hidroxi- ciclopentil)-etil] -6,7-dihidro-pirimido [6,1-a]isoquinolin-4-ona.

8. Una composición farmacéutica, caracterizada porque comprende un compuesto o su sal farmacéuticamente aceptable de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, y un portador farmacéuticamente aceptable.
9. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 8, caracterizada

porque comprende un agente terapéutico adicional, que es un agente para el tratamiento y/o prevención de una afección inflamatoria.

10. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 8, caracterizada porque comprende un agente terapéutico adicional, que es un agente para el tratamiento y/o prevención de enfermedades intestinales inflamatorias.
11. La composición farmacéutica de conformidad con la reivindicación 8, caracterizada porque comprende un agente terapéutico adicional, seleccionado de glucocorticoides, agentes inmunomoduladores sintéticos modificadores de enfermedad y agentes inmunomoduladores biológicos modificadores de enfermedad.

PRIETO & CARRIZOSA
INTELLECTUAL PROPERTY
POWER OF ATTORNEY

The undersigned GRAHAM DIXON, acting on behalf of and representing GALAPAGOS NV, domiciled in _____, hereby appoint(s) **MAURICIO PATIÑO, JORGE DI TERLIZZI** and/or **MARTÍN CARRIZOSA** domiciled in Bogotá D.C., Republic of Colombia, as our true and legal attorneys with the necessary powers:

1) To apply to the administrative, judicial and police authorities of the Republic of Colombia, in any instance or appeal, for obtaining registration of patents, utility models, industrial designs and models, commercial ensigns and names, trademarks, slogans, health licenses, copyrights and domain names as well as their assignments, extensions, renewals and changes of name; 2) To prepare, apply for, obtain, execute and register contracts, licenses, authorizations and registrations of any kind; 3) To intervene as plaintiffs or defendants, in any instance or appeal, before any judge, court, tribunal, corporation, public officer or authority in any judicial, administrative or police action, such as: action dealing with commercial ensigns and names; oppositions against trademark registrations; caducity and nullity actions; recovery actions, actions arising from obtainment and working of license agreements; actions dealing with unfair competition; criminal actions; actions claiming indemnity for damages, complaints or remarks on all sort of industrial property matters; the performance of precautionary measures, and in any other similar action, measure or appeal related to intellectual property matters.

To this effect, I (we) hereby authorize them to file applications, make descriptions, protests, amendments, declarations, oppositions, cancellations, recordals, appeals and claims; to pay taxes, quotas and liens as provided by Law; to waive or abandon granted rights or rights in process of being granted, to receive all kind of documents and securities; to issue the respective releases and, in general, to take, before said authorities, pertinent steps to the above mentioned purposes and take all measures they may deem advisable to protect my (our) interests, with all other necessary legal faculties, and I (we) hereby declare as good and valid whatever the attorneys should do to my (our) benefit.

This power comprises the authority to ratify or confirm on my (our) behalf any action, as well as the faculty of receiving, desisting, transacting, compromising, substituting and revoking substitutions, taking notifications, and appointing judicial or extra-judicial attorneys.

Signed in Yorubá on this 26th day of November of 2008.

T. Eline
Gommers

Seen by U. LUCAS PRIETO, Notary public with residence in Mechelen (Belgium), for the certification on declaration(s) of the signature of GRAHAM DIXON affixed

Mechelen, this 27th of 11

2008

PRIETO & CARRIZOSA
PROPIEDAD INTELECTUAL
PODER

Yo (nosotros) _____, obrando en nombre y representación de _____, con domicilio en _____, nombro(amos) a **MAURICIO PATIÑO, JORGE DI TERLIZZI** y/o **MARTÍN CARRIZOSA** con domicilio en Bogotá D.C., República de Colombia, apoderados verdaderos y legales con poder especial, amplio y suficiente:

1) Para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, dibujos y modelos industriales, registro de marcas, registro de lemas comerciales, depósito de nombres y enseñas comerciales, registros sanitarios, derechos de autor y nombres de dominio así como sus traspasos, prórrogas, renovaciones y cambios de nombre y domicilio; 2) Elaborar, tramitar, solicitar, obtener, realizar, ejecutar y registrar contratos, licencias, autorizaciones y registros de cualesquiera clases; 3) Intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso y ante cualquier juez, entidad, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía, tales como acciones derivadas de nombre o enseña comerciales; oposiciones al registro de marcas; acciones de caducidad y nulidad; acciones reivindicatorias; acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias; acciones de competencia desleal, demandas penales y civiles; acciones de indemnización de perjuicios, reclamos, u observaciones a cualquier asunto sobre propiedad intelectual; al ejercicio de medidas cautelares y cualesquiera otras acciones, medidas o recursos similares relacionados con la propiedad intelectual.

A este efecto, los facultamos para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, apelaciones, inscripción de afectaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la Ley; renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores dando al descargo respectivo, y en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeren conducentes al resguardo de mis (nuestros) intereses, con todas las facultades necesarias, y por este documento desde ahora declaro(amos) válido y bueno todo cuanto los apoderados hicieren en mi (nuestro) beneficio.

Este poder comprende la facultad de ratificar, o confirmar en mi (nuestro) nombre lo actuado, así como la facultad de recibir, desistir, transigir, comprometer, sustituir y revocar sustituciones, recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

Firmado en _____ el _____ de _____ de _____.