

CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-253890-00008-0000

Fecha: 2015-05-06 15:14:15 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve. 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Follos: 21

Señor

Director de la Dirección de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. 13 253890

Solicitud de Patente PCT entrada en Fase Nacional, para:

**"COMPUESTO DE AMIDA COMO INHIBIDOR DEL RECEPTOR HUÉRFANO
RELACIONADO CON RETINOIDE GAMMA (ROR γ)" (Nuevo Título)**

Solicitante: JAPAN TOBACCO INC.

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

Yo, **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, obrando en mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante del asunto citado en la referencia, en atención a su oficio No. **1425** notificado el **17 de febrero de 2015**, atentamente me permito dar respuesta al mismo de la siguiente manera:

1. Modificación a las Reivindicaciones

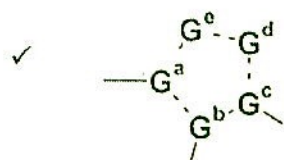
De acuerdo con lo establecido en el Artículo 34 de la Decisión 486 y en vista de las observaciones realizadas por el examinador, se presenta en esta oportunidad un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 18 reivindicaciones, en donde se han realizado las siguientes modificaciones:

- La nueva reivindicación 1 no incluye el compuesto de la formula (I). Por el contrario, esta reivindicación independiente incluye el compuesto de la formula (IV) que se reclamaba en la antigua reivindicación 5. Es necesario tener en cuenta los siguientes aspectos de la nueva reivindicación 1

CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

- Con el fin de restringir la solicitud a una razonable generalización de compuestos, no se incluye la definición de:



✓ R^a

✓ Y^a

- La definición de la porción cíclica U se restringió a un grupo ciclobutilo o un grupo ciclohexil.
- La definición de R^{a1} se adicionó. Es de resaltar que el soporte para esta definición se encuentra en los ejemplos A-1, A-11, A-18, A-20, A-21, A-24, A-60, D-1, D-2, D-3, D-4 de la descripción.
- La definición de R^b se restringió a:
 - (1) grupo etilo, grupo hidroxietilo, grupo trifluorometilo, grupo difluorometilo, grupo 1,1-difluoro-etilo, o grupo isopropilo.
 - ✓ El soporte para esta definición se encuentra en la página 59 líneas 2 a 7 de la descripción, y en los ejemplos A-36, A-93, A-110, A-123, A-133, A-73.
 - (2) grupo vinilo o grupo isopropenilo
 - ✓ El soporte para esta definición se encuentra en la página 59 líneas 8 a 13 de la descripción y en los ejemplos A-90, A-49.
 - (3) grupo ciclopropilo
 - ✓ El soporte para esta definición se encuentra en la página 59 líneas 14 a 22 de la descripción y en el ejemplo A-1.
- Por su parte, la definición de R^c se restringió a:
 - (1) átomo de hidrógeno, o

CASTELLANOS & Co. LTDA

A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

- ✓ El soporte para esta definición se encuentra en la página 59 línea 23 a la página 60 línea 4 de la descripción y en el ejemplo A-1.

(2) grupo metilo

- ✓ El soporte para esta definición se encuentra en la página 60 líneas 6 a 16 de la descripción y en el ejemplo A-94.

- Y^c se restringió a un grupo seleccionado de $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2-$, $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2-$, o $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$

- ✓ El soporte para esta definición se encuentra en página 60 líneas 6 a 16 de la descripción, y los ejemplos A-1, A-19, A-30, A-31, A-38, A-52, A-2, A-68, A-83, A-12.

- No se incluyen las definiciones de Y^{d1} and Y^{d2} .
- Por su parte, la definición de R^{d1} , R^{d2} , R^{d3} , R^{d4} y R^{d5} , se restringió a:

(1) átomo de hidrógeno,

- ✓ El soporte de esta definición se encuentra en la página 64 línea 20 a la página 65 línea 10 de la descripción y el ejemplo A-1.

(2) átomo de flúor, o átomo de cloro,

- ✓ El soporte de esta definición se encuentra en la página 64 línea 20 a la página 65 línea 10 de la descripción, y los ejemplos A-7 y A-16.

(3) grupo metilo, grupo etilo, o grupo trifluorometilo,

- ✓ El soporte de esta definición se encuentra en la página 64 línea 20 a la página 65 línea 10 de la descripción, y los ejemplos A-1, A-40 y A-80.

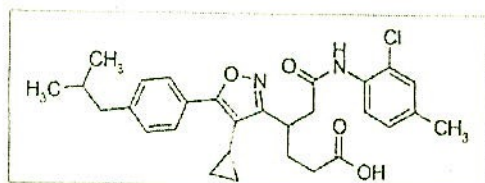
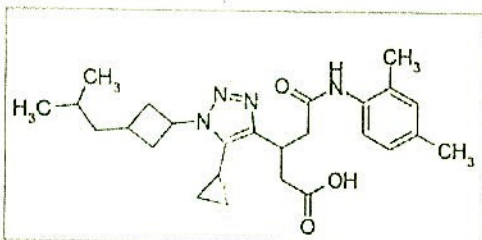
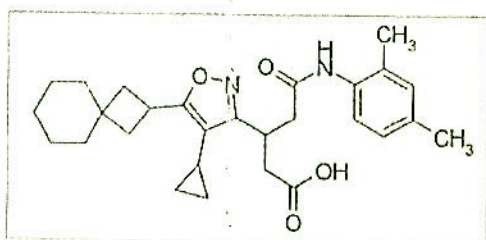
(4) $-\text{OR}^{d10}$ donde R^{d10} es átomo de hidrogeno o grupo metilo, o alternatively

- ✓ El soporte de esta definición se encuentra en el párrafo página 64 línea 20 a la página 65 línea 10 de la descripción, y los ejemplos A-109 y A-16.

CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

- R^{d1} y R^{d2} , o R^{d2} y R^{d3} se pueden tomar juntos para formar un anillo de benceno fusionado con el anillo de benceno al que están todos unidos,
 - ✓ El soporte para dicha definición se encuentra en la página 65 líneas 11 a 14 descripción y en el ejemplo A-62,
- No se incluyen las definiciones de R^e , n^{c1} , n^{c2} , n^d . De igual manera no se incluye el grupo A del antiguo pliego reivindicatorio.
- Con el fin de superar las objeciones planteadas por el examinador, no se incluyen las antiguas reivindicaciones 1, 3, 4, 5, 10, 11, 13, 16, 21, 27 y 29 a 44.
- En la nueva reivindicación 7 (antigua reivindicación 14), no se incluye en la definición de la porción cíclica de U la frase "que puede estar sustituido con 1 a 5 sustituyentes iguales o diferentes seleccionados del grupo A".
- La nueva reivindicación 8 (antigua reivindicación 15) no incluye los siguientes compuestos:

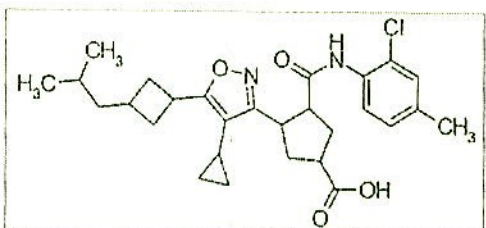
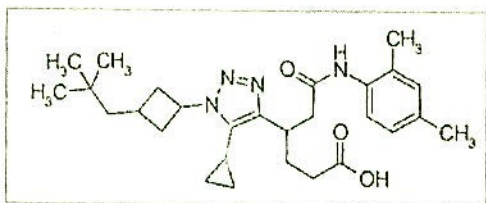
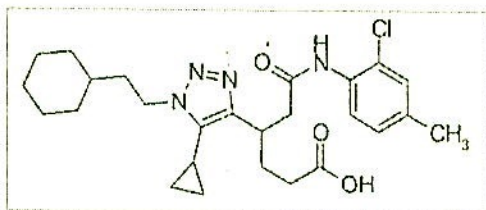
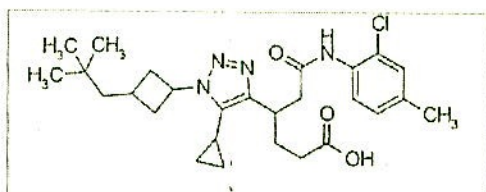


CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS

Calle 94 A No. 7 A - 09

Bogotá, D.C., COLOMBIA



Se solicita atentamente tener en cuenta este nuevo pliego reivindicatorio para el análisis de patentabilidad, toda vez que no implica una ampliación de la materia inicialmente solicitada y además permite superar las objeciones comunicadas por el examinador.

2. Reivindicaciones relativas a uso

Tal como se mencionó en el numeral anterior, no se incluyen dichas reivindicaciones. En consecuencia, esta objeción se ve superada.

3. Título

Siguiendo las amables sugerencias realizadas por el examinador y con el fin que el título de la presente solicitud sea más descriptivo y concordante con la materia reclamada, se informa que el nuevo título es:

**“COMPUESTO DE AMIDA COMO INHIBIDOR DEL RECEPTOR HUÉRFANO
RELACIONADO CON RETINOIDE GAMMA (ROR γ)”**

4. Reivindicaciones

Tal como se indica en el numeral 1, se presenta en esta oportunidad un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 18 reivindicaciones. No obstante, se solicita atentamente tener en cuenta lo siguiente:

- La nueva reivindicación 18 (antigua reivindicación 28), se considera que es clara teniendo en cuenta que es una reivindicación dependiente de la nueva reivindicación 1. Tal y como se demostrará en el numeral 6 de análisis de patentabilidad, se podrá establecer que los compuestos reivindicados son novedosos e inventivos sobre el estado de la técnica. En consecuencia, la composición reclamada en la nueva reivindicación 18 es igualmente novedosa e inventiva y por lo tanto resulta válida de acuerdo a la práctica actual.

En este sentido, es relevante señalar lo mencionado por la Guía para el Estudio de Patentes de Invención y Modelo de Utilidad, publicado por su Despacho, numeral 2.7.3:

"Si el objeto de la solicitud es un nuevo compuesto, el solicitante tiene derecho a reivindicar las composiciones farmacéuticas caracterizadas por contener ese nuevo compuesto, pero no está obligado a utilizar ejemplos de cómo diseñar y preparar composiciones concretas que contengan el nuevo compuesto porque "la solución aportada por la invención", es decir el objeto de la invención, es "el nuevo compuesto" y la persona del oficio normalmente versada en la materia está en capacidad de diseñar y preparar composiciones concretas que contengan el nuevo compuesto, con la información divulgada en la solicitud y con sus conocimientos generales. En tal caso, se considerará que la descripción cumple el requisito de suficiencia".

[Subrayado fuera del texto]

Por lo tanto, se considera que la reivindicación 18 resulta aceptable, por buscar proteger la composición que contiene los compuestos novedosos e inventivos de conformidad con la presente solicitud. Adicionalmente, una persona del oficio normalmente versada en la materia con base en sus conocimientos y lo revelado por la descripción, podrá diseñar y preparar composiciones concretas que contengan los nuevos compuestos.

- Tal como se había mencionado previamente, las antiguas reivindicaciones 16 y 29 no se incluyen en el nuevo pliego reivindicatorio, razón por la cual las objeciones al respecto se

CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

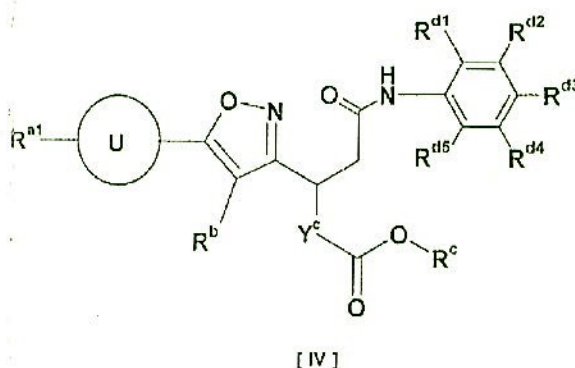
ven superadas. Igualmente ocurre con la antigua reivindicación 15 (nueva reivindicación 8), de acuerdo a las modificaciones realizadas.

- En relación a las antiguas reivindicaciones 17 a 27 (nuevas reivindicaciones 9 a 17), estas se mantienen en el pliego reivindicatorio teniendo en cuenta que dichas reivindicaciones no se encuentran incluidas en las antiguas reivindicaciones 15 y 16 (ahora reivindicación 8). Se hace notar que los compuestos incluidos en las nuevas reivindicaciones 9 a 17 son configuraciones no esteroisómeras, mientras las configuraciones incluidas en la nueva reivindicación 8 son esteroisómeras. En consecuencia, no se repite materia.
- Finalmente, debido a las modificaciones incluidas en la nueva reivindicación 1 y a los argumentos ya presentados, es posible afirmar que ésta es concisa e incluye compuestos que encuentran su debido sustento en la descripción.

En consecuencia, se considera que las reivindicaciones incluidas en el nuevo capítulo reivindicatorio son claras y concisas. Adicionalmente, debido a las modificaciones introducidas en el pliego reivindicatorio y las aclaraciones realizadas, es posible determinar que el nuevo pliego reivindicatorio no va más allá de la materia inicialmente reivindicada y permite superar las objeciones planteadas por el examinador.

5. Unidad de Invención

De acuerdo a las modificaciones introducidas en el pliego reivindicatorio (tal como se mencionó en el numeral 1 del presente memorial), se considera que la solicitud cumple con el requisito de unidad de invención. Se resalta que el compuesto a reivindicar, el cual encuentra sustento en la descripción, presenta un único concepto común inventivo, el cual corresponde a la fórmula IV de la presente solicitud:



CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Por lo tanto, la presente solicitud cumple con el requisito de unidad de invención, toda vez que la misma ha sido restringida.

6. Análisis de patentabilidad

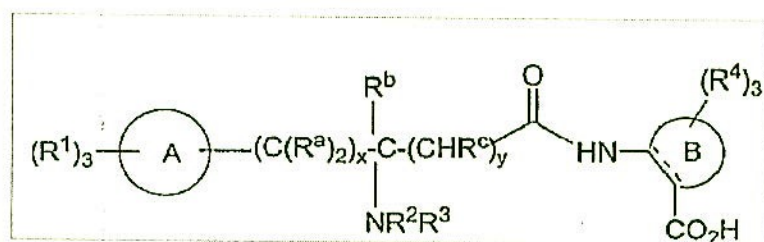
Para la evaluación de la patentabilidad de la invención se citó el documento D1: WO 2007075749, así como el documento D2: WO 1996025405.

El examinador considera que la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el patrón de sustitución de los compuestos divulgados en D2 en la estructura de los compuestos del documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 3 de la presente solicitud.

6.1 Nivel inventivo

En vista de las modificaciones introducidas al pliego reivindicatorio, es posible establecer que el nuevo objeto reivindicado es inventivo sobre el estado de la técnica. Particularmente, en relación con las reivindicaciones 6, 8, 10 y 23 (actuales 1, 4 y 11), las cuales fueron objetadas por carencia de nivel inventivo, es de resaltar lo siguiente:

En primer lugar, D1 divulga compuestos agonistas de los receptores de ácido nicotínico, útiles para el tratamiento de trastornos asociados a los niveles de lípidos en sangre, los cuales corresponden a la formula (I). (Pág. 7, líneas 10-20).

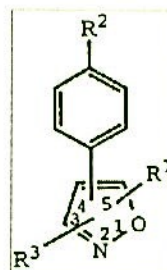


Formula I de D1

CASTELLANOS & Co. LTDA

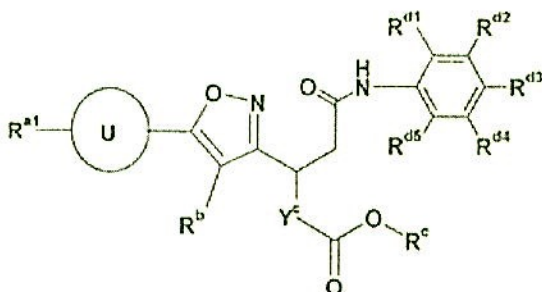
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Por su parte, D2 divulga compuestos capaces de actuar como agentes antiinflamatorios útiles para el tratamiento de trastornos asociados a inflamación, tal como la artritis (Pág. 1, líneas 1-5). Los cuales corresponden a la formula (I). (Pág. 2, líneas 30-35).



Formula I de D2

Sin embargo, ninguno de los documentos citados revela o sugiere los compuestos como se reivindican en la presente solicitud. Las características técnicas estructurales de los compuestos reivindicados vienen determinadas por la fórmula IV y sus respectivos sustituyentes:



Formula IV de la presente solicitud

en donde la porción cíclica U es un grupo ciclobutilo o grupo ciclohexilo, y Rᵈ¹ a Rᵈ⁵ no tienen grupo carboxilo como una opción. Además Rᵇ se selecciona ciertos sustituyentes dentro de los cuales no está incluido el hidrógeno.

En contraste con el arte previo, la presente solicitud demuestra diferencias significativas, tal como se ilustra a continuación:

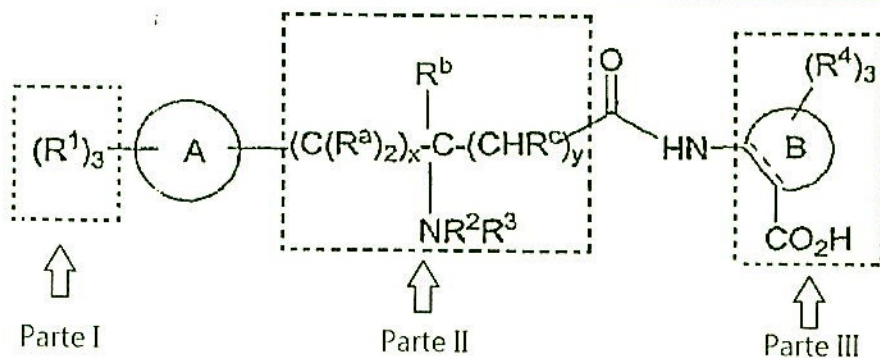
Comparación entre el Compuesto Reivindicado en D1 y el Compuesto Reivindicado en la presente solicitud

CASTELLANOS & Co. LTDA

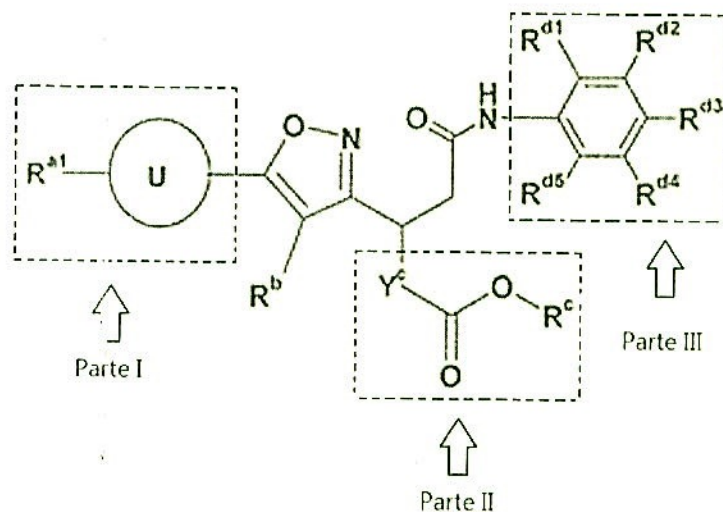
ABOGADOS

Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Compuesto Reivindicado en D1



Compuesto Reivindicado en la presente solicitud



De la anterior tabla se puede observar:

- Los compuestos reivindicados en la presente solicitud tienen grupo ciclobutilo o ciclohexilo como porción cíclica U en la Parte I, pero D1 no revela compuesto específico alguno que tenga un grupo ciclobutilo o ciclohexilo en dicha parte.

Los compuestos reivindicados en la presente solicitud tienen sustituido el isoxazol con R^b (ya se mencionó que R^b no es hidrógeno). Por otro lado, D1 da a conocer en el ejemplo 15 (página 47), el compuesto de fórmula I, el cual tiene isoxazol como anillo A, pero dicho isoxazol no está sustituido.

CASTELLANOS & Co. LTDA

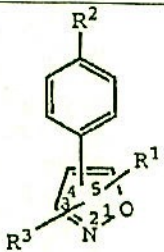
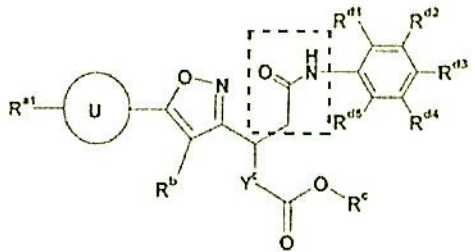
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

- ii. La fórmula reivindicada en D1 esencialmente tiene amino ($-NR_2R_3$) en la segunda parte, mientras que los compuestos reivindicados en la presente solicitud consisten del grupo carboxilo ($-COOR^c$) en la Parte II.

En general, una persona normalmente versada en la materia sabe que el grupo amino tiene características diferentes a las del grupo carboxilo:

- Un grupo amino es un grupo funcional derivado del amoníaco o alguno de sus derivados alquilados por eliminación de uno de sus átomos de hidrógeno. Se fórmula según su procedencia como $-NH_2$, $-NRH$ o $-NR_2$. Un compuesto que contiene un grupo amino es una amina o una amida.
 - En el grupo funcional llamado grupo carboxilo o grupo carboxi ($-COOH$), coincide sobre el mismo carbono un grupo hidroxilo ($-OH$) y carbonilo ($-C=O$). Se puede representar como $-COOH$ ó $-CO_2H$.
- iii. La fórmula de D1 esencialmente posee el grupo $-COOH$ unido al anillo B en la Parte III; sin embargo, en el compuesto reivindicado en la presente solicitud no tiene $-COOH$ como una opción de R^{d1} a R^{d5} en la Parte III.

De igual manera, se presenta la siguiente tabla comparativa entre el compuesto reivindicado en el documento D2 y el compuesto reivindicado en la presente solicitud:

Compuesto Reivindicado en D2	Compuesto Reivindicado en la presente solicitud
	

La fórmula del documento D2 se puede diferenciar estructuralmente en varias maneras. Por ejemplo, la fórmula de D2 tiene un esqueleto de núcleo-isoxazol benceno, pero los compuestos reivindicados en la presente solicitud tienen "un espaciador alquilo + amido" entre el isoxazol y el benceno, como se indicó anteriormente.

CASTELLANOS & Co. LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Adicionalmente, el segmento R² en la fórmula reivindicada del documento D2 es seleccionado entre una variedad de ciertos grupos sulfonilo. Por el contrario, los compuestos reivindicados en la presente solicitud no tienen un grupo sulfonilo como una opción de R^{d1} a R^{d5}.

Como se ha podido observar, la presente invención tiene muchas diferencias estructurales respecto a los compuestos de los documentos D1 y D2. Por lo tanto, una persona normalmente versada en la materia no podría haber predicho el compuesto reivindicado en la presente solicitud a partir de las enseñanzas de D1 o D2.

Por otra parte, y teniendo en cuenta las diferencias estructurales ya mencionadas, es posible determinar que una persona normalmente versada en la materia no tendría argumentos o se vería inducida a incluir patrones de sustitución del compuesto divulgado en D2 en la estructura del compuesto de D1, para llegar al objeto de la reivindicación independiente 1 (fórmula IV de la presente solicitud).

En consecuencia, la presente invención posee características específicas que le conceden nivel inventivo (tanto a las reivindicaciones independientes como dependientes), siendo también novedosa y con aplicabilidad industrial, los cuales son los criterios necesarios para concederle el privilegio de patente a la presente solicitud.

7. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por dieciocho (18) reivindicaciones.

Señor Director,


Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. 39.779.654 de Bogotá
T.P.A. No. 70.819 del C.S.J.
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Teléfono: 756 0770

P3058
RESPUESTA EXAMEN DE FONDO

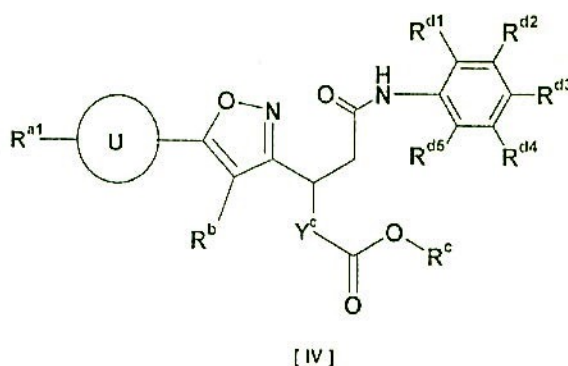
Bogotá, D.C.
MCA/

- 6 MAYO 2015

REIVINDICACIONES MODIFICADAS CON RESPUESTA

A OFICIO 1425 – EXAMEN DE FONDO

1. Un compuesto de fórmula [IV]:



donde

la porción cíclica U es un grupo ciclobutil o un grupo ciclohexil

R^{a1} es un grupo seleccionado de $(CH_3)_2CHCH_2-$, $(CH_3)_3CCH_2-$, $(CH_3)_2CHCH_2CH_2-$, $CH_3CH_2C(CH_3)_2CH_2-$, $(CH_3)_3CCH_2CH_2-$, $(CH_3)_2CHC(CH_3)_2-$, o $CH_3CH_2CH(C_2H_5)CH_2-$;

R^b es un grupo seleccionado de los siguientes (1) a (3):

- (1) grupo etilo, grupo hidroxietilo, grupo trifluorometilo, grupo difluorometilo, grupo 1,1-difluoro-etilo, o grupo isopropilo,
- (2) grupo vinilo o grupo isopropenilo,
- (3) grupo ciclopropilo;

R^c es

- (1) átomo de hidrógeno o
- (2) grupo metilo;

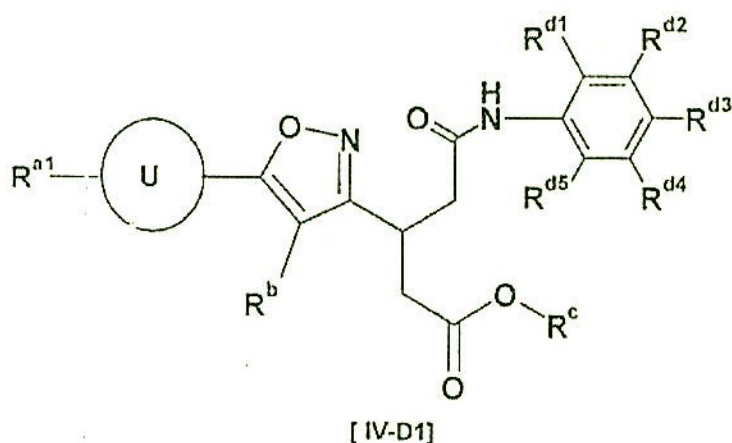
Y^c es un grupo seleccionado de $-CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH(CH_3)-$, $CH_2CH(CH_3)-$, $-C(CH_3)_2-$, $CH_2C(CH_3)_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH(CH_3)CH_2-$, $-C(CH_3)_2CH_2-$, o $-CH_2CH_2CH_2-$;

R^{d1} , R^{d2} , R^{d3} , R^{d4} y R^{d5} son un grupo igual o diferente seleccionado de los siguientes (1) a (4):

- (1) átomo de hidrógeno,
- (2) átomo de fluor, o átomo de cloro,
- (3) grupo metilo, grupo etilo, o grupo trifluorometilo,
- (4) $-OR^{d10}$ donde R^{d10} es átomo de hidrogeno o grupo metilo;

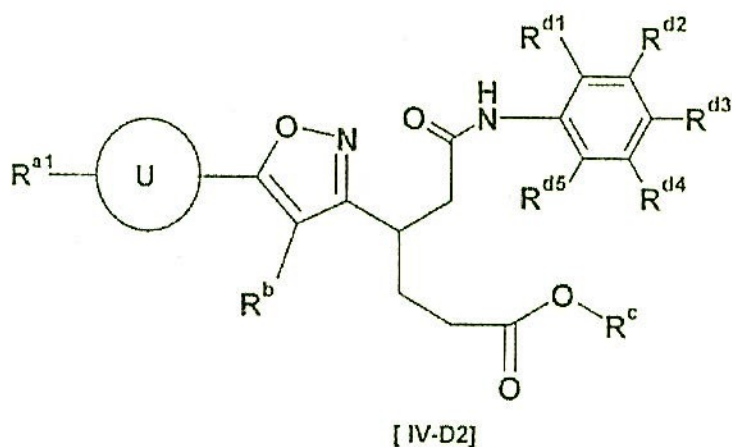
R^{d1} y R^{d2} , o R^{d2} y R^{d3} se pueden tomar juntos para formar un anillo de benceno fusionado con el anillo de benceno al que están todos unidos, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

2. El compuesto de fórmula [IV-D1] de conformidad con la reivindicación 1:



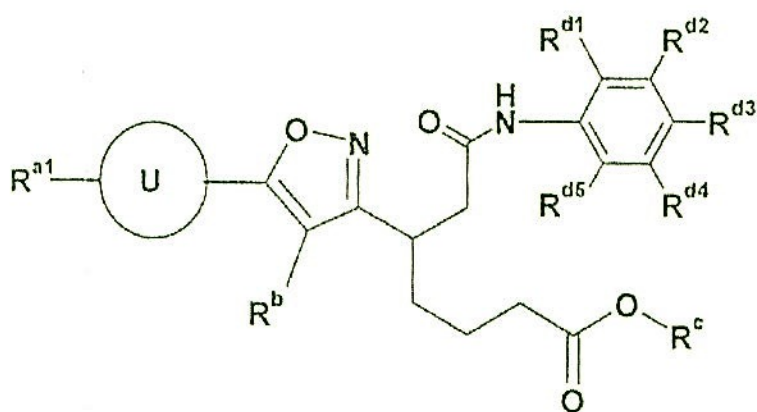
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

3. El compuesto de fórmula [IV-D2] de conformidad con la reivindicación 1:



o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

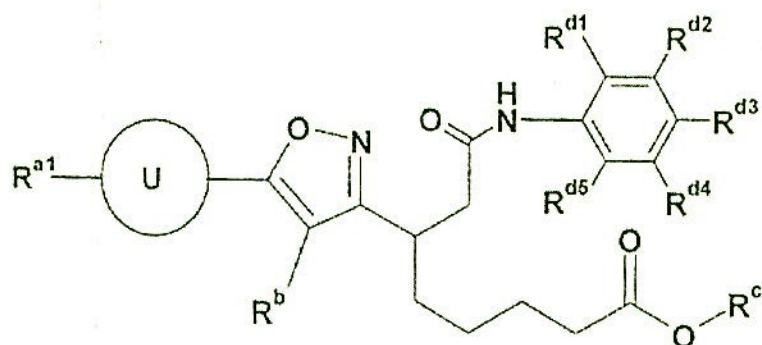
4. El compuesto de fórmula [IV-D3] de conformidad con la reivindicación 1:



[IV-D3]

o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

5. El compuesto de fórmula [IV-D4] de conformidad con la reivindicación 1:



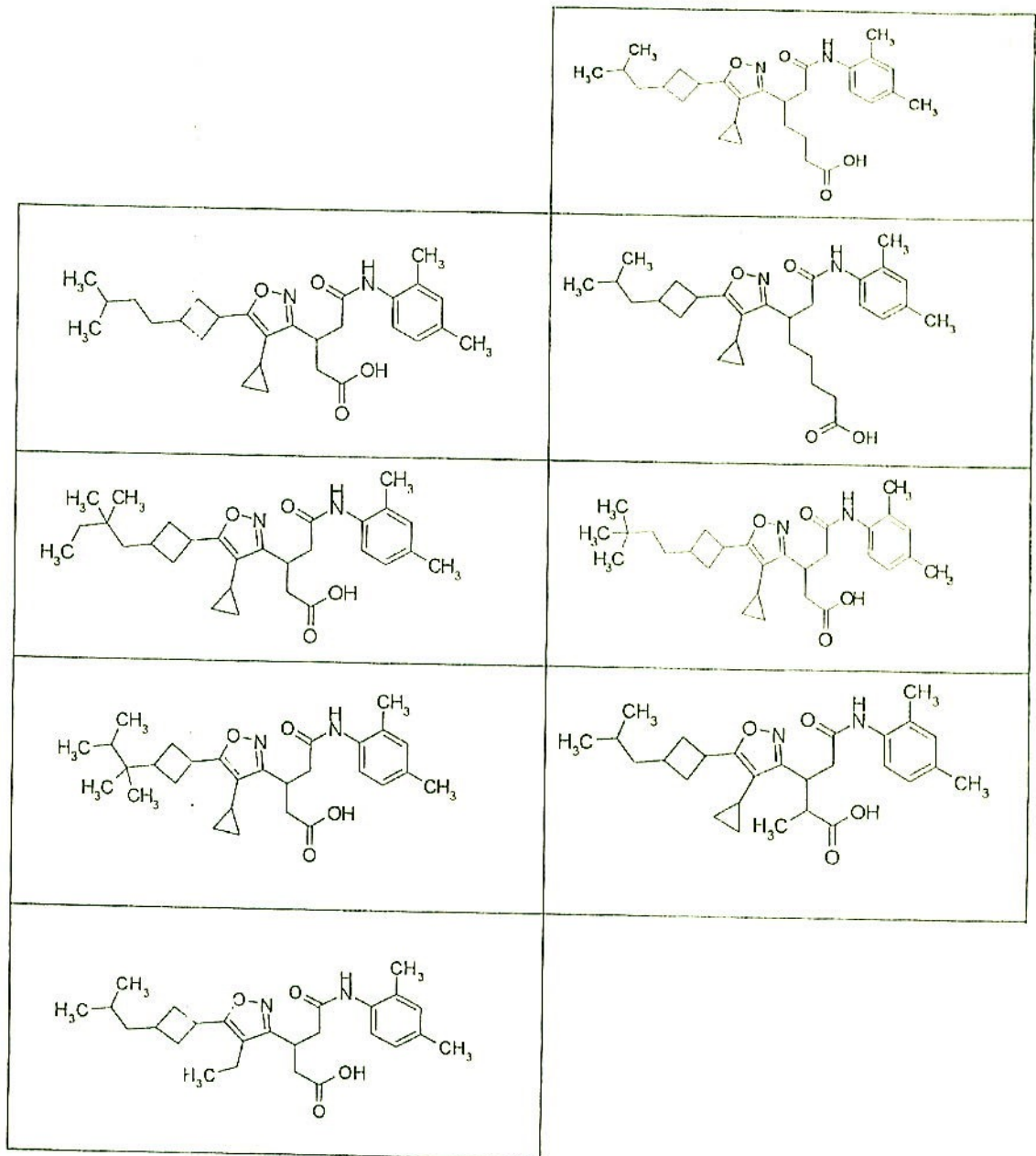
[IV-D4]

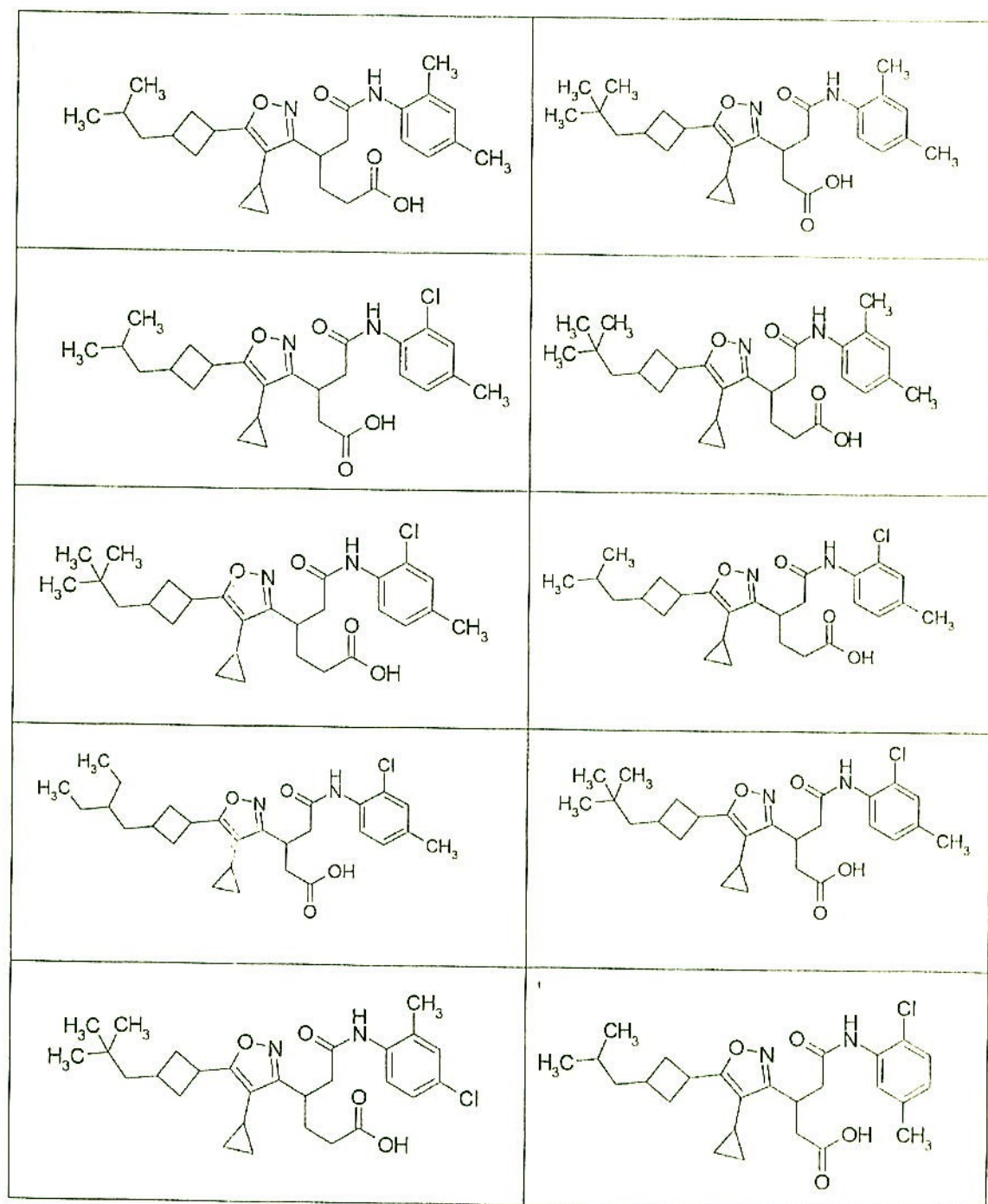
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

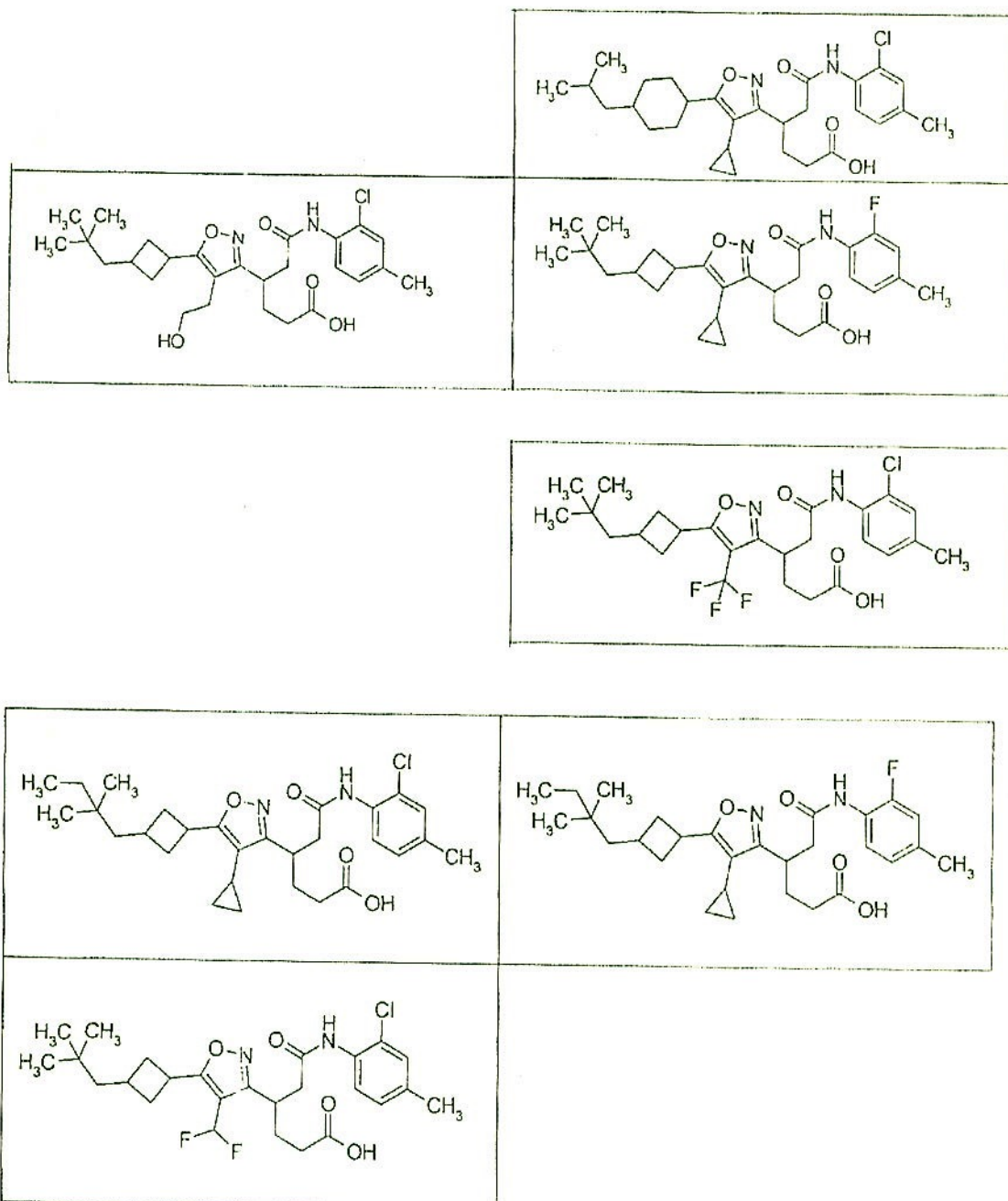
6. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde R^b es grupo ciclopropilo, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

7. El compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en donde la porción cíclica U es grupo ciclobutilo o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

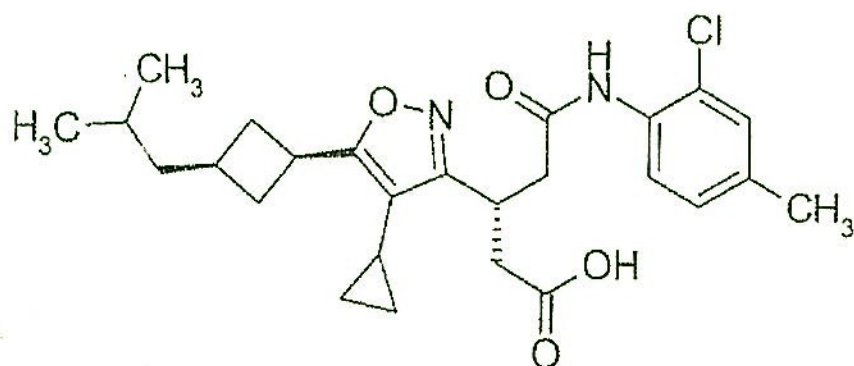
8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual se selecciona del grupo que consiste de las siguientes fórmulas, o una de sus sales farmacéuticamente aceptables:





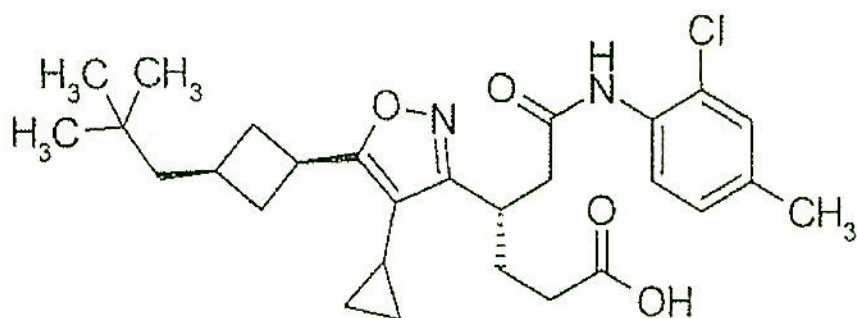


9. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



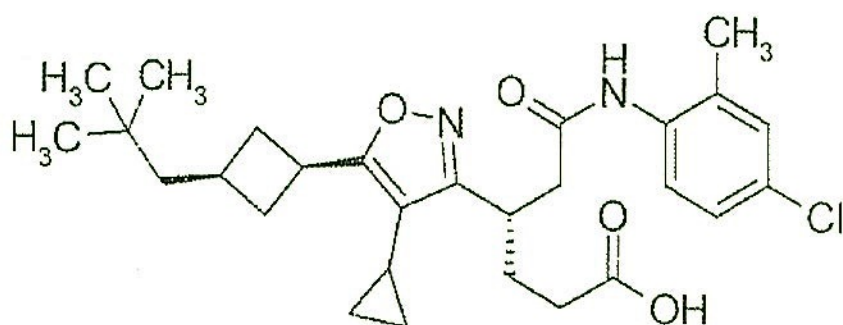
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

10. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



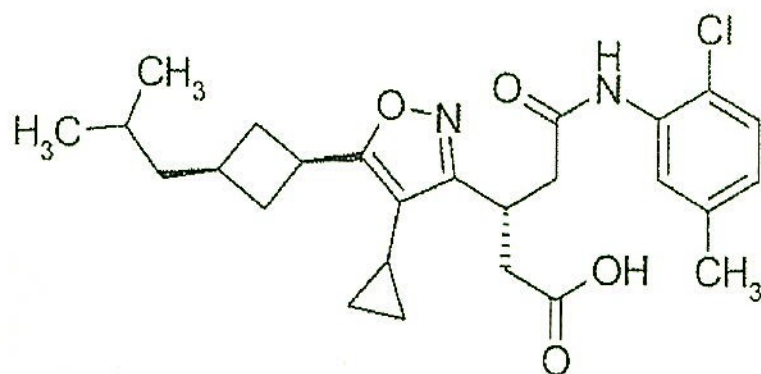
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

11. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



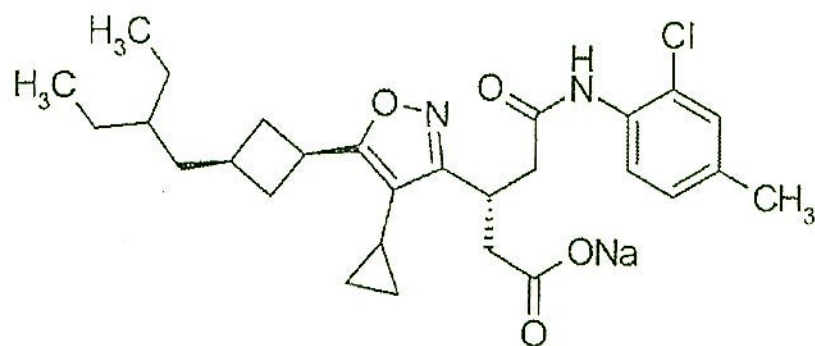
o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

12. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:

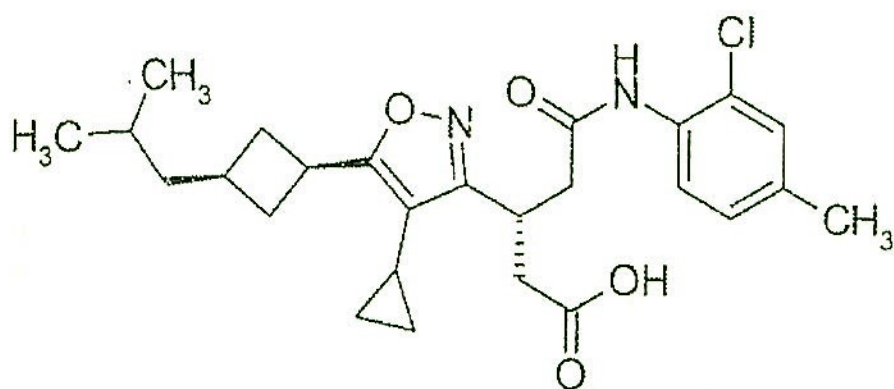


o una de sus sales farmacéuticamente aceptables.

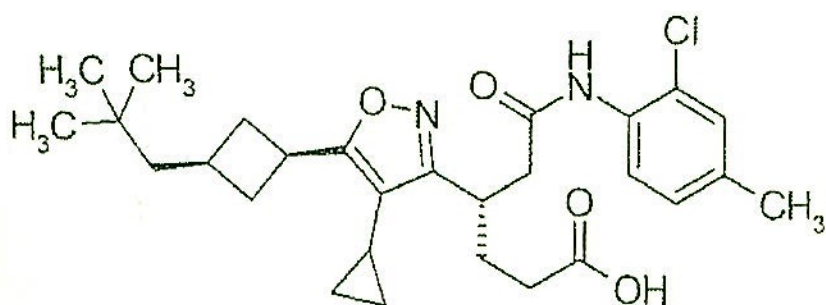
13. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



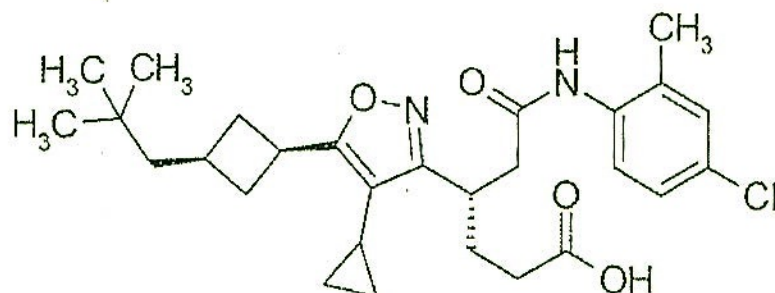
14. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



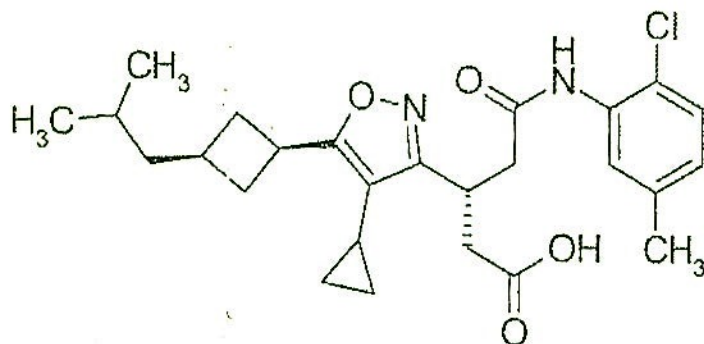
15. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



16. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



17. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, el cual es:



18. Una composición farmacéutica que comprende el compuesto de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 17 o una de sus sales farmacéuticamente aceptables, y un vehículo farmacéuticamente aceptable.