

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-079796- -00008-0000

Fecha: 2012-12-05 16:46:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 7

Medellín

María Clara Múnera

Re: Expediente N°. 09-079.796

Solicitud de Patente de Invención titulada: “DERIVADOS DE 7-(2-METILPIRIDIN-3-ILCARBAMOIL)-4 α -BENCIL-2-(TRIFLUOROMETIL)-1,2,3,4,4 α ,9,10,10 α -OCTAHIDROFENANTREN-2-IL-DIHIDRÓGENO FOSFATO COMO MODULADORES DEL RECEPTOR GLUCOCORTICOIDE”

Solicitante: PFIZER PRODUCTS INC

Nuestra Ref.: P2009/000133

RESPUESTA AL OFICIO No. 12832, NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA No. 411
DE FECHA 25 DE JULIO DE 2012
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo legal de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar la solicitud, del cual se eliminaron las Reivindicaciones 7 a 16.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud inicial, éstas por el contrario, corresponden a una drástica limitación de la materia reivindicada.

2. a- La Examinadora señala que las Reivindicaciones 7 a 16 reclaman materia no patentable.

b- Considero superada la anterior objeción en tanto que las Reivindicaciones 7 a 16 fueron retiradas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

3. a- La Examinadora sugiere corregir el título, remplazando el término benzil por bencil, modificando las letras A y B por α y β , y cambiando el nombre del compuesto ya que corresponde a un dihidrógeno fosfato y no un ácido.

b- Atendiendo la amable sugerencia de la Examinadora, se modifica el título de la solicitud por el siguiente:

“DERIVADOS DE 7-(2-METILPIRIDIN-3-ILCARBAMOIL)-4 α -BENCIL-2-(TRIFLUOROMETIL)-1,2,3,4,4 α ,9,10,10 α -OCTAHIDROFENANTREN-2-IL-DIHIDRÓGENO FOSFATO COMO MODULADORES DEL RECEPTOR GLUCOCORTICOIDE”

4. a- La Examinadora argumenta que la patente WO 00/66522 (D1) y el documento “Pharmaceutical salts¹” (D2) afectan el nivel inventivo de la presente invención.

La Examinadora señala que D1 divulga compuestos derivados de octahidrofenantreno útiles como moduladores del receptor glucocorticoide, encontrando que la única diferencia respecto a la presente invención es que D1 no divulga específicamente el compuesto 7-(2-metilpiridin-3-ilcarbamoil)-4 α -bencil-2-(trifluorometil)-1,2,3,4,4 α ,9,10,10 α -octahidrofenantren-2-ilo.

Así, la Examinadora señala que el efecto que logra la formación de la sal dihidrofosfato del compuesto 7-(2-metilpiridin-3-ilcarbamoil)-4 α -bencil-2-(trifluorometil)-1,2,3,4,4 α ,9,10,10 α -octahidrofenantren-2-ilo consiste en el incremento de la solubilidad y la disolución intrínseca, como se menciona en el Capítulo Descriptivo. Sin embargo, D2 enseña la formación de sales a partir de compuestos farmacéuticos con la finalidad de manipular diferentes características químicas, biológicas, entre otras. La tabla 1 de D2 categoriza todas las formas salinas aprobadas por la FDA, entre las cuales se encuentra la sal fosfato, y afirma que como regla las sales

¹ “Pharmaceutical Salts” Journal of pharmaceutical sciences. Vol. 66 (1). January 1977.

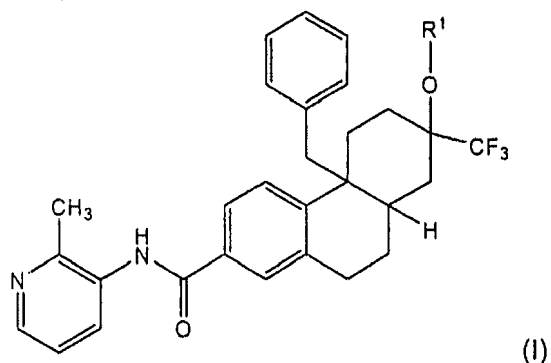
OLARTEMOURE

OLARTE MOURE & ASOCIADOS LTDA.

farmacéuticas exhiben mayor velocidad de disolución que su correspondiente conjugado ácido o base al mismo pH.

La Examinadora concluye que cualquier persona medianamente versada en la materia enfrentada a la necesidad de mejorar el perfil de solubilidad y biodisponibilidad de los compuestos divulgados en D2, prepararía una sal de dicho compuesto estableciendo a ensayo y error aquella sal que posea mejores propiedades fisicoquímicas tal como lo indica la anterioridad, para así, llegar fácilmente al objeto de la Reivindicación 1 de la presente solicitud.

b- En primer lugar, me permito señalar que la presente invención reclama específicamente compuestos de Fórmula I:



en los cuales, R^1 significa $-P(O)(OH)_2$, y sus sales farmacéuticamente aceptables.

Ahora bien, D1 describe una gran diversidad de compuestos tricíclicos, entre los cuales se mencionan derivados de octahidrofenantreno. Sin embargo, dicho documento no enseña núcleos de octahidrofenantreno específicamente sustituidos en la posición 7 por los grupos $-O-P(O)(OH)_2$ y CF_3 .

De otra parte, D2 es simplemente una referencia general y teórica, que hace una revisión sobre las sales farmacéuticas, y sus diferentes efectos en casos específicos. Sin embargo, D2 no se refiere, divulga o sugiere específicamente el compuesto 7-(2-metilpiridin-3-ilcarbamoyl)-4 α -bencil-2-(trifluorometil)-1,2,3,4,4 α ,9,10,10a-octahidrofenantren-2-ilo y menos su sal dihidrofosfato. De acuerdo con lo anterior, es importante insistir en que la utilización de D2 como arte previo para intentar desvirtuar el nivel inventivo de materia específica objeto de solicitudes de patente que reclaman sales resulta totalmente improcedente, porque conduciría necesariamente a que todo el conocimiento general disponible aplicado por un investigador para el desarrollo de una invención, siempre haría obvia toda invención.

Así las cosas, cabe preguntarse, ¿qué aparte específico de D1 motivaría o guiaría a la persona medianamente versada en la materia para incluir específicamente los sustituyentes OH y CF₃ en posición 7, y menos aún, que la posición 2 esté sustituida por un grupo carboxamida. Nada en el arte previo citado sugiere incluir específicamente los sustituyentes -O-P(O)(OH)₂ y CF₃ en posición 7, y que la posición 2 esté sustituida por un grupo carboxamida como ocurre en los compuestos de la presente invención. La única forma en la que la persona medianamente versada en la materia, basándose en D1 y D2 podría haber llegado a la presente invención es a través de una combinación arbitraria y accidental de los miles de sustituyentes y posibilidades que allí se divulgan.

Es más arbitrario y accidental pretender que sin motivación alguna del arte previo, una persona medianamente versada en la materia habría producido específicamente la sal aquí reclamada a partir de una lista de miles de sales farmacéuticamente aceptables, como asegura la Examinadora. Así, se puede concluir que para la Examinadora, D2 enseña de forma clara que todas las sales de dihidrógeno fosfato de compuestos farmacológicamente activos presentan mejorar el perfil de solubilidad y biodisponibilidad, y por lo tanto, una persona medianamente versada en la materia en vista de D1 y D2, y técnicas básicas y comunes habría llegado de manera obvia al polimorfo aquí reclamado. Sin embargo, difiero respetuosamente de dicha aproximación, puesto que, a lo sumo, la persona medianamente versada en la materia podría intentar aplicar algunas de las miles de sales posibles (D2),

Sin embargo, ni D1 ni D2, sugieren la posibilidad de producir los compuestos aquí reclamados, que presentan un patrón de sustitución ni siquiera sugerido por D1, y mucho menos, la sal hdihidrógeno fosfato específicamente reclamada.

La evaluación de la actividad inventiva no puede estar basada en si la invención era posible alcanzar, ya que claramente era posible, ya que los compuestos reivindicados ahora existen. Aplicar un estándar de "posibilidad de alcanzar", haría que ninguna invención fuera susceptible de patentarse, haciendo inviable el sistema de patentes. Del mismo modo, el análisis de patentabilidad no puede implicar la cuestión de si las técnicas de investigación aplicadas son comunes u obvias, sino más bien si el objeto específicamente reclamado podría haber sido evidentemente derivado del arte previo sin necesidad de investigación adicional alguna. La única forma en que una persona medianamente versada en la materia podría llegar a las conclusiones que menciona la Examinadora en su examen de fondo sería al realizar un análisis en retrospectiva una vez conoce la invención aquí reclamada.

El análisis hecho por la Examinadora es anticipado, lo cual corresponde abiertamente a un análisis conocido en el ámbito de patentes como “análisis hindsight”, lo cual distorsiona su juicio. La Examinadora concluye que los compuestos aquí reclamados son obvios puesto que ya conoce la invención aquí reclamada, y de manera simple trata de encontrar elementos aislados que coinciden en el arte previo. Adicionalmente, es importante aclarar que las invenciones en el campo farmacéutico corresponden a un “arte impredecible”, del tal forma que una persona del oficio normalmente versada en la materia no puede esperar o predecir razonablemente, los efectos de compuestos o composiciones recientemente diseñados.

Teniendo en cuenta los argumentos presentados, salta a la vista que los compuestos de la presente invención no se derivaron de manera obvia del arte previo citado, por lo que reviste nivel inventivo.

5. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su primer examen de fondo, han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de patentabilidad y proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

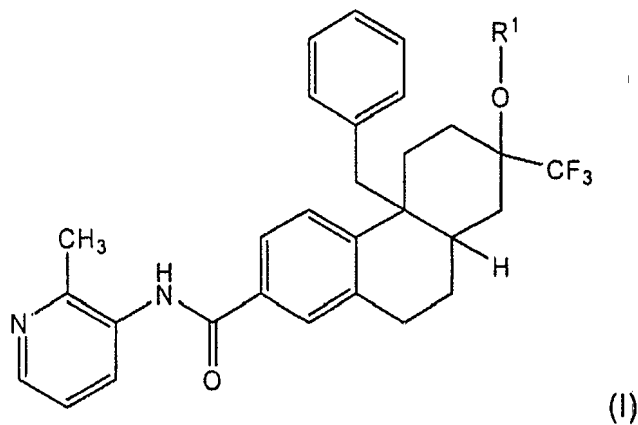
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexo: Capítulo Reivindicatorio Modificado.

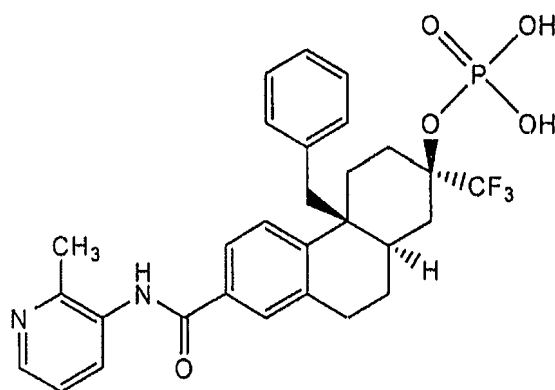
CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Un compuesto de Fórmula I



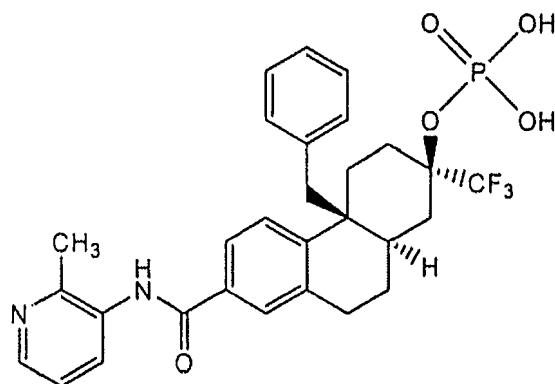
en la que R^1 es $-P(O)(OH)_2$;
o una sal del mismo.

2. El compuesto de la Reivindicación 1, en el que el compuesto es:



o una sal del mismo.

3. El compuesto de la Reivindicación 1, en el que el compuesto es:



2.

4. La sal de calcio del compuesto de la Reivindicación 1.
5. La sal de sodio del compuesto de la Reivindicación 1.
6. Una composición que comprende el compuesto de la Reivindicación 1 o sal del mismo y un portador.
