

ILUSTRÍSSIMA SENHORA DIRETORA DE PATENTES DO INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL

Processo: BR112012024691-7 - WO2011120133 - PCT CA2011000320 (28/03/2011)

Data de depósito: 28/03/2011

Prioridade Unionista: US61/321,573 (07/04/2010) e US61/318,824 (30/03/2010)

Título: Compostos inibidores não nucleosídeos da transcriptase reversa ou sais farmaceuticamente aceitáveis dos mesmos e composição farmacêutica que os compreende

Depositante: Merck Canada Inc. (CA)

ASSOCIAÇÃO BRASILEIRA INTERDISCIPLINAR DE AIDS - ABIA, associação civil sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ/MF sob nº 29.263.068/0001-45, com sede na Avenida Presidente Vargas, 446 – 13º andar, Centro, Rio de Janeiro - RJ, na pessoa de seu representante nos termos de seu Estatuto Social (anexos 1 e 2), por seu advogado (anexo 3);

FÓRUM DAS ONGS AIDS DO ESTADO DE SÃO PAULO - FOAESP, pessoa jurídica de direito privado, sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ sob nº 02.736.953/0001-48, com sede na Av. São João, 324 - 7º Andar - Sala 701 - Centro, São Paulo - SP, na pessoa de seu representante legal nos termos de seu Estatuto Social (anexos 4 e 5), por seu advogado (anexo 6);

FÓRUM ONG AIDS RS, pessoa jurídica de direito privado, sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ sob nº 07.959.716/0001-60, com sede na Rua dos Andradas, 1560 - 6º andar, Centro Histórico, Porto Alegre - RS, na pessoa de seu representante nos termos de seu Estatuto Social (anexos 7 e 8), por seu advogado (anexo 9);

UNIVERSIDADES ALIADAS PARA O ACESSO A MEDICAMENTOS ESSENCIAIS - UAEM/BRASIL, pessoa jurídica de direito privado, sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ sob nº 18.806.411/0001-34, com sede na Rua do Ouvidor, nº 63, sala 709 - Centro, Rio de Janeiro - RJ, na pessoa de seu representante legal nos termos de seu Estatuto Social (anexos 10 e 11), por seu advogado (anexo 12);

GRUPO DE INCENTIVO À VIDA - GIV, pessoa jurídica de direito privado, sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ sob nº 64.180.383/0001-00, com sede à Rua Capitão Cavalcanti, nº 145, Vila Mariana, São Paulo - SP, na pessoa de seu representante legal nos termos de seu Estatuto Social (anexos 13 e 14), por seu advogado (anexo 15);

GRUPO SOLIDARIEDADE É VIDA, pessoa jurídica de direito privado, sem fins lucrativos, inscrita no CNPJ sob nº 69.401.677/0001-38, com sede à Rua São Gabriel, 200 - Bairro Fé em Deus, São Luiz - MA, na pessoa de seu representante legal nos termos de seu Estatuto Social (anexos 16 e 17), por seu advogado (anexo 18);

vêm, respeitosamente, à presença de Vossa Senhoria, com fulcro nos artigos 50 a 54 da Lei nº 9.279/1996 - Lei da Propriedade Industrial (LPI), apresentar o presente requerimento de instauração de

PROCESSO ADMINISTRATIVO DE NULIDADE

da patente de invenção **BR112012024691-7**, concedida em 17/11/2020, uma vez que a mesma não atende aos requisitos legais de patenteabilidade expostos na Lei nº 9279/1996 - Lei da Propriedade Industrial (LPI), especialmente no que refere ao requisito de atividade inventiva (artigos 8º e 13 da LPI), além do não cumprimento dos artigos 24 e 25 da LPI, devido à falta de precisão e suficiência descritiva, e o artigo 32 da LPI, pelo acréscimo de matéria ao pedido original.

I. DA LEGITIMIDADE DAS ORGANIZAÇÕES PROPONENTES E DA TEMPESTIVIDADE

I.a Da legitimidade das organizações proponentes

A Associação Brasileira Interdisciplinar de Aids (Abia) é uma associação civil, de natureza filantrópica, sem fins lucrativos. A Abia foi fundada em 12 de março de 1987 e é uma das mais antigas ONG dedicadas ao combate da epidemia de HIV no Brasil e à garantia de direitos às pessoas vivendo com HIV, tendo como um dos seus fundadores o sociólogo Herbert de Souza (o "Betinho"), figura de reconhecida importância na vida pública brasileira. A Abia segue como uma das mais conceituadas e reconhecidas entidades sobre a matéria no Brasil e com amplo reconhecimento entre seus pares no âmbito nacional e internacional, e conta, na sua composição, com pesquisadores, profissionais e ativistas de notório saber nessa temática, considerados referências em seus campos de atuação no Brasil. Mais informações em: www.abiaids.org.br.

A Abia coordena o Grupo de Trabalho sobre Propriedade Intelectual (GTPI) da Rede Brasileira pela Integração dos Povos (Rebrip). A Rebrip congrega organizações da sociedade civil brasileira para acompanhar e monitorar os acordos comerciais nos quais o governo brasileiro está envolvido, a fim de avaliar e minimizar potenciais impactos no cotidiano da população e em políticas públicas que visam assegurar a efetivação dos direitos humanos no Brasil. Mais informações sobre a Rebrip estão disponíveis em www.rebrip.org.br. Um dos temas relevantes no âmbito da discussão sobre comércio e direitos humanos refere-se à propriedade intelectual, motivo pelo qual a Rebrip constituiu um grupo de trabalho para encaminhar as reivindicações da sociedade civil sobre esta questão, fundado em 2003. O GTPI reúne diversas entidades da sociedade civil e busca discutir, acompanhar e incidir no tema da propriedade intelectual e, sobretudo, mitigar o impacto dos efeitos negativos do atual sistema de patente no acesso aos medicamentos essenciais à população brasileira. Mais informações sobre o GTPI/Rebrip podem ser consultadas em www.deolhonaspatentes.org.

O Fórum de ONGs Aids do Estado de São Paulo (Foaesp) é um colegiado que reúne organizações com atuação no campo da Aids, direitos humanos e saúde pública no estado. Criado em 1996 e fundado em outubro de 1997, hoje é formado por mais de uma centena de organizações, atuando no nível estadual, regional e nacional principalmente no controle social das políticas públicas, na defesa do Sistema Único de Saúde (SUS), na ampliação de ações de prevenção ao HIV e outras coinfeções e na garantia de direitos das pessoas que vivem com HIV e Aids. O Fórum já se consolidou como um importante espaço de interlocução com os gestores de políticas públicas em HIV/Aids, especialmente a Secretaria de Estado da Saúde, tem encaminhado para a especialização e aprofundamento de suas

ações de ativismo, com a criação de Comissões Temáticas e Grupos de Trabalho. Mais informações em: <http://www.forumaidssp.org.br>.

O Fórum de ONGs Aids do Rio Grande do Sul foi fundado em 1999, reúne 48 organizações gaúchas voltadas à prevenção e conscientização acerca da epidemia de HIV. Com sede em Porto Alegre, atua em diferentes regiões do estado pela melhoria da qualidade de vida e pelos direitos das pessoas soropositivas. Algumas das suas ações são: articular a força das diversas ONGs que integram o Fórum para otimizar os resultados; conscientização acerca da prevenção; incentivo à aceitação dos portadores de si mesmos; desconstrução de tabus e preconceitos sobre a doença; melhora da qualidade de vida para pessoas vivendo com HIV; participar da formulação de políticas públicas inclusivas de prevenção e controle da aids; denunciar todas as formas de omissão, transgressão e violação dos direitos humanos, civis, políticos e sociais das pessoas que vivem com HIV. Mais informações em: <https://www.forumongaidrs.org/>.

A Universidades Aliadas para o Acesso a Medicamentos Essenciais (UAEM/BRASIL) é um grupo de estudantes universitários que acredita que as universidades têm a oportunidade e a responsabilidade de aprimorar o acesso global aos bens de saúde pública. Fundada em agosto de 2010, tem a missão de promover o acesso a medicamentos e inovação em tecnologias de saúde; estabelecer políticas de propriedade intelectual que facilitem o acesso ao conhecimento na área de saúde; empoderar estudantes e criar lideranças na incidência sobre políticas de saúde em prol do interesse público. Mais informações em: <https://pt-br.facebook.com/pg/uaembr/about/>.

O Grupo de Incentivo à Vida (GIV) foi fundado em 1990 como um grupo que luta pelos direitos das pessoas vivendo com HIV/AIDS, e das populações mais vulneráveis à infecção pelo HIV, tendo como ponto de partida o protagonismo político das pessoas soropositivas. Não tem finalidades lucrativas e nenhuma vinculação de natureza político partidário ou religiosa. Com seu trabalho e as parcerias que estabeleceu, o GIV firmou-se e contribuiu para o crescimento e fortalecimento das respostas comunitárias de combate à aids, com envolvimento técnico e político na maior parte das decisões e reivindicações importantes para as pessoas vivendo com AIDS, como por exemplo a luta por acesso universal e gratuito a medicamentos. O GIV realiza trabalhos no âmbito da prevenção, luta pelos direitos e contra o preconceito, terapias alternativas, massagens, apoio psicológico individual e em grupo, palestras, cursos, oficinas e grupos de vivência. Mais informações em: <http://www.giv.org.br/>.

O Grupo Solidariedade é Vida é uma organização não-governamental que há 20 anos trabalha com crianças, adolescentes, jovens e adultos vivendo e convivendo com HIV de todo o Maranhão, no atendimento e promoção da cidadania dessas pessoas. A organização mantém duas casas de apoio em São Luís, e é a única instituição de atendimento e apoio às pessoas vivendo com HIV no Maranhão. O objetivo do grupo é oferecer às pessoas vivendo com HIV maior qualidade de vida, informações acerca dos seus direitos e deveres e promover o exercício de sua cidadania. Mais informações em: <https://www.facebook.com/Grupo-solidariedade-%C3%A9-vida-713276028748877/>

Em consonância com o princípio da participação popular¹, a Lei nº. 9.784, de 29 de janeiro de 1999, que regula o processo administrativo no âmbito da administração pública federal, em seus artigos 31, 32 e 33, legitima a atuação de terceiros interessados, prevendo

¹ Pietro, MSZ. Direito Administrativo. 31. ed. Rio de Janeiro: Forense, 2018.

expressamente a legitimidade de organizações, para atuar em defesa de direitos ou interesses coletivos e difusos.

Além disso, mais especificamente, o artigo 51 da Lei da Propriedade Industrial (LPI), Lei nº. 9.279 de 14 de maio de 1996 prevê que o processo administrativo de nulidade poderá ser instaurado mediante requerimento de **qualquer pessoa com legítimo interesse**. Esse é o caso das organizações ora requerentes, que possuem legítimo interesse devido a sua história e trajetória na defesa dos direitos humanos, com ênfase para o direito à saúde e ao acesso a tratamento e assistência farmacêutica de qualidade especialmente para pessoas vivendo com HIV/Aids, além da ativa militância no campo da implementação de políticas públicas na área de propriedade intelectual, visando a primazia do interesse público.

A patente **BR112012024691-7** refere-se a “compostos inibidores não nucleosídeos da transcriptase reversa ou sais farmacêuticamente aceitáveis dos mesmos e composição farmacêutica que os compreende”, incluindo o composto Doravirina, utilizado no tratamento de HIV.

Por esta razão, as organizações proponentes possuem amplo interesse e legitimidade para atuarem como interessadas no processo administrativo de nulidade da patente **BR112012024691-7**, diante de suas trajetórias e missões sociais apresentadas acima.

I.b Da tempestividade do presente Processo Administrativo de Nulidade (PAN)

A Lei da Propriedade Industrial (LPI), Lei nº. 9.279 de 14 de maio de 1996, estabelece, no seu artigo 51, que qualquer pessoa com legítimo interesse pode apresentar requerimento para instauração de processo administrativo de nulidade no prazo de 6 meses contados da concessão da patente. A patente de invenção **BR112012024691-7** foi concedida em 17 de novembro de 2020, deste modo, o presente requerimento está dentro do prazo estipulado para sua apresentação.

Art. 51. O processo de nulidade poderá ser instaurado de ofício ou mediante requerimento de qualquer pessoa com legítimo interesse, no prazo de 6 (seis) meses contados da concessão da patente.

Parágrafo único. O processo de nulidade prosseguirá ainda que extinta a patente.

II. INFORMAÇÕES PRELIMINARES SOBRE O OBJETO DA PATENTE E SUA IMPORTÂNCIA PARA A SAÚDE

II.a Sobre a doravirina

A doravirina é um inibidor da transcriptase reversa não nucleosídeo (ITRNN), que foi aprovado pela Food and Drug Administration (FDA) dos Estados Unidos em 30 de agosto de 2018² para o tratamento da infecção pelo HIV em pacientes adultos. Está disponível como comprimido de 100 mg, é indicada para ser utilizada como parte de um regime em combinação com tenofovir disoproxil (100 mg) e lamivudina (300 mg).

² Disponível em:

https://www.accessdata.fda.gov/scripts/cder/ob/results_product.cfm?Appl_Type=N&Appl_No=210806#35319.

A doravirina é composta por três porções: um anel fenil substituído, ligado por um éter a um anel de heteroaril substituído (mais especificamente uma piridona substituída), ligada por um CH₂ a um anel de triazolínona. Sua estrutura química está representada na Figura 1.

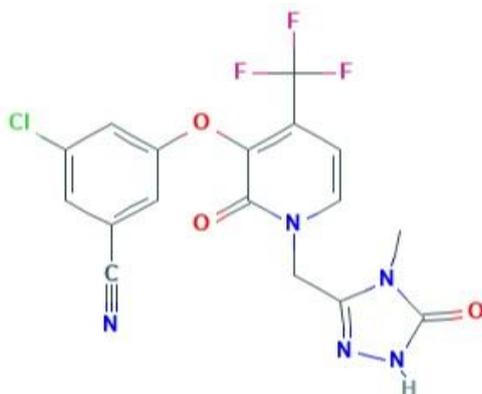


Figura 1: Estrutura química da doravirina. Fonte: Pubchem.

III. SITUAÇÃO DOS PEDIDOS DE PATENTE RELACIONADOS À DORAVIRINA NO BRASIL

Em pesquisa realizada em bases de dados públicas³, foi possível identificar cinco pedidos de patentes ou patentes concedidas no Brasil relacionados à doravirina (Tabela 1), apresentados ao INPI. Dentre eles, dois pedidos de patente foram concedidos, um foi indeferido e há dois pedidos de patente pendentes.

Tabela 1: Pedidos de patentes relacionados à doravirina

PEDIDO DE PATENTE	TÍTULO	DEPOSITANTE	SITUAÇÃO PATENTÁRIA
BR112012024691-7 WO2011120133 US8486975 CA2794377	Compostos inibidores não nucleosídeos da transcriptase reversa ou sais farmacologicamente aceitáveis dos mesmos e composição farmacêutica que os compreende	Merck Canada Inc. (CA)	Depósito em 28/03/11 Situação: Concedida em 17/11/2020
BR112015012843-2 WO2014089140 US2013072964	Método para sintetizar o composto	Merck Sharp & Dohme Corp. (US)	Depósito em 04/12/2013 Situação: Pendente
BR112015005997-0 WO2014052171 US2013060787	Composto	Merck Sharp & Dohme Corp. (US)	Depósito em 20/09/2013 Situação: Indeferido (com recurso)
BR112018011085-0 WO2017095761	Composições farmacêuticas contendo doravirina, fumarato de tenofovir desoproxila e lamivudina	Merck Sharp & Dohme Corp. (US)	Depósito em 29/11/16 Situação: Concedida em 02/06/2020

³ Foram realizadas buscas em: Orange Book, Canada Health, WIPO Patentscope, Espacenet, Patent Opposition Database, Medspal.

BR112018016349-0 WO2017139519	Métodos para tratamento e profilaxia de HIV e aids	Merck Sharp & Dohme Corp. (US)	Depósito em 10/02/17 Situação: Pendente
---	--	--------------------------------	--

IV. HISTÓRICO DA PATENTE BR112012024691-7 NO BRASIL

1. A patente **BR112012024691-7** foi depositada no INPI em 28 de março de 2011 com 16 reivindicações, apresentando prioridade unionista de 30 de março de 2010.
2. Em 19 de setembro de 2019 (RPI 2540), foi publicada a concessão do exame prioritário da patente **BR112012024691-7**.
3. Em 10 de março de 2020 (RPI 2566), a Agência Nacional de Vigilância Sanitária (Anvisa) concedeu a anuência ao **BR112012024691-7**, apresentando subsídio contendo argumentos contrários à concessão, por falta de adequação aos artigos 8.º, 13, 24 e 25 da LPI.
4. Em 23 de março de 2020 (RPI 2569), o INPI publicou parecer técnico, no qual indicou que o pedido de patente **BR112012024691-7** não estava de acordo com os requisitos previstos nos artigos 8.º, 13, 24 e 25 da LPI, carecendo de atividade inventiva e suficiência descritiva.
5. Como resposta ao parecer do INPI, a titular da patente protocolou um recurso junto ao órgão no dia 21 de maio de 2020 (petição n.º 870200063255), no qual reduziu o quadro reivindicatório (QR) para 15 reivindicações e apresentou novas vias do relatório descritivo e do resumo.
6. Em 28 de julho de 2020 (RPI 2586), foi publicado um segundo parecer técnico do INPI, no qual foram feitas exigências técnicas para reformulação do quadro reivindicatório para atender ao artigo 25 da LPI, por conta da falta de suficiência descritiva.
7. Em resposta, a titular da patente submeteu, em 22 de outubro de 2020 (petição n.º 870200133525), um novo recurso apresentando um novo QR, contendo 15 reivindicações, e novas vias do relatório descritivo (RD).
8. Em 03 de novembro de 2020 (RPI 2600), o último parecer do INPI considerou que a titular cumpriu as exigências formuladas no parecer técnico anterior e deferiu o pedido de patente **BR112012024691-7**.
9. Em 17 de novembro de 2020, foi expedida a carta-patente, concedendo 20 anos de monopólio a partir de 28/03/2011.

V. DO OBJETO DA PATENTE BR112012024691-7

A patente **BR112012024691-7**, concedida em 17 de novembro de 2020, possui 15 reivindicações. Segue, na Tabela 2, a sistematização do quadro reivindicatório.

Tabela 2: Quadro reivindicatório da patente **BR112012024691-7**

TIPO DE PROTEÇÃO	REIVINDICAÇÕES	DETALHAMENTO
Composto	1 a 6, 9 e 10	Compostos derivados das fórmulas I, II e III e compostos selecionados
Composição farmacêutica	7 e 11	Composição farmacêutica
Uso	8, 12, 13, 14 e 15	Composto para uso

VI. SOBRE O ESTADO DA TÉCNICA

VI.a Das anterioridades

D1: Sweeney, ZK et al. Discovery of triazolinone non-nucleoside inhibitors of HIV reverse transcriptase. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 18: 4348-4351, 2008.

D2: WO2004085411 (US20040192704). Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors for treating HIV mediated diseases. Data de publicação: 07/10/2004.

D3: WO2004074257. Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. Data de publicação: 02/09/2004.

D4: WO2009067166. Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. Data de publicação: 28/05/2009.

D5: Wermuth CG. (Ed.). *The practice of medicinal chemistry*. Academic Press, 2003.

D6: Wipf P; Henninger TC; Geib SJ. Methyl-and (trifluoromethyl) alkene peptide isosteres: synthesis and evaluation of their potential as β -turn promoters and peptide mimetics. *The Journal of organic chemistry*, 63(18), 6088-6089, 1998.

A anterioridade **D1** descreve a preparação e avaliação da potência e propriedades físicas de vários inibidores não nucleosídeos da transcriptase reversa do HIV (ITRNN). Os compostos têm a estrutura geral **A-O-B-CH₂-C**, em que A é um fenil substituído, B é um fenileno substituído e C é uma triazolinona substituída. Estes compostos inibiram fortemente os vírus do tipo selvagem e resistentes a ITRNN *in vitro* (cepa do HIV K103N / Y181C).

A anterioridade **D2** descreve compostos heterocíclicos de fórmula geral **A-O-B-CH₂-C**, que inibem a transcriptase reversa do HIV, em que A é um fenil substituído, B é um fenileno substituído e C é uma triazolinona substituída (e seus sais farmacologicamente aceitáveis). Além disso, descreve composições farmacêuticas compreendendo o composto e métodos para tratamento ou profilaxia de doenças causadas por HIV.

A anterioridade **D3** descreve derivados de pirazol de fórmula geral **A-O-B-CH₂-C**, que inibem a transcriptase reversa do HIV, em que A é um fenil substituído, B é um heteroaril substituído e C é uma triazolona substituída (e seus sais farmacologicamente aceitáveis). Além disso, descreve composições farmacêuticas compreendendo o composto e métodos para tratamento ou profilaxia de doenças causadas por HIV.

A anterioridade **D4** descreve compostos ariloxi-, cicloalquiloxi- e heterocicloxipiridinas e pirimidinas, compostos relacionados e seu uso para a inibição da transcriptase reversa do HIV. Os compostos têm a fórmula geral **A-O-B-CH₂-C**, em que A é um fenil substituído, B é uma piridona substituída e C é um heteroaril substituído (e seus sais farmacologicamente aceitáveis). Além disso, descreve composições farmacêuticas compreendendo o composto e métodos para o tratamento ou profilaxia de doenças causadas pelo HIV.

A anterioridade **D5** é um manual clássico que pertence ao estado da arte da química medicinal e enfatiza os métodos para conduzir pesquisas e desenvolver novos medicamentos. Em particular, descreve exemplos específicos de isómeros clássicos que mostram que as estratégias usadas na patente em questão são bem conhecidas no estado da técnica.

A anterioridade **D6** é um artigo científico que descreve a substituição isostérica de amidas e fluoroalquenos, e a caracterização de compostos derivados.

Algumas das anterioridades listadas neste procedimento administrativo de nulidade foram utilizadas no processo de análise do INPI, contudo, gostaríamos de reforçar a

importância da anterioridade **D4** (WO2009067166) e das novas anterioridades adendadas nesse processo (**D3, D5 e D6**).

No parecer técnico do INPI de julho de 2020 foi referendada a alegação da titular da patente de que os compostos de fórmula I de **D4** (WO2009067166, D3 no referido documento), embora possuam base similar aos compostos da presente patente não motivariam um técnico no assunto a selecionar especificamente os compostos dessa anterioridade e substituir o heterociclo do substituinte Z. Essa afirmação não se sustenta, porque a referida anterioridade compõe o estado da técnica da mesma área de conhecimento, já que trata de compostos inibidores da transcriptase reversa não nucleosídeos, e o heterociclo do substituinte Z é um heteroaril substituído.

A anterioridade **D3** também faz parte do estado da técnica por compreender compostos inibidores da transcriptase reversa não nucleosídeos, com uma estrutura química muito similar aos compostos da presente patente.

D5 e D6 detalham a substituição isostérica de anéis aromáticos nos compostos divulgados em **D1-D3**, documentos do estado da técnica essenciais para obtenção dos compostos da presente patente.

Segundo as Diretrizes de exame do INPI (Resolução nº 169/2016), a atividade inventiva deve ser avaliada de acordo com o estado da técnica mais próximo, que é constituído por um ou mais documentos relacionados à invenção pleiteada.

5.10 (...) O estado da técnica mais próximo pode ser:

(i) Um ou mais documentos existentes no mesmo campo técnico que o da invenção reivindicada, em que o problema técnico a ser solucionado, os efeitos técnicos ou o uso pretendido são os mais próximos da invenção reivindicada; ou que descrevem o maior número de características técnicas da invenção reivindicada;

Após essa explanação inicial, dentre as anterioridades listadas, fica nítido que **o estado da técnica mais próximo, para avaliação da atividade inventiva da presente patente, consiste em análogos de nucleosídeos descritos em D1 (ou D2/D3) em combinação com D4.**

VII. SOBRE OS DADOS FARMACOCINÉTICOS E ACRÉSCIMO DE MATÉRIA

Na manifestação da titular (Petição 870200063255, de 21/05/2020) foram apresentados testes sobre os parâmetros farmacocinéticos dos compostos. Esses dados são novos e não estavam mencionados no relatório descritivo original da patente. O problema da técnica apresentado e resolvido pelo documento original de pedido de patente é o desenvolvimento de compostos inibidores de transcriptase reversa para cepas mutantes do HIV.

No relatório descritivo originalmente depositado da patente **BR112012024691-7**, não há nenhuma citação referente às propriedades farmacocinéticas dos compostos pleiteados. A alegação de superioridade farmacocinética dos compostos em comparação com o estado da técnica acrescenta matéria ao pedido original. O efeito técnico obtido com o objeto pleiteado deve ser reconhecido pelo técnico no assunto a partir do que é apresentado no relatório descritivo, ou seja, na matéria inicialmente revelada, ainda que não de forma quantitativa, conforme estabelecem os itens 5.15 e 5.16 das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II (Resolução nº 169/2016).

5. 15 Como princípio, qualquer efeito técnico de uma invenção pode ser utilizado como base para a reformulação do problema técnico, desde que o

efeito técnico possa ser reconhecido por um técnico no assunto a partir do que é apresentado no relatório descritivo.

5. 16 Na hipótese de resultados/testes/ensaios ou similares apresentados durante o exame técnico, mesmo após o pedido de exame, com o objetivo de comprovar o efeito técnico da invenção, a apresentação de tais dados na argumentação da requerente deve ser inerente à matéria inicialmente revelada. Nestes casos, o efeito técnico da invenção deve estar descrito na matéria inicialmente revelada, ainda que não em uma forma quantitativa.

Conclusão: Essas informações farmacocinéticas não foram reivindicadas como um avanço técnico no relatório descritivo da patente **BR112012024691-7**. Portanto, **essa possível melhora farmacocinética, consiste em uma informação adicional ao conteúdo da matéria e está em desacordo com o artigo 32 da Lei da Propriedade Industrial.**

VIII. DA AUSÊNCIA DO CUMPRIMENTO DOS REQUISITOS DE PATENTEABILIDADE

VIII.a Reivindicações 1 a 6 (Compostos) - Falta de atividade inventiva

A presente patente refere-se a inibidores da transcriptase reversa não nucleosídeos (ITRNN) que apresentam a seguinte estrutura geral (Figura 2):

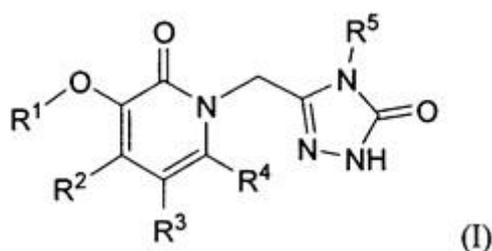


Figura 2: Fórmula I da patente BR112012024691-7, reivindicação 1

Esta estrutura pode ser dividida em três partes principais: A, B e C, conforme destacado na Figura 3). Portanto, os compostos derivados da Fórmula I possuem a fórmula geral A-O-B-CH₂-C, em que:

- A é um fenil substituído
- B é uma piridona substituída
- C é uma triazolinona substituída.

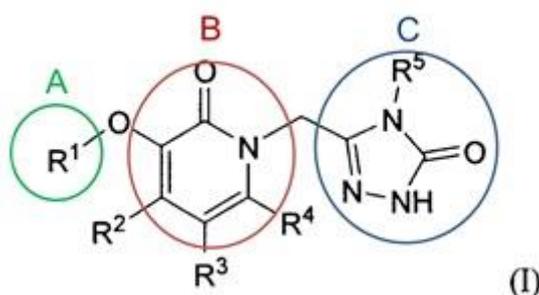


Figura 3: Fórmula I da patente BR112012024691-7, representada por A-O-B-CH₂-C

D1 revela a preparação de compostos inibidores da transcriptase reversa não nucleosídeos com a finalidade de melhorar a solubilidade deles. Os compostos de origem possuíam uma piridazinona na parte C, pois era conhecida a importância da ligação N-NH na interação com a proteína viral. Dessa forma, os autores fizeram modificações na estrutura mantendo essa ligação e substituindo a piridazinona pela triazolinona.

Assim, **D1** divulgou compostos ITRNN com a estrutura geral A-O-B-CH₂-C, em que:

- A é um fenil substituído
- B é um fenileno substituído
- C é uma triazolinona substituída.

Por exemplo, o composto 7a de **D1** (Tabela 4, página 7350) tem a estrutura representada na Figura 4:

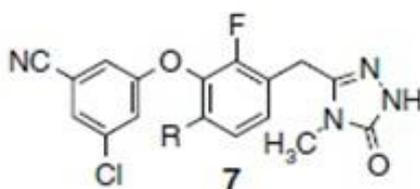


Figura 4: Estrutura do composto 7a de **D1** (página 4350)

As partes A e C dos compostos revelados em **D1** estão incluídas na fórmula Markush da presente patente. No caso do composto exemplificado 7a, A é um 3-cloro-5-cianofenil e C é a mesma triazolinona quando R₅ é CH₃ (igual à presente patente, especificamente na reivindicação 9, página 96).

D2 e **D3** também revelaram compostos inibidores da transcriptase reversa não nucleosídeos, tendo a estrutura geral A-O-B-CH₂-C, em que:

- A é um fenil substituído
- B é um fenileno substituído (**D2**) ou um heteroaril (**D3**)
- C é uma triazolinona substituída.

D2 descreveu compostos com a estrutura Markush representada na Figura 5:

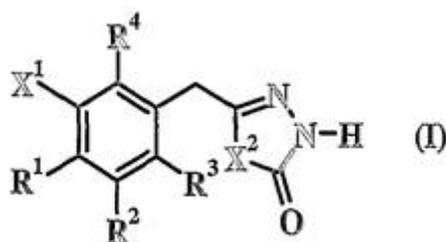


Figura 5: Estrutura Markush de **D2**

Quando X² é NR⁷ (reivindicação 1, página 62 de **D2**), a parte C é uma triazolona substituída como a reivindicada na presente patente. Quando X¹ é OR⁵, and R⁵ é um fenil substituído (reivindicação 1, página 62 de **D2**), mais especificamente um fenil 3,5-dissubstituído (reivindicação 6, página 63 de **D2**), a parte A é um fenil substituído como o revelado na presente patente.

D1, **D2** e **D3** revelam compostos com a estrutura geral A-O-B-CH₂-C, na qual as partes A e C são as mesmas dos compostos da presente patente. A diferença é que a parte B pode ser um fenileno substituído (**D1** e **D2**) ou um heteroaril (**D3**), ao invés de ser uma piridona substituída (na presente patente).

Já a anterioridade **D4** revela compostos inibidores de transcriptase reversa não nucleosídeos com estrutura geral A-O-B-CH₂-C, os quais:

- A é um fenil substituído
- B é uma piridona substituída
- C é um heteroaril substituído.

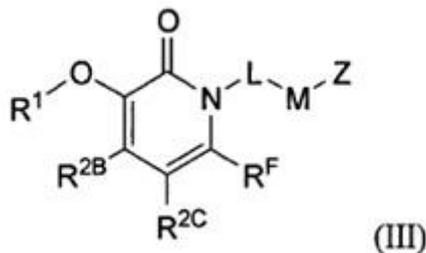


Figura 6: Fórmula III de **D4** (página 162)

A reivindicação 18 de **D4** refere-se a compostos de Fórmula III, na qual R¹ é um fenil substituído (A); L é uma ligação; M é CH₂; e Z é um heteroaril substituído (C) (página 162). A parte B é uma piridona substituída, cujos possíveis substituintes foram revelados em D4. R₂, R₃ e R₄ da reivindicação 1 da presente patente (páginas 62-66) são correspondentes de R^{2B}, R^{2C} e R^F da reivindicação 18 de **D4** (páginas 163-163).

D4 divulga compostos com a estrutura geral A-O-B-CH₂-C, na qual as partes A e B são iguais às da presente patente. A diferença está na parte C dos compostos, porém isso já foi divulgado em **D1-D3**.

A titular da patente alegou na sua manifestação (Petição 870200063255, de 21/05/2020) que nenhum dos documentos de anterioridade forneceria qualquer ensinamento que levaria um técnico no assunto a sintetizar os compostos ora reivindicados na presente patente e/ou acreditar que eles manteriam a atividade biológica ou apresentariam propriedades aprimoradas. Alegou ainda que estes compostos possuem diferenças estruturais relevantes, mas não explicou nem exemplificou quais são essas diferenças estruturais que levariam a efeitos biológicos e farmacocinéticos diferentes. Sendo que é amplamente conhecido na técnica que efeitos biológicos e farmacocinéticos são decorrentes de processos diversos, uma alteração estrutural na molécula não muda necessariamente a farmacocinética de um medicamento.

Além disso, sobre a alegação da titular da patente (Petição 870200063255, de 21/05/2020) de que as propriedades eletrônicas de cada uma das porções são diferentes, assim estes compostos não se comportariam da mesma forma em um sistema biológico, também é de conhecimento de um técnico no assunto as substituições isostéricas utilizadas nesses compostos.

As diferenças entre a parte B dos compostos divulgados em **D1-D3** e os compostos da presente patente (heteroalquil ou fenileno substituído versus piridona substituída) é uma substituição isostérica clássica que tem sido amplamente aplicada em isósteros de anéis aromáticos:

“The substitution of —CH= by —N= or —CH=CH— by —S— in aromatic rings has been one of the most successful applications of classical isosterism. Early examples are found in the sulfonamide antibacterials with the development of sulphapyridine, sulphapyrimidine, sulphathiazole, etc.” (página 193 de D5)

Isósteros são moléculas com número e arranjo idêntico de elétrons, propriedades químicas semelhantes e são muito utilizadas no desenvolvimento de medicamentos. **D5** e

D6 detalham a substituição isostérica de anéis aromáticos nos compostos divulgados em **D1-D3**. Portanto, essa substituição é óbvia para um técnico no assunto pois está contida no conhecimento geral da área de química medicinal, dessa forma não representa uma etapa inventiva.

Em relação à mesma questão, a única diferença entre a parte B do composto 7a divulgado em **D1** e a fórmula geral I (Figura 2) da presente patente é a mudança do fluoroalqueno (existente em um estado transiente dada a ressonância do anel aromático) de **D1** com a função amida presente nessa patente. Esta substituição isostérica foi relatada anteriormente em **D6** e não representa uma etapa inventiva. É de conhecimento do estado da técnica que embora o motivo flúor (**D1**) seja mais lipofílico do que o amida, ele não apresenta todas as características importantes deste último, ou seja, não é um bom doador ou aceitador de ponte de hidrogênio.

Os compostos divulgados em **D1-D4** mostraram inibir a atividade da transcriptase reversa do HIV, na cepa de tipo selvagem e também nos mutantes resistentes relatados (K103N e/ou Y181C, **D1** e **D4**). Como consequência, é óbvio para um técnico no assunto fazer pequenas modificações nos compostos anteriormente divulgados para obter novos compostos com a mesma atividade, como os da presente patente.

Conclusão: a presente patente visa proteger compostos com estrutura geral A-O-B-CH₂-C, em que A é um fenil substituído, B é uma piridona substituída e C é uma triazolinona substituída, a fim de resolver o problema técnico de inibidores da transcriptase reversa do HIV para cepas mutantes.

No entanto, combinando **D1** com **D4** como estado da técnica mais próximo, a abordagem para projetar moléculas para inibir as cepas selvagem e mutante da transcriptase reversa de HIV já foi demonstrada pela adoção de compostos com a estrutura geral de A-O-B-CH₂-C, em que A é um fenil substituído e C é uma triazolinona substituída (**D1**) ou A é um fenil substituído e B é uma piridona substituída (**D4**).

Portanto, um técnico no assunto após analisar a literatura disponível sobre ITRNN poderia ter facilmente combinado as partes A e C dos compostos divulgados em **D1-D3** (Figuras 4 e 5) com a parte B divulgada em **D4** (Figura 6) para chegar aos mesmos compostos do presente pedido de patente sem envolver qualquer etapa inventiva.

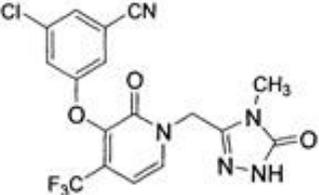
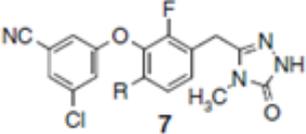
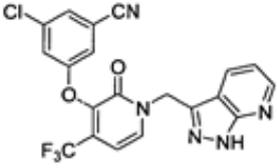
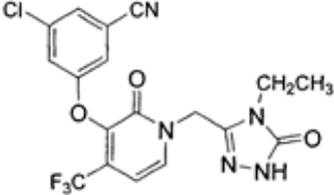
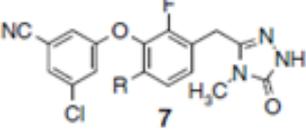
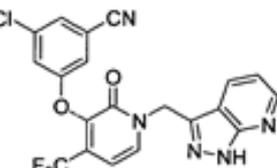
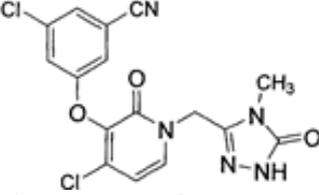
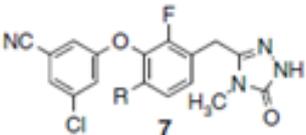
Por esta razão, **as reivindicações 1 a 6 não apresentam atividade inventiva e estão em desacordo com os artigos 8º e 13 da Lei da Propriedade Industrial.**

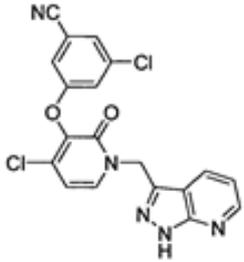
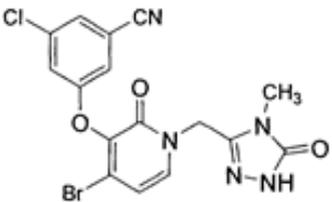
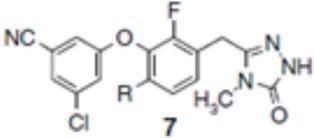
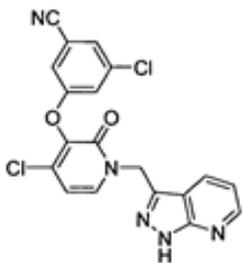
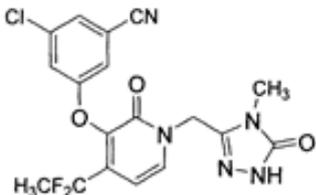
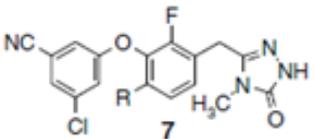
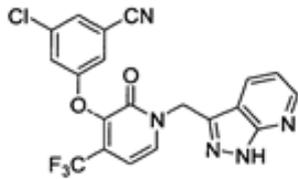
VIII.b Reivindicação 6 (Compostos selecionados) - Falta de atividade inventiva

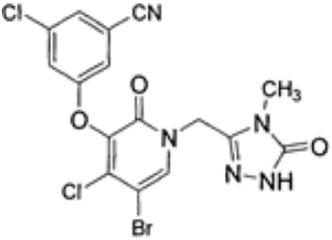
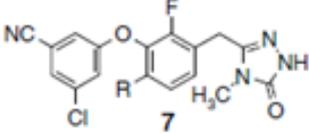
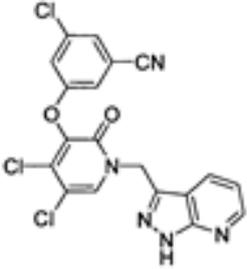
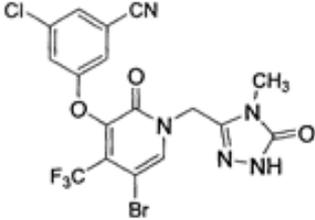
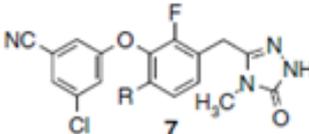
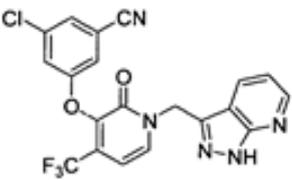
A reivindicação 6 revela oito compostos específicos, que derivam da estrutura Markush I. Esses compostos apresentam como parte A um 3-cloro-5-cianofenil ou 3-difluorometil-5-cianofenil; como parte B uma piridona com substituições em R² tais como CF₃, Cl, Br ou CF₂CH₃ e Br em R³; e como parte C uma triazolinona substituída em R⁵ por CH₃ or CH₂CH₃.

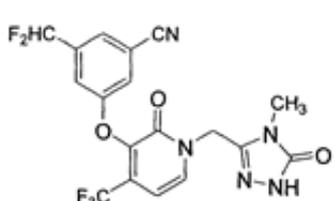
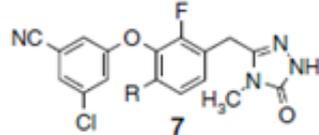
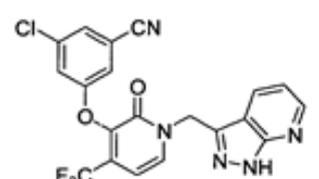
Quadro 1: Comparação entre os compostos das reivindicações 9 e 10 e aqueles de **D1** e **D4**.

COMPOSTO DA REIVINDICAÇÃO 6	COMPOSTOS DE D1 E D4	DETALHES
-----------------------------	----------------------	----------

 <p>(exemplo 1, página 64 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>  <p>D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-cloro-5-({1-[(4- metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-4-(trifluorometil)-1,2-diidropiridin-3-il}oxi)benzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) e D4 (exemplo 13, página 104). • Parte B: piridona substituída em R² com CF₃ anteriormente revelada em D4 (exemplo 13, página 104). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).
 <p>(exemplo 2, página 71 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>  <p>D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-cloro-5-({1-[(4-etil- 5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-4-(trifluorometil)-1,2-diidropiridin-3-il}oxi)benzonitrila</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) e D4 (exemplo 13, página 104). • Parte B: piridona substituída em R² com CF₃ anteriormente revelada em D4 (exemplo 13, página 104). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₂CH₃. A diferença com o composto de D1 é a presença do etil ao invés de do metil (composto 7, página 4350). Essa modificação não é somente óbvia para um técnico no assunto, mas também é a mesma triazolinona revelada em D2: X² é NR⁷ e R⁷ é um alquil de 1-6 carbonos (reivindicação 1, página 62, D2).
 <p>(exemplo 3, página 72 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-cloro-5-({4-cloro-1- [(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-1,2-diidropiridin-3-il}oxi)benzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7 página 4350) e D4 (exemplo 21, página 114). • Parte B: piridona substituída em R² com Cl anteriormente revelada em D4 (exemplo 21, página 114). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃

	 <p style="text-align: center;">D4</p>	<p>anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).</p>
 <p>(exemplo 4, página 75 do relatório descritivo)</p>	 <p style="text-align: center;">D1</p>  <p style="text-align: center;">D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-((4-bromo-1-[(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-1,2-diidropiridin-3-il)oxi)-5-clorobenzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) e D4 (exemplo 21, página 114). • Parte B: piridona substituída em R² com Br. D4 revelou que a piridona central pode ser substituída nessa posição (R^{2B} em D4) com Cl, Br ou outros (R^{2B} reivindicação 18, página 162, D4). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).
 <p>(exemplo 5, página 78 do relatório descritivo)</p>	 <p style="text-align: center;">D1</p>  <p style="text-align: center;">D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-cloro-5-((4-(1,1-difluoroetil)-1-[(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-1,2-diidropiridin-3-il)oxi)benzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) and D4 (exemplo 13, página 104). • Parte B: piridona substituída em R² com CF₂CH₃. O composto revelado em D4 tem um grupo CF₃ (exemplo 13, página 104), entretanto CF₂CH₃ é revelado como possível substituinte na posição R^{2B} (reivindicação 18, opção 4, página 162, D4). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).

 <p>(exemplo 6, página 81 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>  <p>D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-({5-bromo-4-cloro-1- [(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-1,2-diidropiridin-3-il)oxi)-5-clorobenzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) and D4 (exemplo 23, página 119). • Parte B: piridona substituída em R² com Cl e em R³ com Br. O composto revelado em D4 tem Cl nas duas posições (exemplo 23, página 119), entretanto Br é revelado como possível substituinte posição R^{2C} (reivindicação 18, opção 16, página 162, D4). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).
 <p>(exemplo 7, página 82 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>  <p>D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-({5-bromo-1-[(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-4-(trifluorometil)-1,2-diidropiridin-3-il)oxi)-5-clorobenzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-cloro-5-cianofenil anteriormente revelado em D1 (composto 7, página 4350) e D4 (exemplo 13, página 104). • Parte B: piridona substituída em R² com CF₃ e em R³ com Br. O composto revelado em D4 tem o mesmo grupo CF₃ na posição R² e sem substituições em R³ (ou R^{2C} em D4), entretanto Br é revelado como possível substituinte nessa posição (reivindicação 18, opção 16, página 162, D4). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).

 <p>(exemplo 8, página 83 do relatório descritivo)</p>	 <p>D1</p>  <p>D4</p>	<p>O composto revelado na reivindicação 6 é 3-(difluorometil)-5-({1-[(4-metil-5-oxo-4,5-diidro-1H-1,2,4-triazol-3-il)metil]-2-oxo-4-(trifluorometil)-1,2-diidropiridin-3-il}oxi)benzonitrila.</p> <ul style="list-style-type: none"> • Parte A: 3-difluorometil-5-cianofenil. A diferença com os compostos de D1 (composto 7, página 4350) e D4 (exemplo 13, página 104) é a troca do Cl pelo difluorometil. Entretanto, D4 revelou que o grupo fenil pode ser substituído com 1-3 substituintes incluindo haloalquil de 1-4 carbonos, como difluorometil (reivindicação 18, página 162). • Parte B: piridona substituída em R² com CF₃ anteriormente revelada em D4 (exemplo 13, página 104). • Parte C: triazolinona substituída em R⁵ com CH₃ anteriormente revelada em D1 (composto 7, página 4350).
---	---	---

Conclusão: conforme detalhado no Quadro 1, os oito compostos selecionados a partir da fórmula de Markush no presente pedido de patente seguem opções de substituição para as partes A, B e C que já foram divulgadas no estado da técnica mais próximo **D1** e **D4**. Não foi adicionado nada de novo para abordar o proposto problema técnico de desenvolvimento de compostos inibidores de transcriptase reversa para cepas mutantes do HIV. Um técnico no assunto usaria os documentos do estado da técnica para propor tais substituições. Por esta razão, **a reivindicação 6 não apresenta atividade inventiva e está em desacordo com os artigos 8º e 13 da Lei da Propriedade Industrial.**

VIII.c Reivindicações 7 e 11 (Composição farmacêutica) - Falta de atividade inventiva

As reivindicações 7 e 11 visam proteger uma “composição farmacêutica, caracterizada pelo fato de que compreende o composto (...), e um carreador farmacologicamente aceitável.”

Essas reivindicações tratam de mera mistura de componentes: uma molécula (ou seu sal) com um carreador inespecífico. Não são elencados e nem especificados ingredientes de uma possível composição/formulação farmacêutica, tais como: agentes umectantes, diluentes, polímeros e desintegrantes, agente de deslizamento ou lubrificantes.

Essas reivindicações não apresentam inventividade para resolver um problema da técnica, nem apresentam efeito sinérgico ou inesperado resultante da combinação de compostos conhecidos, por exemplo, um problema de estabilidade ou biodisponibilidade de uma formulação anteriormente conhecida.

No próprio relatório descritivo, é reconhecida a obviedade dos métodos usados na preparação de composições farmacêuticas, que estão bem estabelecidos no estado da técnica. Não há nenhum destaque ou inovação dentre as técnicas descritas nos trechos apresentados nas Figuras 7, 8 e 9.

ativo com o sítio do agente de ação. Eles podem ser administrados por quaisquer meios convencionais disponíveis para o uso em conjunção com produtos farmacêuticos, como agentes terapêuticos individuais ou em uma combinação de agentes terapêuticos. Eles podem ser administrados sozinhos, mas tipicamente são administrados com um carreador farmacêutico selecionado com base na escolha da via de administração e prática farmacêutica padrão. Os compostos da invenção podem ser, por exemplo, administrados oral, parenteralmente (incluindo injeções subcutâneas, intravenosa, intramuscular, injeção intraesternal ou técnicas de infusão), pela pulverização de inalação, ou retalmente, na forma de dosagem única de uma composição farmacêutica que contém uma quantidade eficaz do composto e carreadores farmacêuticamente aceitáveis não tóxicos convencionais, adjuvante e veículos. As preparações líquidas adequadas para administração oral (por exemplo, suspensões, xaropes, elixires e os seus semelhantes) podem

Figura 7: Trecho sobre a falta de atividade inventiva (relatório descritivo da BR112012024691-7, p. 54)

tais como um auxiliar de solubilidade. As soluções injetáveis podem ser preparadas de acordo com os métodos conhecidos na técnica em que o carreador compreende uma solução salina, uma solução de glicose ou uma solução que contém uma mistura de solução salina e glicose. Descrição adicional de métodos adequados para o uso na preparação de composições farmacêuticas para o uso na presente invenção e nos ingredientes adequados para o uso nas ditas composições e fornecida na Remington's Pharmaceutical Sciences, 18ª edição, editado pela A. R. Gennaro, Mack Publishing Co., 1990 and in Remington - The Science and Practice of Pharmacy, 21ª edição, Lippincott Williams & Wilkins, 2005.

Figura 8: Trecho sobre a falta de atividade inventiva (relatório descritivo da BR112012024691-7, p. 55)

[0168] É entendido que o escopo de combinações dos compostos desta invenção com agentes anti-HIV não é limitado aos antivirais contra o HIV listados na Tabela A, mas inclui em princípio qualquer combinação com qualquer composição farmacêutica útil para o tratamento ou profilaxia da AIDS. Os agentes antivirais do HIV e outros agentes tipicamente serão utilizados nestas combinações em suas faixas e regimes de dosagem convencionais como relatado na técnica, incluindo, por exemplo, as dosagens descritas nas edições do Physicians' Desk Reference, tais como a 63ª edição (2009) e edições anteriores. As faixas de dosagem para um composto da invenção nestas combinações podem ser as mesmas como aquelas apresentadas acima.

Figura 9: Trecho sobre a falta de atividade inventiva (relatório descritivo da BR112012024691-7, p. 58-59)

Conclusão: considerando que preparações de composições farmacêuticas geralmente requerem o uso de técnicas e de compostos comumente conhecidos por um

técnico no assunto, como o requerente não fornece qualquer informação sobre uma possível vantagem das composições farmacêuticas reivindicadas sobre o conhecimento geral comum para um técnico no assunto. Dessa forma, **as reivindicações 7 e 11 não apresentam atividade inventiva e estão em desacordo com os artigos 8º e 13 da Lei da Propriedade Industrial.**

VIII.d Reivindicações 7 e 11 (Composição farmacêutica) - Falta de suficiência descritiva

As reivindicações 7 e 11 tratam de composições farmacêuticas, contudo faltam informações sobre o preparo ou os componentes das referidas composições. No relatório descritivo, não há nenhum exemplo de composição farmacêutica, seus excipientes ou modo de preparo.

No próprio relatório descritivo, composições farmacêuticas não são adequadamente descritas, conforme trecho apresentado na Figura 10.

[0160] Como aqui usado, o termo “composição” é intencionado abranger um produto que compreende os ingredientes especificados, assim como qualquer produto que resulte, direta ou indiretamente, da combinação dos ingredientes especificados.

[0161] Os ingredientes adequados para a inclusão em uma composição farmacêutica são ingredientes farmacêuticamente aceitáveis, que significa que os ingredientes devem ser compatíveis um com o outro e não nocivo ao seu receptor.

Figura 10: Trecho sobre a falta de suficiência descritiva (relatório descritivo da BR112012024691-7, p. 53)

Tampouco as reivindicações em si acrescentam informações mais detalhadas sobre a composição farmacêutica, seus excipientes ou modo de preparo.

Conclusão: como não há informações no relatório descritivo ou nas reivindicações sobre a composição farmacêutica que se destina a ser protegida, **as reivindicações 7 e 11 não apresentam suficiência descritiva e estão em desacordo com os artigos 24 e 25 da Lei da Propriedade Industrial.**

VIII.e Reivindicações 8, 12 a 15 (Uso)

Quanto às reivindicações de uso, sabe-se que o parágrafo 3.73, do Bloco I, das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, instituídas pela Resolução nº 124/2013, estabelece que, para fins do exame técnico, uma reivindicação de “uso” deve ser considerada como equivalente a uma reivindicação de “processo”.⁴

Sabe-se, ademais, que o parágrafo 5.40, do Bloco II, das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, instituídas pela Resolução nº 169/2016, prevê que “uma invenção de

⁴ INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL. Resolução nº 124, de 04 de dezembro de 2013. Institui as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente - Conteúdo do Pedido de Patente. [S. I.]. Disponível em: <http://www.inpi.gov.br/menu-servicos/patente/legislacao-patente-1>.

novo uso de um produto conhecido refere-se à invenção que utiliza um produto conhecido para um novo propósito”.⁵

Nesse mesmo sentido, sabe-se também que o capítulo 9, das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente na Área de Química, instituídas pela Resolução/INPI/PR nº 208/2017, de modo a complementar os dispositivos supracitados, dispõe sobre as “particularidades do exame técnico de invenções de novos usos de produtos conhecidos, especialmente novos usos médicos”.⁶

No entanto, não obstante a existência dessas diretrizes, no âmbito deste subsídio, defende-se a inequívoca contradição entre esses dispositivos e a legislação vigente. Afinal, no âmbito do ordenamento jurídico brasileiro, não restam dúvidas quanto à impossibilidade de se conceder patentes de uso, limitando-se o escopo da proteção patentária apenas a produtos e processos.

Este posicionamento se alicerça na previsão do art. 42, da LPI, segundo o qual “a patente confere ao seu titular o direito de impedir terceiro, sem o seu consentimento, de produzir, usar, colocar à venda, vender ou importar com estes propósitos: I - **produto** objeto de patente; II - **processo ou produto** obtido diretamente por processo patenteado” (grifo nosso).⁷

Sendo assim, pelas razões expostas acima, **as reivindicações 8, 12, 13, 14 e 15 não podem ser aceitas e deveriam ser preliminarmente indeferidas.**

De qualquer forma, como se verá adiante, mesmo ao se considerar, substancialmente, o conteúdo de cada uma dessas reivindicações, motivos não faltam para serem completamente indeferidas por esta autarquia.

As reivindicações 8, 12, 13, 14 e 15 referem-se a um composto (ou seu sal) para ser usado na (preparação de um medicamento para) profilaxia ou tratamento de uma infecção pelo HIV, ou para uso em combinação com uma série de medicamentos citados. Essas reivindicações são do tipo “fórmula suíça”, dão a impressão de serem reivindicações de invenção de caráter técnico, que na verdade está ausente.

Essas reivindicações não podem ser protegidas por falta de clareza, estão em desacordo com o artigo 25 da LPI, porque a composição está caracterizada pelo seu uso e não por suas características técnicas, conforme as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente – Aspectos relacionados ao exame de pedidos de patente na área de química (exemplos 2 e 3).

Conclusão: como não há definição do produto por suas características técnicas, **as reivindicações 8, 12, 13, 14 e 15 não apresentam clareza e estão em desacordo com o artigo 25 da Lei da Propriedade Industrial.**

Além disso, os compostos cujo uso foi reivindicado nessas reivindicações não apresentam atividade inventiva sobre os compostos divulgados no estado da técnica (**D1-D4**), conforme detalhadamente tratado na seção VII.a. Um técnico no assunto teria combinado compostos de **D1-D4**, ou conseguiria uma substituição isostérica de anéis

⁵ INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL. Resolução nº 169, de 15 de julho de 2016. Institui as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente - Bloco II - Patenteabilidade. [S. l.]. Disponível em: <http://www.inpi.gov.br/menu-servicos/patente/legislacao-patente-1>.

⁶ INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL. Resolução nº 208, de 27 de dezembro de 2017. Institui as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente na Área de Química. [S. l.]. Disponível em: <http://www.inpi.gov.br/menu-servicos/patente/legislacao-patente-1>.

⁷ BRASIL. Lei nº 9.279, de 14 de maio de 1996. Regula direitos e obrigações relativos à propriedade industrial. Brasília, DF: Presidência da República, 15 maio de 1996. Disponível em: http://www.planalto.gov.br/ccivil_03/Leis/L9279.htm.

aromáticos (detalhado em **D5** e **D6**) nos compostos divulgados em **D1-D3**, para obter os compostos da presente patente. Vale ressaltar que, os compostos divulgados em **D1-D4** apresentaram atividade inibidora da transcriptase reversa do HIV em cepas de tipo selvagem e mutantes (K103N e / ou Y181C, **D1** e **D4**).

As anterioridades **D2-D4** reivindicam o uso dos compostos para preparar um medicamento para tratar ou prevenir a infecção por HIV e doenças relacionadas (reivindicação 24 de **D2**; reivindicação 11 de **D3**; reivindicação 29 de **D4**).

Conclusão: é óbvio para um técnico no assunto que os compostos reivindicados na patente BR112012024691-7 apresentam a mesma atividade inibidora da transcriptase reversa do HIV, dessa forma as reivindicações de “uso” não atendem ao requisito de atividade inventiva, **as reivindicações 8, 12, 13, 14 e 15 não apresentam atividade inventiva e estão em desacordo com os artigos 8º e 13 da Lei da Propriedade Industrial.**

IX. DO PEDIDO

A partir do exposto, a Requerente solicita a declaração de nulidade administrativa da **BR112012024691-7**, baseada nos argumentos técnicos apresentados, que evidenciaram a falta de atividade inventiva e de suficiência descritiva da patente em questão. **A patente BR112012024691-7 infringe os artigos 8º, 13, 24, 25 e 32 da Lei da Propriedade Industrial** nº 9.279 de 14 de maio de 1996 e deve ser declarada nula nos termos do artigo 50 e seguintes da LPI.

A patente **BR112012024691-7**, tal como concedida, fere o princípio da função social da propriedade e o princípio da troca entre o público e o privado, que fundamenta a concessão de uma patente ao conceder o privilégio de exploração temporária sem a necessária contrapartida de disponibilizar um conhecimento adicional para a sociedade.

Nestes termos,
Pede Deferimento.

Rio de Janeiro, 17 de maio de 2021.



Carolinne Thays Scopel
CRF/RJ 20.318



Alan Rossi Silva
OAB/RJ 231.800

LISTA DE DOCUMENTOS ANEXOS:

ANEXO 1: Estatuto Social da ABIA

ANEXO 2: Ata de eleição da Diretoria da ABIA

ANEXO 3: Procuração da ABIA

ANEXO 4: Estatuto Social da FOAESP

ANEXO 5: Ata de eleição da Diretoria da FOAESP

ANEXO 6: Procuração da FOAESP

ANEXO 7: Estatuto Social do Fórum ONG Aids RS

ANEXO 8: Ata de eleição da Diretoria do Fórum ONG Aids RS

ANEXO 9: Procuração do Fórum ONG Aids RS

ANEXO 10: Estatuto Social da UAEM

ANEXO 11: Ata de eleição da Diretoria da UAEM

ANEXO 12: Procuração da UAEM

ANEXO 13: Estatuto Social do GIV

ANEXO 14: Ata de eleição da Diretoria do GIV

ANEXO 15: Procuração do GIV

ANEXO 16: Estatuto Social do Grupo Solidariedade é vida

ANEXO 17: Ata de eleição da Diretoria do Grupo Solidariedade é vida

ANEXO 18: Procuração do Grupo Solidariedade é vida

ANEXO 19: Sweeney, ZK et al. Discovery of triazolinone non-nucleoside inhibitors of HIV reverse transcriptase. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 18: 4348-4351, 2008. **(D1)**

ANEXO 20: WO2004085411 (US20040192704). Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors for treating HIV mediated diseases. Data de publicação: 07/10/2004. **(D2)**

ANEXO 21: WO2004074257. Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. Data de publicação: 02/09/2004. **(D3)**

ANEXO 22: WO2009067166. Non-nucleoside reverse transcriptase inhibitors. Data de publicação: 28/05/2009. **(D4)**

ANEXO 23: Wermuth CG. (Ed.). *The practice of medicinal chemistry*. Academic Press, 2003. **(D5)**

ANEXO 24: Wipf P; Henninger TC; Geib SJ. Methyl-and (trifluoromethyl) alkene peptide isosteres: synthesis and evaluation of their potential as β -turn promoters and peptide mimetics. *The Journal of organic chemistry*, 63(18), 6088-6089, 1998. **(D6)**