

COMUNICADO

Consulta Pública Sobre as Diretrizes de Exame dos Pedidos de Patente na Área Química

By Tatiana Almeida Silveira | tatiana.almeida@kasznarleonardos.com

Março de 2017

INPI iniciou consulta pública sobre as suas Diretrizes de Exame de pedidos de Patente, com particularidades associadas ao exame da área química.

A notícia foi publicada no website do INPI na sexta-feira (17/3), onde pode ser encontrada a minuta das diretrizes (em anexo).

Interessados terão até 16 de maio de 2017 para enviar suas sugestões, que devem ser endereçadas eletronicamente ao e-mail saesp@inpi.gov.br.

Após o fim deste prazo, o INPI apresentará as propostas recebidas durante a consulta pública e o texto definitivo das diretrizes.

Havendo interesse em mais informações, favor contatar-nos pelo e-mail: mail@kasznarleonardos.com.

Kasznar ¹⁹¹⁹
Leonardos
PROPRIEDADE
INTELECTUAL



**MINISTÉRIO DA INDÚSTRIA, COMÉRCIO EXTERIOR E SERVIÇOS
INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL**

DIRETRIZES DE EXAME DE PEDIDOS DE PATENTE

**ASPECTOS RELACIONADOS AO EXAME DE PEDIDOS DE PATENTE
NA ÁREA DE QUÍMICA**

**DIRETORIA DE PATENTES, PROGRAMAS DE COMPUTADOR E TOPOGRAFIAS DE
CIRCUITOS INTEGRADOS**

DIRPA – 2017

Sumário

1. INTRODUÇÃO.....	4
2. COMPOSTO QUÍMICO.....	4
2.1 NOVIDADE E ATIVIDADE INVENTIVA.....	4
2.2 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES.....	4
2.3 COMPOSTOS DEFINIDOS POR FÓRMULAS TIPO MARKUSH.....	5
2.4 SAIS, ÉSTERES E ÉTERES.....	6
2.5 PRÓ-FÁRMACOS.....	7
2.6 COMPOSTOS INTERMEDIÁRIOS DE REAÇÃO.....	8
2.6.1 Compostos intermediários como invenção principal.....	8
2.6.2 Compostos intermediários como invenção acessória.....	9
2.6.3 Processo de obtenção de compostos intermediários.....	9
2.7 COMPOSTOS QUÍMICOS ENCONTRADOS NA NATUREZA.....	10
2.8 PEDIDOS DE PATENTE DE SELEÇÃO DE COMPOSTOS QUÍMICOS.....	10
3 ESTEREOISÔMEROS.....	13
3.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA	14
3.2 CLAREZA.....	14
3.3 NOVIDADE.....	15
3.4 ATIVIDADE INVENTIVA	16
4 POLIMORFOS.....	16
4.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA	17
4.2 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES.....	18
4.3 NOVIDADE.....	18
4.4 ATIVIDADE INVENTIVA	19
5 SOLVATOS, CLATRATOS, CO-CRISTAIS.....	19
6 COMPOSIÇÕES, FORMULAÇÕES E FORMAS FÍSICAS DE COMPOSIÇÕES.....	20
6.1 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES	21
7. COMBINAÇÕES DE COMPOSTOS QUÍMICOS.....	26
7.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA, CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES.....	26
7.1.1 Combinação que compreende compostos definidos por “fórmula Markush”.....	26
7.1.2 Combinações que compreendem uma ou mais classes de compostos químicos.....	27
7.1.3 Combinações que compreendem, opcionalmente, outros ingredientes ativos.....	27
7.1.4 Combinação em que os compostos estão em formas separadas.....	28
8 PROCESSOS ANÁLOGOS.....	29

9 NOVOS USOS DE PRODUTOS CONHECIDOS.....	30
9.1 NOVO USO MÉDICO.....	30
9.1.1 Novidade.....	30
9.1.2. Atividade inventiva.....	31
9.1.3. Suficiência descritiva.....	31
9.1.4 Fundamentação, clareza e precisão das reivindicações.....	32

1. INTRODUÇÃO

Estas Diretrizes abordam particularidades do exame de pedidos de patente da área da Química, complementando os aspectos gerais sobre patenteabilidade e formalidades encontrados nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente do INPI, Bloco I (Resolução INPI/PR N° 124/2013 – RPI 2241, de 17/12/2013) e Bloco II (Resolução INPI/PR N° 169/2016 – RPI 2377, de 26/07/2016). Por se tratar de uma complementação das Diretrizes do INPI, deverão ser obrigatoriamente lidas em conjunto às referidas Diretrizes. Buscando auxiliar a compreensão do texto, os capítulos e parágrafos dos Blocos I e II são identificados ao longo de todo o documento.

2. COMPOSTO QUÍMICO

2.1 NOVIDADE E ATIVIDADE INVENTIVA

O exame técnico dos requisitos de patenteabilidade de pedidos de patente que reivindicam compostos químicos seguem os mesmos procedimentos aplicáveis a produtos em geral e encontram-se detalhados no Bloco II das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente. Cabe somente lembrar que, em pedidos de patente de composto, nos quais são reivindicadas também a composição, formulação e/ou forma física, considera-se que a novidade e a atividade inventiva do composto será carregada para a composição (parágrafo 7.6 do Bloco II das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente), formulação e/ou forma física (invenções acessórias).

2.2 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES

A forma mais precisa de se reivindicar um composto químico é aquela que o define em termos de sua estrutura química (fórmula geral), nomenclatura (conforme regras IUPAC) ou outra denominação que o defina de forma inequívoca. Somente nos casos em que não puder ser definido como anteriormente descrito, o composto poderá ser caracterizado pelo seu processo de obtenção, tal como determinado nos parágrafos 3.60 e 3.61 do Bloco I e no parágrafo 4.17 do Bloco II das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, desde que atenda aos requisitos de patenteabilidade.

Reivindicações que definem o composto pelo seu processo de obtenção só são possíveis em casos extremos, em que não é possível defini-lo de outra forma e em que o processo em si seja suficientemente preciso de forma a evitar ambiguidades quanto ao que se está protegendo. Isto porque, na medida em que o produto resultante do processo inclui, por exemplo, os respectivos subprodutos, tais reivindicações tendem a não ser claras quanto à matéria que protegem.

Neste contexto, reivindicações independentes que definem o composto somente por suas propriedades físicas, físico-químicas ou biológicas não são aceitas, pois tais características, por si só, não identificam o composto em questão, comprometendo a clareza e precisão da matéria pleiteada, contrariando o art. 25 da Lei 9.279/96 (Lei da Propriedade Industrial, LPI).

Do mesmo modo, reivindicações independentes que definem um composto por sua aplicação ou uso, como, por exemplo, “Composto caracterizado por ser usado para X” ou “Composto Y caracterizado por ser usado para X” **não** são aceitas, na medida em que representam uma indefinição quanto à matéria a ser protegida, contrariando o art. 25 da LPI (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 4.16).

A clareza de uma reivindicação de composto químico também pode ser comprometida pelo uso de expressões genéricas, frequentemente empregadas no intuito de ampliar o escopo de proteção para englobar os derivados do composto. Este é o caso de reivindicações de composto químico que pleiteiam, além dos compostos *per se*, seus estereoisômeros, hidratos, solvatos, pró-fármacos, éteres e ésteres ou outros derivados. Estas expressões, por si só, não identificam os derivados do composto de forma clara e precisa, visto que somente definem os derivados por meio de sua classe química ou função. Caso o relatório do pedido de patente descreva de forma suficiente estes objetos, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de modo a melhor definir a matéria reivindicada.

Por outro lado, reivindicações de composto que contenham expressões genéricas, tais como “sais farmacologicamente aceitáveis”, “sais agricolamente aceitáveis”, “sais imunologicamente aceitáveis” podem ser aceitas, uma vez que: 1) o composto é o responsável pela atividade, sendo o sal um agente de liberação da fração ativa do composto e; 2) o técnico no assunto tem conhecimento dos sais corriqueiramente empregados na sua área de atuação.

2.3 COMPOSTOS DEFINIDOS POR FÓRMULAS TIPO MARKUSH

As reivindicações de compostos definidos por fórmula do tipo Markush são examinadas conforme as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafos 3.38 e 3.126 a 3.128 e Bloco II, parágrafos 6.1 a 6.14.

2.4 SAIS, ÉSTERES E ÉTERES

Sais, ésteres e éteres de compostos químicos conhecidos do estado da técnica são usualmente empregados para prover ao composto propriedades que possibilitem condições mais apropriadas à sua aplicação industrial.

A análise técnica de pedidos de patente que reivindicam sais, ésteres e éteres segue as mesmas diretrizes aplicadas a compostos químicos em geral. Para ser considerado novo, o sal/éster/éter pleiteado não pode ter sido antecipado no estado da técnica. Quando o estado da técnica antecipar de forma genérica sais/ésteres/éteres de compostos conhecidos, o sal/éster/éter pleiteado não pode ter sido especificamente revelado (Ver Item 2.6 destas Diretrizes e Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafos 4.16 a 4.25 e 5.31 a 5.34). Por exemplo, o pedido de patente pleiteia proteção para o sal mesilato do composto A. O documento do estado da técnica revela o composto A e seus sais, listando como sais preferenciais mesilato, fumarato e cloridrato. Neste caso, o sal de mesilato do composto A reivindicado é considerado especificamente revelado no estado da técnica e, portanto, não apresenta novidade. Por outro lado, se o pedido de patente pleitear o sal succinato do composto A, o dito sal será considerado novo, uma vez que não foi especificamente citado dentre os preferenciais do documento do estado da técnica.

Na possibilidade de um determinado sal, éster ou éter alterar as propriedades do composto base de maneira não óbvia para um técnico no assunto, este sal, éster ou éter será considerado dotado de atividade inventiva.

Cabe ressaltar que um técnico no assunto tem conhecimento de que as características físico-químicas de um composto químico podem ser alteradas pela modificação de seu contra-íon, como por exemplo: solubilidade, dissolução, estabilidade e propriedades organolépticas. Assim, a mera descrição de um sal/éster/éter alternativo de um composto conhecido, quando desassociada de uma propriedade não óbvia ou de um efeito técnico inesperado frente ao estado da técnica, não apresenta atividade inventiva.

Normalmente, o processo de obtenção de um sal, éter ou éster envolve a combinação de procedimentos conhecidos e clássicos do estado da técnica, uma vez que todas as reações de obtenção destas classes de compostos estão descritas na literatura e, por isso, decorrem de maneira óbvia para um técnico no assunto.

Entretanto, caso o sal, éter ou éster seja considerado patenteável, os processos para sua obtenção podem ser analisados como processos análogos (Item 8 destas Diretrizes) e, em consequência, serão também dotados dos requisitos de patenteabilidade.

Ressalta-se que o uso das expressões genéricas “seus éteres” e/ou “seus ésteres” em reivindicações referentes a um composto *per se*, não identificam os derivados éteres e ésteres do composto de forma clara e precisa, visto que somente definem os derivados por meio de sua classe química ou função. Caso o relatório do pedido de patente descreva de forma suficiente estes objetos, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de modo a melhor definir a matéria reivindicada.

Por outro lado, reivindicações de composto que contenham expressões genéricas, tais como “sais farmacologicamente aceitáveis”, “sais agricolamente aceitáveis”, “sais imunologicamente aceitáveis” podem ser aceitas, uma vez que: 1) o composto é o responsável pela atividade, sendo o sal um agente de liberação da fração ativa do composto e; 2) o técnico no assunto tem conhecimento dos sais corriqueiramente empregados na sua área de atuação.

2.5 PRÓ-FÁRMACOS

Os compostos químicos podem funcionar como pró-fármacos, isto é, compostos que necessitam de biotransformação prévia para exibir seus efeitos farmacológicos. Também podem ser considerados compostos inativos (ou substancialmente menos ativos que o fármaco), os quais, após administração, sofrem biotransformação dando origem a compostos farmacologicamente ativos.

Os pró-fármacos são geralmente desenvolvidos a partir da obtenção de derivados de certos grupos funcionais de um determinado composto, visando otimizar as propriedades físico-químicas, biofarmacêuticas ou farmacocinéticas dos compostos farmacologicamente ativos, superando eventuais barreiras relativas a formulação e liberação de fármacos, tais como baixa solubilidade em água, instabilidade química, absorção oral insuficiente, metabolismo pré-sistêmico, penetração inadequada no sistema nervoso central, toxicidade e irritação local.

A análise técnica desta matéria segue as mesmas diretrizes aplicadas a compostos químicos em geral. Especialmente quanto à análise do requisito atividade inventiva, é importante notar que, em certos casos, uma estratégia conhecida para melhorar as propriedades farmacológicas ou farmacotécnicas de fármacos pode levar a um efeito que não decorreria de forma evidente para um técnico no assunto.

Ressalta-se que o uso da expressão genérica “seus pró-fármacos” em reivindicações referentes a um composto *per se*, não identifica os pró-fármacos do composto de forma clara e precisa. Caso o relatório do pedido de patente descreva de forma suficiente estes objetos, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de modo a melhor definir a matéria reivindicada.

2.6 COMPOSTOS INTERMEDIÁRIOS DE REAÇÃO

Intermediários, no sentido restrito, são compostos químicos (ou grupos de compostos químicos) que são utilizados na rota de produção de um outro composto químico (ou grupo de compostos químicos), através de alteração(ões) química(s) e/ou física(s), perdendo sua identidade. Por questão de simplificação, a referência a “composto químico” irá englobar “grupo de compostos químicos”. No contexto destas Diretrizes, intermediários podem ser compostos intermediários *per se* ou produtos de partida (precursores).

Evidentemente, podem existir compostos químicos que, além de funcionarem como precursores (intermediários) de um determinado composto químico, também apresentam aplicações finais, tais como pesticidas, fármacos, etc. No entanto, neste caso, isto é, quando estiverem em sua função como fármacos, etc., não serão mais “intermediários” no sentido desta diretrizes e deverão ser analisados segundo o item anterior.

Tendo em mente as explicações acima, podem ocorrer duas situações:

- (1) o intermediário é a invenção principal;
- (2) o intermediário é o que se convencionou chamar de “invenção acessória”, na qual a invenção principal pode ser um composto químico final ou um processo de obtenção de um composto químico.

Nos casos em que o composto intermediário não for a invenção principal, deverá ser avaliado se o intermediário e seu processo de obtenção pertencem ao mesmo conceito inventivo da invenção principal, que é um composto (produto final) e/ou seu processo de obtenção. Aqui, cabem as orientações contidas nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente Bloco I – itens 3.119 a 3.125.

Observe-se que, em ambos os casos, as reivindicações relativas ao(s) intermediário(s) são, necessariamente, reivindicações de **produto** e devem ser tratadas como tal, aplicando-se as orientações mais adequadas estabelecidas nestas Diretrizes. Também, em ambos os casos, são aceitas reivindicações voltadas para o processo de obtenção do(s) intermediário(s).

2.6.1 Compostos intermediários como invenção principal

As reivindicações relativas ao(s) intermediário(s) são, necessariamente, reivindicações de composto químico e a análise técnica desta matéria segue as mesmas diretrizes aplicadas a compostos químicos em geral.

A atividade inventiva de um intermediário deve ser julgada em função de sua aplicação, enquanto intermediário, e de suas diferenças em relação aos compostos do estado da técnica.

Assim, se o estado da técnica mais próximo revela compostos semelhantes ao intermediário reivindicado, mas não sugere sua aplicação na obtenção de outros compostos, isto é, sua aplicação como intermediários, entende-se que não seria óbvio ou evidente para um técnico no assunto utilizar compostos semelhantes aos do estado da técnica como intermediários de síntese.

No caso em que os compostos do estado da técnica mais próximo apresentem função de intermediários, devem ser observadas as diferenças entre o composto (intermediário) reivindicado e aqueles do estado da técnica, de modo a se avaliar quanto a obviedade ou não destas diferenças, considerando-se a função de intermediário do composto reivindicado.

2.6.2 Compostos intermediários como invenção acessória

Quando o intermediário é uma invenção acessória em um pedido de patente relativo a um outro composto como invenção principal, não é possível extrapolar a novidade e a atividade inventiva da invenção principal para o intermediário, uma vez que os efeitos/atividades/finalidades da invenção principal e do intermediário são diferentes.

Nos casos em que o composto intermediário não for a invenção principal, deverá ser avaliado se o intermediário e seu processo de obtenção pertencem ao mesmo conceito inventivo da invenção principal, que é um composto (produto final) e/ou seu processo de obtenção. Aqui, cabem as orientações contidas nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente Bloco I – itens 3.119 a 3.125.

2.6.3 Processo de obtenção de compostos intermediários

Um processo de obtenção de intermediário pode constituir a invenção principal do pedido de patente, mas o mais comum é que seja uma invenção acessória para uma invenção principal de composto final ou mesmo de um intermediário.

No primeiro caso, no qual o processo de obtenção do intermediário é a invenção, as reivindicações de processo de obtenção de intermediário deverão definir:

- (1) o material de partida, o produto obtido e o meio de se transformar o primeiro no segundo e;
- (2) as diversas etapas necessárias a se atingir o objetivo proposto.

2.7 COMPOSTOS QUÍMICOS ENCONTRADOS NA NATUREZA

Compostos químicos encontrados na natureza não são considerados invenção, de acordo com o disposto no art. 10 (IX) da LPI.

Os compostos químicos obtidos sinteticamente que possuam correspondentes de ocorrência natural, não havendo como distingui-los dos compostos encontrados na natureza, também não são considerados invenção. Este aspecto foi abordado com maior detalhe nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 1.43, e nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente na Área de Biotecnologia, item 4.2.1.1.

2.8 PEDIDOS DE PATENTE DE SELEÇÃO DE COMPOSTOS QUÍMICOS

Alguns pedidos de patente podem tratar de uma seleção de compostos de uma classe ampla de compostos descritos no estado da técnica, como por exemplo, compostos descritos por fórmulas genéricas do tipo Markush. Usualmente, o documento anterior refere-se a uma nova classe de compostos químicos.

Os procedimentos de exame técnico dos pedidos de patente de seleção de compostos químicos encontram-se detalhados no Bloco II das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, parágrafos 4.19 a 4.25 e 5.31 a 5.34.

Em linhas gerais, para ser considerado novo, o composto químico selecionado não pode ter sido especificamente revelado no estado da técnica na forma de exemplos, testes, resultados, listas, tabelas, nomenclatura, fórmula estrutural individualizada ou método de preparação. Além disso, a seleção do dito composto não pode decorrer de maneira óbvia ou evidente para um técnico no assunto a partir dos ensinamentos do estado da técnica. Invariavelmente, por se tratar de uma seleção de compostos já descritos de forma genérica em um documento anterior, a avaliação do requisito de atividade inventiva do pedido de patente de seleção de compostos envolve a apresentação de dados comparativos em relação ao estado da técnica. Conforme definido no Bloco II das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, parágrafos 4.19 e 5.32, a comparação deve ser realizada em relação ao estado da técnica mais próximo, que, neste caso, corresponde ao(s) composto(s) de maior similaridade estrutural especificamente revelado(s) no estado da técnica.

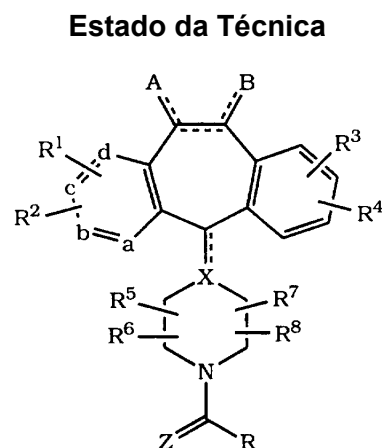
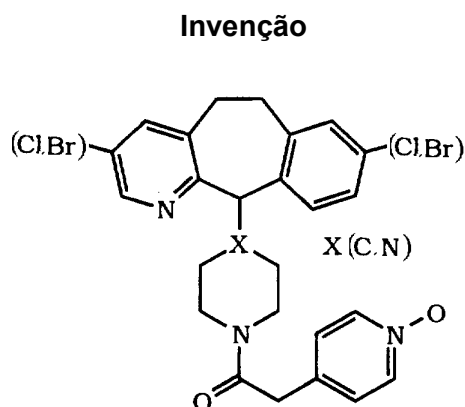
A seguir, são apresentados alguns exemplos que ilustram três situações que podem ocorrer no exame técnico de pedidos de patente de seleção de compostos químicos: 1) Compostos selecionados desprovidos de novidade e atividade inventiva; 2) Compostos selecionados novos, porém desprovidos de atividade inventiva e; 3) Composto selecionado novo e inventivo.

Exemplo 1: Compostos desprovidos de novidade e de atividade inventiva Invenção

Compostos de amida tricíclica úteis no tratamento de doenças proliferativas.

Estado da técnica

O documento do estado da técnica revela compostos de amida ou ureia tricíclicas utilizados também no tratamento de doenças proliferativas.



Análise técnica

Os compostos químicos selecionados representam um grupo restrito dentre os compostos revelados de forma genérica na fórmula Markush do documento do estado da técnica. Esses compostos selecionados no pedido em análise não correspondem aos compostos exemplificados no documento do estado da técnica; entretanto, foram previstos dentre os compostos ditos preferenciais no referido documento. Dessa forma, os compostos pleiteados são considerados como especificamente revelados no estado da técnica (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafos 4.21 a 4.23) e não preenchem o requisito de novidade.

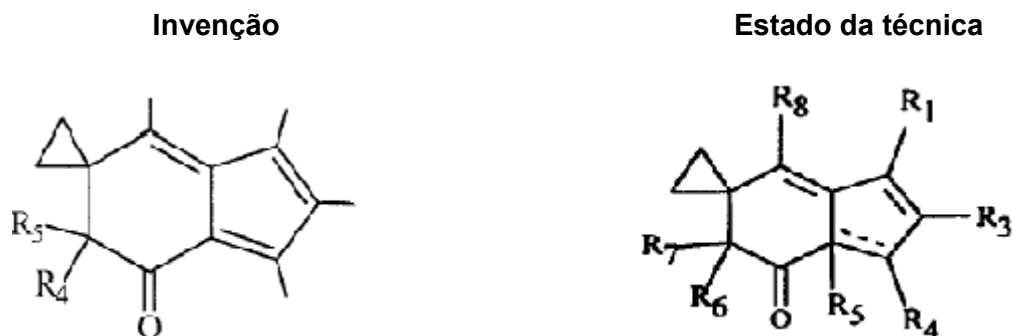
Com o intuito de demonstrar a atividade inventiva, o requerente apresentou uma série de testes biológicos comparando os compostos selecionados com os compostos de maior similaridade estrutural especificamente revelados no estado da técnica. Entretanto, tendo em vista que os compostos pleiteados não são novos, também não atendem ao requisito de atividade inventiva.

Exemplo 2: Compostos novos, desprovidos de atividade inventiva Invenção

O pedido de patente refere-se a compostos análogos de iludinas com atividade antiproliferativa para o tratamento de tumores em mamíferos.

Estado da técnica

O estado da técnica descreve de forma genérica, na fórmula Markush, substâncias análogas de iludina úteis como agentes antiproliferativos.



Análise técnica

Os compostos selecionados representam um grupo restrito dentre os compostos revelados de forma genérica no documento da técnica, mas como não foram especificamente revelados dentre os compostos exemplificados, tampouco dentre possíveis compostos tidos como preferenciais, são considerados novos (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafos 4.21 a 4.23).

O requerente apresentou resultados de testes comparando a atividade antiproliferativa entre os compostos pleiteados e os compostos de maior similaridade estrutural especificamente revelados no estado da técnica. Os resultados apresentados não demonstraram efeito não óbvio em relação ao estado da técnica, pois a atividade antiproliferativa dos compostos pleiteados foi muito semelhante à dos compostos revelados no estado da técnica (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 5.33). Dessa forma, embora os compostos pleiteados sejam considerados novos, não atendem ao requisito de atividade inventiva.

Exemplo 3: Compostos providos de novidade e de atividade inventiva

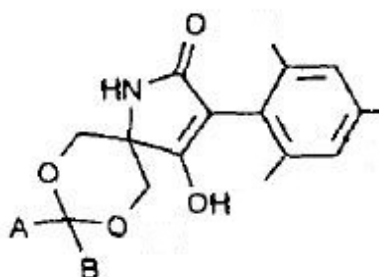
Invenção

O pedido de patente refere-se a cetoenóis cíclicos substituídos por fenila, processos para a sua preparação e seu emprego em composições praguicidas e herbicidas.

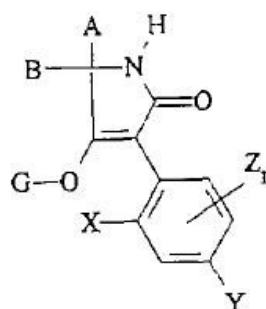
Estado da Técnica

O estado da técnica apresenta uma descrição genérica de cetoenóis cíclicos com atividade pesticida e herbicida que englobam os compostos selecionados no pedido de patente em análise.

Invenção



Estado da técnica



Análise Técnica

Os compostos pleiteados no pedido de patente de seleção foram considerados novos, pois, embora sejam derivados químicos previstos de forma genérica na fórmula Markush no documento do estado da técnica, não foram especificamente revelados (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafos 4.21 a 4.23).

Para comprovação da atividade inventiva da matéria foram apresentados dados de testes que demonstram claramente o efeito técnico não óbvio dos compostos reivindicados comparativamente aos compostos de maior similaridade estrutural especificamente revelados no estado da técnica. Desta forma, os compostos selecionados foram considerados não óbvios para um técnico no assunto (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 5.34).

3 ESTEREOISÔMEROS

Isômeros são compostos que possuem fórmulas moleculares idênticas, mas diferem na natureza, na sequência da ligação ou no arranjo espacial de seus átomos. Enantiômeros, atropoisômeros e diastereoisômeros, que serão abaixo definidos, são integrantes da classe de isômeros que possuem a mesma fórmula molecular, mas diferem na posição geométrica e/ou espacial de seus átomos.

Os enantiômeros são moléculas que apresentam centro quiral ou ausência de simetria, sendo que tais moléculas são imagens especulares não sobreponíveis uma da outra. Compostos diastereoisômeros são estereoisômeros que não são imagens especulares um do outro e possuem

diferentes propriedades físico-químicas.

Atropoisômero é uma subclasse de isômeros conformacionais, o qual pode ser isolado como espécie química pura e que surge de uma rotação restrita de uma ligação simples (geralmente devido a substituintes muito volumosos).

Mistura estereoisomérica é uma mistura de estereoisômeros, em qualquer proporção.

Mistura racêmica é uma mistura de estereoisômeros equimolar.

3.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA

A descrição clara e suficiente do estereoisômero na forma pura reside na caracterização da configuração absoluta de seu centro quiral no ato do depósito do pedido de patente.

Técnicas analíticas, tais como dicroísmo circular, ressonância magnética nuclear (com adição de reagente de deslocamento quiral), birrefringência circular, dispersão rotatória óptica, cromatografia (com coluna quiral), polarimetria e difratometria de raios X de monocristal podem ser utilizadas para a caracterização do enantiômero/atropoisômero/diastereoisômero pleiteado.

Os parâmetros do processo de obtenção do estereoisômero, seja por síntese assimétrica ou pelo processo de purificação posterior à síntese do composto, devem ser especificados no relatório descritivo, de modo a garantir sua reprodutibilidade por um técnico no assunto. Devido à possibilidade de racemização dos compostos quirais durante o processo de obtenção, é importante que o relatório descritivo revele os reagentes utilizados (principalmente na etapa de formação do centro quiral), as condições reacionais, os métodos de isolamento e de purificação do estereoisômero obtido pelo referido processo. O relatório deve ainda descrever o eventual excesso enantiomérico obtido e o método de análise empregado para sua aferição.

3.2 CLAREZA

Os estereoisômeros devem ser definidos através da nomenclatura oficial (IUPAC) ou outro sistema que os identifiquem de forma inequívoca.

Ressalta-se que o uso da expressão genérica “seus estereoisômeros” em reivindicações referentes a um composto *per se*, não identifica os estereoisômeros do composto de forma clara e precisa. Caso o relatório do pedido de patente descreva de forma suficiente estes objetos, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de modo a melhor definir a matéria reivindicada.

3.3 NOVIDADE

Os compostos estereoisômeros serão considerados novos caso o estado da técnica não descreva o enantiômero/atropoisômero/diastereoisômero reivindicado. Também será atribuída a novidade nos casos em que tenham sido descritos no estado da técnica enantiômero/atropoisômero/diastereoisômero isolados da natureza e que seja agora reivindicado o antípoda destes.

Entretanto, uma vez que no estado da técnica já tenha sido revelado o composto na forma racêmica, os compostos enantioméricos ou atropoisoméricos puros, em si, não são considerados novos, visto que a mistura estereoisomérica já possui ambos os estereoisômeros. Ressalta-se que, quando o estado da técnica não especificar a configuração absoluta dos centros quirais dos compostos descritos, será considerado que a distribuição dos enantiômeros ocorre de forma equitativa, ou seja, trata-se de uma mistura racêmica.

No caso de pedidos de patente que tratam de diastereoisômeros, a novidade será comprovada quando o estado da técnica não descrever especificamente o diastereoisômero pleiteado. Em alguns casos, a aferição da novidade do diastereoisômero pleiteado somente torna-se possível por meio da apresentação de dados de caracterização do composto conhecido para que se possa traçar uma comparação entre o diastereoisômero pleiteado e o estado da técnica. Neste caso, as mesmas técnicas analíticas empregadas para a caracterização do diastereoisômero pleiteado devem ser aplicadas a amostras do estereoisômero revelado no estado da técnica.

A composição contendo somente um dos estereoisômeros é considerada nova ainda que o estado da técnica descreva uma composição contendo o composto na forma de uma mistura racêmica ou outra mistura estereoisomérica. Neste caso, a redação da reivindicação de composição deve, necessariamente, excluir a possibilidade da proteção também recair sobre a composição racêmica ou outra composição contendo estereoisômeros já descrita no estado da técnica. Particularmente, o emprego do termo **consiste**, por ser considerado um termo restritivo, limita os constituintes de uma composição somente àqueles definidos na reivindicação (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafo 3.48). Por exemplo, uma reivindicação do tipo “*Composição caracterizada por **consistir** do enantiômero R do composto X e veículos*” exclui a presença de qualquer outro estereoisômero diferente daquele definido na composição pleiteada. Por outro lado, o emprego do termo **compreende** torna o escopo de proteção de reivindicações de composição mais amplo, comprometendo a novidade. Por exemplo, a redação de uma reivindicação do tipo “*Composição caracterizada por **compreender** o enantiômero R do composto X e veículos*” não limita os constituintes apenas aos elementos definidos na composição reivindicada, podendo englobar, além do estereoisômero R, outros constituintes, inclusive o estereoisômero S (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafo 3.49).

Uma composição que consista de uma mistura estereoisomérica de constituição definida (excesso estereoisomérico determinado) será considerada nova, desde que esta não tenha sido previamente revelada no estado da técnica

O uso de um enantiômero/atropoisômero isolado não é novo se o estado da técnica já revela o uso da sua mistura racêmica para tal finalidade. O mesmo é considerado para os pedidos que tratam de diatropoisômeros de um composto, quando o estado da técnica antecipa o uso pleiteado para o dito composto.

Caso o pedido trate de um novo uso de um composto estereoisômero isolado, o exame deve ser baseado nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafos 3.73 a 3.76 e Bloco II, parágrafo 4.18 e nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente – Química, item sobre Novos Usos de Produtos Conhecidos.

3.4 ATIVIDADE INVENTIVA

Quando as propriedades do composto do estado da técnica são conhecidas, há uma expectativa de que o estereoisômero puro deste composto apresente estas mesmas propriedades. Assim, considera-se que há uma indicação no estado da técnica que motivaria um técnico no assunto a obter este estereoisômero com o objetivo de identificar a forma mais adequada à utilização industrial, como por exemplo, a forma estereoisomérica mais ativa ou menos tóxica do composto. O mesmo posicionamento deve ser assumido para análise de atividade inventiva de composições contendo estereoisômeros.

Caso o pedido trate de um novo uso de um composto estereoisômero isolado, o exame deve ser baseado nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafos 3.73 a 3.76, e Bloco II, parágrafos 5.40 a 5.45 e nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente – Química, item sobre Novos Usos de Produtos Conhecidos.

4 POLIMORFOS

Polimorfismo refere-se à habilidade de um composto químico existir em uma ou mais fases cristalinas que possuem diferentes arranjos e/ou conformação das moléculas em uma rede cristalina ordenada. Sólidos amorfos consistem de sólidos com arranjos desordenados das moléculas e não possuem uma rede cristalina definida.

4.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA

Para a caracterização da forma cristalina, o relatório descritivo deve conter, na data de depósito do pedido, os dados de identificação obtidos por técnicas de caracterização físico-química de sólidos, tais como as exemplificadas a seguir ou por técnicas alternativas validadas que melhor o identifique:

- a. Difração de Raios X de Cristal Único (DRX de Monocristal);
- b. Difração de Raios X pelo Método de Pó (DRX pelo Método de Pó);
- c. Espectroscopia de Ressonância Magnética Nuclear de Carbono-13 no Estado Sólido (RMN de ^{13}C);
- d. Espectrometria na Região do Infravermelho;
- e. Espectroscopia Raman;
- f. Microscopia Eletrônica (*hot stage*);
- g. Análise Térmica: Calorimetria Diferencial Exploratória (DSC), Termogravimetria (ATG) e Análise Térmica Diferencial (ATD).

Cabe destacar que a técnica de DRX de cristal único é suficiente para a perfeita caracterização da estrutura cristalina do sólido. Não sendo fornecidos os dados de DRX de cristal único, deve-se utilizar a técnica de DRX pelo método do pó com indexação, associada a outros métodos de identificação físico-química de sólidos, desde que o conjunto de técnicas seja suficiente para a inequívoca identificação da forma cristalina.

Os parâmetros do processo de obtenção da forma cristalina devem ser especificados no relatório descritivo, de modo a garantir sua reprodutibilidade por um técnico no assunto. Consideram-se parâmetros essenciais nestes processos, por exemplo, a indicação do(s) solvente(s) e sua(s) concentração(ões), taxas de adição de solvente(s), taxas de aquecimento e resfriamento, descrição do processo de obtenção de eventuais sementes empregadas no processo de cristalização e demais parâmetros que possam ser considerados críticos.

Cabe notar que a forma cristalina pleiteada é considerada parte do processo de preparação, ou seja, para que se possa considerar que o processo está suficientemente descrito de modo a permitir a sua reprodução por um técnico no assunto, o polimorfo obtido por tal processo deve estar devidamente caracterizado no relatório descritivo.

4.2 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES

A identificação de uma forma cristalina é feita por meio de parâmetros físico-químicos que definam a sua estrutura. A simples denominação por designações como, por exemplo, forma alfa ou beta, forma I ou II, não define de maneira clara e precisa a forma cristalina. A seguir, são apresentados exemplos de reivindicações de formas cristalinas com redação clara e precisa.

Exemplo 1:

Forma cristalina do composto X caracterizada por possuir ponto de fusão de 151°C, medido por calorimetria diferencial exploratória (DSC 2K min⁻¹);

apresentar reflexões (2-teta) a 7,5, 10,1, 12,0, 12,4, 13,7, 15,0, 16,0, 17,3, 17,7, 18,0, 19,2, 19,8, 20,7, 21,0, 22,2, 22,7, 22,9, 23,6, 24,1, 25,6 e 30,5, com as respectivas intensidades relativas 11,4, 63,0, 19,0, 21,0, 7,6, 15,2, 9,5, 7,6, 5,7, 14,3, 5,7, 23,0, 11,4, 11,4, 61,0, 100,0, 13,3, 7,6, 28,6, 9,5 e 7,6, em seu difratograma de raios X;

apresentar picos máximos a 3338, 1708 e 1431 cm⁻¹ em seu espectro de infravermelho, apresentar picos máximos a 107,9, 118,2 e 135,0 ppm em seu espectro de RMN de estado sólido ¹³C, e apresentar picos máximos a 3080, 1580 e 122 cm⁻¹ em seu espectro Raman.

Exemplo 2:

Forma cristalina do composto X caracterizada por apresentar reflexões (2-teta) a 7,5, 10,1, 12,0, 12,4, 13,7, 15,0, 16,0, 17,3, 17,7, 18,0, 19,2, 19,8, 20,7, 21,0, 22,2, 22,7, 22,9, 23,6, 24,1, 25,6 e 30,5, com as respectivas intensidades relativas 11,4, 63,0, 19,0, 21,0, 7,6, 15,2, 9,5, 7,6, 5,7, 14,3, 5,7, 23,0, 11,4, 11,4, 61,0, 100,0, 13,3, 7,6, 28,6, 9,5 e 7,6, em seu difratograma de raios X de monocristal.

4.3 NOVIDADE

As características distintivas das formas cristalinas são baseadas nos parâmetros físico-químicos e, em geral, o estado da técnica mais próximo é aquele que revela a obtenção do composto que, em sua grande maioria, não está caracterizado quanto à sua estrutura cristalina. Nestes casos, dados de caracterização físico-química do composto sólido descrito no estado da técnica deverão ser apresentados para que se possa fazer a comparação com a forma cristalina pleiteada.

Se o estado da técnica já revela a forma cristalina reivindicada, ainda que em mistura com outras formas, independentemente de sua concentração, a forma cristalina pleiteada não é

considerada nova.

No caso do estado da técnica descrever o composto em um estado não sólido (por exemplo, líquido, pastoso ou oleoso), os dados de caracterização físico-química do composto do estado da técnica são dispensáveis, uma vez que, nestas circunstâncias, não há dúvidas quanto à novidade do polimorfo pleiteado.

4.4 ATIVIDADE INVENTIVA

Ainda que se trate de uma mesma substância química e que a possibilidade de formação de diferentes redes cristalinas seja uma propriedade peculiar dos sólidos, as formas polimórficas podem ter propriedades físico-químicas diferentes tanto nos processos de preparação dos produtos, quanto no tempo de prateleira ou ainda em termos de efeitos químicos.

No entanto, é importante ressaltar que a obtenção de sólidos cristalinos de um composto é uma prática comum da indústria para se aprimorar as características físico-químicas de compostos em geral. Assim, a mera descrição e caracterização de um sólido cristalino alternativo de um composto conhecido, quando desassociada de uma propriedade não óbvia do sólido ou de um avanço técnico relevante frente ao estado da técnica, não apresenta atividade inventiva.

5 SOLVATOS, CLATRATOS, CO-CRISTAIS

Em alguns sólidos cristalinos, o solvente pode ser incorporado na rede cristalina do composto em proporções estequiométricas ou não-estequiométricas. Estes adutos moleculares são denominados solvatos, também denominados pseudopolimorfos. Quando a água for o solvente de cristalização, o sólido resultante é denominado hidrato.

Quando um solvato perde as moléculas do solvente incorporado na rede cristalina (propositalmente ou não) e o cristal retém a estrutura do solvato, o sólido obtido é denominado dessolvato. Esta matéria deve ser avaliada conforme discutido no item sobre Polimorfo destas Diretrizes, uma vez que se refere a forma cristalina composta apenas por um tipo de molécula.

De uma maneira geral, solvatos, clatratos e co-cristais apresentam as seguintes características em comum:

- 1) todos são formados por pelo menos duas moléculas;

- 2) todos podem assumir formas cristalinas diferentes;
- 3) todos podem apresentar características diferentes de acordo com a estrutura e os constituintes do cristal.

Em um pedido de patente cuja invenção seja qualquer um destes produtos, deve ser considerado que:

- 1) para a descrição clara e suficiente de um solvato, clatrato, complexo cristalino ou co-cristal faz-se necessária, obrigatoriamente, a identificação química da molécula e da estequiometria, a qual pode ser determinada através de técnicas de análise termogravimétrica (ATG), Karl Fischer ou outras técnicas validadas que forneçam tais informações;
- 2) se a invenção a ser protegida for um solvato, para avaliação da matéria pleiteada, devem ser consultados o item sobre Composto Químico desta Diretriz e as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente do INPI, já que o solvato é considerado um composto químico diferente do seu correspondente sem solvatação ou anidro;
- 3) se a invenção a ser protegida for uma forma cristalina (clatrato, co-cristal ou a forma cristalina do solvato), esta deve ser caracterizada fisico-quimicamente através das técnicas descritas no item sobre Polimorfo desta Diretriz, além das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente do INPI, de modo a definir tanto os constituintes quanto a estrutura da forma cristalina.
- 4) o uso das expressões genéricas “seus solvatos”, “seus hidratos”, “seus clatratos” e/ou “seus co-cristais” em reivindicações referentes a um composto *per se*, não identificam os derivados solvatos, hidratos, clatratos e co-cristais do composto de forma clara e precisa. Caso o relatório do pedido de patente descreva de forma suficiente estes objetos, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de modo a melhor definir a matéria reivindicada.

6 COMPOSIÇÕES, FORMULAÇÕES E FORMAS FÍSICAS DE COMPOSIÇÕES

As reivindicações de composições, formulações e formas físicas de composições são examinadas conforme as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, em seus parágrafos 7.1 a 7.15.

6.1 CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES

Conforme discutido nas Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafos 7.1 a 7.15, uma composição é usualmente definida somente por seus constituintes. No entanto, as composições podem ainda ser definidas por características mistas, de modo a englobar características de forma física ou de aplicação, desde que sejam definidas qualitativa e/ou quantitativamente por seus constituintes. A seguir, são apresentados exemplos complementares de composições, com ênfase na análise de clareza e precisão das reivindicações (art. 25 da LPI).

Exemplo 1:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica, caracterizada por compreender o composto A e os excipientes B e C.

Reivindicação 2: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por ser para administração por via oral.

Atende ao art. 25 da LPI, uma vez que a composição está definida por seus constituintes na reivindicação 1 e a forma de administração é uma característica adicional que restringe a matéria reivindicada ao campo das composições para uso por via oral (comprimidos, cápsulas, xaropes, etc.).

Reivindicação 3: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por estar na forma de cápsula.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está definida por seus constituintes na reivindicação 1 e a expressão “por estar na forma de cápsula” é uma característica adicional da matéria reivindicada.

Reivindicação 4: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por ser para o tratamento de asma.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está definida por seus constituintes na reivindicação 1 e a sua aplicação é uma característica adicional, que restringe a matéria reivindicada ao campo dos produtos úteis ao tratamento da asma.

Reivindicação 5: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por liberar oitenta por cento (80%) do componente A em menos de trinta minutos.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está definida por seus constituintes na reivindicação 1, e a liberação do componente A é uma característica adicional, que informa sobre as propriedades da matéria reivindicada.

Exemplo 2:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica caracterizada por compreender o composto A e os excipientes B e C para administração oral.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está definida por seus constituintes. A informação sobre a forma de administração é uma característica adicional, que restringe a matéria reivindicada ao campo das composições para uso por via oral (comprimidos, cápsulas, xaropes, etc.).

Exemplo 3:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica caracterizada por compreender o composto A e os excipientes B e C para tratar asma.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está definida por seus constituintes. A informação sobre o uso da composição representa somente uma caracterização adicional da composição, que restringe a matéria reivindicada ao campo dos produtos úteis ao tratamento da asma.

Exemplo 4:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica compreendendo o composto A e os excipientes B e C caracterizada por ser para o tratamento da doença Y.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois a composição não está caracterizada por seus constituintes e sim pela sua aplicação. Neste caso, para atender ao art. 25 da LPI, é possível reformular a redação da reivindicação, deslocando os elementos constituintes da composição para a parte caracterizante. (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, Parágrafos 3.04 a 3.09)

Caso a composição seja conhecida no estado da técnica, a reivindicação também não seria nova, pois a característica relativa ao uso da composição não confere novidade ao produto.

Exemplo 5:

Reivindicação 1: Composição caracterizada por liberar oitenta por cento (80%) do princípio ativo em menos de trinta minutos.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois a composição não está caracterizada por seus constituintes. A porcentagem liberada do princípio ativo não define a matéria pleiteada.

Exemplo 6:

Reivindicação 1: Composição inseticida caracterizada por estar na forma de spray.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois a composição não está caracterizada por seus constituintes e a forma de aplicação não define a matéria pleiteada.

Exemplo 7:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica caracterizada por compreender o composto A e seus excipientes B e C para ser utilizada sob a forma de comprimidos de liberação prolongada capaz de liberar oitenta por cento (80%) do componente A em menos de trinta minutos.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está caracterizada por seus constituintes e a forma farmacêutica e as propriedades do produto são características adicionais da composição.

Exemplo 8:

Reivindicação 1: Comprimido caracterizado por compreender o composto A e os excipientes B e C.

Atende ao art. 25 da LPI, pois o comprimido está caracterizado por seus constituintes (neste caso, os elementos da composição).

Exemplo 9:

Reivindicação 1: Forma farmacêutica caracterizada por estar na forma de um comprimido constituído por 100 mg de A, 220 mg de B e 200 mg de C.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a forma farmacêutica está caracterizada por seus constituintes e pela forma física de comprimido.

Exemplo 10:

Reivindicação 1: Composição farmacêutica caracterizada por compreender o composto A e seus excipientes B e C.

Reivindicação 2: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de a dosagem de A variar de 45 a 90 mg por kg do paciente.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que a característica adicional da reivindicação dependente refere-se ao método de administração da composição farmacêutica, que é parte de um regime terapêutico e não guarda relação com o produto. A característica adicionada não acrescenta informações sobre o produto per se, o que gera uma inconsistência à matéria reivindicada.

Reivindicação 3: Composição farmacêutica, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de ser administrada 2 vezes ao dia.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que a característica adicional da reivindicação dependente refere-se ao método de administração da composição farmacêutica, que é parte de um regime terapêutico e, não, de um produto. A característica adicionada não acrescenta informações sobre o produto per se, o que gera uma inconsistência à matéria reivindicada.

Exemplo 11:

Reivindicação 1: Composição caracterizada por compreender um composto A e um composto B.

Reivindicação 2: Composição, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por compreender, opcionalmente, outros ingredientes ativos.

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que o termo “e, opcionalmente, outros ingredientes ativos” não define os referidos ingredientes ativos.

Caso o relatório do pedido apresente uma descrição suficiente dos denominados “ingredientes ativos”, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado, de forma a restringir os ingredientes ativos aos que foram descritos no relatório descritivo.

Exemplo 12:

Reivindicação 1: Composição de vidro de soda-cal de cor cinza caracterizada por compreender um elemento A e um elemento B nas concentrações x e y, respectivamente, presentes como

agentes colorantes, sendo que o vidro tenha uma transmissão luminosa total < 20% para um vidro com espessura de 4 mm.

Reivindicação 2: Composição de vidro de soda-cal de cor cinza, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato do vidro ter uma transmissão luminosa total < 10% para um vidro com espessura de 4 mm.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está caracterizada pelos seus constituintes e suas respectivas concentrações. A transmissão luminosa (parâmetro físico) é uma característica adicional da matéria pleiteada.

Exemplo 13:

Reivindicação 1: Composição fertilizante caracterizada por compreender a matéria-prima A (ex. Nitrato de amônio) e a matéria-prima B (ex. Sulfato de cálcio), nas concentrações X e Y, respectivamente.

Reivindicação 2: Composição fertilizante, de acordo com a reivindicação 1, caracterizada por conter o nutriente Z (ex. Nitrogênio total) na concentração de 80%, em peso, e o nutriente W (ex. cálcio) na concentração de 10%, em peso.

Atende ao art. 25 da LPI, pois a composição está caracterizada pelas suas matérias-primas e suas concentrações. Os nutrientes e suas concentrações são características adicionais da composição.

Exemplo 14:

Reivindicação 1: Composição fertilizante caracterizada por consistir de elementos X, Y e Z (ex: carbono, hidrogênio, nitrogênio, fósforo, potássio...).

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois a composição não está caracterizada pelas matérias-primas que contêm tais elementos, assim como não especifica as suas concentrações.

7. COMBINAÇÕES DE COMPOSTOS QUÍMICOS

Uma combinação é a associação de dois ou mais compostos visando um determinado produto final. A combinação pode estar contida em uma única forma ou em formas separadas para aplicação simultânea. Para o exame de combinações, devem ser considerados os parágrafos 5.24 a 5.30 e 7.16 a 7.23 das Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II.

No caso particular das invenções relacionadas a combinações, a interação entre os compostos associados deve produzir um efeito não óbvio, como por exemplo um efeito sinérgico ou supra-aditivo, o qual não corresponde a um efeito aditivo, ou seja, à mera soma dos efeitos individuais de cada composto que compõe a dita combinação.

Sendo assim, quando o resultado da associação de dois ou mais compostos conhecidos for um somatório dos efeitos que seriam esperados para cada composto usado isoladamente, a combinação reivindicada será considerada desprovida de atividade inventiva, uma vez que a dita combinação corresponde a uma associação previsível de compostos conhecidos para gerar um efeito técnico esperado.

A comprovação do efeito não óbvio de uma combinação, frequentemente, envolve a apresentação de dados que permitam traçar uma comparação entre os efeitos observados com os respectivos compostos quando usados isoladamente e aqueles obtidos a partir da combinação destes compostos nas mesmas condições experimentais.

Cabe notar que o efeito não óbvio alegado não pode estar sugerido no estado da técnica, como por exemplo, em combinações de compostos com estruturas químicas muito similares às dos compostos da combinação em análise (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 7.19).

7.1 SUFICIÊNCIA DESCRITIVA, CLAREZA E PRECISÃO DAS REIVINDICAÇÕES

7.1.1 Combinação que compreende compostos definidos por “fórmula Markush”

Quando a invenção se refere a uma nova combinação de dois ou mais compostos, na qual pelo menos um dos compostos seja definido por uma fórmula geral do tipo “Markush”, como por exemplo,

“Combinação *caracterizada por* compreender um composto conforme definido pela fórmula geral (I) em associação ao composto A”,

atenção especial deve ser dada à clareza e precisão da redação da reivindicação e devem ser consultadas as Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II (parágrafos 6.13 e 6.14).

7.1.2 Combinações que compreendem uma ou mais classes de compostos químicos

A invenção se refere a uma combinação que compreende um ou mais grupos de compostos definidos por sua classe química ou por seu mecanismo de ação, por exemplo,

“Combinação pesticida *caracterizada por* compreender um composto piretróide e um composto inibidor da enzima X”.

A definição dos compostos da combinação por sua classe química ou por seu mecanismo de ação de uma maneira genérica, sem especificar qual(is) é(são) o(s) exato(s) composto(s) compreendidos na combinação, não é suficiente para definir claramente a matéria que se deseja proteger, contrariando o disposto no art. 25 da LPI.

Caso o relatório do pedido apresente uma descrição suficiente dos compostos que são enquadrados nas classes de compostos de acordo com a invenção, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado de forma a restringir os compostos aos que foram descritos no relatório descritivo.

7.1.3 Combinações que compreendem, opcionalmente, outros ingredientes ativos

Os pedidos relativos a uma nova combinação podem englobar, além da reivindicação principal relacionada à combinação, reivindicações acessórias do tipo:

“Combinação *caracterizada por* compreender o composto A e B e, opcionalmente, outros ingredientes ativos”.

Em tais situações, atenção especial deve ser dada à clareza e precisão da redação da reivindicação de combinação, pois a simples menção do termo “e, opcionalmente, outros ingredientes ativos” não é suficiente para definir claramente a matéria reivindicada, contrariando o disposto no art. 25 da LPI.

Caso o relatório do pedido apresente uma descrição suficiente dos compostos que são enquadrados como os outros ingredientes ativos de acordo com a invenção, o quadro reivindicatório poderá ser reformulado, de forma a melhor definir a matéria que se deseja proteger.

7.1.4 Combinação em que os compostos estão em formas separadas

Em pedidos relacionados a combinações em que os compostos estão em formas separadas, o relatório descritivo deve apresentar evidências de que tais combinações são obtíveis na forma de um produto para aplicação simultânea, ainda que seja pleiteado por meio de um kit (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco II, parágrafo 7.11).

Exemplo:

Relatório Descritivo:

O pedido de patente refere-se a uma combinação compreendendo os herbicidas A e B. No relatório descritivo, foi demonstrado o efeito sinérgico da combinação quando os compostos foram aplicados às plantas separadamente, mas de forma simultânea.

Quadro Reivindicatório:

Reivindicação 1: “Combinação herbicida sinérgica *caracterizada por* compreender o composto A e o composto B.”

Reivindicação 2: “Método para o controle de ervas daninhas *caracterizado pelo* fato de que as plantas são tratadas com a combinação conforme definida na reivindicação 1.”

Reivindicação 3: “Método, de acordo com a reivindicação 2, *caracterizado pelo* fato de que o composto A e o composto B são aplicados simultaneamente ou sequencialmente.”

Análise técnica:

As reivindicações 1 e 2 podem ser aceitas desde que atendam aos requisitos de patenteabilidade. Ao contrário, a reivindicação 3 não pode ser aceita, uma vez que inclui a possibilidade da aplicação dos compostos A e B ocorrer de forma sequencial.

8 PROCESSOS ANÁLOGOS

Os processos análogos compreendem materiais de partida e/ou produtos finais que apresentem novidade e atividade inventiva perante o estado da técnica, apesar de tais processos envolverem a combinação ou o emprego de procedimentos conhecidos do estado da técnica.

Identificando-se novidade e atividade inventiva para os materiais de partida e/ou produtos finais, não é necessário investigar tais requisitos para as suas respectivas reivindicações de processos análogos, desde que as mesmas estejam interligadas à reivindicação principal de material de partida e/ou produto final.

Desta forma, as reivindicações de processos análogos podem ser interpretadas genericamente como reivindicações acessórias, pois, por definição, a atribuição de novidade e atividade inventiva é função da presença destes requisitos *per se* no produto e/ou material de partida. Além dos processos análogos referentes à síntese de compostos químicos que possuem novidade e atividade inventiva, o conceito também pode ser extrapolado para aqueles processos referentes à produção de composições farmacêuticas, agroquímicas, medicamentos, catalisadores, lubrificantes, pesticidas ou herbicidas, dentre outros.

Caso o exame técnico considere que os materiais de partida e/ou produtos finais não possuam novidade e/ou atividade inventiva, os processos análogos reivindicados não serão aceitos por falta de novidade e/ou atividade inventiva perante o estado da técnica.

Em outra situação, caso o exame técnico considere que os materiais de partida e/ou produtos finais não possuam novidade e/ou atividade inventiva, mas considere que os processos reivindicados envolvem passos novos e/ou inventivos, tais reivindicações de processos devem ser examinadas como reivindicações comuns de processo, ou seja, não se tratará mais de uma reivindicação de processo análogo.

Pelo fato das etapas envolvidas nos processos análogos serem, em geral, bem conhecidas por um técnico no assunto, pode ser suficiente menciona-las genericamente no relatório descritivo. Ressalta-se, contudo, que cabe ao examinador decidir, pela análise do relatório descritivo, o nível de detalhamento necessário a cada caso para o perfeito entendimento por um técnico no assunto, visando à adequada realização do processo de preparação em questão.

9 NOVOS USOS DE PRODUTOS CONHECIDOS

Este item trata de particularidades do exame técnico de invenções de novos usos de produtos conhecidos, especialmente novos usos médicos, em complementação às Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafos 3.73 a 3.76 e Bloco II, parágrafos 4.18 e 5.40 a 5.45.

A proteção da reivindicação de novo uso se dá ao conjunto do uso da substância conhecida para uma nova finalidade. Desta forma, o relatório deve descrever clara e suficientemente o novo uso pleiteado.

No caso do pedido pretender proteção para um novo uso de vários compostos, por exemplo, identificados em uma “fórmula Markush”, somente será considerado suficientemente descrito o uso dos compostos que foi efetivamente demonstrado no relatório descritivo, de modo a comprovar o uso pleiteado. Embora, teoricamente, os compostos definidos por uma determinada “fórmula Markush” possam apresentar atividades semelhantes, não é possível extrapolar o novo uso de um único composto para todos os demais, a menos que sejam apresentados testes comprovando esta equivalência de efeito.

O pedido que trata de um novo uso de um grupo de compostos terá unidade de invenção se ditos compostos forem estruturalmente relacionados (fórmula Markush, por exemplo) ou apresentarem o mesmo mecanismo de ação. Na área farmacêutica, o pedido que tratar de um novo uso médico destinado a um conjunto de doenças de mesma etiologia também terá unidade de invenção.

9.1 NOVO USO MÉDICO

9.1.1 Novidade

Para ser considerada nova, a invenção de novo uso médico deve revelar a aplicação de um produto farmacêutico já conhecido para produzir um medicamento para tratar ou prevenir uma doença diferente daquela para a qual este produto já era empregado no estado da técnica.

Características relacionadas ao uso do composto, tais como o esquema terapêutico (dosagem, forma de administração/aplicação, intervalo posológico) e/ou grupo de pacientes não

conferem novidade ao uso conhecido do composto. Por exemplo, se o estado da técnica revela o “uso do composto X para fabricar um medicamento para tratar a doença Y” e o pedido pleiteia o “uso do composto X para fabricar um medicamento para tratar a doença Y em pacientes diabéticos”, o uso pleiteado não é considerado novo.

9.1.2. Atividade inventiva

No caso das invenções de novo uso médico, alguns aspectos devem ser observados para aferição do requisito de atividade inventiva:

1. O mecanismo de ação do composto envolvido no novo uso não deve ser depreendido do seu mecanismo de ação para uso médico já revelado no estado da técnica.
2. O novo uso deve se referir ao tratamento de uma doença cuja etiologia seja diferente da etiologia da doença relacionada ao uso revelado no estado da técnica.
3. O novo uso não pode ser depreendido a partir da relação estrutura-atividade do fármaco em comparação com moléculas estruturalmente relacionadas, ou seja, a partir da analogia estrutural com outros compostos que apresentam a mesma atividade ora pleiteada, já revelada no estado da técnica.
4. O novo uso não pode ser depreendido a partir da revelação de efeitos adversos conhecidos do estado da técnica para o fármaco em questão.
5. O novo uso não pode ser depreendido a partir do uso do composto para o tratamento de um sintoma de uma doença já revelado no estado da técnica, ainda que o uso pleiteado se refira a uma doença diferente.

9.1.3. Suficiência descritiva

Há que se entender que a proteção da reivindicação de novo uso médico se dá ao conjunto do uso da substância conhecida para fabricar um medicamento para um novo uso terapêutico. Desta forma, o relatório deve descrever clara e suficientemente o novo uso pleiteado.

Resultados de testes “*in vitro*” podem apresentar indícios do novo uso terapêutico; entretanto, apenas testes “*in vivo*” são comprobatórios do novo uso, garantindo a sua realização

por um técnico no assunto. Vale lembrar que os resultados de testes “*in vitro*” muitas vezes não se confirmam “*in vivo*”, por ocasião de aspectos metabólicos, farmacocinéticos, dentre outros relacionados ao comportamento do fármaco dentro do organismo. Desta forma, nem sempre é possível extrapolar os resultados dos ensaios “*in vitro*” para uma aplicação terapêutica real.

Quando se tratar de estudos realizados em animais, os modelos adotados deverão apresentar a possibilidade de extrapolação para os seres humanos ou animais a serem tratados.

No caso do pedido pretender proteção para um novo uso médico de uma “fórmula Markush”, somente será considerado suficientemente descrito o uso dos compostos que foi efetivamente demonstrado “*in vivo*”. Embora, teoricamente, os compostos definidos por uma determinada “fórmula Markush” possam apresentar aplicações semelhantes, não é possível extrapolar o uso de um único composto para todos os demais, a menos que sejam apresentados testes comprovando esta equivalência de efeito. Além disso, pelos motivos anteriormente expostos, tendo em vista os fatores relacionados ao comportamento do fármaco dentro do organismo, somente serão aceitos testes “*in vivo*” para comprovação da nova atividade terapêutica de cada composto derivado da “fórmula Markush”.

9.1.4 Fundamentação, clareza e precisão das reivindicações

As reivindicações de novo uso para preparar um medicamento devem especificar a doença a ser tratada. Reivindicações de novo uso que se refiram a distúrbios, síndromes, sintomas ou quaisquer outros termos genéricos, como por exemplo, “distúrbios gastro-intestinais”, “síndromes respiratórias”, não serão aceitas, por causarem indefinição quanto à matéria a ser protegida.

As reivindicações de novo uso médico que se refiram à condição tratada em termos de mecanismo de ação, como por exemplo, “*uso do composto X para preparar um medicamento para tratar uma doença pela ocupação seletiva de um receptor de serotonina*” ou “*uso do composto X para preparar um medicamento inibidor da recaptação da serotonina*”, não serão aceitas, uma vez que não definem a doença em questão de forma clara e precisa.

Trechos contidos nas reivindicações de novo uso médico relacionados ao esquema terapêutico e grupo de pacientes tampouco definem o uso de um composto para preparar um medicamento e, assim, não são aceitos por causarem indefinição à matéria. A seguir são apresentados exemplos complementares relacionados a novo uso médico.

Exemplo 1:

Reivindicação: “Uso do produto (ou composto ou princípio ativo) X *caracterizado por* ser na preparação de um medicamento para tratar a doença Y.”

Atende ao art. 25 da LPI, pois o uso do produto está caracterizado, de forma clara e precisa, para preparação de um medicamento para tratar uma doença definida.

Exemplo 2:

Reivindicação: “Produto X caracterizado pelo fato de ser usado como medicamento.”

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que o produto está sendo definido pelo seu uso e não por suas características técnicas.

Ademais, uma vez que o produto é conhecido do estado da técnica, não apresentaria novidade (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafo 3.74).

Exemplo 3:

Reivindicação: “Produto X caracterizado pelo fato de ser para o tratamento da doença Y.”

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que o produto está sendo definido pelo seu uso e não por suas características técnicas.

Ademais, uma vez que o produto é conhecido do estado da técnica, não apresentaria novidade (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente Bloco I, parágrafo 3.74).

Exemplo 4:

Reivindicação: “Uso do produto X caracterizado por ser no tratamento da doença Y.”

Não aceitável, uma vez que, da forma como redigida, refere-se a um método terapêutico (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafo 3.76).

Exemplo 5:

Reivindicação: “Processo para tratar a doença Y caracterizado pela administração do produto X.”

Não aceitável, uma vez que, da forma como redigida, refere-se a um método terapêutico (Diretrizes de Exame de Pedidos de Patente, Bloco I, parágrafo 3.76).

Exemplo 6:

Reivindicação: “Uso do composto X para preparar um medicamento inibidor do receptor Y.”

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois se refere à condição a ser tratada em termos de mecanismo de ação e não define uma doença de forma clara e precisa.

Exemplo 7:

Reivindicação: “Uso do composto X para preparar um medicamento para tratar distúrbios ou síndromes do SNC.”

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), pois se refere à condição a ser tratada em termos genéricos e não define uma doença de forma clara e precisa.

Exemplo 8:

Reivindicação: “Uso do produto X caracterizado por ser na preparação de um medicamento para tratar a doença Y que consiste em administrar o medicamento 3 vezes ao dia por via oral.”

Não aceitável por falta de clareza (art. 25 da LPI), uma vez que a característica adicional da reivindicação (“...consiste em administrar o medicamento 3 vezes ao dia por via oral”) refere-se ao método de administração que é parte de um regime terapêutico e, não, do uso (processo para preparar um medicamento para tratar a doença Y).