

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral
26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 10 de noviembre de 2009, con el N° 09-127785-00000-0000, por la sociedad Pfizer Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "Derivados de 6-(pirrolidin-3-il)1h-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5h)-ona útiles como inhibidores de PDE9", que corresponde a la solicitud internacional PCT/IB2008/001125 del 05 de mayo de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 624 del 20 de enero de 2011, habiéndose presentado oposición por parte de la sociedad Lafrancol S.A., una vez fue estudiada por el Despacho, no desvirtuó la patentabilidad del objeto en estudio como se analizará más adelante.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 14705 y notificado por fijación en lista el 21 de agosto de 2012 se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico visibles a folios 456 a 461 del cuaderno administrativo, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente.

CUARTO: Que el solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-127785-00009-0000 del 28 de diciembre de 2012, respondió oportunamente el requerimiento formulado, y presentó nuevas reivindicaciones 1 a 10 (Fls. 474 a 479) que reemplazan las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina *"Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."*

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 10 contenidas en los folios 474 a 479, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Análisis de la oposición presentada por la sociedad Lafrancol S.A.

Afirma el opositor que esta solicitud pretende obtener patente para una serie de composiciones y combinaciones farmacéuticas que corresponden a inhibidores de PDE9 para ser empleadas en el tratamiento de trastornos neurodegenerativos y cognitivos como Alzheimer y esquizofrenia, los cuales son conocidos y no presentan novedad.

En otro aparte, manifiesta que las composiciones farmacéuticas que involucran agentes como Donepezilo, Galantamina, Rivastigmina, Memantina, Tacrina son plenamente conocidas y refiere las patentes EP 296560, US 4895841, DE 3805744, US 5602176 y US 3391142 donde se dan a conocer los compuestos y composiciones que contienen los principios activos Donepezilo, Galantamina y Memantina. Adicionalmente, manifiesta que la molécula Tacrina está plenamente identificada a pesar de no poseer patentes, concluyendo que las composiciones y combinaciones farmacéuticas no poseen novedad y nivel inventivo por ser plenamente conocidas y adjunta para demostrar ello fotocopias del "The Index Merck".

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

De igual forma, afirma que las combinaciones farmacéuticas objeto de la solicitud, no se consideran invenciones debido a que la mezcla (combinaciones) de producto (moléculas) y su variación, bien sea en uso, forma, dimensión o de materia. Por lo tanto, NO se consideran invenciones por cuanto no son susceptibles de aplicación industrial, nivel inventivo y novedad, luego NO pueden acceder a beneficios patentarios.

Finalmente, el opositor solicitó tener como prueba los siguientes documentos:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	The Merck Index Fourteenth Edition. 2006. Pág. 143-144, 578,1007,1422-1423 y 1550	"An encyclopedia of chemical, drugs and biologicals"	2006

Respuestas del Solicitante

El solicitante señala que el opositor 1.) argumenta que las composiciones y combinaciones farmacéuticas que corresponden a inhibidores de PDE9 carecen de novedad y nivel inventivos puesto que ya eran conocidas en el estado del arte. Anotando que el Donepezilo, Galantamina, Rivastigmina, Memantina, Tacrina son moléculas conocidas y reveladas por ejemplo en el Index Merck y las patentes EP 296560 y US 4895841 para el Donepezilo, DE 3805744 y US 5602176 para la Rivastigmina y US 3391142 para la Memantina y que 2.) concluye que no es posible conceder beneficio de patente a formulaciones que contienen moléculas conocidas en el arte previo.

El solicitante manifiesta respetuosamente que el opositor no ha comprendido adecuadamente el objeto de la invención reivindicada. Dado que esta revela y reclama derivados de la 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona como inhibidores selectivos de la fosfodiesterasa tipo 9 (PDE9). Afirma que una persona medianamente versada en la materia fácilmente apreciaría que los documentos de

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

estado del arte citados por el opositor no son relevantes para la invención, porque estos divulgan activos que de acuerdo con el capítulo descriptivo, podrían en el mejor de los casos, estar incluidos en las combinaciones farmacéuticas que incluyan compuestos de la presente invención.

Adicionalmente, empleando las estructuras químicas de los compuesto Donepezilo, Galantamina, Rivastigmina, Memantina y Tacrina afirma que ningún documento refiere o sugiere compuestos derivados 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona y concluyen que los compuestos son estructuralmente muy lejanos y no relacionados con los que son objeto de su solicitud y que ninguno de ellos son reclamados en forma individual porque fueron referidos en el capítulo reivindicatorio como posibles combinaciones con los activos de la invención.

Finalmente, manifiesta que ninguno de los documentos afecta la novedad o nivel inventivo de la invención y señala que el análisis del nivel inventivo no puede estar basado 1.) En si es posible o no obtener la invención reclamada, pues claramente es posible o 2.) Si las técnicas aplicadas en el desarrollo de la invención son comunes u obvias, sino que el método de la invención podría derivarse de manera evidente del arte previo.

Respuesta del Examinador Técnico

Los documentos presentados en la oposición no desvirtúan la novedad o el nivel inventivo del objeto de esta solicitud porque estos no se refieren a ningún derivado de los compuestos Donepezilo, Galantamina, Rivastigmina, Memantina y Tacrina sino a derivados de la 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona y en el capítulo reivindicatorio solo hace mención a estos compuesto para la combinación farmacéutica con a otro principio activo objeto de esta invención y para el manejo de enfermedades asociables a la acción inhibidora de PDE9.

De igual forma, se le informa al opositor sobre la existencia de una modalidad de

Página 4 de 14

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1050261143

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

patente denominada “Invención por combinación” empleada para obtener el privilegio de patente cuando se reúnen elementos conocidos, pero son en sí una nueva solución técnica a un problema técnico. La cual es susceptible de obtener si cumple los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicabilidad industrial. Por lo cual “la afirmación donde se manifiesta que: *las combinaciones farmacéuticas no se consideran invenciones debido a que la mezcla (combinaciones) de producto (moléculas) y su variación, bien sea en uso, forma, dimensión o de materia. Por lo tanto, NO se consideran invenciones por cuanto no son susceptibles de aplicación industrial, nivel inventivo y novedad, luego NO pueden acceder a beneficios patentarios*” (Folio. 422) es imprecisa.

De igual modo, se le informa al solicitante que las patentes DE 3805744 y US 5602176 hacen referencia a la molécula Galantamina y no a la Rivastigmina como lo afirma.

Finalmente, se concluye que los documentos presentados en la oposición no desvirtúan la novedad ó el nivel inventivo del objeto de esta solicitud; por lo cual no se considerarán dentro del Examen de Patentabilidad.

6.2. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud es suministrar compuestos inhibidores de la PDE9. Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



Compuesto I

6.3. Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 11 de mayo de 2007, que corresponde a la fecha de la prioridad invocada.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

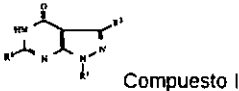
RESOLUCIÓN No: 1514
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US 5294612	6-heterocyclyl-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-ones,	15/marzo/1994
D2	US 8044060	6-cyclilmethyl- and 6-alkylmethyl pyrazolo[3,4-D]pyrimidines, methods for their preparation an methods for their use to treat impairments of perception, concentration, learning and/or memory.	18/noviembre/2004

El documento D1^[1] divulga una serie de compuestos derivados de la 6–heterocicliil-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-onas inhibidores de la actividad enzimática de la fosfodiesterasa (PDE) útiles en el tratamiento de enfermedades cardiovasculares de fórmula I y las composiciones que las contienen.



Adicionalmente, en los resultados de la evaluación biológica refiere que la fosfodiesterasa empleada en la evaluación inhibe la hidrólisis, preferentemente en cGMP frente a cAMP y que la misma fue aislada de tejido cardiovascular (corazón y aorta) y que para evaluar su selectividad y potencia fue ensayada frente a los dos nucleótidos cíclicos (Folio 36, columna 1)

El documento D2^[2] una serie de compuestos 6–cicliilmetil y 6–alquilmetil pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-onas inhibidores del efecto de la c-GMP fosfodiesterasa PDE9A y por lo tanto, útiles para el tratamiento de la pérdida de percepción, concentración, aprendizaje y/o memoria (Folio. 1, columna. 2).

^[1]<http://www.google.com/patents/US5294612>

^[2]<http://www.google.com/patents/US8044060>

6.4. Nivel Inventivo

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

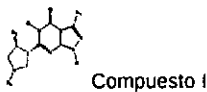
RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: “Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

En el presente caso, las composiciones reclamadas en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 refiere un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



La tabla siguiente presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en los documentos D1 y D2, que representan el estado de la técnica cercano:

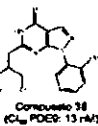
Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de fórmula I:  Compuesto I	Un compuesto de fórmula I:  Compuesto I	Un compuesto de fórmula I:  Compuesto I
R	R ¹	R ¹
alquilo(C ₁ -C ₈) cicloalquilo heterocicloalquilo	alquilo cicloalquilo(C ₃ -C ₇) arilo y heteroarilo	No refiere
R ₁	R ²	Hidrógeno
hidrógeno, alquilo(C ₁ -C ₄)	Hidrógeno Alquilo inferior	
	R ³	donde R ¹ es
R ²	Es un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno	No refiere
R ³	R ³ es opcionalmente sustituido	R ³ es opcionalmente sustituido
alquilo(C ₁ -C ₄) haloalquilo(C ₁ -C ₄) heteroarilo seleccionado del grupo que consta de piridinio, piridazino, pirimidino, y pirazolino, y ER ₂	donde los nitrógenos o 1 o 2 de los átomos de carbono pueden estar sustituido de igual o diferente manera por un grupo seleccionado	alquilo(C ₁ -C ₄) trifluorometilo trifluorometoxilo heteroarilaminocarbonilo cicloalquilo(C ₃ -C ₇)
R ₂	alquilo inferior halogéno trifluoroacetilo heteroarilo	
Hidrógeno alquilo cicloalquilo(C ₃ -C ₇) haloalquilo(C ₁ -C ₄)		

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

Características esenciales	D1	D2
Realizaciones preferidas	Realizaciones preferidas	Realizaciones preferidas
 compuesto 4 (C₁₆, PDE: 524 nM)	 Compuesto 71 (C₁₆, o-GMP-PDE I: 3700 nM)	 Compuesto 34 (C₁₆, PDE: 12 nM)
 compuesto 42 (C₁₆, PDE: 268 nM)	 Compuesto 83 (C₁₆, o-GMP-PDE I: 370)	 Compuesto 11 (C₁₆, PDE: 6 nM)
 compuesto 32 (C₁₆, PDE: 8,19 nM)	 Compuesto 77c (% Inhibición o-GMP-PDE I: 13% a 10 μM)	 Compuesto 38 enantiómero I (C₁₆, PDE: 30 nM)
 compuesto 68 (C₁₆, PDE: 334 nM)  compuesto 9 (C₁₆, PDE: 9,45 nM)	 Compuesto 127c (% Inhibición o-GMP-PDE I: 72% a 0,01 μM)  Compuesto 130b (% Inhibición o-GMP-PDE I: 91% a 0,01 μM)	 Compuesto 58 (C₁₆, PDE: 13 nM)

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la materia reclamada definida en la reivindicación 1 porque divulgan una serie de compuestos caracterizados por ser derivados de la 6-((heterociclil de 5 o 6 miembros miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno)-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona inhibidores de la actividad enzimática de la fosfodiesterasa (PDE), de manera preferente inhiben la hidrólisis preferentemente cGMP frente a cAMP asociables a las fosfodiesterasas y por lo tanto son útiles en el tratamiento de enfermedades.

La diferencia entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 1 y el compuesto I del documento D1 corresponde a que la materia reclamada define en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona un sustituyente pirrolidin-3-il y el documento D1 lo define como un anillo heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno opcionalmente sustituido, el cual es ejemplificado preferencialmente como un sustituyente piridin 4-il.

Las diferencias entre la materia reclamada, definida en la reivindicación 1 y el compuesto I

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

del documento D2 corresponden a que la materia reclamada define en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona un sustituyente pirrolidin-3-il y el documento D2 no refiere un sustituyente pirrolidin-3-il sino un metilo opcionalmente sustituido por una gran variedad de sustituyentes ejemplificados de manera preferente por un anillo ciclopentilo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo seleccionar de los compuestos de fórmula I conocidos en D1 aquellos caracterizados por ser derivados de la 6-(1-sustituido-pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona para obtener inhibidores de la acción enzimática de la fosfodiesterasa y específicamente de la PDE9.

Sin embargo, el documento D1 refiere que los compuestos con un anillo heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona son inhibidores de la acción enzimática de la fosfodiesterasa, sin especificar si la acción es selectiva frente al subtipo PDE9 pero indica que estos son inhibidores preferentemente de la hidrólisis cGMP frente a cAMP asociable a fosfodiesterasas y dado que el documento D2 refiere una serie de compuestos caracterizados porque presentan una serie de sustituyentes ciclometil y alquilmetil en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona que son inhibidores específicos del efecto de la fosfodiesterasa PDE9A.

En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría suficientemente motivada para seleccionar los compuestos derivados de la 6-(1-sustituido-pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona para obtener inhibidores de la acción enzimática de la fosfodiesterasa y específicamente de la PDE9 de los compuestos divulgados por el documento D1 como compuestos alternativos a los compuestos divulgados en D2. Por lo cual la selección efectuada en la reivindicación 1 se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-7 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

De la composición

La reivindicación 8 corresponde a una composición farmacéutica, la cual comprende, el compuesto de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1-7 o su sal farmacéuticamente aceptable y un vehículo, excipiente o diluyente farmacéuticamente aceptable.

Características esenciales	D1
Composición farmacéutica que contiene:	Composición farmacéutica que contiene:
Un compuesto de formula I  Compuesto I	Una cantidad terapéuticamente efectiva del compuesto de formula I  Compuesto I
R alquilo(C ₂ -C ₆) cicloalquilo heterocicloalquilo	R1 alquilo cicloalquilo(C ₄ -C ₇) arilo y heteroarilo
R1 hidrógeno, alquilo(C ₁ -C ₄)	R3 Hidrógeno Alquilo inferior
	R6 Es un anillo heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno.
R2 alquilo(C ₁ -C ₄) haloalquilo(C ₁ -C ₄) heteroarilo seleccionado del grupo que consta de pindinilo, piridazinilo, pirimidinilo, y pirazinilo, y ER ₅	R6 es opcionalmente sustituido donde los nitrógenos o 1 o 2 de los átomos de carbono pueden estar sustituido de igual o diferente manera por un grupo seleccionado alquilo inferior halógeno trifluoroacetilo heteroarilo
R3 Hidrógeno alquilo cicloalquilo(C ₄ -C ₇) haloalquilo(C ₁ -C ₄)	

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la solicitud definida en la

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

reivindicación 8 porque divulgan una serie composiciones farmacéuticas que comprenden derivados de la 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona inhibidores de la actividad enzimática de la fosfodiesterasa (PDE) útiles en el tratamiento de enfermedades cardiovasculares y otras enfermedades asociables .

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la composición farmacéutica del documento D1 corresponde a que la solicitud define para el compuesto I en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona un sustituyente pirrolidin-3-il y el documento D1 lo define como un anillo heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno opcionalmente sustituido.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo seleccionar de las composiciones farmacéuticas conocidas en D1 aquellas caracterizadas porque comprenden derivados de la 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona para obtener composiciones alternativas de inhibidores de la acción enzimática de la fosfodiesterasa y específicamente de la PDE9.

Sin embargo, el documento D1 indica que los compuestos con un anillo heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno en la posición 6 del anillo 1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona son inhibidores de la acción enzimática de la fosfodiesterasa, sin especificar si la acción es selectiva frente al subtipo PDE9.

En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría suficientemente motivada para seleccionar de las composiciones farmacéuticas conocidas en D1 aquellas caracterizadas porque comprenden derivados de la 6-(pirrolidin-3-il)1H-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona como composiciones farmacéuticas alternativas a las divulgadas en el documento D1. Por lo cual la selección efectuada en la reivindicación 8 se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones 9 y 10 no revelan alguna característica que le confiera nivel inventivo a la composición, por lo cual son obvias.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

En referencia a los argumentos de la solicitante, según los cuales 1.) no hay nada en D1 ni en D2, solos o en combinación, que motive a la persona medianamente versada en la materia a incluir un grupo pirrolidina en la posición 6 del núcleo 1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-4(5H)-ona como se reclama, 2.) la única manera como una persona medianamente versada en la materia, partiendo de D1 o D2, podría haber llegado a la invención seleccionada sería a través de la combinación arbitraria y accidental de los sustituyentes y sólo después de innumerables selecciones y 3.) el examinador pasa por alto las páginas 165 y 166 del Capítulo Descriptivo, en las que de manera clara se evidencia la actividad inhibitoria sobre la fosfodiesterasa de 114 Ejemplos, que se encuentran dentro de la materia aquí reivindicada al mostrar los resultados de un ensayo realizado específicamente sobre PDE9. Este Despacho se permite informar que:

- El documento D1 refiere de manera explícita en su resumen que los derivados 6-heterocicilil-pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona caracterizados porque el sustituyente en la posición 6 del anillo es un heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene uno o dos átomos de carbono o un anillo bicíclico de 9 o 10 miembros que contiene uno o dos átomos de nitrógeno poseen actividad inhibitoria cGMP-PDE de manera preferente frente cAMP-PDE, característica de la fosfodiesterasa 9, tal y como lo indica el solicitante (Folio 174. líneas 2-5). Adicionalmente, divulga a través de sus realizaciones preferidas como sustituyentes seleccionados los grupos piridin-4-il en la posición 6 y tert-butil o ciclopentil en la posición 1 de núcleo central pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona (Folio. 3, columna 2, resumen de la invención) e indica de manera explícita que los ejemplos son de carácter ilustrativo pero de ninguna manera limitan el objeto de la invención (Folio. 8, columna 2, líneas 18-19), de lo cual una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría sin ninguna dificultad que por medio de una razonable restricción soportada por sus ejemplos el documento incluye inequívocamente el sustituyente pirrolidin-3-il y otras series bioisotéras del mismo dentro del grupo *heterociclo de 5 o 6 miembros que contiene uno o dos átomos de carbono* máxime cuando se excluyen como sustituyentes en esta posición del núcleo central pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona los anillos estructuralmente cercanos

Página 12 de 14

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1050261143

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/09-127785

como los compuestos heterocíclicos saturados o no que: 1.) sean menores a 4 miembros, 2.) posean 7 o 8 miembros, 3.) sean bicíclicos con 11 o más miembros y/o 4.) posean más de tres átomos de nitrógeno.

- La solicitante refiere la inobservancia de la evaluación de la actividad inhibitoria PDE9 efectuada por el solicitante. Sin embargo, una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría de la misma sin ninguna dificultad que: 1.) no toda la materia reclamada a través de la reivindicación 1 (Folio. 474) posee el efecto técnico atribuido (Ver ejemplos 42 y 58), 2.) que efecto técnico no es atribuible a ninguna de las selecciones en los sustituyentes efectuadas por la solicitante en las posiciones 1,3 y 6 del núcleo central pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona, esto debido a la simple comparación de los resultados de la pruebas biológicas presentadas donde los compuestos con un anillo 6-(pirrolidin-3-il)pirazolo[3,4-d]pirimin-4(5H)-ona sustituidos por grupo hidrocarbonados lineales, ramificados ó cíclicos pueden o no poseer el efecto técnico descrito (Ver compuestos 3, 4, 32, 42 y 58).

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentada, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Declarar infundada la oposición presentada por la sociedad Lafranco S.A., de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente Resolución.

ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "DERIVADOS DE 6-(PIRROLIDIN-3-IL)1H-PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIN-4(5H)-ONA ÚTILES COMO INHIBIDORES DE PDE9" de acuerdo con la modificación presentada por la sociedad solicitante.

Página 13 de 14

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1050261143

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 1514

Por la cual se deniega una patente de invención

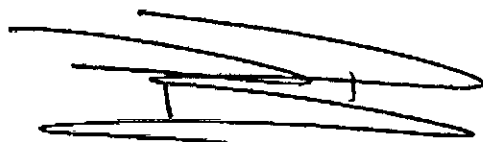
Rad.PCT/09-127785

ARTÍCULO TERCERO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedades Pfizer Inc. y Lafrancol S.A., entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco 5 días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 28 Ene 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor
CARLOS REINALDO OLARTE GARCÍA
office@olartemoure.com

Doctor
TITO NOÉ PARRA MURILLO
tparra@lafrancol.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero ✓
Revisó: Natalia Lamprea Bermudez ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓

Página 14 de 14

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1050261143

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26- 55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia