

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

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 30 de septiembre de 2010, con el N° 10-121065-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Boehringer Ingelheim International GMBH, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "DERIVADOS DE 1-HETEROCICLILO-1,5-DIHIDRO-PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIDIN-4-ONA Y SU USO COMO MODULADORES DE LA PDE9A", que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2009/053907 del 01 de abril de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 632 del 20 de septiembre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 22723, notificado por fijación en lista el 18 de diciembre 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, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 10-121065-00006-0000 del 25 de abril de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 19 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

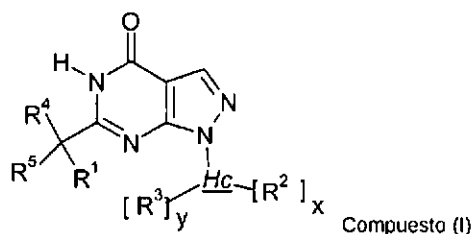
QUINTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina “Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo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

SEXTO: Que las reivindicaciones 1 a 19, no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema técnico consiste en la necesidad de proporcionar compuestos moduladores de la PDE9A útiles para el tratamiento de trastornos del sistema nervioso central (SNC).

Para resolver este problema técnico solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I):



6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 02 de abril de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente(s) documento(s) que anticipa(n) el objeto de esta solicitud:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

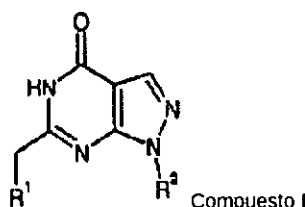
RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

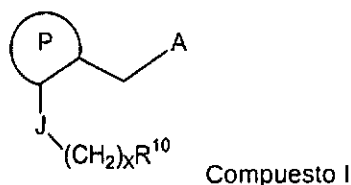
Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2004099210	"6-arylmethyl-substituted pyrazolopyrimidines"	18/noviembre/2004
D3	WO2004096811	"PDE9 inhibitors for treating type 2 diabetes, metabokic syndrome, and cardiovascular disease"	11/noviembre/2004

El documento D1^[1] divulga pirazolopirimidinas sustituidas por 6-arilmetilo de fórmula (I) y su utilización para la fabricación de medicamentos que permiten mejorar la percepción, la capacidad de concentración y/o la capacidad de memoria. (Fl. 1, resumen)



De igual forma, el documento D1 divulga que los compuestos son inhibidores específicos de la fosfodiesterasa PDE9A inclusive en el rango nanomolar (Fl.17, tabla 1)

El documento D3^[2] divulga inhibidores de la fosfodiesterasa 9 (PDE9) de fórmula (I) y su uso para el tratamiento de enfermedades como diabetes, hiperglicemia, dislipidemias, entre otras (Fl.4)



1: [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2004099210A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20041118&DB=EPODOC&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2004099210A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20041118&DB=EPODOC&locale=en_EP

2: [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20041111&CC=WO&NR=2004096811A1&KC=A1)

DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20041111&CC=WO&NR=2004096811A1&KC=A1

Página 3 de 8

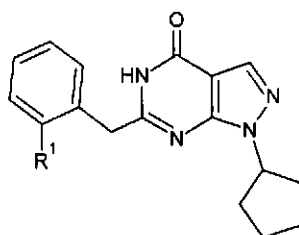
REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

De igual forma, el documento D3 da conocer los compuestos 4 (Fl. 27) y 13 a 16 (Fl. 29) caracterizados por ser derivados de la 1-ciclopentil-4-oxo-4,5-dihidro-6-bencil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina con la siguiente estructura común.



Finalmente, el documento D3 divulga que los compuestos evaluados producen una inhibición mayor al 40% de la fosfodiesterasa PDE9 en concentración de 1 μ M y con IC₅₀, en el caso de algunos compuestos inferior a 50 nM (Fl. 55, resultados).

6.3. Nivel Inventivo.

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, los compuestos reclamados en la solicitud no tienen nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: "Un compuesto de la fórmula (I)..." (Pág.12 del radicado N° 10-121065-00006-0000)

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D3 que representa(n) el estado de la técnica:

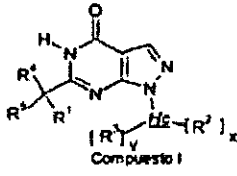
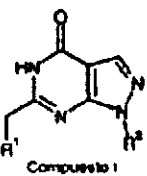
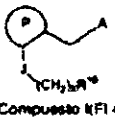
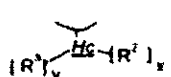
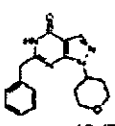
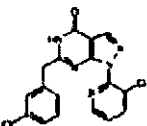
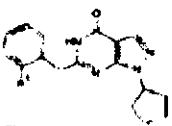
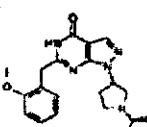
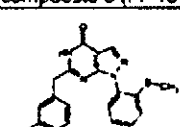
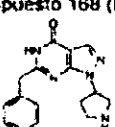
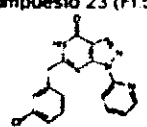
Tabla 2

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

Características esenciales	D1	D3
Un compuesto de fórmula (I)  Compuesto I	Un compuesto de fórmula (I)  Compuesto I (FI 1 resumen)	Un compuesto de fórmula (I)  Compuesto I (FI 4) Donde A es el anillo (h) y P es fenilo y representados por la siguiente fórmula 
 R1 es fenilo y 2-, 3- y 4-piridilo R2 y R3 es hidrógeno	R1 fenilo, piridilo o tiofenilo opcionalmente sustituido	fenilo sustituido con un grupo  Donde J es O, S, y (CH2)xR10 es COOH
 tetrahidropirranilo, tetrahidrofuranilo, piperidino y pirrolidino	R2 Fenilo o heteroarilo	R2 (C3-C9)heterocicloalquil
Compuestos divulgados	Ejemplos	Ejemplo
 compuesto 40 (FI 78)	 compuesto 8 (FI 48)	 Estructura común compuestos 4 y 13 a 16 (FIs 27 y 29)
 compuesto 168 (FI 89)	 compuesto 23 (FI 56)	
 compuesto 199 (FI 91)	 Compuesto 27 (FI 56)	

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

Como se dijo anteriormente, el documento D3 es considerado el estado de la técnica cercano a la materia reclamada definida en la reivindicación 1 porque divulga y ejemplifica inhibidores de la fosfodiesterasa PDE9 que presentan estructura de: 1-ciclopentil-4-oxo-4,5-dihidro-6-bencil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina.

La diferencia entre la solicitud, definida en la reivindicación 1 y los compuestos del divulgados en el documento D3 consiste en que en la solicitud se define el sustituyente en la posición 1 del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidina como: (C₅-C₆)heterocicloalquil, que se selecciona entre tetrahidropiraniilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo y pirrolidino mientras que en el documento D3 se define como sustituyente en este posición un (C₃-C₆)heterocicloalquil de forma general.

El efecto que se logra al seleccionar los derivados de la 1-(tetrahidropiraniilo o tetrahidrofuranilo o piperidinilo o pirrolidino)-4-oxo-4,5-dihidro-6-bencil-1H-pirazolo[3,4-d]pirimidina consiste en obtener compuestos moduladores alternativos de la PDE9A útiles para el tratamiento de trastornos del sistema nervioso central (SNC).

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta solicitud se puede formular así: cómo obtener compuestos alternativos a los divulgados en el documento D1 moduladores de la PDE9A, útiles para el tratamiento de trastornos del sistema nervioso central (SNC).

Ahora bien, dado que el documento D1 divulga que las pirazolopirimidinas sustituidas por 6-arilmetilo son inhibidores selectivos de la fosfodiesterasa PDE9, útiles para el tratamiento de trastornos cognitivos porque mejoran la percepción, la capacidad de concentración y de memoria, y que el documento D1 divulga una selección de compuestos del documento D3 cercanos a los seleccionados en la solicitud, se puede concluir con certeza que una persona del oficio contaba con la sugerencia o motivación razonable para elegir aquellos compuestos que presentaban un perfil de actividad medida en términos de IC₅₀ similar al que se reporta en los documentos D1 y D3, esperando conservar la capacidad de los mismos para tratar enfermedades cognitivas, por lo tanto la selección efectuada por el solicitante no presenta efecto técnico inesperado y se considera

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad.PCT/10-121065

obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 19 no mencionan características adicionales, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

En referencia a los argumentos de la solicitante, según los cuales los compuestos de la solicitud son activos en el tratamiento de deterioro cognitivo como consecuencia de la sustitución con un grupo seleccionado entre: tetrahidropiraniilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, y pirrolidinilo porque logran cruzar la barrera hematoencefálica, este Despacho aclara que los compuestos del documento D1 no presentan como sustituyente en la posición 1 del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidina un grupo tetrahidropiraniilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, y pirrolidinilo como la solicitud en estudio, sin embargo, comparten las demás características técnicas esenciales y son útiles para el tratamiento de deterioro cognitivo de acuerdo con los resultados in vivo del test de ensayo social de reconocimiento en ratas adultas, efectuado para probar la actividad o acción mejorada sobre aprendizaje y memoria (Fl. 19, líneas 7-33) y puesto que el documento D1 divulga que los compuestos fueron administrados a los animales en estudio a través de inyección, una persona del oficio normalmente versada en la materia concluiría sin dificultad que los compuestos del documento D1 atraviesan la barrera hematoencefálica y ejercen su actividad independientemente que el sustituyente en la posición 1 del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidina corresponda a los indicados por la solicitante. Por lo cual, la selección efectuada por el solicitante se considera obvia.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "DERIVADOS DE 1-HETEROCICLILO-1,5-DIHIDRO-PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIDIN-4-ONA Y SU USO COMO MODULADORES DE LA PDE9A".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es)

Página 7 de 8

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1556941175

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
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: 50000

Por la cual se deniega una patente de invención

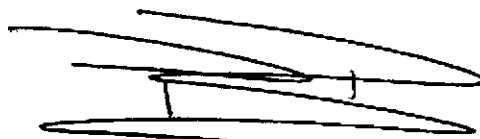
Rad.PCT/10-121065

Boehringer Ingelheim International GMBH, entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) 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 26 Ago 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
cavelier@cavelier.com

Elaboró: Lenin Roberto Guerrero ✓
Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓