

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 10-121065- -4	FECHA: 2012-11-27 13:19:44
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 6
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
cavelier@cavelier.com

Asunto: Radicación: 10-121065- -4
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 22723
Folios: 6

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/EP2009/053907				
Fecha de Presentación Internacional	01/04/2009				

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 369 a 650	30/Septiembre/2010
Reivindicaciones:	Folios 651 a 716	30/Septiembre/2010
Prioridad:	EP 081553987.6	02/Abril/2008

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

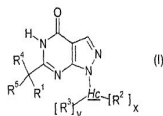
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las

cubiertas por la tasa pagada. Por tal motivo, y teniendo en cuenta la tasa pagada por el solicitante, se estudiará las reivindicaciones 1 a 28 contenidas en los folios 651 a 716.

Título de la solicitud: “derivados de 1-heterociclilo-1,5-dihidro-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona y su uso como moduladores de la PDE9A”.

El problema planteado en esta solicitud 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 la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 487/4

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literal d)

El objeto de la reivindicación 27 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 20 – 25 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Titulo

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque la referencia al uso no debe definir la invención, por lo cual se sugiere al Solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso por cuanto los términos cicloalquilo, cicloalquilalquilo, heteroaril, heterociclil, heterociclilalquilo, heteroarilalquilo, arilo, arilalquenil indicado para cada uno de los sustituyentes R1, R2, R3, R4, R5 y R10 son definidos de manera funcional y no definen indistintamente la materia reivindicada, al señalar un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Por ejemplo para los términos arilo o heteroaril, heterociclil, heterociclilalquilo, heteroaril alquilo, no se define el número de átomos de carbono o de miembros que conforman los anillos, si es monocíclico o bíciclico, y en el caso de hetero no se definen los posibles heteroátomos que los pueden conformar. Es así como, de acuerdo a los ejemplos que soportan la descripción, se encuentra:

- Hc corresponde a tetrahidropiraniilo, tetrahidropirriilo, tetrahidrofuranilo, piperidina, tetrahidrotiofenilo, y preferiblemente corresponde a tetrahidropiraniilo.
- R1 corresponde en mayoría fenilo, cicloalquilo y alquilo C1 a C6.
- R4 y R5 corresponde en su mayoría a H y F.

Por esta razón, se requiere al solicitante definir términos precisos acerca de la naturaleza y tamaño de los sustituyentes del compuesto reivindicado y restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados, considerando por

ejemplo, que para las distintas definiciones de Hc no se observa la misma actividad terapéutica en términos de IC50.

La reivindicación 1 no es clara porque Hc se define como un anillo mono, bi o tricíclico pero en la misma reivindicación se define la sustitución como un monociclo con sus correspondientes características. Se sugiere al solicitante hacer la correspondiente corrección.

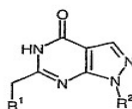
En el capítulo reivindicatorio se encuentra el término solvato, el cual si bien es cierto que es conocido por la persona del oficio medianamente versada en la materia, no encuentra soporte en la descripción con respecto a cómo los compuestos reclamados pueden llegar a formarlos. Se sugiere suministrar la información en la descripción para dar soporte o eliminar este término del alcance del capítulo reivindicatorio.

7. Determinación del Estado de la Técnica

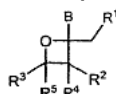
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: abril 02 de 2008 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	WO2004099210	6-arylmethyl-substituted pyrazolopyrimidines	18/Noviembre/2004
D2	WO2005051944	Heterocyclyl-substituted oxetanes for the treatment of proliferative or infectious diseases	09/Junio/2005

El documento D1¹ divulga (resumen) compuestos 6-arilmetil sustituidos de fórmula



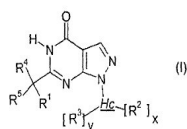
El documento D2² divulga (resumen) un compuesto nucleósido de fórmula



8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en el compuesto de fórmula (I).



(folios 651 a 655)

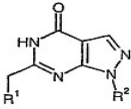
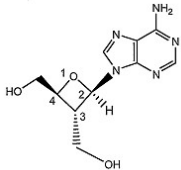
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

¹[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20041118&CC=WO&NR=2004099210A1&KC=A1)

DB=worldwide.espacenet.com&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20041118&CC=WO&NR=2004099210A1&KC=A1

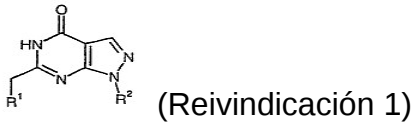
²[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2005051944A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20050609&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP)

CC=WO&NR=2005051944A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20050609&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

Características esenciales		D1	D2
Compuesto de fórmula (I).			
Hc	Heterociclilo mono-, bi- o tri-cíclico cuyos miembros en el anillo son átomos de carbono y al menos 1, preferiblemente 1, 2, o 3, heteroátomos que se seleccionan del grupo de nitrógeno, oxígeno y azufre, que está en forma de -S(O)r siendo r 0, 1 o 2 y es un anillo monocíclico saturado o parcialmente saturado, no aromático y está unido a la estructura química por dicho monocíclico no aromático.	R2 corresponde a arilo o heteroarilo.	oxetano
R1	Alquil C1-8	Alquil C1-8	No se menciona
	Alquenil C2-8	Alquenil C2-8	
	Alquinil C2-8	Alquinil C2-8	
	Alquil C1-6-S-	Alquil C1-6-S-	
	Alquil C1-6-S- Alquil C1-3	Alquil C1-6-S- Alquil C1-3	
	Cicloalquil C3-7	Cicloalquil C3-7	
	Cicloalquil C3-7-Alquil C1-6	Cicloalquil C3-7-Alquil C1-6	
	Cicloalquil C3-7-Alquenil C2-6	Cicloalquil C3-7-Alquenil C2-6	
	Cicloalquil C3-7-Alquinil C2-6	Cicloalquil C3-7-Alquinil C2-6	
	Heterocicloalquil C3-7	Heterocicloalquil C3-7	
	Heterocicloalquil C3-7-alkil C1-6	Heterocicloalquil C3-7-alkil C1-6	
	Heterocicloalquil C3-7-alkenil C1-6	Heterocicloalquil C3-7-alkenil C1-6	
	Heterocicloalquil C3-7-alkinil C1-6	Heterocicloalquil C3-7-alkinil C1-6	
	Arilo	Arilo	
	Arilalquil C1-6	Arilalquil C1-6	
	Arilalquenil C2-6	Arilalquenil C2-6	
	Arilalquinil C2-6	Arilalquinil C2-6	
	Heteroarilo	Heteroarilo	
	Heteroarilalquil C1-6	Heteroarilalquil C1-6	
	Heteroarilalquenil C2-6	Heteroarilalquenil C2-6	
	Heteroarilalquinil C2-6	Heteroarilalquinil C2-6	
R4 y R5	H	H	H

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque

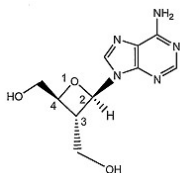
El documento D1 divulga un compuesto Inhibidores de la PDE9A (resumen, Págs. 15 y 16) de fórmula



La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D1 es que la sustitución sobre el nitrógeno del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona corresponde a un heterociclilo no aromático en el compuesto de la invención y arilo o heteroarilo en el compuesto enseñado en el

documento D1.

Por su parte, el documento D2 divulga compuestos análogos de nucleósidos que tienen un anillo de oxetano en lugar del azúcar



(Párrafo 4, Pág. 2)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D2 es la presencia adicional de una sustitución en la posición 6 del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona.

No hay evidencia que la sustitución sobre el nitrógeno del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona por un heterociclilo no aromático presente un efecto o propiedad adicional a lo divulgado por el documento D1 debido a que los compuestos enseñados en el documento tienen actividad inhibitoria de PDE9A con IC50 de 1 a 1200nm (resumen, Págs. 15 y 16, tabla 1).

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “¿cómo modificar el compuesto conocido en D1 para conseguir compuestos alternativos inhibidores de la PDE9A?”.

Sin embargo, la sustitución del nitrógeno del anillo pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona por un heterociclilo no aromático tal como un anillo oxetano ya está divulgada por el documento D2.

En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia tendría una razonable expectativa de éxito de obtener compuestos alternativos inhibidores de la PDE9A, al combinar el conocimiento respecto a la actividad terapéutica de los compuestos enseñados por el documento D1 y la posibilidad de sustituir el anillo pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona por un heterociclilo no aromático, según lo enseñado por el documento D2, llegando así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

9. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2004099210	1 – 28	Nivel Inventivo
D2	WO2005051944	1 – 28	Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2012-12-18

Elaboró: Maria Del Pilar Obando Patiño

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon