

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 10-121065- -12	FECHA: 2014-03-14 18:24:00
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 5
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

Asunto: Radicación: 10-121065- -12
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 3414
Folios: 5

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:	10-021065-00000-0000	30/Septiembre/2010
Reivindicaciones:	10-021065-00006-0000	25/Abril/2013
Prioridad:	EP 08153987.6	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

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 técnico se refiere a la necesidad de proporcionar compuestos moduladores de la PDE9A útiles para el tratamiento de trastornos del Sistema Nervioso Central (SNC), para solucionar este problema la solicitud presenta compuestos derivados de 1-heterocicliilo-1,5-dihidro-pirazolo[3,4-d]pirimidin-4-ona

de la fórmula (I) y composiciones que los contienen.

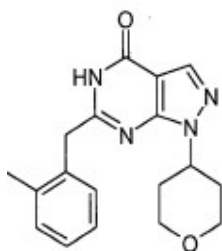
El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K 31/519; A61P 25/00; C07D 487/04

4. De la Solicitud de Patente

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X 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 dado que la solicitud contiene 19, es decir más de diez (10) reivindicaciones y se pagó la tasa complementaria, se estudiarán todas las reivindicaciones presentadas porque fueron cubiertas por la tasa pagada.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa porque menciona un gran número de sustituyentes, siendo que la mayor parte de los compuestos descritos tiene la estructura fenil-pirazolopirimidinona-heterociclo, como por ejemplo el compuesto 2:



Compuesto 2

por lo cual la reivindicación no define un tipo de compuesto particular. De acuerdo con la descripción, tan sólo los compuestos del 'aspecto 18' (Pág. 75) parecen tener actividad, expresada por su IC50 de 1 a 1200 nM (Págs. 146 a 150). Por tanto, se sugiere restringir la solicitud al tipo de compuestos que son activos.

5. 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 invocada, es decir el 02/Abril/2008.

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	WO2004099210	"6-cyclylmethyl- and 6-alkylmethyl-substituted pyrazolopyrimidines"	18/Noviembre/2004
D2	WO2004018474	"Phenyl-substituted pyrazolopyrimidines"	04/Marzo/2004

El documento D1¹ divulga derivados de 6-cyclylmethyl-y 6-alkil-metilo-sustituido pirazolopirimidinas, método para la producción y uso de los mismos para la producción de medicamentos para la mejora de la cognición, concentración, aprendizaje y / o la capacidad de memoria (Pág. 1, Ejs., Pág. 20, reivindicaciones).

¹ http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2004099211&KC=&FT=E&locale=en_EP

El documento D2² divulga nuevas pirazolopirimidinas sustituidas con fenilo, a un método para la producción de los mismos, y a su uso para la producción de medicamentos que sirven para mejorar la percepción, concentración, aprendizaje y / o memoria (Pág. 1, Ejs., Pág. 20, reivindicaciones).

6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

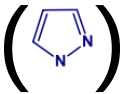
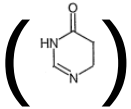
Nivel Inventivo (Art18 D486)

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “*Un compuesto según la fórmula general (I)... en la que **Hc** es seleccionado del grupo de tetrahidropiraniilo... **R¹** se selecciona del grupo de fenilo, 2-,3- y4-piridilo, pirimidilo ...*” (Pág. 12 del radicado 10-121065-00006-0000).

La tabla 1 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.

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga compuestos conformados por la estructura cicloalquilo-pirazolopirimidinona-fenilo y enseña un medicamento destinado a mejorar la cognición, concentración, aprendizaje y / o la capacidad de memoria (Pág. 1, Ejs., Pág. 20, reivindicaciones).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y los compuestos del documento D1 consiste en que tienen el sustituyente fenilo en el anillo pirazolo


 y un sustituyente cicloalquilo en lugar del heterociclo, en el anillo pirimidinona
 
 .

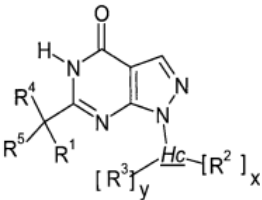
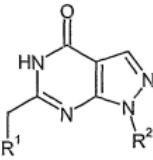
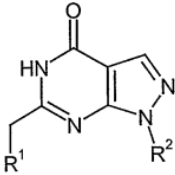
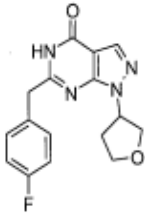
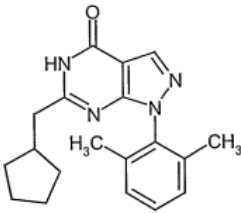
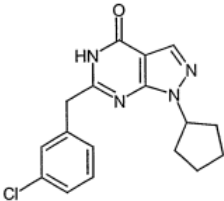
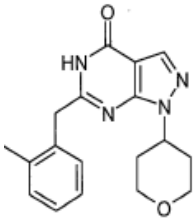
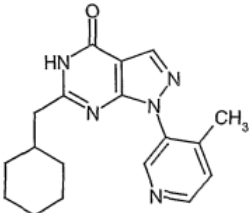
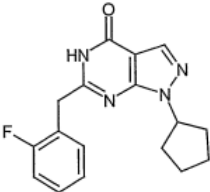
No hay evidencia de que el incluir específicamente el sustituyente fenil sobre el anillo pirazolo proporcione un compuesto con algún efecto técnico diferente al que ya proporcionaba el del documento D1, puesto que el compuesto del documento D1 ya tiene actividad inhibidora de la PDE9A, puesto que la IC₅₀ de los compuestos reivindicados es de 1 a 1200 nM, mientras que la misma actividad de los compuestos divulgados en el documento D1 es IC₅₀ = 5 - 60 nM (Pág. 20).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “¿cómo modificar el compuesto conocido en documento D1 para proporcionar otro compuesto alternativo, inhibidor de la PDE9A?”.

El documento D2 divulga compuestos que tienen la estructura fenilo-pirazolopirimidinona- cicloalquilo y enseña un medicamento destinado a mejorar la cognición, concentración, aprendizaje y / o la capacidad de memoria (Pág. 1, Ejs., Pág. 20, reivindicaciones).

2 http://worldwide.espacenet.com/publicaionDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2004018474A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20040304&DB=&locale=en_EP

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
Reiv 1		
		
Reiv 1	Reiv 1	Reiv 4 y Pág. 10, compuesto Ib
		
Ej. 79	Ej. 1	Ej. 1
		
Ej. 2	Ej 76	Ej. 2
Efecto	Efecto	Efecto
Inhbe PDE9A	Inhbe PDE9A	Inhbe PDE9A
IC50 = 1 - 1200 nM	IC50 = 5 - 60 nM	IC50 = 20 - 62 nM
Págs. 146 a 150	Pág. 20	Pág. 20

En consecuencia, la persona normalmente conocedora de la materia, incluiría un sustituyente heterociclo en los compuestos que se conocen en documento D1, teniendo en cuenta que la estructura continúa manteniendo la misma distribución estérica de las cargas, dado que esta es una consecuencia de los grupos químicos de la estructura y, como se observa en la tabla, estos son semejantes. De hecho, la reivindicación 10 se refiere a compuestos que tienen cicloheptanil en lugar del grupo fenil, de donde se entiende que estos grupos son bioisósteros dado que tanto unos compuestos como los otros mantienen el mismo tipo de actividad. Además, los compuestos alternativos reivindicados, de la misma manera que los compuestos del estado de la técnica, están también destinados a inhibir la PDE9A. Por lo cual la reivindicación 1 de la solicitud se considera obvia.

Dado que las reivindicaciones dependientes 2 a 8 y 10 a 19 no presentan alguna característica adicional que conceda nivel inventivo al objeto de la reivindicación independiente, se considera que tampoco tienen nivel inventivo.

La composición de la reivindicación 9, que se caracteriza porque contiene un compuesto de las reivindicaciones precedentes, no tiene nivel inventivo, dado que aquellos no lo tienen.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2004099210	1 – 19	Nivel Inventivo
D2	WO2004018474	1 – 19	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) días contados a partir del día siguiente 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) días 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 2014-03-18

Elaboró: Olga Rosa Gonzalez Fonseca

Revisó: Consuelo Leguizamon Leguizamon