

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-81349- -6	FECHA: 2013-01-17 08:00:08
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 4
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

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

Asunto: Radicación: 11-81349- -6
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 391
 Folios: 4

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/US2009/006442				
Fecha de Presentación Internacional	07/12/2009				

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 06 a 107	29/junio/2011
Reivindicaciones:	Folios 108 a 130	29/junio/2011
	Folios 142 a 164	15/julio/2011
Prioridad:	US 61/120,441	06/diciembre/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. En el presente caso se estudiarán las reivindicaciones 1 a 20 del capítulo reivindicatorio (Fls. 142 a 164).

Título de la solicitud: “Compuestos orgánicos”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de compuestos que inhiban selectivamente la actividad PDE1, especialmente PDE1A y/o actividad PDE1B.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona una 4,5,7,8-tetrahidro-(opcionalmente 4-tioxo o 4-imino (1H ó 2H)-imidazol [1,2-a]pirazolo[4,3-e]pirimidina opcionalmente substituida ó 4, 5, 7, 8, 8-pentahidro-(1H ó 2H)-pirimido[1,2-a]pirazolo-[4,3-a]pirimidina, en su forma libre o de sal.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C7D 491/0

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

El objeto de las reivindicaciones 7 – 17 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 18 – 19 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Título

El título actual de la solicitud no corresponde con el objeto de la misma porque es amplio y no específico, por lo cual se sugiere al solicitante realizar la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La Reivindicación 1 no es clara ni concisa porque:

1. Reclama dos grupos de pirimidinas de una manera muy amplia, menciona únicamente los nombres de las estructuras de los núcleos de los compuestos que desea reclamar el solicitante, y adicionalmente presenta varias opciones entre cada uno de los núcleos. Se sugiere realizar ajustes al contenido de dicha reivindicación.

La Reivindicación 2 no es clara ni concisa porque:

1. Reclama un compuesto de acuerdo a la formula II, en el cual la opción v) tiene múltiples posibles sustituyentes, y adicionalmente algunas de las funciones allí reclamadas no han sido limitadas por el número de átomos de carbono, lo cual se observa también en la opción vi) y xi).
2. Se sugiere restringir el alcance de la reivindicación 2.

La Reivindicación 3 no es clara ni concisa porque:

1. Reclama un compuesto de acuerdo a la formula I, en el cual la opción v) tiene múltiples posibles sustituyentes, y adicionalmente algunas de las funciones allí reclamadas no han sido limitadas por el número de átomos de carbono, lo cual se observa también en la opción vi) y xi).
2. Se sugiere restringir el alcance de la reivindicación 3.

La Reivindicación 20 no es clara ni concisa porque:

1. Reclama una composición caracterizándole mediante el uso que esta puede tener en el tratamiento de cualquier enfermedad. Se sugiere retirarla del capítulo reivindicatorio.

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque:

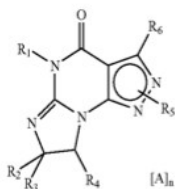
Las reivindicaciones 1, 2 y 3 presentan repetición de la materia reclamada, se sugiere al solicitante aclarar.

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: 06 de diciembre de 2008 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US2008188492	Organic compounds	2008-08-07

El documento D1¹ divulga compuestos 7,8-dihidro-imidazo [1,2-alfa] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4-ona y 7,8,9-trihidro-[1H o 2 / f] pirimido-[1,2-a] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4 (5H)-ona, sustituidos de acuerdo a la formula I y procedimientos para su producción, su uso como productos farmacéuticos, particularmente como inhibidores de PDE1, y farmacéuticas que los comprenden (resumen).



8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 se refiere a una 4,5,7,8-tetrahidro-(opcionalmente 4-tioxo o 4-imno)(1H ó 2H)-imidazo[1,2-a]pirazolo[4,3-e]pirimidina opcionalmente substituida ó 4,5,7,8,9-pentahidro-(1H ó 2H)-pirimido[1,2-a]pirazolo-[4,3-e]pirimidina, en forma libre o de sal.

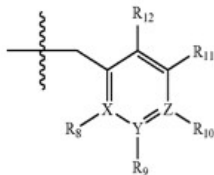
Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Una 4,5,7,8-tetrahidro-(opcionalmente 4-tioxo o 4-imno) (1H ó 2H)-imidazo[1,2-a]pirazolo[4,3-e]pirimidina opcionalmente substituida ó 4,5,7,8,9-pentahidro-(1H ó 2H)-pirimido[1,2-a]pirazolo-[4,3-e]pirimidina, en forma libre o de sal.	Compuestos 7,8-dihidro-[1H o 2H]-imidazo [1,2-a] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4 (5H)-onas o 7, 8, 9-trihidro-[1H o 2H] pirimido [1,2-a] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4 (5H)-onas, sustituidos en la posición 1 o 2 con C2-9 alquilo o C3 -9 cicloalquilo, o heteroarilalquilo opcionalmente sustituido o arilalquilo sustituido, en forma libre, de sal o profármaco (Párr. [0008])

El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos inhibidores de la fosfodiesterasa I (PDEI) que corresponden (Párr. [0009]) a compuestos 7,8-dihidro-[1H o 2H]-imidazo [1,2-a] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4 (5H)-onas y 7, 8,9-trihidro-[1H o 2H] pirimido [1,2-a] pirazolo [4,3-e] pirimidin-4 (5H)-onas, de fórmula I en el que (i) R1 es H o alquilo C1-4 (por ejemplo, metilo); (ii) R4 es H o alquilo C1-4 y R2 y R3 son, independientemente, H o alquilo C1-4 alquil (por ejemplo, R2 y R3 son ambos metilo, o R2 es H y R3 es isopropilo), arilo,

¹ http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2008188492&KC=&FT=E&locale=en_EP

heteroarilo, (opcionalmente hetero) arilalcoxi, o (opcionalmente hetero) arilalquilo; o R2 es H y R3 y R4 juntos forman un di-, tri-o puente tetrametileno (pref. en el que el R3 y R4 juntos tienen la configuración cis, por ejemplo, donde los carbonos que llevan R3 y R4 tienen las configuraciones R y S, respectivamente) ; (iii) R5 es un heteroarilalquilo sustituido, por ejemplo, sustituido con haloalquilo o R5 está conectado a uno de los nitrógenos en la porción de pirazolo de la Fórmula 1 y es un resto de la fórmula A



en la que X, Y y Z son, independientemente, N o C, y R8, R9, R11 y R12 son independientemente H o halógeno; en libre, sal o profármaco del formulario, incluyendo sus enantiómeros, diastereoisómeros y racematos (Párr. [0009] a [0020]).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en el número de hidrógenos sobre el núcleo de la estructura.

El efecto que logra el incluir tal grado de sustitución en la estructura es que logra inhibir la enzima fosfodiesterasa 1 (PDE1), se observa que los compuestos de la presente solicitud parecen lograr una actividad inhibidora IC₅₀ de PDE1 de menos de 1um, 250 nM, 10 nM, 1 nM y de PDE1A de menos de 250 nM (fl 106).

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar los compuestos conocidos en D1 para proveer compuestos alternativos para tratar desórdenes causados por la enzima PDE1.”.

Sin embargo, los compuestos divulgados por D1 revelan una actividad inhibitoria de PDE, IC₅₀ de menos de 1uM a 10 nM.

En consecuencia, dado que los compuestos reclamados conservan la actividad biológica de los compuestos revelados por D1 y que no se observa ningún efecto sorprendente o inesperado, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría modificaciones de las sustituciones en los compuestos de D1 para llegar 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).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 6 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2006133261	1-6	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 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 2013-01-22

Elaboró: Maria Alejandra Sanchez Melo
Revisó: Natalia Lamprea Bermudez