

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:73061

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-081349

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 día 29 de junio de 2011 con el N° 11-081349-0000, por la(s) sociedad(es) Intra-cellular Therapies, Inc., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “COMPUESTOS ORGÁNICOS”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/006442 del 07 de diciembre de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 640 del 15 de marzo de 2012, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 391, notificado por fijación en lista el 22 de enero de 2013, 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° 11-081349-00008-0000 del 29 de mayo de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 5 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.

QUINTO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud se modifica el título de la invención, el cual quedará de la siguiente manera: “COMPUESTOS 4,5,7,8 TETRAHIDRO-(OPCIONALMENTE 4-TIOXO o 4-IMINO)-(1H o 2H)-IMIDAZO[1,2-a]PIRAZOLO[4,3-e]PIRIMIDINA OPCIONALMENTE SUBSTITUIDA o 4, 5, 7, 8, 9 PENTAHIDRO-(1H o 2H)-PIRIMIDO[1,2-a] PIRAZOLO-[4,3-e]PIRIMIDINA COMO INHIBIDORES DE FOSFODIESTERASA 1 (PDE1)”.

SEXTO: 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.*”

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 5 no cumplen con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención.

El problema técnico consiste en la necesidad de proporcionar compuestos inhibidores de fosfodiesterasa 1 (PDE1). Para resolver este problema técnico la solicitud proporciona compuestos derivados de fórmula I junto con composiciones que los contienen.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:73061
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-081349

7.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 06 de diciembre de 2008, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la 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:

Ítem	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US2008188492	“Organic Compounds”	07/Agosto/2008

El documento D1⁽¹⁾ 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 y su uso como productos farmacéuticos, particularmente como inhibidores de PDE1 (Resumen).

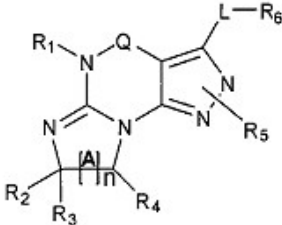
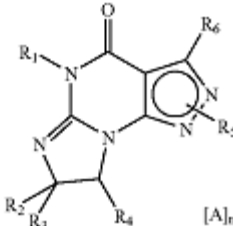
7.3. Nivel Inventivo.

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, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Un compuesto de la fórmula I en donde Q es C(=S) (...)” (Pág. 11 del radicado N° 11-081349-00008-0000).

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 documento D1 que representan el estado de la técnica:

Tabla No 1

Características esenciales	D1
	

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:73061

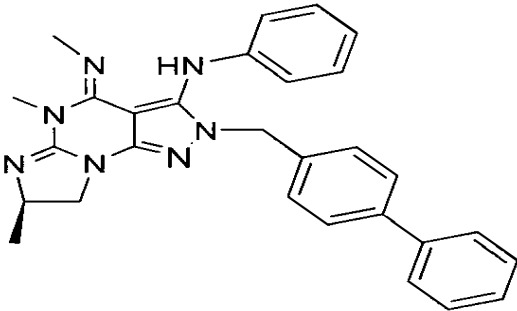
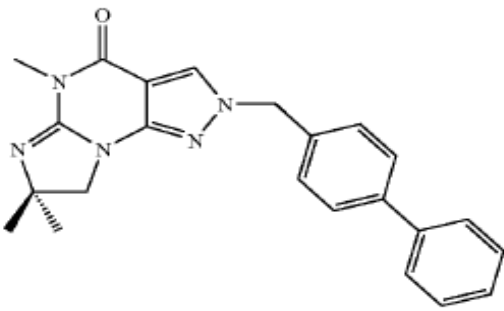
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-081349

Características esenciales	D1
Donde R1, R2, R3 y R4 son hidrógeno	Donde R1, R2, R3 y R4 son hidrógeno (Pág. 22, reivindicación 1)
[An] es C(R13R14), donde R13 y R14 son hidrógeno n=0	[An] es C(R13R14), donde R13 y R14 son hidrógeno n=0 (Pág. 22, reivindicación 1)
Donde Q es C=S	
Donde R5 es Heteroarilalquilo	Donde R5 es Heteroarilalquilo (Pág. 22, reivindicación 1)
 Donde L es un enlace Donde R6 es hidrógeno	 donde R6 es hidrógeno (Pág. 22, reivindicación 1)

Como se dijo anteriormente, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque 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 y su uso como productos farmacéuticos, particularmente como inhibidores de PDE1 (Resumen).

Además, los compuestos reclamados en la presente solicitud guardan similitud química con los compuestos específicos divulgados en el documento D1, de acuerdo a lo presentado en el siguiente cuadro:

Compuesto reclamado Reivindicación 2	Compuesto Ej. 1 (Pág. 13, Párr. 0185)
	

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 73061

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-081349

documento D1 consiste en que el compuesto reclamado presenta las siguientes opciones: C(=S), C(=N(R20)) y metileno en la posición Q, mientras que el compuesto divulgado en el documento D1 en la misma posición presenta un carboxilo.

El efecto que logra el incluir un metileno o C(=S), C(=N(R20)) en la posición Q de la estructura de fórmula I, consiste en que se logran compuestos con actividad inhibitoria de la fosfodiesterasa 1(PDE1) IC50 entre 1µM a 250nM.

El problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: Cómo modificar los compuestos divulgados en el documento D1 para proveer compuestos alternativos con actividad inhibitoria PDE1.

Sin embargo, el documento D1 enseña que sus compuestos presentan una actividad inhibitoria PDE1 IC50 menor a 10nM (Pág. 22, Párr. 0259), mientras que la solicitud define para sus compuestos una actividad inhibitoria PDE1 IC50 menor a 1µM. Los ejemplos 1 y 2 definen una actividad IC50 de menos de 250nm. Por lo anterior, no se observa un efecto técnico sorprendente por parte de la solicitud. Adicionalmente, el remplazo de C(=O) por C(=S), corresponde a la aplicación de los conceptos de bioisosterismo conocidos por la persona normalmente versada en la materia⁽²⁾.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, estaría motivada a modificar en la posición Q las opciones metilo, C(=S), C(=N(R20)) y metileno por el carboxilo, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual la materia reclamada se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 a 5 no mencionan características inventivas, se considera que tales reivindicaciones tampoco tienen nivel inventivo.

La solicitante argumenta que el documento D1 no divulga para la posición Q reemplazos distintos a C=O, mientras que la presente solicitud define para Q las siguientes alternativas C=S, C=N(R20) y CH₂. Al respecto, este Despacho manifiesta que es conocido dentro del estado de la técnica la aplicación del bioisostermismo en el desarrollo de nuevos compuestos con propósitos terapéuticos, donde se enseña que el remplazo C=O y el C=S. Por lo anterior, para una persona normalmente versada en la materia sería obvio este remplazo.

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 “COMPUESTOS 4,5,7,8 TETRAHIDRO-(OPCIONALMENTE 4-TIOXO o 4-IMINO)-(1H o 2H)-IMIDAZO[1,2-a]PIRAZOLO[4,3-e]PIRIMIDINA OPCIONALMENTE SUBSTITUIDA o 4, 5, 7, 8, 9 PENTAHIDRO-

² Lúdia Moreira Lima y Eliezer J. Barreiro, “Bioisosterism: A useful strategy for molecular modification and drug design”, Current Medicinal Chemistry, 2005, 12, 23-49.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:73061

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/11-081349

(1H o 2H)-PIRIMIDO[1,2-a] PIRAZOLO-[4,3-e]PIRIMIDINA COMO INHIBIDORES DE FOSFODIESTERASA 1 (PDE1)".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Intra-cellular Therapies, Inc., 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 29 Nov 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

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

Elaboró: German Antonio Clavijo Cohen
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez