

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

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 4 de junio de 2014, con el N° 14-119455-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Abbvie INC., y Abbvie Deutschland GMBH & CO. KG., entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada “NUEVOS COMPUESTOS INHIBIDORES DE LA FOSFODIESTERASA DEL TIPO 10A”, que corresponde a la solicitud internacional PCT/EP2012/072150 del 8 de noviembre de 2012.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 703 el 21 de agosto de 2014, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: *“Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales. (...) Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente”.*

CUARTO: Que de conformidad con el artículo 45 antes mencionado se realizó el examen de fondo, y se requirió a la(s) solicitante(s) mediante Oficio N° 5732 notificado por fijación en lista el 2 de junio de 2015, para que se pronunciara sobre las objeciones efectuadas a la solicitud en cuanto a la materia reclamada que constituye una excepción a la patentabilidad, falta de claridad y/o concisión de las reivindicaciones, falta de unidad de invención, la necesidad de dividir o limitar la invención a un solo concepto inventivo y la falta de novedad y/o nivel inventivo, de acuerdo con las exigencias de los artículos 14, 15, 18, 20, 25 y 30 de la Decisión 486.

QUINTO : Que la(s) solicitante(s) mediante escrito radicado bajo el N° 14-119455-00008-0000 el 2 de octubre de 2015, respondió (respondieron) oportunamente el requerimiento formulado y presenta(n) nueva(s) reivindicación(es) 1 a 51 que reemplaza(n) la(s) originalmente presentada(s), atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo, argumentado que con este nuevo pliego reivindicatorio se superan las objeciones en

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

cuanto a la excepción a la patentabilidad, la falta de claridad y/o concisión de las reivindicaciones, la falta de unidad de invención, la necesidad de dividir o limitar la invención a un solo concepto inventivo y la falta de novedad y/o nivel inventivo. Adicionalmente, la solicitante presenta el siguiente título modificado: "NUEVOS COMPUESTOS 2-{4-[1-METILPIRIDIN-4-IL-1-H-PIRAZOL-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA Y LA 2-{4-[PIRIDIN-4-IL-1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-1-H-PIRAZOL-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA INHIBIDORES DE LA FOSFODIESTERASA"

Adicionalmente, la(s) solicitante(s) presenta(n) las solicitud(es) divisional(es) radicada(s) bajo el No. 15-234235-00000-0000, el 2 de octubre de 2015, las cuales serán estudiadas en trámites independientes y decididas en los respectivos expedientes.

Sin embargo, la(s) nueva(s) reivindicación(es) 1 a 51 no superan la objeción sobre falta de unidad de invención, por cuanto el capítulo reivindicatorio modificado aún comprende múltiples grupos inventivos toda vez que como se explicó en el requerimiento por Art. 45, los compuestos reclamados mediante la fórmula Markush no comparten una estructura esencial para atribuir una actividad común. Como se indicó, al no existir una estructura común estas fórmulas generales corresponden a conceptos inventivos diferentes. Por lo tanto se requirió a la solicitante para que realizara una generalización racional del alcance de la solicitud con fundamento en la materia ejemplificada y ensayada que evidencie ser una solución real al problema técnico ya que no existe información en la solicitud que evidencie una posesión real del alcance total de la solicitud y tampoco existe información suficiente que direcciona a la persona versada en la materia para desarrollar la solicitud teniendo en cuenta su elevada extensión y a las marcadas variaciones estructurales contempladas por la solicitante que no definen un núcleo común.

El capítulo reivindicatorio de la solicitud tal y como fue presentado o tal como se encuentra modificado, no cumple con el requisito de unidad de invención de conformidad con lo dispuesto en el artículo 25 de la referida Decisión 486, en razón a que allí se establece que *"La solicitud de patente sólo podrá comprender una invención o un grupo de invenciones relacionadas entre sí, de manera que conformen un único concepto inventivo"*. Lo anterior, por cuanto se encuentran nueve grupos inventivos definidos de acuerdo con las siguientes características esenciales:

1. Compuestos en los cuales X^1 es CH, X^3 es $-X^4=C(R^8)$ y composiciones que los contienen
2. Compuestos en los cuales X^1 es N, X^3 es $-X^4=C(R^8)$ y composiciones que los contienen
3. Compuestos en los cuales X^1 es CH, X^3 es $-X^5=C(R^9)$ y composiciones que los contienen
4. Compuestos en los cuales X^1 es N, X^3 es $-X^5=C(R^9)$ y composiciones que los contienen
5. Compuestos en los que A representa (A^1) y composiciones que los comprenden.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

6. Compuestos en los que A representa (A^2) y composiciones que los comprenden.
7. Compuestos en los que A representa (A^3) y composiciones que los comprenden.
8. Compuestos en los que A representa (A^4) y composiciones que los comprenden.
9. Compuestos en los que A representa (A^5) y composiciones que los comprenden.

La solicitud carece del requisito de claridad y/o concisión Art. 30 y 22 de la Decisión 486, debido a que la reivindicación 1 reclama las prodrogas de los compuestos de fórmula (I), sin embargo la descripción no evidencia la obtención real de estos productos, no se presenta direccionamiento suficiente para que la persona versada pueda obtener los profármacos reclamados, no se divulga la estructura química de los profármacos y tampoco se realiza una caracterización fisicoquímica suficiente de los mismos y de su utilidad y ventajas para resolver el problema técnico. En consecuencia, tampoco existe sustento descriptivo para estos productos.

Se reitera que la reivindicación 1 carece de los requisitos de concisión, claridad y sustento descriptivo ya que abarca un indefinido número de agentes, como consecuencia de su elevada variabilidad estructural según lo establecido para cada uno de sus sustituyentes. La solicitud carece de un núcleo central definido por lo cual no es posible determinar el alcance real de la solicitud, ni tampoco se puede realizar una búsqueda con fundamento en una estructura fija principal.

SÉXTO: 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*

SÉPTIMO: Que el (los) 9 grupo(s) inventivo(s) definido(s) en la(s) reivindicación(es) 1 a 51, no cumple(n) con el requisito de nivel inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

7.1. Objeto de la invención.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar un producto útil en el tratamiento de patologías psiquiátricas o neurológicas relacionadas con la fosfodiesterasa tipo 10A.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de la fórmula (I), su método de elaboración y composiciones que los comprenden.

7.2 Determinación del estado de la técnica.

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 9 de noviembre de 2011, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303
Por la cual se deniega una patente de invención

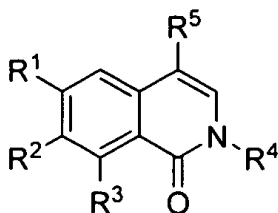
Rad. PCT/14-119455

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	US5.624.922	"Aryl-fused and hetaryl-fused-2,4-diazepine and 2,4-diazocine antiarrhythmic agents "	29/abril/1997
D2	WO2009029214	"Isoquinolone derivatives as phosphodiesterase 10 inhibitors"	5/marzo/2009

D1¹ divulga 2,4-diazepinas aril o heteroaril fusionadas de fórmula XXXVI, benzodiazocinas de fórmula XXX, benzodiazepinas de fórmula II, y arildimetaminas de fórmula XXXVII donde A es un anillo arilo o heteroarilo (Resumen).

D2² enseña isoquinolin-1(2H)-ona útiles como inhibidores PEDEI (Resumen, Reiv. 1):



7.3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

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 y composiciones reclamada(s) en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la(s) reivindicación(es) 1 a 51 está(n) referida(s) a: *"Un compuesto caracterizado porque es de fórmula I..."* (Ver radicado N° 14-119455-00008-0000)

1[https://www.google.com/patents/US5624922?](https://www.google.com/patents/US5624922?dq=US5624922&hl=es&sa=X&ei=tXJTVZz_KYyaNsGPgZAM&ved=0CBoQ6AEwAA)
[dq=US5624922&hl=es&sa=X&ei=tXJTVZz_KYyaNsGPgZAM&ved=0CBoQ6AEwAA](https://www.google.com/patents/US5624922&hl=es&sa=X&ei=tXJTVZz_KYyaNsGPgZAM&ved=0CBoQ6AEwAA)
2<https://www.google.com/patents/WO2009029214A1?cl=en&hl=es>

REPÚBLICA DE COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

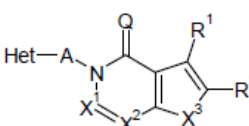
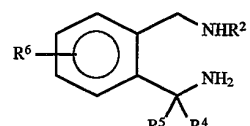
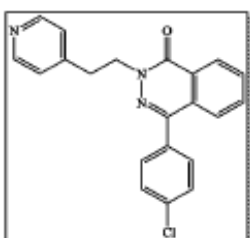
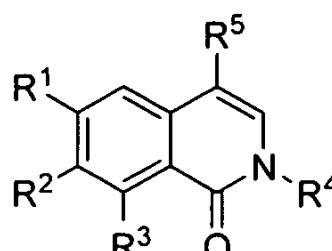
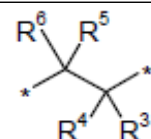
Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la(s) reivindicación(es) 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Nivel Inventivo grupo 1

Tabla 1

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto caracterizado porque es de fórmula (I)  (I)	Compuestos derivados de la fórmula:  Que se encuentran comprendidos dentro del alcance de la presente solicitud. de manera específica divulga el compuesto:  (Col. 143, ejemplo 334).	Compuestos derivados de la fórmula:  Que se encuentran comprendidos dentro del alcance de la presente solicitud. R4 monociclo heterocicloalquil.
Q es O X¹ es CH X² es CR⁷ X³ es -X⁴=C(R⁸)- X⁴ es N o C-R⁹ Het se selecciona de heteroarilo	 (A¹) A representa -(A¹) con la condición adicional de que cuando X³ es X⁴=C(R⁸), uno o dos de los radicales R¹, R⁷ Y R⁹ son una porción Y¹-Cyc¹, Y²-Cyc² o Y³-Cyc³, respectivamente;	También enseña las composiciones que comprenden este compuesto (Col. 167, líneas 18-28)

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

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

El documento D2 enseña derivados de isoquinolinona sustituidos como inhibidores de la fosfodiesterasa (Párr. 00146), esta anterioridad también divulga las composiciones farmacéuticas que comprenden estos agentes (Reiv. 14).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D2 consiste en que la presente solicitud comprende sustituyentes adicionales para todos los radicales y las nuevas modificaciones incluyen condiciones adicionales especificando que cuando X^3 es $X^4=C(R^8)$, uno o dos de los radicales R^1 , R^7 y R^9 son una porción Y^1-Cyc^1 , Y^2-Cyc^2 o Y^3-Cyc^3 , respectivamente y que cuando X^3 es $X^5=C(R^9)$, uno o dos de los radicales R^1 , R^7 y R^9 son una porción Y^1-Cyc^1 , Y^2-Cyc^2 o Y^3-Cyc^3 , respectivamente.

Estas diferencias no parecen conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los agentes reclamados en esta solicitud porque debido a la amplia variabilidad estructural no es posible atribuir la actividad farmacológica señalada por la solicitante al ilimitado número de compuestos reclamados.

El problema técnico objetivo de esta solicitud consiste en la necesidad de agentes terapéuticos alternativos a los divulgados en D2.

Sin embargo, D1 enseña compuestos 2,4- diazepina aril y heteroaril fusionados. De manera específica D1 enseña el compuesto 2-(2-(4-piridinil)etil)-4-(4-clorofenil)-1(2H)-ftalazinona (Ejemplo 334) que se encuentra dentro del alcance de la presente solicitud. De igual forma, D1 divulga las composiciones farmacéuticas que comprenden estos agentes (Col. 167, líneas 18-28). El documento D1 es particularmente relevante debido al hecho de que el núcleo farmacofórico divulgado en este documento se encuentra comprendido dentro del alcance de los grupos cíclicos fusionados objeto de la presente reclamación, indicando que las modificaciones a dicho núcleo puede dar lugar a variaciones en la actividad de los compuesto reivindicados, lo cual evidencia que los ejemplos presentados por la solicitante en la descripción no son representativos para el elevado alcance de la misma teniendo en consideración los efectos en la actividad que evidentemente pueden derivarse producto de dichas modificaciones.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el núcleo modificaciones en la estructura anular propuesta en D2 según las enseñanzas del documento D1 con la expectativa razonable de obtener agentes terapéuticos alternativos. Por lo cual se considera obvia.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y en las reivindicaciones 2 – 51 es obvia y no tiene nivel inventivo.

Respuesta a los argumentos la(s) solicitante(s)

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

Mediante el escrito radicado bajo el número 14-119455-00008-0000, la sociedad solicitante argumenta que los compuestos de fórmula I de la presente reivindicación 1 tienen actividad inventiva porque D2 no se superpone con el alcance de la reivindicación 1. No hay información alguna en el documento D2 que hubiese motivado a una persona versada en la materia proporcionar compuestos que tengan un radical Y¹-Cyc¹ que tiene una porción cíclica, en lugar de un radical pequeño no cíclico.

Con respecto a los anteriores argumentos, esta Superintendencia encuentra que el estado de la técnica representado por los documentos D1 y D2 evaluado de manera conjunta sí provee enseñanzas suficientes para que la persona versada en la materia proporcione los núcleos farmacofóricos reivindicados en la presente solicitud con modificaciones en los radicales que los constituyen, con la expectativa razonable de obtener productos farmacológicamente activos alternativos a los agentes conocidos en D1 y D2. Como se explicó en el examen de patentabilidad, el documento D1 sí es una anterioridad pertinente debido a que comprende anillos cíclicos fusionados como los de los compuestos que son objeto de la presente solicitud, lo cual evidencia que los ejemplos y ensayos presentados por la solicitante son insuficientes para sustentar la afirmación de la misma según la cual todos estos agentes son activos como inhibidores de la fosfodiesterasa tipo 10. En cuanto al argumento de la solicitante relacionado con que no hay sugerencias de compuestos que tengan un radical Y¹-Cyc¹, esta Oficina se permite aclarar que considerando que el radical Y corresponde entre otros a un enlace químico o CH₂, y el grupo Cyc corresponde entre otros a naftilo o fenilo, entonces estos sustituyentes esencialmente pueden ser un grupo fenil, naftil o monociclos saturados o parcialmente insaturados, por lo tanto, es evidente que el documento D1 sí enseña sustituyentes al anillo tricíclico de este tipo, ya que indica que el sustituyente R1, R2 y R3 puede ser entre otros bencil, naftil, o heteromonociclos como piridinil, piperidino, pirrolidino (Reiv. 1). De igual forma, el documento D2 también sugiere la presencia de sustituyentes tipo fenil, naftil o monociclos saturados o parcialmente insaturados ya que indica que el sustituyente R5 que correspondería al sustituyente R7 de la presente solicitud puede ser aril, heteroaril o un anillo heterocíclico monocíclico (Reiv. 1). En consecuencia, el arte previo provee enseñanzas suficientes para que la persona versada en la materia desarrolle los compuestos modificados objeto de la presente solicitud, con la expectativa de obtener agentes terapéuticos alternativos.

Agrega la solicitante que de acuerdo con la presente reivindicación1, el radical que está unido al nitrógeno del núcleo bicíclico fusionado central es un radical A-Het, en donde Het es, hablando ampliamente un radical aromático o heteroaromático, y A es, hablando ampliamente, un conector bivalente, el cual separa a Het del núcleo bicíclico fusionado central por medio de una cadena de carbono de dos miembros. Aunque el radical R4 de la fórmula I de D2 puede ser heteroaralquilo, el cual pareciera abarcar de manera general Het-A en esa posición, el documento D2 no concibe un radical Het-A en esa posición.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

Con respecto a los anteriores argumentos, este Despacho considera que el radical que está unido al nitrógeno en el documento D2 sí sugiere los sustituyentes propuestos por esta solicitud ya que la anterioridad indica que este puede ser un heterocicloalquil monocíclico o un heteroaralquil que pueden contener por lo menos un átomo de nitrógeno o un oxígeno. Por lo tanto debido a que el sustituyente Het-A de la presente solicitud corresponde a una generalidad que abarca un indeterminado número de sustituyentes posibles se considera que los mismos se encuentran sugeridos por la divulgación realizada en D2.

Es importante enfatizar en el hecho de que los compuestos objeto de la presente solicitud son una alternativa obvia que no representa un avance técnico real, toda vez que la solicitud carece de información técnica que evidencie un efecto técnico sorprendente o mejorado con referencia a las enseñanzas contenidas en el arte previo que ya solucionaban la necesidad de agentes inhibidores de fosfodiesterasa tipo 10. De igual forma, los resultados de ensayos presentados por la solicitante no son de ninguna manera representativos de la indeterminada variabilidad estructural reivindicada dejando amplias dudas en relación con la utilidad de los compuestos reivindicados ya que el arte previo evidencia que modificaciones dentro de este mismo grupo farmacofórico pueden dar lugar a compuestos con actividades terapéuticas diferentes. De igual manera, los resultados de ensayo aportados por la solicitante en la descripción de la presente solicitud mediante la tabla 1 (Pág. 278) no permiten establecer una ventaja significativa con respecto a la solución propuesta en D2 ya que los mismos no son comparativos, y las respuestas obtenidas en la presente solicitud indican un amplio rango de actividad (IC_{50} de menos de 500nM) lo cual no se considera un efecto ventajoso.

OCTAVO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud, el título quedará de la siguiente manera: “NUEVOS COMPUESTOS 2-{4-[1-METILPIRIDIN-4-IL-1-H-PIRAZOL-3-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA Y LA 2-{4-[PIRIDIN-4-IL-1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-1-H-PIRAZOL3-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA INHIBIDORES DE LA FOSFODIESTERASA”.

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

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada “NUEVOS COMPUESTOS 2-{4-[1-METILPIRIDIN-4-IL-1-H-PIRAZOL-3-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA Y LA 2-{4-[PIRIDIN-4-IL-1-(2,2,2-TRIFLUOROETIL)-1-H-PIRAZOL3-3-IL]FENOXIMETIL}-QUINOLONA INHIBIDORES DE LA FOSFODIESTERASA”.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No:90303

Por la cual se deniega una patente de invención

Rad. PCT/14-119455

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Abbvie INC., y Abbvie Deutschland GMBH & CO. KG, 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 diez (10) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚMPLASE

Dada en Bogotá D.C., el 23 Nov 2015

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, sic@castellanosyco.co

Elaboró: Emilse Cano Urrego
Revisó: Rubiela Pacanchique Vargas
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez
Aprobó: José Luis Londoño FernÁndez