

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

Señor(a)
SAGE THERAPEUTICS INC.

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “**ESTEROIDES NEUROACTIVOS C21 SUSTITUIDOS**”
NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US2015/056054
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 16 de octubre de 2015.
PRIORIDAD: US 62/064,961 del 16 de octubre de 2014

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

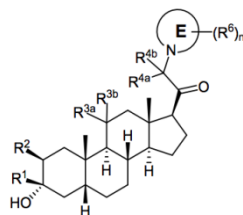
Se aceptan las modificaciones radicadas al capítulo reivindicatorio radicadas el 21 de marzo de 2019, bajo el número NC2017/0004649, por ajustarse a los requisitos legales.

2. Objeto de la invención

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, 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 al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486. Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 36 del radicado N° NC2017/0004649 del 21 de marzo de 2019.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de esteroides neuroactivos nuevos y mejorados que actúen como agentes moduladores de la excitabilidad cerebral, así como agentes para la prevención y el tratamiento de enfermedades relacionadas con el SNC.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos de la fórmula I-a y II-a1 y composiciones que los comprenden.



Fórmula II-a1

3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 16 de octubre de 2014 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

sustituido, carbociclilo sustituido o no sustituido, o arilo sustituido o no sustituido, o R ^{C6} y R ^{D6} junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un carbociclilo sustituido o no sustituido de 3-6 miembros o un anillo heterociclilo sustituido o no sustituido;		
R ¹ es metilo, o metoximetilo;	-CH ₃ (pág. 9 línea 8)	R ¹ es aralkinil, arilalkil, arilalkenil, aril (reiv. 1)
R ² es hidrógeno, o -OR ^{A2} , donde R ^{A2} es alquilo C ₁₋₆ sustituido o no sustituido;	-H (pág. 9 línea 8)	R es -H (reiv. 1)
R ^{3a} es hidrógeno o -OR ^{A3} , donde R ^{A3} es hidrógeno, alquilo C ₁₋₆ sustituido o no sustituido;	-H (pág. 9 línea 8)	R ² es -H (reiv. 1)
R ^{3b} es hidrógeno;	-H (pág. 9 línea 8)	Sobre el C11 del anillo es -H (reiv. 1)
R ^{4a} es hidrógeno, o metilo,	-H (pág. 9 línea 8)	Definido dentro de R ³ heteroarilacetil (reiv. 1)
y R ^{4b} es hidrógeno o metilo.	-H (pág. 9 línea 8)	

El documento D2 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga el compuesto 3 α -hidroxi-21-(2'H'-1,2,3,4-tetrazol-2'-il)-3 β -pregnan-20-ona (pág. 9 línea 8) útil para modular el receptor GABA (pág. 9 línea 8)

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado de D2 consiste en que el compuesto de fórmula II-a1 comprende los sustituyentes tipo heteroaril con 2 a 4 heteroátomos en la posición 21 del pregnano.

No se evidencia efecto técnico para todos los compuestos contenidos por la fórmula II-a1 ya que el documento D2 muestra que compuesto 3 α -hidroxi-21-(2'H'-1,2,3,4-tetrazol-2'-il)-3 β -pregnan-20-ona presenta un IC₅₀ de 46 nM en ensayos de modulación del receptor GABA. Solo puede ser reconocido el efecto técnico para los compuestos que muestren mejoras respecto del estado de la técnica, es decir, menores IC₅₀ respecto del compuesto 3 α -hidroxi-21-(2'H'-1,2,3,4-tetrazol-2'-il)-3 β -pregnan-20-ona.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el compuesto de 3 α -hidroxi-21-(2'H'-1,2,3,4-tetrazol-2'-il)-3 β -pregnan-20-ona conocido en D2 con el fin de obtener compuestos alternativos para modular el receptor GABA?

Sin embargo, el incluir sustituyentes tipo heteroaril que contienen 2 a 4 heteroátomos ya está divulgado en el documento D1 que se refiere a un compuesto derivado del pregnano que en su posición 21 comprende sustituyentes heteroaril definidos como sustituyentes cíclicos de 5 a 14 miembros no saturados que contienen 1, 2, 3 o 4 átomos de O, N, o S que contienen 6, 10 o 14 electrones π deslocalizados en uno o más anillos (reiv. 1).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir sustituyentes tipo heteroaril que contienen 2 a 4 heteroátomos del documento D1 en el compuesto de D2, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

Las reivindicaciones dependientes 2 a 36 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

5. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO1995021617	1 a 36	Nivel inventivo
D2	WO9805337	1 a 36	Nivel inventivo

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

Argumentos respecto al examen de novedad y nivel inventivo

El solicitante afirma que la nueva reivindicación 1 y sus reivindicaciones dependientes son novedosas y se encuentran dirigidas al compuesto de la fórmula (II-a1) que poseen simultáneamente un hidrógeno en configuración β en la posición C5, y la sustitución de R6 en el anillo E unido por nitrógeno, y un metilo o metoximetilo en C3. Por lo anterior, ninguno de los compuestos divulgados en D1 o D2 posee al mismo tiempo estas características. Del mismo modo, los compuestos ejemplares de las nuevas reivindicaciones 22-35 también son nuevos. Por lo tanto, D1 y D2 no enseñan ni divulgan los compuestos de las actuales reivindicaciones.

Se aclara que de acuerdo a las modificaciones presentadas, el compuesto de fórmula II-a1 tal como se define en el capítulo reivindicatorio, cumple con el requisito de novedad frente a los documentos D1 y D2.

El solicitante afirma que ninguno de los documentos D1 y D2 contienen enseñanza alguna que indique que la selección de los sustituyentes definidos en la nueva reivindicación 1 para el compuesto de la fórmula II-a1 conduciría a desarrollar compuestos que tengan actividad moduladora del receptor GABA. El solicitante afirma que ha demostrado que los compuestos reivindicados por la presente solicitud tienen una actividad moduladora del receptor GABA, tal y como los demuestran los ejemplos de la presente solicitud. En particular, los datos de CI50 para los compuestos de la presente invención fueron obtenidos por medio de ensayos de unión de TBPS. Por tanto, el solicitante declara que el compuesto de Fórmula (II-a1) descrito en las reivindicaciones 1 a 36 de la presente solicitud representa un avance inventivo para el desarrollo de compuestos con actividad moduladora del receptor GABA, al que la persona del oficio normalmente versada en la materia no habría podido llegar de manera obvia simplemente a partir de las enseñanzas contenidas en el arte previo.

Es importante aclarar que no todos los compuestos de la invención presentan un efecto técnico que mejore el estado de la técnica representado por el compuesto 3 α -hidroxi-21-(2'H'-1,2,3,4-tetrazol-2'-il)-3 β -pregnan-20-ona. De acuerdo a dichas enseñanzas, se consideraría que existe un efecto técnico superior en los compuestos que disminuyan el IC₅₀ en ensayos de modulación del receptor GABA. Por lo anterior, no se consideran inventivos los compuestos de la fórmula II-a1 contenidos en la reivindicación 1 y sus dependientes.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

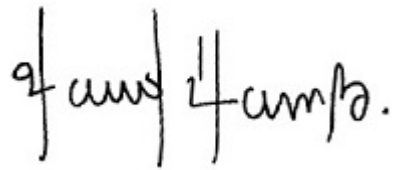
Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



MARÍA JOSÉ LAMUS BECERRA
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES



REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2017/0004649		1°		2°		3°	X	Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/US2015/056054		16 de octubre de 2015							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
16/10/2014				X					
Solicitante									
SAGE THERAPEUTICS INC.									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1-36
Palabras clave utilizadas	GABA, PREGNAN-20-ONE 5-BETA 21-HETEROARYL
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: A01N 51/00
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
ISA	WO1995021617 WO9805337	17/08/1995 12/02/1998	1 A 36 1 A 36	pág. 9 línea 8 Reiv. 1	Y Y
(1) Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen(Número), pp-pp.					
O					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.					
(2) Categorías de documentos citados					
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O,X, O,Y o bien O,A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada. “T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.					

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 2748 de 20 de mayo de 2019

Ref. Expediente N° NC2017/0004649

Fecha del reporte de búsqueda: 09/05/2019
Examinador: JUAN NICOLAS TARQUINO CHIA