

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE
office@olartemoure.com

ASUNTO	Radicación	10 070 365
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	12 - 19663

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☒ Cap. II ☐
No. Solicitud Internacional PCT/EP2008/067220			
Fecha de Presentación Internacional 10/Diciembre/2008			

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 180 a 378	10/Junio/2010
Reivindicaciones:	Folios 379 a 424	10/Junio/2010
	Folios 449 a 476	20/Septiembre/2010
Prioridad:	US 61/013.122	12/Diciembre/2007
	US 61/024.709	30/Enero/2008

2. Análisis de la Prioridad

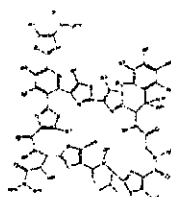
Se acepta la reivindicación de prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "AMINOTIAZOLES Y SUS USOS".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar nuevas clases estructurales de antibióticos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I) y composiciones que lo contienen.



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 417/04; A 61 P 31/00; A 61 K 31/471.

4. De la Solicitud de Patente

Observaciones generales

La materia reclamada en la presente solicitud se superpone con la materia reclamada en la solicitud en trámite CO08125888, razón por la cual se sugiere al solicitante delimitar el alcance de la presente solicitud de tal manera que no se superponga con dicha solicitud.

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque la denominación aminotriazoles es general, por lo cual se sugiere al Solicitante el título: compuestos macrocíclicos derivados de aminotriazol como antibióticos.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa por cuanto el término alquilo indicado para los sustituyentes R2a, R2b, R4a, R4b y R5 no define el número de átomos que lo conforman y en el caso del término para el sustituyente R2a es sustituido o no sustituido pero no define la naturaleza y cantidad de sustituciones a lugar; el término heterociclo-alquileo indicado para el sustituyente Z no define los posibles heteroátomos que lo pueden conformar, configurando ilimitadas opciones que no tienen soporte en el capítulo descriptivo. Es así como, de acuerdo a los ejemplos que soportan la descripción, se encuentra:

- R3 corresponde a H
- R12 corresponde a $-\text{CH}_2\text{OCH}_3$
- R2a corresponde a OH
- R2b corresponde a H
- R4a corresponde a H
- R4b corresponde a metilo
- R5 corresponde a H
- R1 corresponden a H o la definición de la reivindicación 4 (fórmula 4) donde Z corresponde a alquilo de 1 a 10 átomos
- R1a corresponden la definición de la reivindicación 4 (fórmula 4)

Por esta razón, se requiere al solicitante definir términos precisos acerca de la naturaleza y tamaño de los sustituyentes del compuesto reivindicado y restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado ó probado, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

En el capítulo reivindicatorio se encuentra el término n-óxido, el cual si bien es cierto que es conocido por la persona del oficio medianamente versada en la materia, no encuentra soporte en la descripción con respecto a cómo los compuestos reclamados pueden llegar a formarlos ni en qué punto de la estructura química

pueden formarse. Se sugiere suministrar la información en la descripción para dar soporte o eliminar este término del alcance del capítulo reivindicatorio.

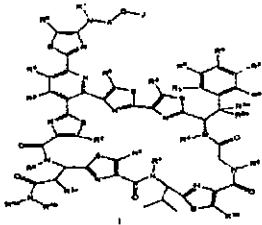
La reivindicación 5 no tiene soporte en la descripción por cuanto lo ejemplos suministrados en el capítulo descriptivo no muestran compuestos de acuerdo a la fórmula V. Se sugiere suministrar la información en el capítulo descriptivo para dar soporte o eliminar dicha reivindicación.

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: Diciembre 12 de 2007 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Prioridad
D1	CO 08 125888	Derivados de amino-tiazol y sus usos como agentes antibacterianos	31/Mayo/2006

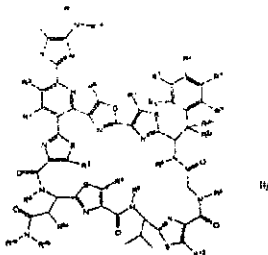
D1 divulga (folios 487 a 493, reivindicación 1) un compuesto de fórmula



6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de fórmula I



(folios 449 y 450)

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

Características esenciales		D1
compuesto de fórmula I		Compuesto de formula
R1	-Z-CO2H	Alquil-J (definido como CO2H)
R1a	H	H
	A-Z-CO2H	A-G- CO2H

R1 y R1a tomados en combinación forman un heterociclo saturado, parcialmente saturado o aromático, que tiene 4 a 7 átomos del anillo, que tiene 0 a 3 átomos heterogéneos adicionales del anillo seleccionados a partir de N, O y S, en donde el heterociclo está sustituido por cuando menos dos residuos seleccionados independientemente a partir de CO₂H, -Z-CO₂H y A-Z-CO₂H		Compuesto de fórmula
--	--	-----------------------------

En donde R1 se define como Alquil-J, y J a su vez es definido como CO2H; R1 a se define como hidrógeno o A-G-CO2H; A se define como C(O), C(O)O, C(O)NR8a, SO2, SO, C(H)=N, SO2NR8a y SONR8a; Z que corresponde a G y se define [C(Ra)(Rb)]x, cicloalquil, heterocicli, aril, heteroaril, H y C(Ra)(Rb)]x-O-[C(Ra)(Rb)]; R2a se define como H, alquilo sustituido o no sustituido, OH, OR4a, OC(O)R4a, OC(O)NR4a y N(R4a)2; R2b se define como ausente, H o alquilo; R2a y R2b pueden forman juntos =O o =NH; R3 y R12 se definen como H, halógeno, OR4b, G-J N(R8a)2; R4a se define como H o alquilo; y R4b se define como alquilo o (CH2CH2-O)n en donde n corresponde a un integral de 1-500, 1000, 2000,3000, 4000, 5000, 10000, 20000, 30000, 40000, 50000 o 60000 o una plralidad de enteros que tienen un valor de 1-500, 1000, 2000,3000, 4000, 5000, 10000, 20000, 30000, 40000, 50000 o 60000. (reivindicacion 1, folios 491 a 493)

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 2 – 10 no mencionan alguna característica que haga nueva el compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

7. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO 08 125888	1 – 10	Novedad

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 para dar respuesta y presentarla por escrito.

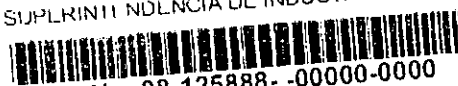
Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 30 OCT. 2012

Elaborado por: María del Pilar Obando Patiño.
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 



No. 08-125888-00000-0000

Fecha: 2008-11-26 15:55:45 Dep. 2020 NUCLEACION
Ira 11 PATENTE IYII Evt: 378 FASE NACIONAL
Act 411 PRESENTACION Folios: 375PETITORIO - FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD
PATENTE PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

P2008/000179

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención.

☐

Patente de Modelo de Utilidad.

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)Nombre: NOVARTIS AGDirección: Lichtstrasse 35, CH-4056 BaselNacionalidad o Domicilio: SuizaLugar de Constitución: Suiza

Teléfono: _____ Fax: _____

E-mail: _____

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

REPRESENTANTE
O APODERADONombre: CARLOS R. OLARTEDirección: World Trade Center Torre A,
Calle 100 No. 8A-37 Piso 10Teléfono: 601-7700 Fax: 601-7799E-mail: office@olarteraisbeck.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 79.782.747BtaTP 74.295INVENTOR (ES)
(72)Nombre: VER PAGINA ADJUNTADirección: VER PAGINA ADJUNTA

Nacionalidad o Domicilio: _____

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/US2007/012768Fecha Mayo 30, 2007Publicación Internacional No. WO 2007/142986Fecha Diciembre 13, 2007

6

Título (54) DERIVADOS DE AMINO-TIAZOL Y SUS USOS COMO AGENTES
ANTIBACTERIANOSClasificación Internacional (51) C07K 5/06, A61K 38/00, A61P 31/00

Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

US

(32) Fecha

Mayo 31, 2006

(31) Número de
Solicitud

60/809,693

Comprobante de pago No. 08-88,102Fecha Noviembre 10 de 2008

10

ANEXOS

☒

Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.

☒

Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.

☒

Poderes, si fuere el caso. Adjunto copia simple ver expediente No. 07-026393

☒

Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. *Declaración 4.17 bajo la Regla del PCT.*

☐

Declaraciones.

☒

Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).

☒

Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).

☐

Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).

☐

Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.

☐

De ser el caso, copia del contrato de acceso.

☐

De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.

☐

De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.

☐

Arte final 12 x 12.

☐

De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.

☐

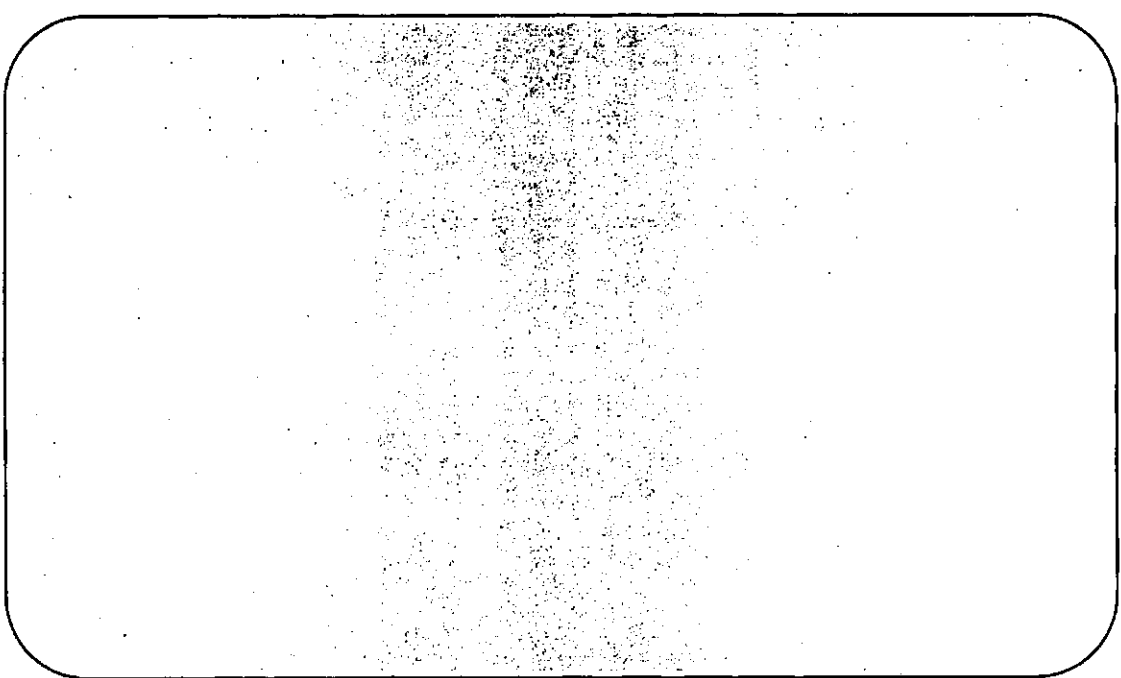
De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.

☒

Otros. Búsqueda Internacional, Secuencias.

11

FIGURA CARACTERÍSTICA:



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: CARLOS R. OLARTE

FIRMA: *[Signature]*

C.C. 79.782.747 Btá T.P. 74.295

LISTA DE INVENTORES

PCT/US2007/012768

1. **Matthew J. LAMARCHE**,
11 Keith Road, Reading,
Massachusetts 01867
Estados Unidos
Nacionalidad: Estadounidense
2. **Simon BUSHELL**,
124 King Street, Unit B, Boston,
Massachusetts 02122
Estados Unidos
Nacionalidad: Británico
3. **Michael A. PATANE**,
273 Forest Street, Reading,
Massachusetts 01867
Estados Unidos
Nacionalidad: Estadounidense
4. **Lewis WHITEHEAD**,
35 Elmwood Road, Swampscott,
Massachusetts 01907
Estados Unidos
Nacionalidad: Británico

DERIVADOS DE AMINO-TIAZOL Y SUS USOS COMO AGENTES ANTIBACTERIANOS

Antecedentes

5 Desde el descubrimiento de la penicilina, las compañías farmacéuticas han producido un número de agentes anti-bacterianos para combatir una amplia variedad de infecciones bacterianas. En los pasados varios años, ha habido un rápido surgimiento de resistencia bacteriana a varios de estos antibióticos. La resistencia a

10 múltiples fármacos entre estos patógenos bacterianos también puede deberse a la mutación que conduce al aislamiento clínico más virulento. Tal vez la presentación más perturbadora ha sido la adquisición de resistencia a vancomicina, un antibiótico generalmente considerado como el agente de último recurso para las

15 infecciones gram-positivas graves.

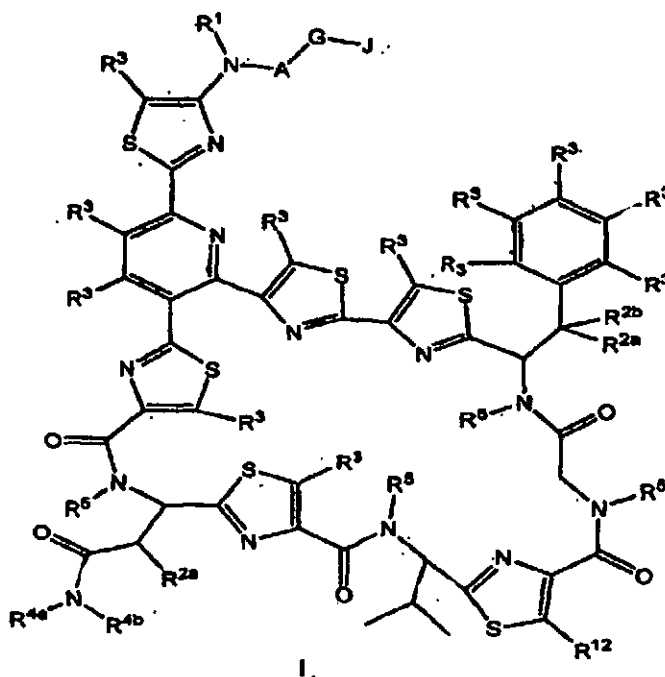
Esto es cierto en especial en algunos grupos de patógenos gram-positivos, tales como *staphylococci*, *pneumococci*, y *enterococci* (S. Ewig y colaboradores; Antibiotika-Resistenz bei Erregern ambulant erworbener Atemwegsinfektionen (resistencia a

20 antibióticos en patógenos de infecciones del tracto respiratorio adquiridos por pacientes externos); Chemother. J. 2002, 11, 12-26; F. Tenover; Development and spread of bacterial resistance to antimicrobial agents: an overview; *Clin. Infect. Dis.* 15 de septiembre de 2001, 33 Suplemento 3, 108-115), así como *Staphylococcus*,

25 *Streptococcus*, *Mycobacterium*, *Enterococcus*, *Corynebacterium*,

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la Fórmula I:



15 y sales farmacéuticamente aceptables, enantiómeros, estereoisómeros, rotámeros, tautómeros, diaestereómeros, atropisómeros, o racematos del mismo, incluyendo el N-óxido de piridina del mismo;

en donde:

20 A se selecciona a partir del grupo que consiste en un enlace, H, $-(CH_2)-$, $-C(\text{alquilo})_2-$, $-(CH_2)_{1-8}-$, $[C(\text{alquilo})_2]_{1-8}-$, $-(\text{cicloalquilo})-$, $-(\text{arilo})-$, $-(\text{heteroarilo})-$, $-C(O)-$, $-C(O)C(O)-$, $-C(O)O-$, $-C(O)N(R^{8a})-$, $-S(O)_2-$, $-S(O)-$, $-S(O)_2N(R^{8a})-$, $-S(O)N(R^{8a})-$, $-C(=NR^8)N(R^{8a})$, $-C(=NR^8)N(R^{8a})C(O)-$, $-C(=NR^8)-$, $-C=C-C(O)-$, $-C=C-C(O)O-$, $-C=C-C(O)N(R^{8a})-$;

alquilo y $-(\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O})_n\text{-R}^9$, en donde n es un entero de 1 a 500, 1,000, 2,000, 3,000, 4,000, 5,000, 10,000, 20,000, 30,000, 40,000, 50,000, ó 60,000, o es un promedio de una pluralidad de enteros que tienen un valor de 1 a 500, 1,000, 2,000, 3,000, 4,000, 5,000, 10,000, 20,000, 30,000, 40,000, 50,000, ó 60,000;

R^5 se selecciona a partir del grupo que consiste en H, alquilo, y R^{4b} ;

R^8 se selecciona a partir del grupo que consiste en H, CN, NO_2 , alquilo, cicloalquilo, y SO_2 -alquilo;

10 R^{8a} está ausente, o se selecciona a partir del grupo que consiste en H, $-(\text{alquilo})-$, $-(\text{cicloalquilo})-$, $-\text{C}(\text{alquilo})_2\text{-J}$, $-\text{R}^{4b}$, en donde R^{8a} también puede ciclarse con el átomo con el que está enlazado R^{8a} para formar un anillo de 3, 4, 5, 6, ó 7 miembros, que es aromático o no aromático, y puede contener uno o más

15 heteroátomos, en donde el anillo puede estar adicionalmente sustituido una o más veces con sustituyentes que sean iguales o diferentes; y

R^9 se selecciona a partir del grupo que consiste en H, alquilo, y $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$.

20 2. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^{2b} , R^{4b} , y R^5 son H, y R^{4a} es CH_3 .

3. El compuesto de la reivindicación 1, en donde R^{2b} , R^{4b} , y R^5 son H, R^{4a} es CH_3 , y R^{12} es $\text{CH}_2\text{-O-CH}_3$.

4. El compuesto de la reivindicación 1, en donde la Fórmula

25 I está representada por un compuesto de la Fórmula II: