

HUMBERTO RUBIO & CIA.

ABOGADOS

Cra. 7a # 74 – 64 Oficina 506
Tel: (571) 3132408 – 3132423 - 3132410 - 3131759
Fax: (571) 3131647 - 3132367
E-mail: rubiolaw@cable.net.co
Apartado Aereo 21848
Bogota, D.C. - Colombia

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRI

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRI

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-027711- -00017-0000

Fecha: 2013-12-27 15:21:59 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 19

Re: Expediente No. **11-027711**
Patente de Invención: **“COMPUESTOS DE
TETRACICLINA SUSTITUIDOS
CON FLÚOR EN C7”**
Solicitud Internacional: **PCT/US2009/053142**
Clasificación Internacional: **C07C 237/26, C07D 205/04**
Titular: **TETRAPHASE
PHARMACEUTICALS, INC.**

**RESPUESTA A REQUERIMIENTO OFICIO NO. 15697 NOTIFICADO POR
FIJACION EN LISTA DE 27 DE AGOSTO DE 2013.**

HUMBERTO RUBIO CAMACHO, mayor de edad, domiciliado en Bogotá, D.C., con la Oficina 506 de la Carrera 7 No. 74-64 de ésta ciudad, Abogado en Ejercicio, portador de la Tarjeta Profesional No. 50.007 expedida por el Consejo Superior de la Judicatura, actuando en carácter de apoderado de la sociedad **TETRAPHASE PHARMACEUTICALS, INC.**, domiciliada en 480 Arsenal Street, Suite 110, Watertown, Massachusetts 02472, Estados Unidos de America; reconocido por su despacho y encontrándome dentro del término legal para dar contestación al auto proferido por su Despacho mediante Oficio No.15697, notificado por Estado de 27 de agosto de 2013, y cuya prorroga de termino fue radicado ante su Despacho el 12 de noviembre de 2013, me permito:

Manifestar:

I- En el informe oficial expedido contra la presente solicitud, se han emitido las objeciones que a continuación se resumen:

1. **Excepción a la Patentabilidad** (Art 20 D 486 literal (d).

El objeto de las reivindicaciones 3 no es patentable de acuerdo con el Art citado, porque se refiere al método de tratamiento realizado con el compuesto reclamado en la reivindicación 1.

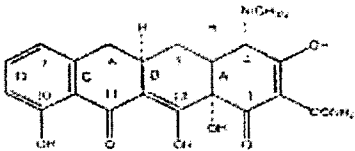
2. **Determinación del Estado de la Técnica**

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: agosto 08 de 2008, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Titulo	Fecha de Publicación*
D1	EP0582789	Novel 7-(substituted)-8-(substituted)-9-(substituted glycyl) amido-6-demethyl-6-deoxytetracyclines	Febrero 16 de 1994
D2	*Artículo	Tetracycline Antibiotics: Mode of action, Applications, Molecular Biology, and epidemiology of Bacterial Resistance	Junio de 2001

D1 divulga nuevos compuesto derivados 6 demetil, 6 deoxy tetraciclinas sustituidos 7, 8 y 9 y sus composiciones, los cuales tienen efecto como antibióticos frente a microorganismos resistentes a las tetraciclinas.

D2 divulga diferentes miembros de las clases de tetraciclinas, cuyo grupo farmacóforo es:



y tienen actividad antibacterial frente a organismos resistentes a tetraciclinas.

3. **Examen de Patentabilidad** (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art 18 D486)

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

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el compuesto de D1 consiste en la presencia de un grupo metilo en la posición 6 y que no está sustituido en la posición 8.

Adicionalmente, la presencia de un grupo metilo en la posición 6 y la no sustitución en la posición 8, ya está divulgada en los compuestos del documento D2, que se refiere a derivados de tetraciclinas, que en la posición 7 tienen un cloro en lugar del flúor en la posición 7 del compuesto reclamado, el grupo protector ConHCH₂-N en la posición 2 en lugar de la posición 9 del compuesto reclamado, sin embargo dichos compuestos presentan actividad antibiótica sobre microorganismos resistentes a dicha tetraciclinas.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría el grupo metilo en la posición 6 y no sustituiría la posición 8 de acuerdo a lo divulgado en los compuestos del documento D2, en el compuesto de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud, Por lo cual se considera obvia.

Puesto que la reivindicación dependiente 2 no menciona características inventivas adicionales, tampoco se puede considerar inventiva.

3. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP0582789	1-2	Nivel inventivo
D2	*Artículo	1-2	Nivel inventivo

II.- En contestación a las observaciones anteriores, manifestamos lo siguiente:

2.1. Consideraciones

Antes de responder el informe técnico emitido por esa Entidad, debo manifestar que mi representada y el suscrito nos encontramos totalmente desconcertados y sorprendidos y rechazamos el absurdo proceder de las

examinadoras Dra. Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer y Dra. Gloria Jacqueline Alfonso Roza, con la emisión de esta desacertada acción oficial, pues viola entre otros, los principios de seguridad jurídica y uniformidad de los actos administrativos, por los motivos que me permito exponer:

- a. Mi poderdante radico ante esa entidad la Fase Nacional PCT el día 7 de marzo de 2011.
- b. Mediante solicitudes radicadas el 8 de marzo de 2011 y 6 de octubre de 2011, ante ese Despacho, se presentó modificación voluntaria al capítulo reivindicatorio.
- c. El extracto de la solicitud fue publicado en la Gaceta Oficial No. 635 de 20 de diciembre de 2011.
- d. Contra dicha publicación NO fueron presentadas oposiciones.
- e. Mediante escrito presentado ante su Despacho el 8 de mayo de 2012, se solicitó la examinación de la solicitud.
- f. Mediante Resolución No. 74812 de 30 de noviembre de 2012, su Despacho decide CONCEDER PARCIALMENTE la solicitud de patente.
- g. Estando dentro del término legal por intermedio del suscrito, mi representada recurrió dicha Resolución por no estar de acuerdo con la denegación de la reivindicación 3.
- h. Mediante Resolución 37045 se revoca la Resolución No.74812, enviando el expediente para un nuevo examen de patentabilidad.

Ahora, por intermedio de las examinadoras mencionadas anteriormente, su Despacho considera que la patente que fue otorgada a mi poderdante en noviembre de 2012, y cuya novedad y nivel inventivo se encuentran en vigor desde la fecha señalada en la solicitud de patente, sorpresivamente ahora se ve afectada por los Documentos D1 y D2, es decir como si dicha solicitud se estuviera tramitando en otra entidad diferente a la que profirió la concesión, procedimiento que consideramos totalmente inapropiado, por las razones siguientes:

- En primer lugar, antes de emitir una denegación directa de la reivindicación 3, y como ya manifestamos en nuestro recurso del 14 de Enero del 2013, las examinadoras estaban en la obligación de emitir su opinión sobre la supuesta no patentabilidad de la misma mediante un oficio, de manera que

mi mandante tuviera oportunidad de eliminarla y adecuar el alcance de su solicitud a la materia que él considerara pertinente incluir en la misma, basándose en la solicitud como se presentó inicialmente, para lo cual había pagado sus tasas oficiales oportuna y apropiadamente.

- En segundo lugar, si en una primera actuación las examinadoras encontraron patentables las reivindicaciones 1 y 2, lo que las llevó a concederlas directamente sin emitir objeción alguna contra las mismas, no resulta para nada coherente el análisis ahora proferido por su Despacho y sus representantes los examinadores, que en esta oportunidad consideren que dichas reivindicaciones carecen de nivel inventivo. Con esta actuación se está simplemente pisoteando el principio de seguridad jurídica.
- En tercer lugar consideramos que la autoridad de examen está en la obligación de, si un examinador sin experiencia realiza un análisis inapropiado de una solicitud de patente y llega a conclusiones erróneas sobre la misma, que al menos el revisor de ese análisis tenga el conocimiento y la pericia adecuados para poder detectar esto oportunamente, y no permitir que estos errores afecten a los solicitantes, entorpeciendo innecesariamente el procedimiento de patentar sus invenciones.

No obstante a los planteamientos anteriores, mi representado tiene gran interés que su creación sea protegida como corresponde, razón por la cual además de solicitar que sean estudiados y analizados todos los antecedentes del presente proceso de registro de Patente de Privilegio de Invención, procedemos a dar respuesta a este oficio con los siguientes argumentos y adecuaciones.

2.2. Reivindicaciones

Acompañamos a esta respuesta un nuevo capítulo reivindicatorio (1-9), cuyo contenido se encuentra sustentado en el de la solicitud originalmente presentada, y por lo tanto es permitido según el Artículo 34 de la Decisión Andina 486.

En el nuevo capítulo que se adjunta, las reivindicaciones pendientes 1-3 se cancelan y se agregan nuevas reivindicaciones 1-9. Las modificaciones introducidas son las siguientes:

- La nueva reivindicación 1 se basa en la reivindicación 3 de la solicitud original del PCT (solicitud internacional publicada con el número WO 210/ 017470).
- La nueva reivindicación 2 se basa en la reivindicación 9 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 3 se basa en la reivindicación 10 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 4 se basa en la reivindicación 11 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 5 se basa en la reivindicación 13 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 6 se basa en la reivindicación 14 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 7 se basa en la reivindicación 16 de la solicitud original del PCT.
- La nueva reivindicación 8 se dirige al compuesto 34 descrito en la presente solicitud (véase, por ejemplo, la página 21 de la solicitud publicada).
- La nueva reivindicación 9 se refiere a las composiciones farmacéuticas que comprenden los compuestos reivindicados.
- La reivindicación anterior 3, objeto del rechazo previo, se ha eliminado en el nuevo capítulo reivindicatorio que se adjunta, superándose esta deficiencia de las reivindicaciones anteriores.

3. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Las reivindicaciones 1 y 2 anteriores fueron objetadas como carentes de nivel inventivo a la luz de los documentos del estado de la técnica D1 y D2. Dichas reivindicaciones 1 y 2, ahora se cancelan en el nuevo capítulo reivindicatorio que se adjunta. Sin embargo, para dejar claramente establecida la patentabilidad de las reivindicaciones enmendadas, a continuación se proporcionan los siguientes argumentos:

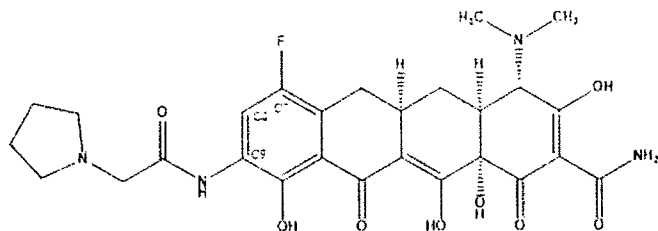
D1: EP0582789 (en lo adelante "Sum");

D2: Chopra y Roberts, "Tetracycline Antibiotics: Mode of Action. Applications, Molecular Biology, and Epidemiology of Bacterial Resistance," Microbiology and Molecular Biology Reviews, June 2001, pp. 232-260 (en lo adelante "Chopra").

La Examinadora se basa en D1 para la divulgación de los compuestos de tetraciclina 7, 8, 9-sustituidos (véase la fórmula I de D1) los cuales presentan actividad antibiótica. La Examinadora considera, presumiblemente refiriéndose a la fórmula estructural descrita en la reivindicación 1 del solicitante, que la diferencia entre la reivindicación 1 del solicitante y la fórmula I de D1 es la presencia de un grupo metilo en la posición 6 y la ausencia de un sustituyente en la posición 8. La Examinadora se basa en D2 por sus enseñanzas de derivados de tetraciclina no sustituidos en la posición 8.

Como cuestión preliminar, se dirige respetuosamente la atención de la Examinadora a la Sección 6 de la Oficina de Acción, en la que se presenta una tabla comparativa sobre "las características técnicas esenciales del estado de la técnica". La fórmula estructural que se reproduce en la columna de la izquierda, en referencia al compuesto reivindicado en la reivindicación 1 del solicitante, es incorrecta. La posición 6 del compuesto reivindicado, el compuesto 34, no está sustituida.

Con respecto al análisis del nivel inventivo que se hace en la acción oficial, se podrá apreciar que la nueva la reivindicación 1 se dirige a un género químico que incluye el compuesto 34. Dicho compuesto 34 es ahora el objeto de la nueva reivindicación 8 y se reproduce a continuación:



(Compuesto 34).

La nueva reivindicación 1 es inventiva sobre la combinación de los documentos D1 y D2 por las siguientes razones:

- Como cuestión preliminar, se llama la atención sobre el hecho de que Sum no anticipa la nueva reivindicación 1. De hecho, el género químico definido por las reivindicaciones de Sum requiere, y todos los compuestos ejemplificados en Sum incluyen, un sustituyente en la posición 8 del núcleo de la tetraciclina. Por el contrario, el género químico definido en la nueva reivindicación 1 del solicitante no incluye un sustituyente en esa posición. Como tal, la invención del solicitante es novedosa sobre Sum.
- Para establecer que la nueva reivindicación 1 carece de actividad inventiva a la luz de Sum, solo o en combinación con cualquier otra referencia, la Examinadora debe demostrar que una persona experta en la materia, sobre la base de las enseñanzas de Sum, (1) seleccionaría los sustituyentes adecuados a partir de las enseñanzas genéricas de Sum para su colocación en la estructura principal de la tetraciclina; y luego (2) modificaría esos sustituyentes para llegar a la invención reivindicada del solicitante.
- En particular, para llegar a la materia objeto de la nueva reivindicación 1 del solicitante, una persona experta en la materia tendría que, tras la lectura de Sum, seleccionar el valor de R (el sustituyente C-7 de la fórmula I de Sum) como flúor, seleccionar los valores de R3 y R4 en la fórmula I de Sum como hidrógenos, y luego eliminar el sustituyente obligatorio en el C-8 (la variable X de la fórmula I) con un hidrógeno. Por otra parte, para llegar a la materia objeto de la nueva reivindicación 8 (compuesto 34), esa persona también tendría que seleccionar el valor de W en la fórmula I de Sum para que fuera pirrolidin-1-il.
- También se debe notar que en la tabla del punto 6 de la acción oficial, en la columna central, la Examinadora sólo menciona halógeno como una posible variable para C-8 (variable X de Sum), pero X puede ser también trifluormetanosulfonilo. Solo un análisis retrospectivo

inadmisible para la evaluación del nivel inventivo, podría suponer, basado en la restricción que hace la Examinadora del valor de la variable X, que X es halógeno en lugar de halógeno y trifluórometanosulfonilo, como correspondería. Aparentemente la Examinadora ha seleccionado los valores de los sustituyentes en D1 y D2 sobre la base de su conocimiento previo del compuesto 34 del solicitante.

- El solicitante también nota que en la página 4 de la acción oficial, la Examinadora parece basarse en los datos presentados en la presente solicitud, y obtenidos usando los propios compuestos del solicitante 134 y 135, para apoyar su afirmación de la equivalencia de la pirrolidin-1-il-acetamida y la terc-butilamino acetamida como sustituyentes de C-9. La dependencia de la Examinadora de las propias enseñanzas del solicitante para rechazar las reivindicaciones pendientes de la presente solicitud, es inadecuado y por consiguiente inaceptable.

Afirmamos que la presente invención reivindicada es inventiva sobre las referencias D1 y D2 ya que:

- (1) Ninguna de las referencias mencionadas conduciría a una persona con conocimientos en el campo técnico a seleccionar al flúor como sustituyente en la **posición 7**; y
- (2) Sum no sugiere a una persona experta en la técnica a eliminar el sustituyente obligatorio en la **posición 8**.

(1) *Sum no sugiere seleccionar al flúor como sustituyente en C-7.*

La nueva reivindicación 1 define un género químico en la que se sustituye C-7 del núcleo de tetraciclina con un átomo de flúor. La Fórmula (I) de Sum incluye un sustituyente R genéricamente definido en C-7. Aunque el sustituyente R de Sum puede ser un halógeno, no hay ejemplificación de ningún tipo en Sum de compuestos que tienen un grupo halo en la posición 7: los compuestos ejemplificados específicamente en Sum sólo poseen NMe₂ o H en C-7. De hecho, existe una clara preferencia en Sum por átomos de halógeno distintos de flúor. En efecto, véase, por ejemplo, la página 6, líneas 27-30 de Sum, donde el flúor se omite de la lista de valores preferidos del sustituyente C-7.

Por lo tanto, si el documento de Sum fuera seleccionado por un experto en la materia como un punto de partida para abordar el problema técnico objetivo de la presente solicitud, éste sin duda no hubiera identificado compuestos que poseen un grupo 7-halo (por no hablar de un grupo 7-flúor) como que ofrecieran la mayor promesa de una solución a dicho problema.

Con respecto a la nueva reivindicación 8 (dirigida al compuesto 34), se debe notar adicionalmente que la posición 9 de este compuesto está sustituida con un grupo pirrolidin-1-il-acetamido. Este grupo corresponde a la variable W de Sum en la que C4 es un azacicloalquilo, las variables R3 y R4 son cada una H. Sin embargo, incluso si un experto en la técnica comenzó con cualquiera de los dos compuestos de Sum donde W es un azacicloalquilo C4 (es decir, los compuestos 43 y 62), este no estaría motivado a sustituir el grupo H o N(CH₃)₂ presente en C-7 de estos compuestos con un halo, y aún menos con un flúor, en vista de lo anterior.

Es evidente que no hay nada en las divulgaciones de Sum que hubieran conducido a un experto en la materia a seleccionar específicamente un sustituyente-7 que es halo, porque Sum se centra en compuestos que tienen sustituyentes muy diferentes en la posición 7.

(2) Sum no sugiere eliminar el sustituyente obligatorio C-8.

Además de lo anterior, una persona con habilidad ordinaria en el campo técnico, con el fin de llegar a la materia objeto de nueva reivindicación 1 del solicitante, tendría que eliminar el sustituyente C-8 requerido por la Fórmula I de Sum. Tal persona experta no estaría motivada a modificar los compuestos de Sum de tal manera como para llegar al compuesto actualmente reivindicado. Esto se debe a que Sum enseña que un sustituyente en C8 es obligatorio (X no puede ser hidrógeno en cualquiera de los géneros de Sum), y por lo tanto enseña en contra de la modificación de cualquiera de sus compuestos mediante la eliminación del sustituyente en C-8.

(3) Referencia de Chopra (referencia D2)

Finalmente queremos señalar que Chopra (D2) no va más allá que Sum en dirigir a una persona con conocimientos en la técnica hacia la materia de la nueva reivindicación 1 de la presente solicitud. Chopra ofrece una breve

introducción a la relación estructura-actividad (SAR) de las tetraciclinas (comenzando en la página 233). Los compuestos considerados por Chopra se listan en la Tabla 2, página 234. El solicitante hace notar que los únicos compuestos de la Tabla 2 de Chopra que incluyen tanto un sustituyente en C-7 y un sustituyente en C-9 son los compuestos que tienen $N(CH_3)_2$ en C-7. El resumen de la SAR se proporciona en la Figura 2 de Chopra, en la página 236. Aunque Chopra sugiere que la posición 8 (R8 de la fórmula estructural reproducida en la Figura 2 de Chopra) queda sin sustituir, la misma figura también sugiere que la actividad antibacteriana óptima requiere que el sustituyente en la posición 7 (R7 de la Figura 2 de Chopra) esté ausente o se seleccione entre los grupos cloro, dialquilamino o nitro. Por lo tanto, no sólo Chopra no sugiere que el sustituyente en C-7 sea el átomo de flúor, tampoco sugiere que la posición C-7 pudiera estar sustituida con un halógeno y que C9 también estuviera sustituido, sino que Chopra llevaría un experto en la técnica lejos de un sustituyente flúor en C-7, ya que no figura entre los “requerimientos para la actividad antibacteriana óptima” de sustitución (véase la Fig. 2).

Por último, la sugerencia de la Examinadora de que la sustitución de la posición C-2 (en el anillo A) con el grupo pirrolidin-1-il-acetamido equivale a la sustitución de la posición C-9 (en el anillo D) con el mismo grupo es incorrecta, al menos debido a que el anillo D es aromático mientras que el anillo A no lo es.

En resumen, las enseñanzas de Sum están distantes de dejar a C-8 sin sustituir, y muestra una clara preferencia en excluir el sustituyente flúor en C-7, mientras que Chopra está distante también de la colocación del átomo de flúor en C-7. Ninguna de las referencias dirige una persona con conocimientos ordinarios en la técnica a modificar cualquiera de los compuestos de los ejemplos descritos en las mismas, en una manera necesaria para llegar a la invención definida por la nueva reivindicación 1 de la presente solicitud. En consecuencia, la nueva reivindicación 1 y sus reivindicaciones dependientes son inventivas sobre Sum, considerando solamente esta referencia o en combinación con Chopra.

Por las razones expuestas anteriormente, consideramos que las reivindicaciones como se han modificado tienen nivel inventivo frente a los documentos señalados por la Examinadora.

HUMBERTO RUBIO & CIA.

ABOGADOS

Página 12 de 12

Solicitud No.11-027.711

Teniendo en cuenta que las nuevas reivindicaciones definen la materia que se desea proteger siendo claras, concisas y debidamente sustentadas en la descripción y que ni el documento D1 y D2 solos o en combinación afectan la presente solicitud conforme fue expuesto anteriormente, consideramos que se han subsanado todos y cada uno de las objeciones expuestas por el examinador, por tanto el nuevo capítulo reivindicatorio contiene materia nueva susceptible de considerarse con novedosa conforme lo establece el artículo 16 de la Decisión 486. Solicito que, sobre la base de las nuevas reivindicaciones que aquí se adjuntan, se proceda a la concesión de la patente colombiana correspondiente.

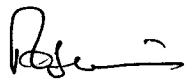
Anexo:

- i) Capítulo reivindicatorio modificado (Reivindicaciones 1-9).
- ii) Resolución No.74812.

Petición:

Conforme a lo anterior, una vez atendidos los requerimientos y exigencias de la Examinadora y al tener en cuenta el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, solicito muy amablemente a su Despacho, que considerando los argumentos aquí expuestos, sea concedido el privilegio de invención solicitado, y en caso contrario se hagan las correspondientes observaciones con el ánimo de hacer lo pertinente dentro del presente trámite.

Atentamente,



HUMBERTO RUBIO CAMACHO

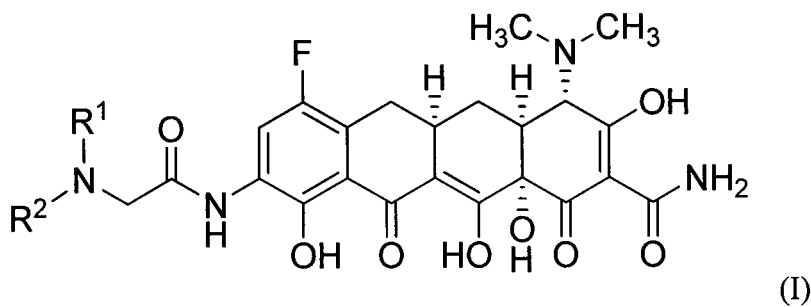
C.C. 17'192.062 de Bogotá

**T.P. 50.007 Consejo Superior
de la Judicatura**

COD. 4134

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la Fórmula Estructural (I):



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo, en el cual

R¹ y R² se seleccionan cada uno independientemente entre hidrógeno, (C₁-C₇)alquil, (C₃-C₆)cicloalquil, (C₁-C₄)alquil, (C₁-C₇)alcoxi, (C₁-C₄)alquil, (C₃-C₆)cicloalcoxi, (C₁-C₄)alquil, (C₃-C₆)cicloalquil, aril, aril(C₁-C₄)alquil, ariloxi(C₁-C₄)alquil, ariltio(C₁-C₄)alquil, arilsufinil(C₁-C₄)alquil, arilsulfonil(C₁-C₄)alquil; o

R¹ y R² tomados junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un heteroaril monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico unido mediante puente o espiro bicíclico, donde el heteroaril o heterociclo contiene opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados independientemente entre N, O y S.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en el cual R¹ y R², tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen, forman un heteroaril monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado, bicíclico unido mediante puente o espiro bicíclico, donde el heteroaril o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado a partir de N, O y S; y el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados a partir del grupo que consiste de (C₁-C₄)alquil, halo, -OH, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)alquilsufinil, (C₁-C₄)alquilsulfonil, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, y -N(R³)(R⁴); y el heteroaril está sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste de (C₁-C₄)alquil, halo, -OH, (C₁-C₄)alcoxi, -S-(C₁-C₄)alquil, -S(O)(C₁-C₄)alquil, -S(O)₂(C₁-C₄)alquil, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, -N(R³)(R⁴), -CN, halo(C₁-C₄)alquil, y halo(C₁-C₄)alcoxi.

3. El compuesto de la reivindicación 2, en el cual R¹ y R², tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen, forman un heterociclo seleccionado a partir del grupo que consiste de azetidina, pirrolidina, morfolina, piperidina, octahidrociclopenta[c]pirrol, isoindolina, y azabicyclo[3.1.0]hexano, en el cual el heterociclo está opcionalmente

sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionado a partir del grupo que consiste de (C₁-C₄)alquil, halógeno, -OH, (C₁-C₄)alcoxi, -S-(C₁-C₄)alquil, -S(O)(C₁-C₄)alquil, -S(O)₂(C₁-C₄)alquil, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, y -N(R³)(R⁴).

5 4. El compuesto de la reivindicación 3, en el cual el heterociclo está opcionalmente sustituido con halógeno, metoxi, hidroxil, metoximetil o el grupo dimetilamino.

5. El compuesto de la reivindicación 1, en el cual R¹ y R² tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen forman un grupo seleccionado a partir de:

- 10 a) azetidín-1-il;
b) 3-fluoroazetidín-1-il;
c) 3-metilazetidín-1-il;
d) 3-metoxiazetidín-1-il;
e) pirrolidín-1-il;
15 f) morfolín-4-il;
g) 3-fluoropirrolidín-1-il;
h) 3-hidroxipirrolidín-1-il;
i) 3-N,N-dimetilaminopirrolidín-1-il;
j) 2-metoximetilpirrolidín-1-il;
20 k) piperidín-1-il;
l) octahidrociclopenta[c]pirrol-2-il;
m) isoindolín-2-il; y
n) 3-azabíciclo[3.1.0]hexan-3-il,

o una sal farmacéuticamente aceptable de cualquiera de los anteriores.

25

6. El compuesto de la reivindicación 1, en el cual

R¹ es hidrógeno o un (C₁-C₄)alquil; y
R² es seleccionado a partir de (C₁-C₇)alquil, (C₃-C₆)cicloalquil(C₁-C₄)alquil,
(C₁-C₇)alcoxi(C₁-C₄)alquil, fenil, fenil(C₁-C₄)alquil, (C₃-C₆)cicloalquil y halo(C₁-
30 C₄)alquil, en el cual cada grupo funcional alquil, alcoxi y cicloalquil en los grupos
representados por R² está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes
independientemente seleccionado a partir el grupo que consiste de alquil (C₁-C₄) y halo;
y cada grupo funcional fenil en los grupos representados por R² está opcionalmente
sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionado a partir el grupo
35 que consiste de of (C₁-C₄)alquil, halo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, -CN,
halo(C₁-C₄)alquil, y halo(C₁-C₄)alcoxi; o

R¹ y R² tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen, forman un heteroaril monocíclico o bicíclico, o un heterociclo monocíclico, bicíclico fusionado,

bicíclico unido mediante puente o espiro bicíclico, donde el heteroaril o heterociclo contiene opcionalmente un heteroátomo adicionales seleccionado a partir de N, O y S; y el heterociclo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionado a partir el grupo que consiste de (C₁-C₄)alquil, halo, -OH, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)alquilsulfinil, (C₁-C₄)alquilsulfonil, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, y -N(R³)(R⁴); y el heteroaril está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionado a partir el grupo que consiste de (C₁-C₄)alquil, halo, -OH, (C₁-C₄)alcoxi, -S-(C₁-C₄)alquil, -S(O)(C₁-C₄)alquil, -S(O)₂(C₁-C₄)alquil, (C₁-C₄)alcoxi(C₁-C₄)alquil, -N(R³)(R⁴), -CN, halo(C₁-C₄)alquil, y halo(C₁-C₄)alcoxi.

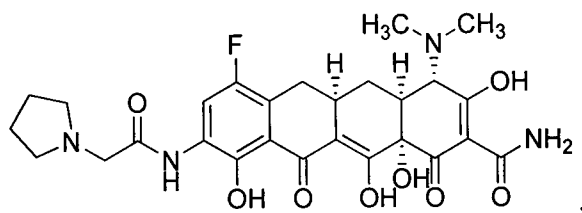
7. El compuesto de la reivindicación 1, en el cual:

R¹ hidrógeno, metil, o etil

R² es seleccionado a partir metil, etil, n-propil, isopropil, n-butil, 2,2-dimetilpropil, t-butil, isobutil, n-pentil, cicloalquil(C₄-C₆), cicloalquilmetil(C₃-C₅), metoxietil, y 2-fluoroetil; o

R¹ y R² tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen forman un anillo seleccionado a partir de azetidil, pirrolidinil, piperidinil, tetrazolil, o octahidrociclopenta[c]pirrolil, y en el cual el anillo formado por R¹ y R² tomados juntos con el átomo de nitrógeno al cual ellos se unen está opcionalmente sustituido con flúor.

8. El compuesto de la reivindicación 1 representado por la siguiente fórmula estructural:



o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

9. Una composición farmacéutica que comprende un portador o diluyente farmacéuticamente aceptable y un compuesto de cualquiera de la reivindicaciones 1-8 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 74812

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-027711

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el
numeral 26 del artículo 3º del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 07 de marzo de 2011, con el N° 11-027711-00000-0000, por la sociedad Tetraphase Pharmaceuticals, INC, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7", que corresponde a la solicitud internacional PCT/US2009/053142 del 07 de agosto de 2009.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 635 del 20 de diciembre de 2011, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: 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."

CUARTO: Que en el presente caso las reivindicaciones 1 y 2 contenidas en el folio 220 cumplen los requisitos indicados en el considerando anterior y, en consecuencia, este Despacho encuentra procedente conceder para las mismas la patente solicitada.

Página 1 de 4

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Cod Verificación: 1496118975

S Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26-55 int. 2 Tel 5737020
Call Center 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 74812

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-027711

Que por su parte, no se acepta la reivindicación 3 contenida en el folio 220, por cuanto está referida a un método para tratar una infección bacteriana en un sujeto que comprende la administración de una cantidad eficaz del compuesto reclamado en esta solicitud. El método reclamado en la reivindicación 3, es un método de tratamiento terapéutico, el cual no puede ser objeto de patente de conformidad con lo dispuesto en el artículo 20 lit. d) de la referida Decisión 486, en razón a que allí se establece que no serán patentables: "los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o animales".

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Otorgar patente de invención a la solicitud que entró en fase nacional en virtud del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), para la creación titulada:

" COMPUESTOS DE TETRACICLINA SUSTITUIDOS CON FLÚOR EN C7"

Clasificación IPC: C 07 C 237/26, 239/20, 275/16, 275/42, 311/08, 311/21; C 07 D205/04, 207/08, 207/10, 207/12, 207/14, 207/16, 207/34, 209/44, 209/52.

Reivindicaciones: 1 y 2 **Folio:** 220.

Titular: TETRAPHASE PHARMACEUTICALS, INC.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 74812

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

CERTIFICADO

Rad. PCT/11-027711

Domicilio: Water Town, Massachusetts, Estados Unidos de América.

Inventores: Zhou Jingye, Xiao Xiao-Yi, Plamondon Louis, Hunt Diana Katharine, Clark Roger B. y Zahler Robert B.

Prioridad N°: 61/188,307 Fecha: 08 de agosto de 2008 País: US.

Solicitud internacional N°: PCT/US2009/053142 Fecha: 07 de agosto de 2009.

Vigente desde: 07 de agosto de 2009 Hasta: 07 de agosto de 2029

ARTÍCULO SEGUNDO: Denegar la patente de invención solicitada para la reivindicación 3 contenida en el folio 220 del expediente administrativo, de acuerdo con las razones expuestas en la parte considerativa de la presente resolución.

ARTÍCULO TERCERO: El titular tendrá los derechos y las obligaciones establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina y en las demás disposiciones legales vigentes sobre propiedad industrial, precisando que para mantener vigente la patente se deberá cancelar la tasa anual de mantenimiento, conforme lo dispone el artículo 80 de la referida norma comunitaria.

ARTÍCULO CUARTO: Entregar al titular copia auténtica de esta resolución y el certificado de patente, previas las anotaciones en los libros de registro.

ARTÍCULO QUINTO: Notificar el contenido de la presente resolución a la sociedad Tetraphase Pharmaceuticals, INC, entregándole copia de la misma y advirtiéndole que contra ella procede el recurso de reposición, ante el

Página 3 de 4

Al contestar favor indique el número
de radicación que se indica a continuación:
Ced Verificación: 1496118975

S. Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5670000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26-55 int. 2 Tel: 5737020
Call Center: 5920400. Línea gratuita Nacional 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: contactenos@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 74812

Por la cual se otorga parcialmente una patente de invención

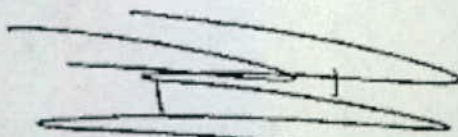
CERTIFICADO

Rad. PCT/11-027711

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 30 Nov 2012

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Ductor
HUMBERTO RUBIO CAMACHO
mail@rubiolawyers.com
hrubio@rubiolawyers.com

Elaboró: Gina Paola Duarte Beltrán
Revisó: Consuelo Leguizamón Leguizamón
Revisó: José Luis Salazar López
Aprobó: José Luis Londoño Fernández