

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 11-53320- -3	FECHA: 2013-03-06 17:51:41
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA

Asunto: Radicación: 11-53320- -3
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 4530
Folios: 9

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/JP2009/68400				
Fecha de Presentación Internacional	27/10/2009				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 231 a 471	02/Mayo/2011
Reivindicaciones:	Folios 472 a 480	02/Mayo/2011
Prioridad:	JP 2008-280828	31/Octubre/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

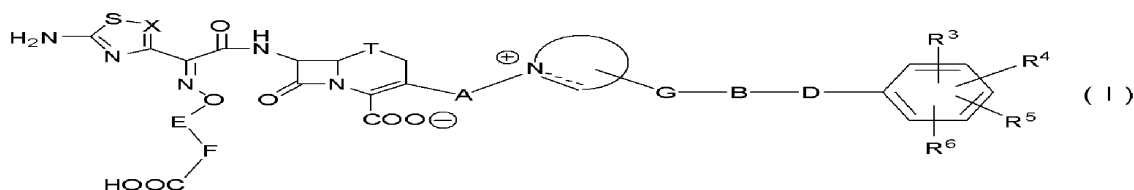
De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. Para esta solicitud se cancelaron las tasas correspondientes, por lo tanto se estudiaran las 22 reivindicaciones presentadas.

Título de la solicitud: “Cefarosporinas que tienen un grupo catecol”

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos alternativos de potente acción antimicrobiana contra bacterias Gram negativas que producen beta-

lactamasa.”.

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



(Fls. 472 y 473)

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 505/24 // 501/46 // 519/06; A 61 K 31/5365 // 31/546 // 31/55; A 61 P 31/04

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

El objeto de la reivindicación 20 no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de las reivindicaciones 19, 21 y 22 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la Solicitud de Patente

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 no es concisa, porque la definición de los diversos sustituyentes conllevan a un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción. Al revisar en la descripción se observa que no se encuentran soportados compuestos en los cuales T corresponda a CH₂ ni tampoco compuestos en los cuales D corresponda a -O-CO-, -CO-O-, -O-, -S-, -SO-, -SO₂-NR⁷-, -NR⁷-SO₂-, o -SO₂-. Adicionalmente A corresponde a metileno o propenileno; El grupo amonio cuaternario es un grupo de acuerdo al objeto reclamado en la reivindicación 2; El grupo E es un grupo de acuerdo al objeto reclamado en la reivindicación 12; R³ y R⁶ son hidrógeno o cloro, R⁴ y R⁵ son hidroxilo. Por lo tanto, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización de tales ejemplos.

La reivindicación 19 indica el uso que puede darse a la composición farmacéutica aunque la reivindicación esté encabezada en términos de “La composición farmacéutica”, la materia objeto de la reivindicación 19 ya se encuentra contemplada en la reivindicación 18. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio

La reivindicación 20 se refiere a un método de tratamiento el cual no es patentable según la legislación aplicable. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 21 indica el uso que puede darse al compuesto aunque la reivindicación esté encabezada en términos de “El compuesto”, la materia objeto de la reivindicación 21 ya se encuentra contemplada en las reivindicaciones 1 a 17. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio.

La reivindicación 22 se refiere a un uso lo cual no es patentable según la legislación aplicable. Se sugiere eliminar esta reivindicación del pliego reivindicatorio.

7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 31 de octubre de 2008.

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

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1 ^[1]	WO2007119511	"CEPHEM COMPOUNDS AND USE AS ANTIMICROBIAL AGENTS"	25/Octubre/2007
D2 ^[2]	US5149803	"Intermediates for cephalosporin compounds"	22/Septiembre/1992
D3 ^[3]	EP0474049	"Antibiotic C-3 catechol-substituted cephalosporin compounds, compositions and use thereof"	11/Marzo/1992
D4 ^[4]	EP0241901	"Cephalosporin derivatives, processes for their preparation and antibacterial agents."	21/Octubre/1987
D5 ^[5]	Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, Vol. 5, No. 9, pp. 963-966, 1995 Tsuji et al "SYNTHESIS AND ANTIBACTERIAL ACTIVITY OF CEPHALOSPORINS HAVING C-3 CATECHOL-CONTAINING (PYRIDINIUM-4'-THIO)-METHYL GROUPS	"SYNTHESIS AND ANTIBACTERIAL ACTIVITY OF CEPHALOSPORINS HAVING C-3 CATECHOL-CONTAINING (PYRIDINIUM-4'-THIO)-METHYL GROUPS"	1995

El documento D1 divulga un compuesto de la fórmula (I) útiles como agentes antimicrobianos (Págs. 1 a 9, Párr. [1] a [5])

El documento D2 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Col. 1, línea 53 a Col. 6, línea 42)

El documento D3 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Pág.7, línea 15 a Pág. 8 línea 25)

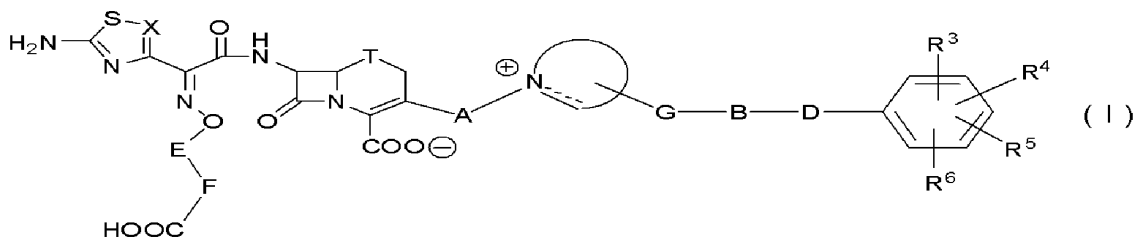
El documento D4 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Pág.4, línea 34 a Pág. 8 línea 49)

El documento D5 divulga un compuesto cefalosporina conteniendo un grupo catecol (Págs. 963 a 966)

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de la fórmula (I)



(Fls. 472 y 473)

1[]URL: <http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2007119511A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20071025&DB=worldwide>.

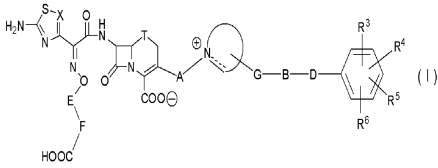
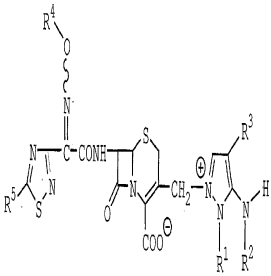
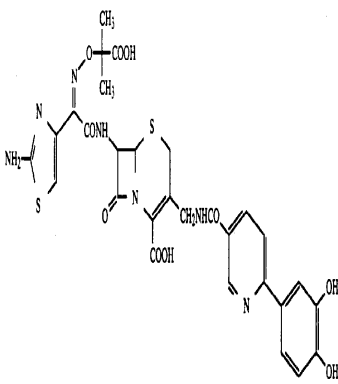
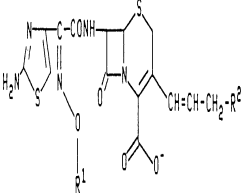
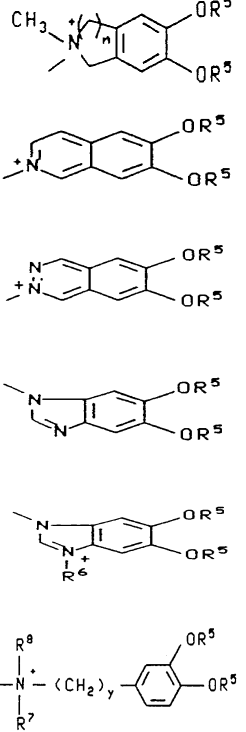
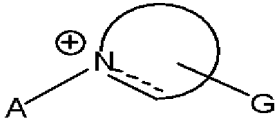
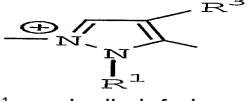
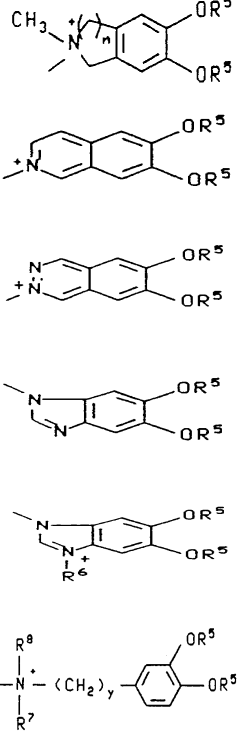
2[]URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=US&NR=5149803A&KC=A&FT=D&ND=3&date=19920922&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

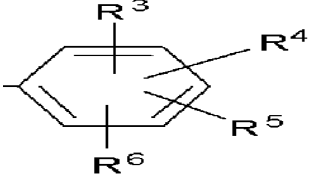
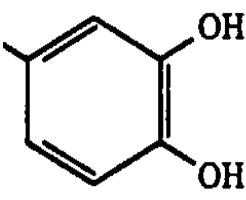
3[]URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=0474049A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19920311&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

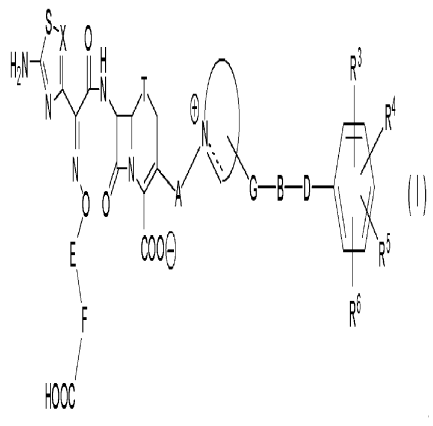
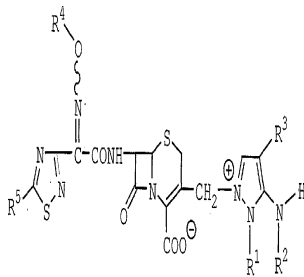
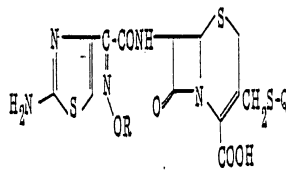
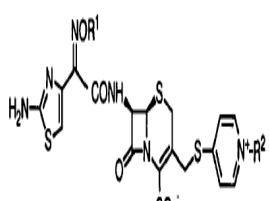
4[]URL: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=EP&NR=0241901A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=19871021&DB=worldwide.espacenet.com&locale=en_EP

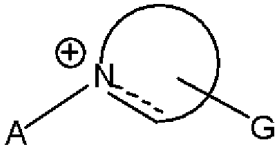
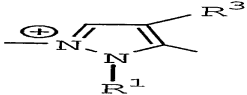
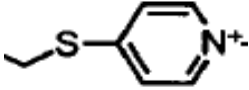
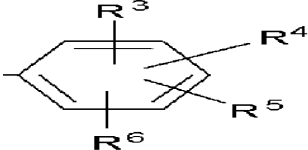
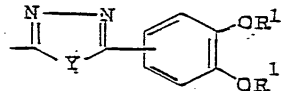
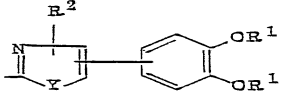
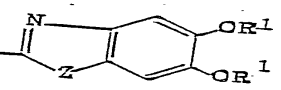
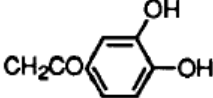
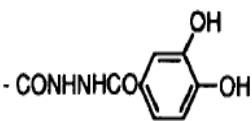
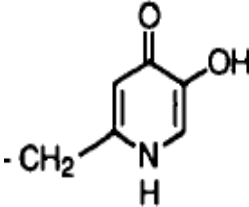
5[]URL: <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0960894X9500143H>

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

SOLICITUD	D1	D2	D3
 (1) X es N E es alquilenio inferior opcionalmente sustituido F es un enlace sencillo o fenileno opcionalmente sustituido T es S, S=O, CH₂ o O G es un enlace sencillo, alquilenio inferior, alquilenio inferior o alquinileno inferior B es un enlace sencillo o grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene al menos 1 a 3 átomos de N D es un enlace sencillo, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR⁷-, -NR⁷-CO-, -CO -, -NR⁷-CO-NR⁷-, -O-, -S-, -SO-, -SO₂-NR⁷-, -NR⁷-SO₂-, -CH₂-NR⁷-CO-, o -SO₂-, R⁷ es hidrógeno o alquilo inferior	 (Pág. 1 línea 31 a Pág. 4 línea 19) R⁵ es amino (Pág. 3 línea 3) R⁴ es alquilo inferior sustituido por un grupo carboxilo (Pág. 3 líneas 1 y 2)	 (Cols. 13 y 14)	 (Pág. 7 línea 16 a Pág. 9 línea 26) R¹ es hidrógeno o un grupo alquilo lineal ramificado o cíclico inferior teniendo hasta 6 átomos de Carbono o un radical de la fórmula $\begin{array}{c} R^3 \\ \\ -C- CO_2H \\ \\ R^4 \end{array}$ R³ y R⁴ son independientemente hidrógeno, metilo o etilo (Abstract) R² es un radical seleccionado de los grupos:  R⁵ es hidrógeno o acetilo (Pág. 2)
 Es un grupo amonio cuaternario, cíclico, monocíclico o fusionado, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido que contiene al menos uno o mas átomos N	 R¹ es alquilo inferior o hidroxialquilo inferior (Pág. 2 línea 3) R³ es un grupo representado por $-CH \begin{array}{l} (CH_2)_m - R^6 \\ (CH_2)_n - R^7 \end{array} \quad (1)$ O $-N \begin{array}{l} (CH_2)_q - R^8 \\ (CH_2)_r - R^9 \end{array} \quad (2)$ R⁶ y R⁷ son independientemente grupos amino o guanidino protegidos siempre que R⁶ y R⁷ no sean juntos grupos amino R⁸ y R⁹ son independientemente grupos amino, iminoalquilamino inferior, guanidino o amidino protegidos M, n, q y r son enteros entre 0 y 6. (Pág. 2 líneas 10 a 20)	No se menciona	R² es un radical seleccionado de los grupos:  R⁵ es hidrógeno o acetilo (Pág. 2)

SOLICITUD	D1	D2	D3
 R^3, R^4, R^5 y R^6 cada uno es independientemente hidrógeno, halógeno, nitrilo, o $-OR^8$ R^8 es hidrógeno, alquilo inferior, haloalquilo inferior, alquilcarbonilo inferior o carbamoilo	R^2 R^2 es hidrógeno, arilalquilo inferior, alcanilo inferior o alcoxicarbonilo inferior (Pág. 3 líneas 24 y 25)		El anillo de benceno sustituido por grupos OR^5 se encuentra fusionado al anillo heterocíclico.

SOLICITUD	D1	D4	D5
 X es N E es alquilenio inferior opcionalmente sustituido F es un enlace sencillo o fenileno opcionalmente sustituido T es S, $S=O$, CH_2 o O G es un enlace sencillo, alquilenio inferior, alquenileno inferior o alquinileno inferior B es un enlace sencillo o grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene al menos 1 a 3 átomos de N D es un enlace sencillo, $-CO-$, $-O-CO-$, $-CO-O-$, $-NR^7-$, $-NR^7-CO-$, $-CO-NR^7-$, $-CO-NR^7-CO-$, $-O-S-$, $-SO-$, $-SO_2-NR^7-$, $-NR^7-SO_2-$, $-CH_2-NR^7-CO-$, o $-SO_2-$, R^7 es hidrógeno o alquilo inferior	 (Pág. 1 línea 31 a Pág. 4 línea 19) R^5 es amino (Pág. 3 línea 3) R^4 es alquilo inferior sustituido por un grupo carboxilo (Pág. 3 líneas 1 y 2)	 (Pág. 4 línea 34 a Pág. 5 línea 1) R es un alquilo inferior lineal o ramificado, un alquilo cíclico inferior, alquenilo inferior, alquinileno inferior, arilalquilo, fenilo o 2-pirrolidon-3-il (Pág. 4 líneas 44 y 45)	 R^1 es CH_3, CH_2CO_2H o $C(CH_3)_2CO_2H$ (Pág. 964, compuestos 8(a-c), 9(a-c) y 10(a-c))

SOLICITUD	D1	D4	D5
 Es un grupo amonio cuaternario, cíclico, monocíclico o fusionado, saturado o insaturado, opcionalmente sustituido que contiene al menos uno o mas átomos N	 R¹ es alquilo inferior o hidroxialquilo inferior (Pág. 2 línea 3) R³ es un grupo representado por $\text{---CH} \begin{cases} (\text{CH}_2)_m\text{---R}^6 \\ (\text{CH}_2)_n\text{---R}^7 \end{cases} \quad (1)$ 0 $\text{---N} \begin{cases} (\text{CH}_2)_q\text{---R}^8 \\ (\text{CH}_2)_r\text{---R}^9 \end{cases} \quad (2)$ R⁶ y R⁷ son independientemente grupos amino o guanidino protegidos siempre que R⁶ y R⁷ no sean juntos grupos amino R⁸ y R⁹ son independientemente grupos amino, iminoalquilamino inferior, guanidino o amidino protegidos M, n, q y r son enteros entre 0 y 6. (Pág. 2 líneas 10 a 20)	No se menciona	 (Pág. 964, compuestos 8(a-c), 9(a-c) y 10(a-c))
 R³, R⁴, R⁵ y R⁶ cada uno es independientemente hidrógeno, halógeno, nitrilo, o –OR⁸ R⁸ es hidrógeno, alquilo inferior, haloalquilo inferior, alquilcarbonilo inferior o carbamoilo	R² R² es hidrógeno, arilalquilo inferior, alcanoilo inferior o alcoxycarbonilo inferior (Pág. 3 líneas 24 y 25)	Q es    Y es un átomo de azufre o un átomo de oxígeno Z es un átomo de azufre o un átomo de oxígeno o un grupo imino sustituido por alquilo inferior R¹ es hidrógeno o acetilo R² es hidrógeno, carboxilo o carboximetilo. (Pág. 4 líneas 45 a 58)	R² es   0  (Pág. 964, compuestos 8(a-c), 9(a-c) y 10(a-c))

El documento D1 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) útiles como agentes antimicrobianos (Págs. 1 a 9, Párr. [1] a [5])

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D1 consiste en que este documento no divulga específicamente el anillo de fenilo sustituido por los radicales R^3 , R^4 , R^5 y R^6

El documento D2 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Col. 1, línea 53 a Col. 6, línea 42)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D2 consiste en que este documento no divulga el grupo amonio cuaternario unido mediante el enlazante A al núcleo de la cefalosporina

El documento D3 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Pág.7, línea 15 a Pág. 8 línea 25)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D3 consiste en que este documento no divulga el grupo G-B-D enlazando el grupo amonio cuaternario con el anillo de fenilo; en sus lugar el anillo de fenilo es fusionado al grupo amonio cuaternario cíclico.

El documento D4 divulga un compuesto cefalosporina de la fórmula (I) (Pág.4, línea 34 a Pág. 8 línea 49)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D4 consiste en que este documento no divulga el grupo carboxilo acompañando el grupo O-E-F ni tampoco el grupo amonio cuaternario unido mediante el enlazante A al núcleo de la cefalosporina

El documento D5 divulga un compuesto cefalosporina conteniendo un grupo catecol (Págs. 963 a 966)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto del documento D5 consiste en el grupo $-\text{CH}_2\text{-S-}$ en lugar del grupo A de la solicitud.

El efecto que logra el incluir el anillo de fenilo sustituido por los radicales R^3 , R^4 , R^5 y R^6 es que proporciona nuevos compuestos alternativos de potente acción antimicrobiana contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto conocido en el documento D1 para proporcionar nuevos compuestos alternativos de potente acción antimicrobiana contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa."

Sin embargo, la utilización del anillo de fenilo sustituido por los radicales R^3 , R^4 , R^5 y R^6 para aumentar la eficiencia, ya está divulgada en los documentos: D2 que divulga un compuesto cefalosporina útil contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa en el cual se divulga un grupo catecol (Cols. 13 y 14), D3 que divulga un compuesto cefalosporina útil contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa en el cual se divulga un grupo catecol fusionado a un grupo amonio cuaternario cíclico, manteniendo el núcleo de la cefalosporina lo cual sugiere la presencia de un grupo catecol unido mediante un enlazante al grupo amonio cuaternario cíclico, D4 que divulga un compuesto cefalosporina útil contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa en el cual se divulga un anillo de fenilo sustituido por grupos OR^1 donde R^1 corresponde a hidrógeno o acetilo (Pág. 4 líneas 45 a 58) y D5 que divulga un compuesto cefalosporina útil contra bacterias Gram negativas que producen beta-lactamasa en el cual se divulga un grupo catecol (Pág. 964, compuestos 8(a-c), 9(a-c) y 10(a-c))

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un grupo catecol (sustituyentes R^4 y R^5 correspondientes a OR^8 siendo R^8 hidrógeno) divulgados en los documentos D2,

D3, D4 y D5 unido mediante un grupo enlazante a un grupo amonio cuaternario como los sugeridos en los documentos utilizados en el compuesto cefalosporina divulgado en el documento D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia a la luz de los documentos D1 con D2, D1 con D3, D1 con D4 y D1 con D5

En conclusión la reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 18 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

En consecuencia las reivindicaciones 1 – 18 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2007119511	1 - 18	Nivel Inventivo
D2	US5149803	1 -18	Nivel Inventivo
D3	EP0474049	1 -18	Nivel Inventivo
D4	EP0241901	1 -18	Nivel Inventivo
D5	“SYNTHESIS AND ANTIBACTERIAL ACTIVITY OF CEPHALOSPORINS HAVING C-3 CATECHOL-CONTAINING (PYRIDINIUM-4'-THIO)- METHYL GROUPS”	1 -18	Nivel Inventivo

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 de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

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 2013-03-12

Elaboró: Rodolfo Cadena Amaya
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo