

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-083156- -00008-0000

Fecha: 2014-05-08 16:52:17 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 31

Señor Director
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 523

Referencia : Expediente No. **11.083.156**
Asunto : Solicitud de patente para: **"COMPUESTOS DE QUINOLONA Y SU COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA PARA REDUCIR LA PROGRESIÓN DE LA DISFUNCIÓN NEUROLÓGICA"**
Solicitante : **OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.**
Fecha de solicitud : 05 de julio de 2011.

1. Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, me refiero al oficio No. **23555** notificado por fijación en lista el 31 de diciembre de 2013.
2. Mediante memorial del 12 de marzo de 2014 se solicitó oportunamente plazo para responder la acción oficial.
3. Mediante oficio No. **23555** se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Las observaciones realizadas en el oficio se refieren a que las reivindicaciones 18 a 21 se refieren a un uso, a la claridad del título, a la claridad del pliego reivindicatorio, a la novedad de la reivindicación 22 en vista del documento D2: US 6,645,983, y al nivel inventivo de las reivindicaciones 1 a 17 y 23 en vista de los documentos D1: EP 1886996 y D2: US 6,645,983.

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel: (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección Oficina 852 - Tel: (57-4) 520 4760 / (57-4) 326 0789 / (57) 317-365 8663 / (57) 318 532 2365- COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

4. Respuesta a las objeciones

De este modo y con el objeto de atender las objeciones arriba mencionadas, se desea presentar las siguientes modificaciones, aclaraciones y argumentos:

4.1 Modificación de una solicitud en trámite

De acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, donde se establece que la modificación de una solicitud es posible en cualquier momento del trámite mientras no implique una ampliación de la solicitud inicial, me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones, junto con un nuevo título.

4.1.1 El título se ha modificado de la siguiente manera:

**“COMPUESTOS DE QUINOLONA Y SU COMPOSICIÓN FARMACÉUTICA PARA
REDUCIR LA PROGRESIÓN DE LA DISFUNCIÓN NEUROLÓGICA”**

4.1.2 Se han introducido las siguientes modificaciones al capítulo reivindicatorio:

- Se eliminaron las reivindicaciones 4, 6, 8-10, 12 y 18 a 23.
- Se modificaron las reivindicaciones 1, 2, 3, 5, 7, 11 y 13 a 15.
- Se reenumeraron las reivindicaciones.

Se eliminaron las reivindicaciones 18 a 21 que hacían referencia al uso de la invención, por lo que se ve superada esta objeción. Se eliminaron las reivindicaciones independientes 4, 6, 8, 10, 12 y 22, de manera que ahora el pliego reivindicatorio solo tiene una reivindicación independiente. La nueva reivindicación independiente 1 ahora incluye la materia de las reivindicaciones originales 4, 6, 10 y 12.

Con respecto a la objeción del término “opcionalmente” en las reivindicaciones originales 1 a 13, respetuosamente manifestamos nuestro desacuerdo con el Examinador

ya que se considera que dicho término define claramente alternativas de la composición (sustituido o no con el compuesto que lo sucede) que no altera la similitud entre compuestos. En el caso de una fórmula Markush, como el presente caso, el término “opcionalmente” no genera ambigüedad, ya que define de forma clara y concisa alternativas similares. De hecho, el término en cuestión está implícito en todas las fórmulas tipo Markush, ya que al definir un conjunto de alternativas, se está diciendo que una modalidad se puede realizar seleccionando opcionalmente cada uno de los elementos definidos. Sin embargo, con el fin de facilitar el proceso de patentabilidad se ha eliminado dicho término del pliego reivindicatorio.

En general la reivindicación 1 y sus dependientes han sido modificadas para limitar los sustituyentes para corresponder con aquellos descritos en la Tabla 1 de la acción oficial. De esta manera, el nuevo pliego reivindicatorio se encuentra completamente soportado por los Ejemplos de la descripción de la presente invención. Con respecto a la objeción de la reivindicación 17, respetuosamente manifestamos nuestro desacuerdo con el Examinador, ya que consideramos que la composición si se encuentra sustentada en el capítulo descriptivo, toda vez que describe el ingrediente activo de dicha composición, permitiendo de tal forma a la persona versada en la materia llevar a cabo la invención y reproducirla a partir de dicha información.

Teniendo en cuenta las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio y los argumentos presentados, todas las objeciones formuladas por el Examinador en cuanto a la claridad y concisión del pliego reivindicatorio se ven superadas. En consecuencia, debido a que se han superado las objeciones formuladas por su Despacho y que se cumple con los requisitos del artículo 30 de la Decisión 486, se solicita amablemente aceptar este nuevo pliego reivindicatorio para el nuevo análisis de patentabilidad.

4.3 Argumentos a favor de la novedad de la presente solicitud

De acuerdo con el artículo 16, de la Dec. 486 de la Comunidad Andina, el cual se refiere a la novedad de la invención se establece que:

“Artículo 16: Una invención se considerará nueva cuando no esté comprendida en el estado de la técnica.

El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente, o en su caso, de la prioridad reconocida.”

El método mediante el cual se evalúa la novedad de una invención, es a través de la comparación uno a uno de sus características esenciales. De este modo, para que una invención se objete por novedad, es porque sus características esenciales son **exactamente iguales** a las de un documento del estado de la técnica. Por lo tanto **en caso que llegue a existir al menos una diferencia entre dicha comparación**, se afirma que la invención **SI** cumple con el requisito de novedad.

En el presente caso, teniendo en cuenta las modificaciones realizadas al pliego reivindicatorio, se eliminó la reivindicación original 22, por lo que se ve superada la objeción de falta de novedad.

4.4 Argumentos a favor del nivel inventivo de la presente solicitud

El artículo 18 de la Decisión 486 señala lo siguiente:

“Artículo 18.- 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”.

Consecuentemente, una invención se considerará inventiva si la misma no hubiese resultado obvia a partir del arte previo, para una persona del oficio normalmente versada en la materia. Esto a su vez implica que el Examinador a cargo de esta evaluación debe colocarse en el momento exacto en el que el inventor buscaba resolver el problema técnico contemplado en la solicitud y para el cual poseía la literatura y el conocimiento disponibles en dicho momento.

Siguiendo entonces los lineamientos de la Jurisprudencia aplicable al análisis del nivel inventivo de una solicitud de patente, se considera que una anterioridad o una combinación de dos anterioridades puede afectar dicho requerimiento de patentabilidad, si una persona medianamente versada en la materia encuentra enseñanzas o sugerencias claras que, a partir de un conocimiento medio en dicho campo, le permitan llegar de manera obvia a la invención reivindicada. Adicionalmente se considera que una mejora sustancial, un efecto inesperado o una ventaja con respecto al arte previo es un indicio de nivel inventivo, por cuanto aporta un salto tecnológico en la regla técnica.

Adicionalmente, se debe tener en cuenta que los documentos del estado de la técnica frente a los cuales se debe efectuar el examen de nivel inventivo son aquellos que dentro del mismo campo técnico estén dirigidos a solucionar el mismo problema. Lo anterior, por cuanto estos son los documentos que se presume debieron ser de conocimiento del inventor para a partir de ellos formular su invención. Así los documentos relacionados con otros campos técnicos o dirigidos a solucionar cualquier otro problema no serían relevantes para estos efectos en la medida que no harían parte del grupo de documentos de los cuales el inventor hubiera podido derivar de manera obvia y evidente su invención.

A este respecto, respetuosamente manifestamos nuestro desacuerdo con el análisis llevado a cabo por el Examinador y con las conclusiones del mismo y solicitamos atentamente la reconsideración de las razones por las cuales se objeta el nivel inventivo, con base en la siguiente información:

En las reivindicaciones originales 1 y 4, los sustituyentes R₄ y R₅ o R₆ y R₇ que forman un anillo son características técnicas esenciales y estructurales. Los documentos D1 y D2 no enseñan un compuesto de quinolona que tenga la estructura de anillo como se especifica en las reivindicaciones de la presente solicitud.

La presente invención se relaciona a compuestos de quinolona que tienen los sustituyentes específicos que cumplen completamente con los requerimientos de soporte en la descripción, es decir los compuestos de los Ejemplos. Debido a dichos sustituyentes específicos, el compuesto de quinolona presenta efectos, como por ejemplo, proteger y

mejorar la función mitocondrial y/o un efecto de proteger neuronas y reparar función neuronal.

El Examinador establece que aunque el documento D1 tiene sustituyentes diferentes a los del compuesto de quinolona de la presente invención, el compuesto de quinolona de la presente invención es obvio al combinar los sustituyentes del compuesto del documento D2 y el compuesto de D1.

Sin embargo, el blanco para ser tratado por el componente de quinolona del documento D2 es cáncer y en el documento D1 se trata la alta afinidad para los receptores GABA_A, lo cual claramente es diferente del blanco del compuesto de quinolona de la presente invención. De esta manera, para obtener el compuesto de quinolona de la presente invención, una persona versada en la materia no se vería motivada a combinar las enseñanzas divulgadas en los documentos D1 y D2 que revelan compuestos empleados para el tratamiento de cáncer, para obtener los compuestos de quinolona de la presente invención los cuales proporcionan una reducción en la progresión disfuncional neurológica, el cual es un propósito completamente diferente a aquel tratado en los documentos citados.

Adicionalmente, el objeto de la presente invención es obtener un compuesto de quinolona que tenga un efecto de proteger y mejorar la función mitocondrial y/o un efecto de proteger neuronas y reparar función neuronal.

Además, las características del documento D1 yacen en un grupo carbonilmetil en la posición 1 y el objeto de D1 es proporcionar compuesto de quinolona que tengan una alta afinidad para los receptores GABA_A. Por lo tanto, debido a que la presente invención y el documento D1 tienen funciones diferentes, los problemas a resolver por la invención son completamente distintos. De modo que, una persona versada en la materia no se vería motivada a emplear las enseñanzas del mismo para solucionar el problema técnico planteado en la presente solicitud. Igualmente, el documento D2 trata otro blanco, es decir, cáncer, que es distinto a la función de los compuestos de quinolona de la presente

invención. De esta manera, no existe ninguna motivación en los documentos D1 o D2 para combinar D1 con D2 y resolver el problema técnico de la presente invención.

Adicionalmente, el Examinador establece en la acción oficial que los sustituyentes deben ser limitados a aquellos que se encuentran completamente soportados en la descripción de la solicitud. Esto indica que el Examinador reconoce que distintos efectos se pueden obtener al cambiar los sustituyentes de la presente invención. Por ende, consideramos que la afirmación del Examinador de que la persona versada en la materia podría fácilmente lograr la presente invención a partir de D1 y D2, es inconsistente.

Su Despacho se ha pronunciado en diversas oportunidades sobre la forma de llevar a cabo el análisis de nivel inventivo, de acuerdo a las directrices dadas por el Tribunal Andino. En efecto, el Tribunal ha dicho que *“Para determinar si el objeto de la reivindicación resulta obvio o se deriva de manera evidente del estado de la técnica se recurre, siempre que sea posible, al método problema-solución”* (Proceso 36-IP-2010). Siguiendo dicha metodología, se tiene que en el momento de la presente invención la persona versada en la materia se planteó como problema técnico, encontrar compuestos de quinolona que disminuyeran la progresión de la disfunción neurológica. El Examinador considera que el documento D1 es el más cercano a la invención, sin embargo el documento D1 solo tiene un ejemplo en donde R₄ corresponde a halógeno y en ninguna parte divulga datos farmacéuticos de dicho ejemplo. Además, como se mencionó anteriormente el documento D1 está dirigido a compuestos para el tratamiento de enfermedades asociadas con la modulación de los receptores GABA_A, de tal manera que estas razones demuestran que sería improbable que la persona versada en la materia hubiera escogido este documento como el estado de la técnica más cercano para poder lograr la presente invención. El “INSTRUCTIVO EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD” de su Despacho establece que: *“El estado de la técnica cercano es un documento que se encuentra en el mismo campo técnico que la invención o trata de solucionar el mismo problema o uno semejante. Suele ser el que tiene más características en común con la invención o presenta leves modificaciones de estructura e indica la misma función, propósito”*, en el presente caso el documento D1 no indica la misma función o propósito de la presente invención. Aun así con el fin de probar nuestro razonamiento, supongamos que la persona versada en la

materia sí escogió el documento D1 y además seleccionó específicamente el ejemplo en donde R₄ corresponde a halógeno a partir de todos los compuestos a los cuales se refiere este documento, sin ninguna motivación para hacerlo. Partiendo de este compuesto del documento D1 se tiene que la diferencia entre la presente invención y dicho compuesto es que en la posición R1 se define como sustituyente un alquilo C1-C6 carbamilo, mientras que el compuesto del documento D1 en la misma posición presente un grupo alquil-ácido (CHO). En este punto la persona versada en la materia se enfrenta con el problema técnico que es “como proporcionar un compuesto alternativo derivado de 4-quinolona para disminuir la degeneración neurológica”. El Examinador establece que la persona versada en la materia hubiera recurrido al documento D2 para compensar la diferencia entre el compuesto de la presente invención y el del documento D1, pero se debe cuestionar bajo que circunstancia dicha persona versada hubiera recurrido al documento D2. Adicionalmente, al encontrarse con el documento D2 cómo hubiera sabido que el cambio que debía realizar al compuesto era el sustituyente R1 de la presente invención y como hubiera sabido que hacer ese cambio iba poder obtener compuestos derivados de quinolona para disminuir la degeneración neurológica. Como se mencionó anteriormente, el documento D2 está dirigido a compuestos para tratar el cáncer, por lo que no existía en D2 ninguna enseñanza o sugerencia que le mostrara a la persona versada en la materia qué sustituyentes necesitaba cambiar del compuesto del documento D1 para poder resolver el problema técnico de la presente invención. El “INSTRUCTIVO EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD” de su Despacho establece: *“Esta etapa consiste en responder a la pregunta de si en el estado de la técnica en su conjunto hay un segundo documento que contiene una enseñanza que indicaría (no sólo que podría indicar, sino que indicaría) a la persona medianamente versada en la materia, enfrentada al problema técnico, cómo modificar o adaptar el estado de la técnica más cercano para resolver el problema, de la forma reivindicada, sin realizar una actividad inventiva”* (énfasis añadido). El documento D2 no indica como modificar el compuesto de D1 para resolver el problema técnico de la presente invención. De hecho, en ninguno de los dos documentos D1 o D2 existe alguna enseñanza o sugerencia que hubieran permitido saber a la persona versada en la materia que este tipo de compuestos iban a ser útiles para lograr proteger y mejorar la función mitocondrial y/o proteger neuronas y reparar función neuronal.

De esta manera, es claro que debido a que los documentos citados D1 y D2 no sugieren ni enseñan por sí solos o combinados: unos compuestos derivados de quinolona con sustituyentes específicos que logran proteger y mejorar la función mitocondrial y/o proteger neuronas y reparar función neuronal, se considera que la individualización de la selección del sustituyente alquilo C1-C6 carbamoilo de D2 realizada por el Examinador, solamente resulta posible si se efectúa un análisis retrospectivo de la presente invención, es decir, partiendo de la solución dada al problema técnico que la misma pretendía resolver. Lo anterior, por cuanto se reitera que no existe enseñanza o sugerencia alguna en dichos documentos que permita concluir que seleccionado la combinación total de todos los sustituyentes que se escogieron en la presente invención se podrían obtener dichos compuesto con un efecto técnico específico que no había sido divulgado en ninguno de los dos documentos del estado de la técnica, es decir no se sabía que iban a solucionar el problema técnico. Sin embargo, como es bien sabido, el análisis ex post facto se encuentra proscrito por el método problema-solución, por cuanto en todos los casos llevaría infundadamente a la conclusión que las invenciones sometidas a estudio carecen de nivel inventivo. Por todo lo anterior, se considera que la presente invención si cumple con el requisito de nivel inventivo y se debe dar por superada esta objeción.

4.5 Conclusiones

De acuerdo a todos los argumentos presentados, la presente solicitud cumple a cabalidad con los requerimientos exigidos en la Decisión 486 y las objeciones formuladas por el Examinador se ven superadas. Con respecto al nivel inventivo, consideramos que como se reconoce por el Examinador la materia del nuevo pliego reivindicatorio demuestra que el inventor en el momento de solucionar el problema técnico de la solicitud tuvo que emplear habilidad inventiva, ya que la presente invención no resulta de la mera extrapolación de las enseñanzas del arte previo.

5. Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por el Examinador, se solicita atentamente proceder al otorgamiento de la solicitud de patente. En este sentido, respetuosamente recordamos al Examinador que la patente no podrá ser negada con base en objeciones diferentes a las expuestas en la acción oficial No. 23555, toda vez que al no haber sido trasladadas a mi representada, dicha decisión violaría tanto el tenor literal del artículo 45 de la Decisión 486 como el derecho constitucional al debido

proceso. En este evento, y con base en el inciso 2 del artículo 45, respetuosamente solicitamos al Examinador expedir una nueva acción oficial que permita a mi representada contra argumentar las mismas o modificar la solicitud con el fin de cumplir los requisitos de patentabilidad.

Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

6. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 11 reivindicaciones.

Señor Director,


LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

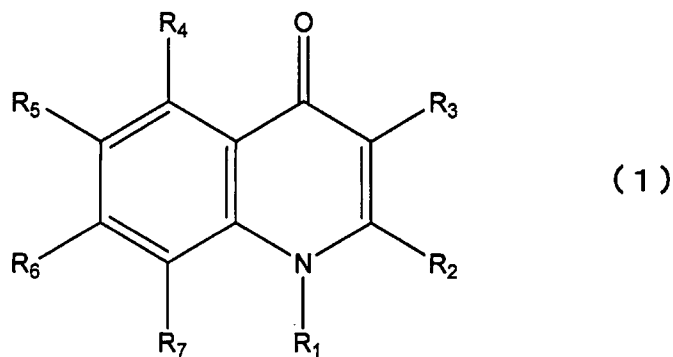
C.C. 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555

 COLO-14055-0841-015-9
FBJ\FBJ\ID-264780\WPC14055
No. M-2014-264780\FBJ

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de quinolona representado por la fórmula (1):



o una sal del mismo,

en donde R_1 representa:

- (1) hidrógeno,
- (2) C_1-C_6 alquilo,
- (3) C_1-C_6 alquilo sustituido con halógeno,
- (4) C_2-C_6 alquenilo,
- (5) C_1-C_6 alcanoilo,
- (14) carboxi C_1-C_6 alquiltio C_1-C_6 alquilo,
- (18) carboxi C_1-C_6 alquilsulfonil C_1-C_6 alquilo,
- (25) C_1-C_6 alcoxicarbonil C_1-C_6 alquilo,
- (27) morfolinil C_1-C_6 alquilo,
- (29) amino C_1-C_6 alquilo que puede tener uno o más grupos C_1-C_6 alquilo,
- (30) piperazil C_1-C_6 alquilo que tiene, en el anillo piperazina, uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por C_1-C_6 alcoxi C_1-C_6 alquilo, y piridilo,
- (31) piperidil C_1-C_6 alquilo que tiene uno o más grupos morfolinilo,
- (32) azetidil C_1-C_6 alquilo que tiene uno o más grupos hidroxil en el anillo azetidina,
- (33) isoindolinil C_1-C_6 alquilo que tiene uno o más grupos oxo,
- (35) carbamoil C_1-C_6 alquilo que tiene uno o más sustituyentes seleccionados de morfolinil C_1-C_6 alquilo;
- (36) fosfono-oxi C_1-C_6 alquilo que puede tener uno o más grupos protectores hidroxil, o
- (40) C_1-C_6 alcanoilamino C_1-C_6 alquilo que tiene, en el grupo C_1-C_6 alcanoilo, uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por amino; C_1-C_6 alcoxicarbonilamino; piperazinilo que tiene uno o más imidazolilo; y morfolinilpiperidilo;

R_2 representa:

- (1) hidrógeno, o
- (2) C_1-C_6 alquilo;

R_3 representa fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo, en donde:

el anillo fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo representado por R_3 puede ser sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (2), (5), (8) y (11):

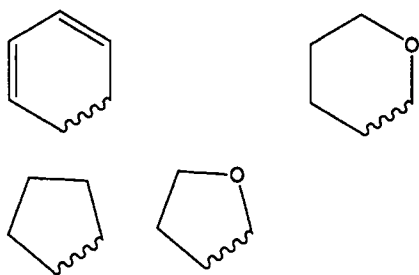
(2) C_1-C_6 alcoxi,

(5) hidroxilo,

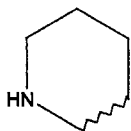
(8) benzoiloxi C_1-C_6 alcoxi, y

(11) pirrolidinilcarbonilo;

R_4 y R_5 se enlazan para formar un grupo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas:



o un grupo representado por la siguiente fórmula



el grupo puede tener uno o más sustituyentes seleccionados del grupo consistente de grupos oxo;

R_6 representa hidrógeno;

R_7 representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2), (6), (7), (9) y (11);

(2) C_1-C_6 alcoxi,

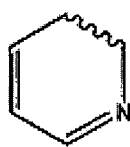
(6) carbamoilo C_1-C_6 alcoxi que tiene uno o más morfolinil C_1-C_6 alquilo,

(7) amino que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de C_1-C_6 alquilo y ciclo C_3-C_8 alquilo,

(9) carboxi C_1-C_6 alcoxi, y

(11) pirrolidinilo; y

R_6 y R_7 pueden ser enlazados para formar un grupo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas:



o

R1 representa:

- (1) hidrógeno,
- (2) C₁-C₆ alquilo,
- (3) C₁-C₆ alquilo sustituido con halógeno,
- (4) C₂-C₆ alquenilo,
- (5) C₁-C₆ alcanoilo,
- (14) carboxi C₁-C₆ alquiltio C₁-C₆ alquilo,
- (18) carboxi C₁-C₆ alquilsulfonil C₁-C₆ alquilo,
- (25) C₁-C₆ alcoxicarbonil C₁-C₆ alquilo,
- (27) morfolinil C₁-C₆ alquilo,
- (29) amino C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o más grupos C₁-C₆ alquilo,
- (30) piperazil C₁-C₆ alquilo que tiene, en el anillo piperazina, uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo, y piridilo,
- (31) piperidil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o más grupos morfolinilo,
- (32) azetidil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o más grupos hidroxil en el anillo azetidina,
- (33) isoindolinil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o más grupos oxo,
- (35) carbamoil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o más sustituyentes seleccionados de morfolinil C₁-C₆ alquilo;
- (36) fosfono-oxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o más grupos protectores hidroxil, o
- (40) C₁-C₆ alcanoilamino C₁-C₆ alquilo que tiene, en el grupo C₁-C₆ alcanoilo, uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por amino; C₁-C₆ alcoxicarbonilamino; piperazinilo que tiene uno o más imidazolilo; y morfolinilpiperidilo;

R2 representa:

- (1) hidrógeno, o
- (2) C₁-C₆ alquilo,

R3 representa fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo, en donde:

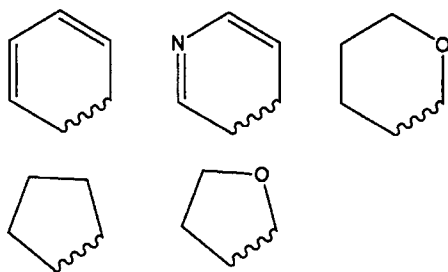
el anillo fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo representado por R₃ puede sustituirse con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por los siguientes sustituyentes (2), (5), (8) y (11):

- (2) C₁-C₆ alcoxi,
- (5) hidroxil,
- (8) hidroxil C₁-C₆ alcoxi protegido, y
- (11) pirrolidinilcarbonilo;

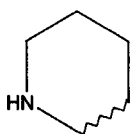
R_4 representa halógeno, C_1 - C_6 alquilo, o C_1 - C_6 alcoxi;

R_5 representa hidrógeno; o

R_4 y R_5 se enlazan para formar un grupo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas:

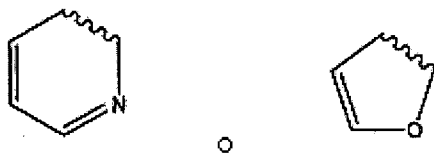


o a grupo representado por la siguiente fórmula:



el grupo puede tener uno o más sustituyentes seleccionados del grupo conformado por grupos oxo;

R_6 y R_7 se enlazan para formar un grupo representado por cualquiera de las siguientes fórmulas:



o

R_1 representa:

- (3) C_1 - C_6 alquilo sustituido con halógeno,
- (4) C_2 - C_6 alquenilo,
- (5) C_1 - C_6 alcanoilo,
- (14) carboxi C_1 - C_6 alquiltio C_1 - C_6 alquilo,
- (18) carboxi C_1 - C_6 alquilsulfonil C_1 - C_6 alquilo,
- (25) C_1 - C_6 alcoxicarbonil C_1 - C_6 alquilo,
- (27) morfolinil C_1 - C_6 alquilo,
- (29) amino C_1 - C_6 alquilo que puede tener uno o dos grupos C_1 - C_6 alquilo,
- (30) piperazil C_1 - C_6 alquilo que tiene, en el anillo piperazina, un sustituyente seleccionado del grupo conformado por C_1 - C_6 alcoxi C_1 - C_6 alquilo, y piridilo,
- (31) piperidil C_1 - C_6 alquilo que tiene un grupo morfolinilo,
- (32) azetidil C_1 - C_6 alquilo que tiene un grupo hidroxil en el anillo azetidina,
- (33) isoindolinil C_1 - C_6 alquilo que tiene uno o dos grupos oxo,

(35) carbamoil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados de morfolinil C₁-C₆ alquilo;

(36) fosfono-oxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo en el grupo fosfono, o

(40) C₁-C₆ alcanoilamino C₁-C₆ alquilo que tiene, en el grupo C₁-C₆ alcanoilo, uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo conformado amino; C₁-C₆ alcoxicarbonilamino; piperazinilo que tiene un imidazolilo; y morfolinilpiperidilo;

R₂ representa:

(1) hidrógeno, o

(2) C₁-C₆ alquilo;

R₃ representa fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo, en donde:

el anillo fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo representado por R₃ puede ser sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (2), (5), (8) y (11):

(2) C₁-C₆ alcoxi,

(5) hidroxilo,

(8) tetrahidropiraniloxi C₁-C₆ alcoxi, y

(11) pirrolidinilcarbonilo,

R₄ representa halógeno;

R₅ representa hidrógeno;

R₆ representa hidrógeno; y

R₇ representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2), (6), (7), (9) y

(11):

(2) C₁-C₆ alcoxi,

(6) carbamoil C₁-C₆ alcoxi que tiene un morfolinil C₁-C₆ alquilo,

(7) amino que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de C₁-C₆ alquilo y ciclo C₃-C₈ alquilo,

(9) carboxi C₁-C₆ alcoxi, y

(11) pirrolidinilo; o

R₁ representa:

(1) hidrógeno, o

(2) C₁-C₆ alquilo;

R₂ representa hidrógeno;

R₃ representa fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo, en donde:

el anillo fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo representado por R₃ es sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (8) y (11):

(8) benciloxi C₁-C₆ alcoxi, y

(11) pirrolidinilcarbonilo;

R_4 representa halógeno;

R_5 representa hidrógeno;

R_6 representa hidrógeno; y

R_7 representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2), (6), (7), (9) y

(11):

(2) C_1-C_6 alcoxi,

(6) carbamoil C_1-C_6 alcoxi que tiene un morfolinil C_1-C_6 alquilo,

(7) amino que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de C_1-C_6 alquilo y ciclo C_3-C_8 alquilo,

(9) carboxi C_1-C_6 alcoxi, y

(11) pirrolidinilo; o

R_1 representa:

(1) hidrógeno o

(2) C_1-C_6 alquilo;

R_2 representa hidrógeno;

R_3 representa fenilo, en donde:

el fenilo representado por R_3 es sustituido con un C_1-C_6 alcoxi,

R_4 representa halógeno, o C_1-C_6 alcoxi;

R_5 representa hidrógeno;

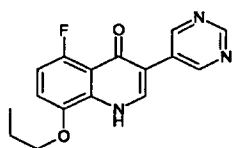
R_6 representa hidrógeno; y

R_7 representa uno cualquiera de los siguientes grupos (6) y (11):

(6) carbamoil C_1-C_6 alcoxi que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo conformado por C_1-C_6 alquilo y morfolinil C_1-C_6 alquilo, y

(11) pirrolidinilo; o

En donde el compuesto de quinolona o una sal del mismo es



2. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

R_1 representa:

(1) hidrógeno,

(2) C_1-C_6 alquilo,

(3) C_1-C_6 alquilo sustituido con halógeno,

- (4) C₂-C₆ alquenilo,
- (5) C₁-C₆ alcanoilo,
- (14) carboxi C₁-C₆ alquiltio C₁-C₆ alquilo,
- (18) carboxi C₁-C₆ alquilsulfonil C₁-C₆ alquilo,
- (25) C₁-C₆ alcoxicarbonil C₁-C₆ alquilo,
- (27) morfolinil C₁-C₆ alquilo,
- (29) amino C₁-C₆ alquilo que puede tener un grupo C₁-C₆ alquilo en el grupo amino,
- (30) piperazil C₁-C₆ alquilo que tiene, en el anillo piperazina, un sustituyente seleccionado del grupo conformado por C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo, y piridilo,
- (31) piperidil C₁-C₆ alquilo que tiene un grupo morfolinilo en el anillo piperidina,
- (32) azetidil C₁-C₆ alquilo que tiene un grupo hidroxil en el anillo azetidina,
- (33) isoindolinil C₁-C₆ alquilo que tiene dos grupos oxo en el anillo isoindolina,
- (35) carbamoil C₁-C₆ alquilo que tiene, en el grupo carbamoilo, un sustituyente seleccionado de morfolinil C₁-C₆ alquilo;
- (36) fosfono-oxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo en el grupo fosfono, o
- (40) C₁-C₆ alcanoilamino C₁-C₆ alquilo que tiene, en el grupo C₁-C₆ alcanoilo, uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo conformado por amino; C₁-C₆ alcoxicarbonilamino; piperazinilo que tiene un imidazolilo; y morfolinilpiperidilo;

R₂ representa:

- (1) hidrógeno,
- (2) C₁-C₆ alquilo, o

R₃ representa fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo, en donde:

el anillo fenilo, tienilo, furilo, o pirimidinilo representado por R₃ puede ser sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (2), (5), (8) y (11):

- (2) C₁-C₆ alcoxi,
- (5) hidroxil,
- (8) benzoiloxi C₁-C₆ alcoxi, y
- (11) pirrolidinilcarbonilo;

R₆ representa hidrógeno; y

R₇ representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2), (6), (7), (9) y (11):

- (2) C₁-C₆ alcoxi,
- (6) carbamoil C₁-C₆ alcoxi que tiene, en el grupo carbamoilo, un morfolinil C₁-C₆ alquilo,
- (7) amino que tiene dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de C₁-C₆ alquilo y ciclo C₃-C₈ alquilo,
- (9) carboxi C₁-C₆ alcoxi, y
- (11) pirrolidinilo.

3. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 2, en donde

R₁ representa:

- (1) hidrógeno,
- (2) C₁-C₆ alquilo,
- (3) halógeno sustituido C₁-C₆ alquilo,
- (25) C₁-C₆ alcoxicarbonil C₁-C₆ alquilo,
- (27) morfolinil C₁-C₆ alquilo,
- (30) piperazil C₁-C₆ alquilo que tiene, en el anillo piperazina, un C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo,
- (31) piperidil C₁-C₆ alquilo,
- (35) carbamoil C₁-C₆ alquilo que tiene un morfolinil C₁-C₆ alquilo, o
- (36) fosfono-oxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo;

R₂ representa:

- (1) hidrógeno, o
- (2) C₁-C₆ alquilo,

R₃ representa fenilo, tienilo, o furilo, en donde:

el anillo fenilo, tienilo, o furilo representado por R₃ puede ser sustituido con un grupo C₁-C₆ alcoxi,

R₆ representa hidrógeno; y

R₇ representa C₁-C₆ alcoxi.

4. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R₁ representa:

- (1) hidrógeno,
- (2) C₁-C₆ alquilo, o
- (36) fosfonooxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo;

R₂ representa hidrógeno,

R₃ representa fenilo en donde el anillo aromático o heterocíclico representado por R₃ puede ser sustituido con un grupo C₁-C₆ alcoxi;

R₄ representa C₁-C₆ alquilo, o C₁-C₆ alcoxi; y

R₅ representa hidrógeno.

5. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R₁ representa:

- (3) C₁-C₆ alquilo sustituido con halógeno,
- (4) C₂-C₆ alquenilo,
- (5) C₁-C₆ alcanoilo,

- (14) carboxi C₁-C₆ alquiltio C₁-C₆ alquilo,
- (18) carboxi C₁-C₆ alquilsulfonil C₁-C₆ alquilo,
- (25) C₁-C₆ alcoxicarbonil C₁-C₆ alquilo,
- (27) morfolinil C₁-C₆ alquilo,
- (29) amino C₁-C₆ alquilo que tiene uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo,
- (30) piperazil C₁-C₆ alquilo que tiene, en el anillo piperazina, un sustituyente seleccionado del grupo conformado por C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo, y piridilo,
- (31) piperidil C₁-C₆ alquilo que tiene un grupo morfolinilo,
- (32) azetidil C₁-C₆ alquilo que tiene un grupo hidroxil en el anillo azetidina,
- (33) isoindolinil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o dos grupos oxo,
- (35) carbamoil C₁-C₆ alquilo que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados de morfolinil C₁-C₆ alquilo;
- (36) fosfonooxi C₁-C₆ alquilo que puede tener uno o dos grupos C₁-C₆ alquilo en el grupo fosfona, o
- (40) C₁-C₆ alcanoilamino C₁-C₆ alquilo que tiene, en el grupo C₁-C₆ alcanoilo, uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo conformado por amino; C₁-C₆ alcoxicarbonilamino; piperazinilo que tiene un imidazolilo; y morfolinilpiperidilo;

R₂ representa hidrógeno;

R₃ representa fenilo, o pirimidinilo,

en donde:

el anillo fenilo o pirimidinilo representado por R₃ puede ser sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (2), (5), (8), y (11):

(2) C₁-C₆ alcoxi,

(5) hidroxil,

(8) tetrahidropiraniloxi C₁-C₆ alcoxi, y

(11) pirrolidinilcarbonilo;

R₄ representa halógeno;

R₅ representa hidrógeno;

R₆ representa hidrógeno; y

R₇ representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2), (7) y (11):

(2) C₁-C₆ alcoxi,

(7) amino que tiene uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo consistente de C₁-C₆ alquilo y ciclo C₃-C₈ alquilo, y

(11) pirrolidinilo.

6. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R₁ representa hidrógeno;

R_3 representa fenilo, en donde:

el fenilo representado por R_3 puede ser sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo consistente de los siguientes sustituyentes (8) y (11):

(8) benciloxi C_1 - C_6 alcoxi, y

(11) pirrolidinilcarbonilo;

R_4 representa halógeno;

R_5 representa hidrógeno;

R_6 representa hidrógeno; y

R_7 representa uno cualquiera de los siguientes grupos (2) y (11):

(2) C_1 - C_6 alcoxi; y

(11) pirrolidinilo.

7. Un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R_1 representa hidrógeno;

R_3 representa fenilo, en donde:

el fenilo representado por R_3 puede ser sustituido con un C_1 - C_6 alcoxi,

R_4 representa halógeno;

R_5 representa hidrógeno;

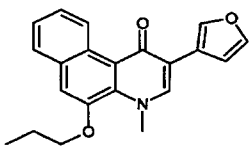
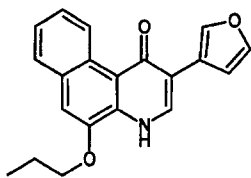
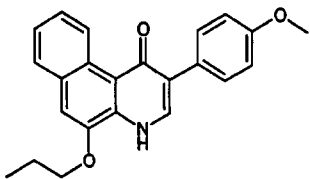
R_6 representa hidrógeno; y

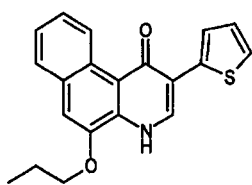
R_7 representa uno cualquiera de los siguientes grupos (6) y (11):

(6) carbamoil C_1 - C_6 alcoxi que puede tener un sustituyente seleccionado del grupo conformado por C_1 - C_6 alquilo y morfolinil C_1 - C_6 alquilo, y

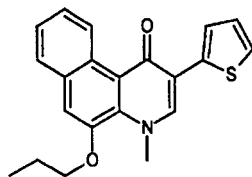
(11) pirrolidinilo.

8. Un compuesto de quinolona de acuerdo con la reivindicación 1, que es la siguiente fórmula:

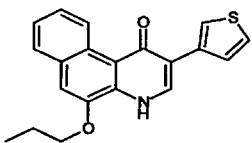




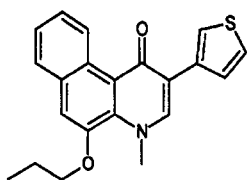
,



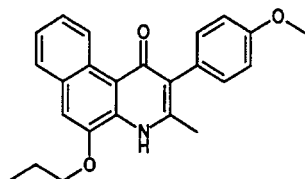
,



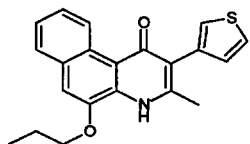
,



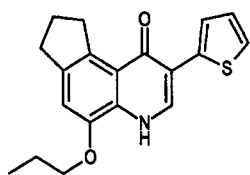
,



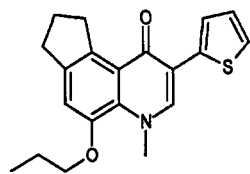
,



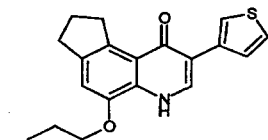
,



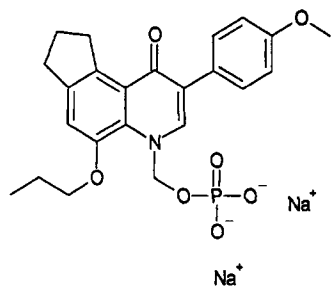
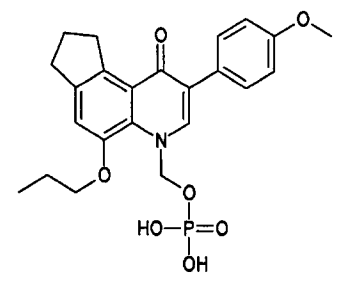
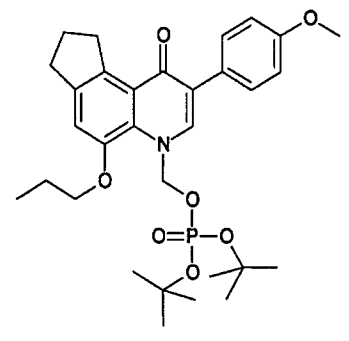
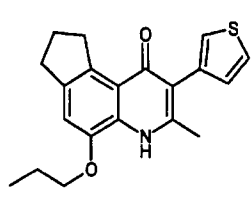
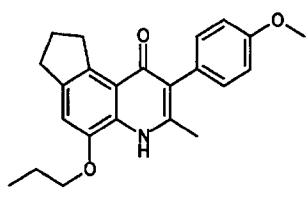
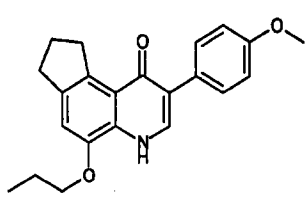
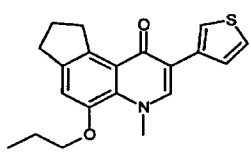
,

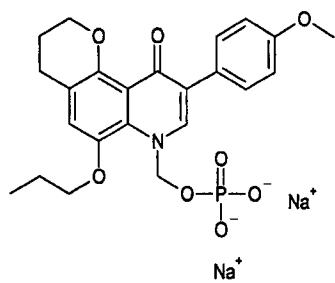
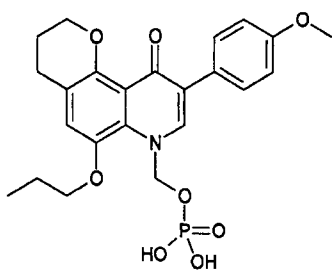
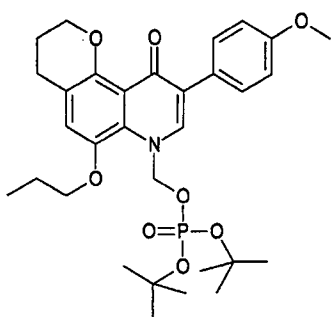
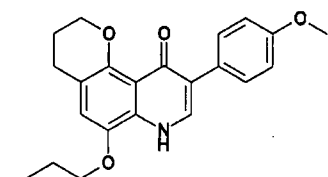
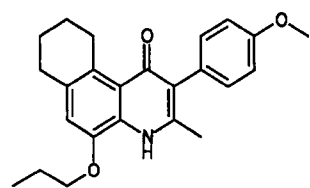
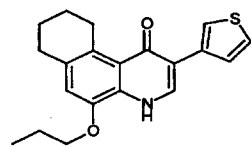
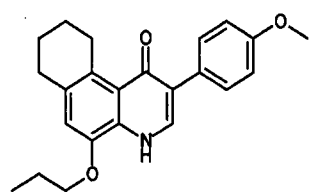


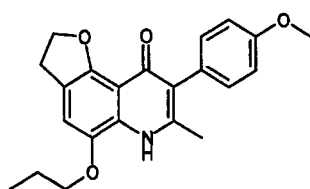
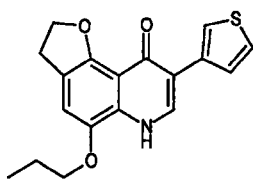
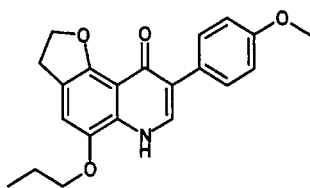
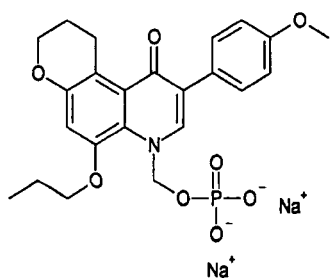
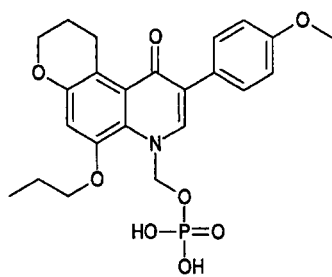
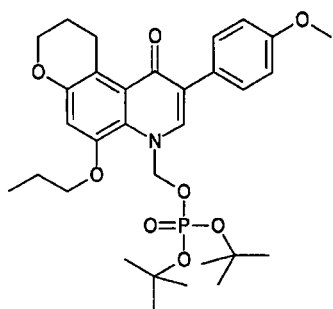
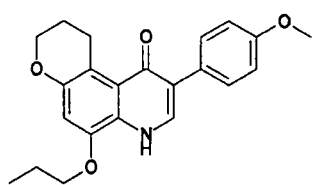
,

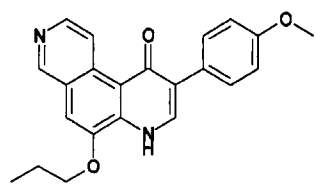
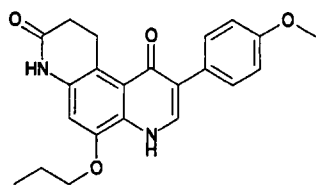
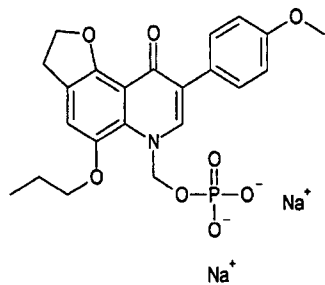
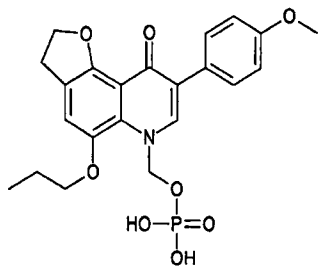
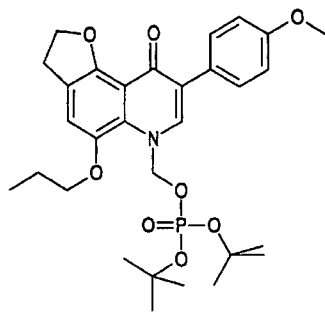


,

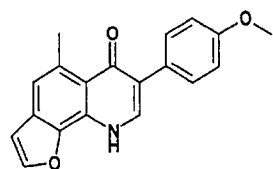


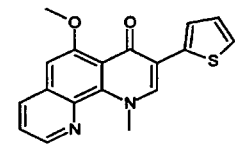
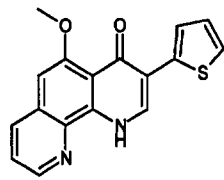
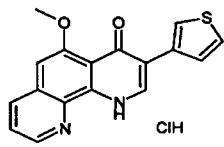
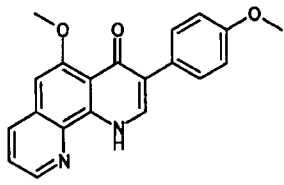




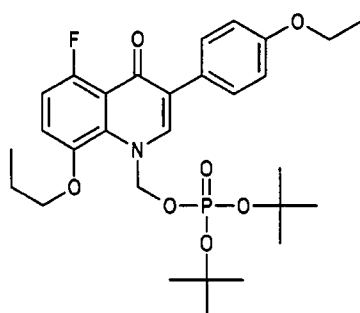
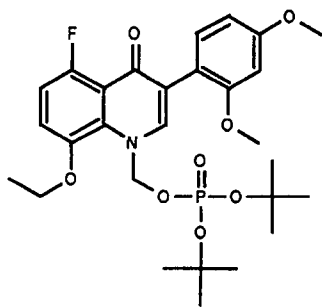
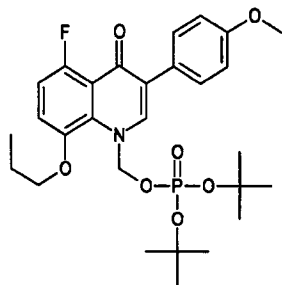


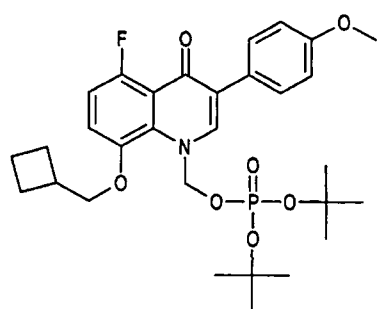
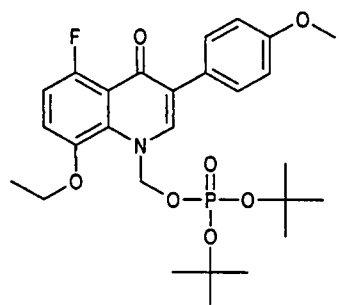
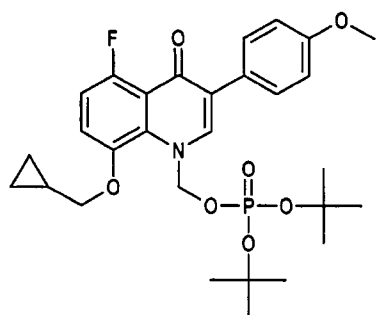
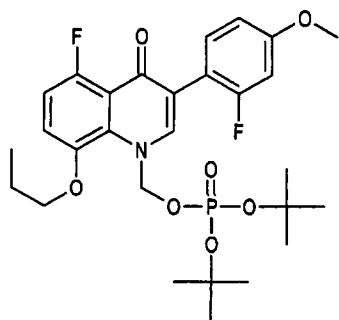
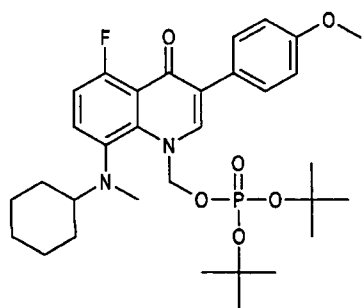
9. Un compuesto de quinolona de acuerdo con la reivindicación 1, que es la siguiente fórmula:

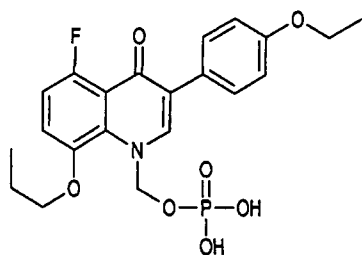
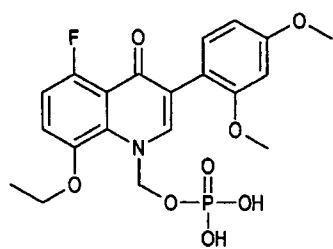
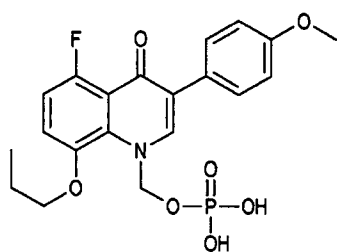
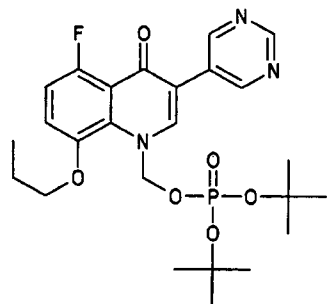
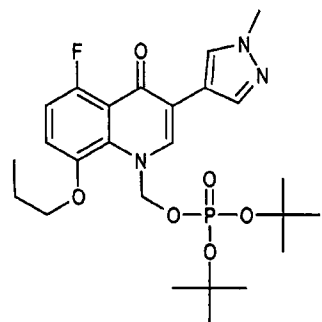
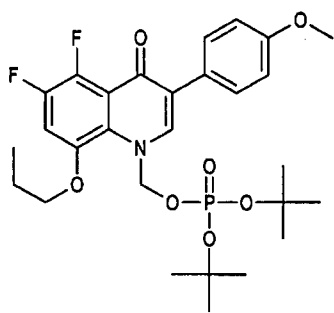


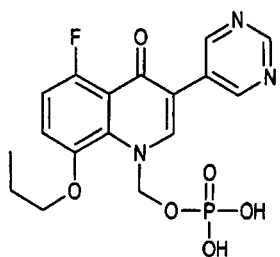
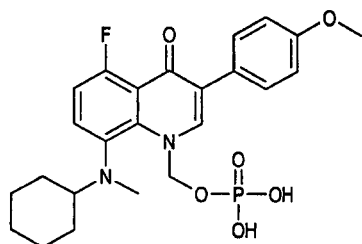
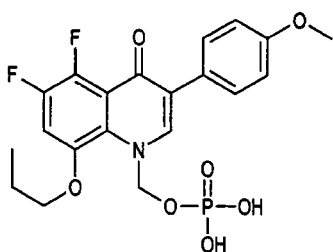
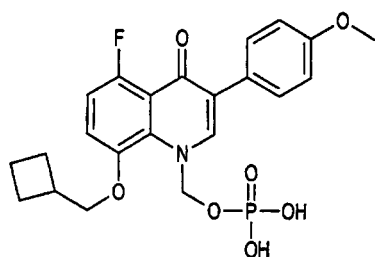
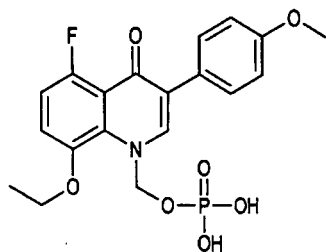
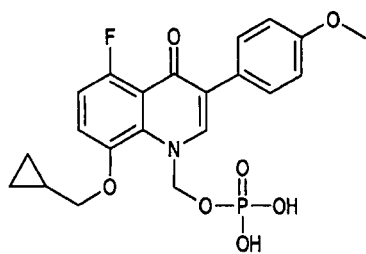


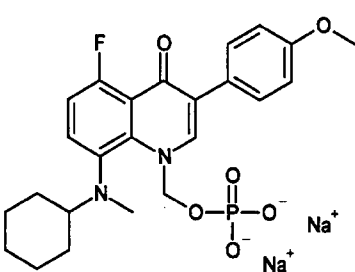
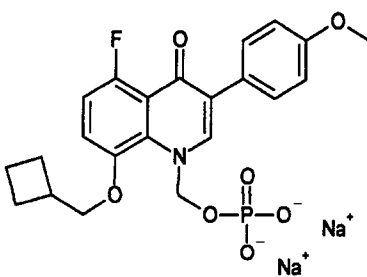
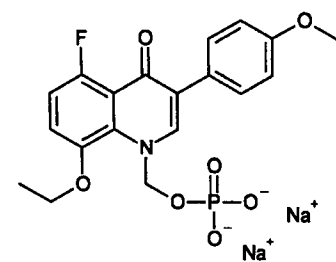
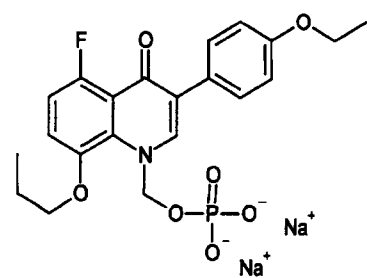
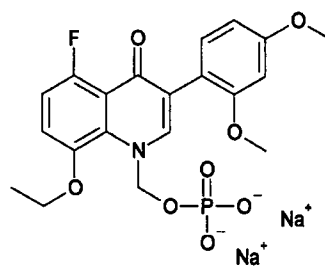
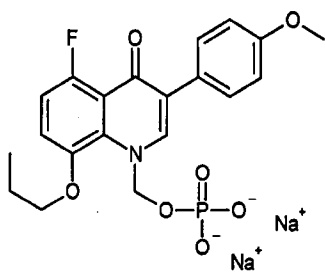
10. Un compuesto de quinolona de acuerdo con la reivindicación 1, que es la siguiente fórmula:

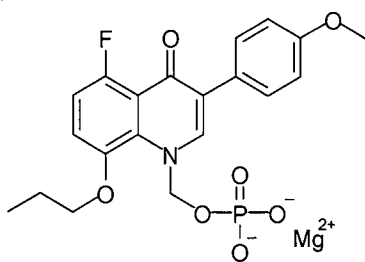
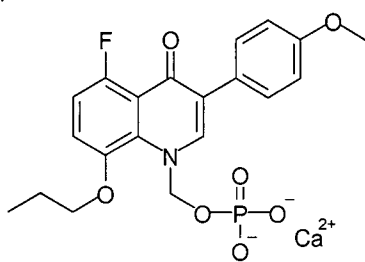
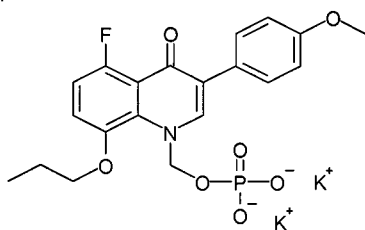
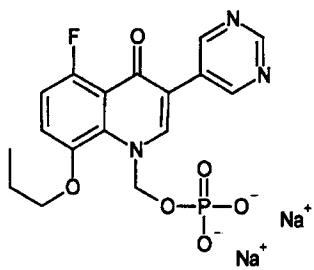












11. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de quinolona de Fórmula General (1) de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 o una sal del mismo como un ingrediente activo; y un vehículo farmacéuticamente aceptable.