

Clarke, Modet & C^o

COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-003900- -00013-0000

Fecha 2010-02-04 15:02:12 Dep 2020 DIR.NUEVASCR
Tra 11 PATENTE.IYII Eve 379 FASENACIONALII
Act 444 RESPUESTA.RLQUE Folios: 14

P-1979

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

Re: Expediente No. 05-003.900

Solicitud de patente a nombre de **THE PROCTER & GAMBLE COMPANY.**

Yo, DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN, actuando como apoderada sustituta de acuerdo con la sustitución presentada el 29 de diciembre de 2009, identificada como aparece al pie de mi firma, domiciliada en la carrera 11 A No. 86-53, piso 6, obrando como apoderada de la sociedad **THE PROCTER & GAMBLE COMPANY**, domiciliada en Ohio, Estados Unidos de América, solicitante de la patente de la referencia, en respuesta al oficio No. 11985 notificado por fijación en lista el 23 de octubre de 2009 relacionado con el concepto técnico de fondo No. 3140, me permito manifestar lo siguiente:

1. Con fundamento en la facultad que confiere el artículo 34 de la Decisión 486 al solicitante para modificar la solicitud de patente en cualquier momento del trámite, presento junto con este memorial nuevo juego de reivindicaciones, que ahora consta de 25 cláusulas, en el cual se realizaron las siguientes modificaciones:

1.1 Se introdujeron las nuevas reivindicaciones 3, 4 y 5 que cubren las opciones específicas enunciadas en la antigua cláusula 2 en donde la cláusula 3 hace referencia al proceso de la cláusula 1 donde R es $-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CHF}_2$ y $-\text{CF}_3$, la cláusula 4 especifica que R es $-\text{Cl}$ y la reivindicación 5 especifica que R es $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$.

1.2 Las antiguas reivindicaciones 3 a 9 se renumeraron como las nuevas cláusulas 6 a 12 y se modificó su dependencia.

1.3 La antigua reivindicación 9 se abrió en las nuevas reivindicaciones 12, 13 y 14 donde se especificó que el hidruro metálico es seleccionado del grupo LiH, NaH, KH, CaH_2 y mezclas de éstos, la base inorgánica es seleccionada de Na_2CO_3 , NaHCO_3 , K_2CO y mezclas de éstos y la base orgánica se selecciona de butil litio y diisopropilamida de litio, respectivamente.

1.3 Se renumeraron las antiguas reivindicaciones 10 a 18 como las nuevas cláusulas 15 a 23 y se modificó su respectiva dependencia.

1.4 Se agregaron las nuevas reivindicaciones 24 y 25 donde se especificó que agente de sililación es N,O-bis(trimetilsilil)acetamida y se especificó que en el paso (d) se hace bajo reflujo en presencia de un solvente.

En relación con las anteriores modificaciones, nos permitimos manifestar que las mismas no amplían en ningún sentido el alcance de la solicitud como fue originalmente presentada y se realizaron con el fin de realzar la novedad y la altura inventiva de la presente invención.

Teniendo en cuenta el concepto técnico emitido por el Señor Superintendente Delegado para la propiedad intelectual GianCarlo Marcenaro Jiménez a la doctora Ana Maria Castro Wey, que da alcance a las comunicaciones No. 09-001524 y 09-012566, no se presenta una tasa adicional, toda vez la solicitud fue presentada con anterioridad al 1 de enero de 2009.

2. Novedad

El señor examinador argumenta que el proceso reivindicado en la solicitud es "idéntico al divulgado en D1," y que por consiguiente carece de novedad.

Con relación a la argumentación presentada en el concepto técnico No. 3140, resulta pertinente dirigir la atención del señor examinador al artículo 16 de la Decisión 486 donde se establece que: "Una invención **se considera nueva cuando no está 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 resaltado es nuestro).

Si de acuerdo con el espíritu de la norma legal indicada, la invención no se considera como nueva si está "comprendida" en el estado de la técnica, dicha norma se está refiriendo, naturalmente, a la totalidad del invento y no a alguno o a algunos de los componentes que hacen parte de la nueva solicitud.

En efecto, para que la invención pierda su calidad de novedosa, es claro que ella, TODA ELLA, ha de estar contenida en el "*conjunto de conocimientos existentes que son aplicables al proceso industrial*" como define el estado de la técnica el Tribunal de justicia del Acuerdo de Cartagena (Proceso No. 6-IP-89, sentencia de 31 de octubre de 1989, publicada en Jurisprudencia del Tribunal de Justicia del Acuerdo de Cartagena, Tomo 11, BID-INTAL, Buenos Aires, 1994, página 60).

Esto se conoce como **NOVEDAD ABSOLUTA**, de conformidad con lo cual para desvirtuar el requisito de novedad de una invención será necesario que lo reivindicado por la invención bajo estudio corresponda de **forma total** con lo revelado en un documento o anterioridad señalada, conclusión a la que se llega después de un análisis exhaustivo mediante una comparación entre el capítulo reivindicatorio de la invención en estudio y la divulgación citada por ese despacho como anterioridad.

Ahora bien, si un determinado elemento, condición o circunstancia de la nueva creación ya hace parte del estado de la técnica no quiere ello decir, desde luego, que la invención deba ser rechazada por carecer del requisito de novedad. No sin razón ha dicho el mencionado Tribunal: *"hay que advertir que toda creación es en cierta forma, producto del estado de la técnica existente, en el sentido de que el inventor ha de tener en cuenta un conjunto de conocimientos técnicos que le permitan crear nuevos procedimientos aplicables a la industria"* (Ibidem, páginas 53 y 54) (El subrayado es nuestro).

Por lo tanto y teniendo en cuenta lo anteriormente expuesto, como mínimo la novedad debe contemplar los siguientes aspectos:

-Que la invención en estudio esté contenida de forma **TOTAL** y **ABSOLUTA** en el documento que se menciona como anterioridad; y

-Que la invención en cuestión puede partir de conocimientos conocidos, caso en el cual habrá que hacer la comparación no de lo conocido sino de lo inédito y novedoso, teniendo que analizarse el **valor agregado** que aporta la invención con sus nuevas características al campo técnico al cual pertenece la solicitud en estudio.

Aplicando lo anterior al caso concreto, para que las razones que aduce ese despacho para desvirtuar la novedad fuesen ciertas, sería forzoso que se demostrara que la invención de mi mandante está comprendida en el estado de la técnica de forma **TOTAL**, lo cual no sucede debido a que ~~la presente invención requiere de dos precursores específicos de quinolona~~ en tanto que la anterioridad D1 únicamente revela el segundo precursor con el grupo flúor en la posición 2 del anillo fenílico como así se puede observar en el ejemplo 5 ubicado en la página 88 de D1.

Por consiguiente, existen diferencias entre lo reportado en D1 y la materia objeto de la presente solicitud.

3. Nivel inventivo

En cuanto a este requisito, esa oficina es de la opinión que las enseñanzas combinadas de los documentos D1 (WO 0248113) y US5703231 (D2) afectarían la altura inventiva del proceso de la invención en estudio, ya que D2 sugiere emplear una acetofenona como compuesto de partida en lugar de un ácido benzoico como lo reporta D1.

Sobre este particular, el señor examinador podrá notar que en el nuevo juego de reivindicaciones se especificó el segundo componente de la mezcla para ser uno en el cual el flúor reemplaza el grupo etoxi en la posición 2 del grupo fenílico. En este sentido, respetuosamente dirigimos la atención del señor examinador a las páginas 9 a 11 de la memoria descriptiva donde se pone de manifiesto que existía un problema en el estado del arte relacionado con la eliminación indeseada del átomo de flúor en la posición 2 durante la preparación de los precursores de antibióticos de quinolona, donde dicho átomo de flúor era sustituido por un grupo etoxilo, lo cual disminuía el rendimiento de la reacción principal.

En este sentido, el solicitante encontró que de manera sorprendente se puede realizar la ciclización de dicho subproducto etoxilado en la segunda posición del anillo fenílico mediante una reacción con el aducto de 2-fluoro correspondiente en una reacción llevada en condiciones suaves y de alto rendimiento.

Ahora bien, teniendo en cuenta que D1 no revelaba ni sugería la presencia de este segundo producto, nos permitimos manifestar que una persona medianamente versada en la técnica no habría encontrado motivación alguna a partir de lo mostrado en D2 para solucionar las deficiencias señaladas anteriormente en D1. En efecto, es bien sabido por aquellos versados en la materia que el patrón de sustitución sobre un anillo aromático, especialmente sobre un anillo fenílico influencia la reactividad del anillo núcleo. En D2, como se puede apreciar en su descripción, el primer paso del ejemplo 9, el grupo flúor en la posición 4 del anillo fenílico es reemplazado por un anillo 4-metilpiperazina, el cual está claramente en contraposición al proceso reclamado en la presente solicitud, especialmente mostrado en la antigua reivindicación 8 (nueva cláusula 11), donde el grupo flúor en la posición 4 se encuentra presente a lo largo de toda la reacción.

Así las cosas, los reactivos mostrados y enseñados en D2 son completamente diferentes de aquellos señalados en la nueva reivindicación 11. Por consiguiente, los pasos de reacción también son diferentes y la reacción reclamada, por ende, es inventiva sobre lo mostrado en D1 y D2. Aún más, El solicitante encontró de manera sorprendente que el compuesto 2-etoxi actualmente reivindicado, el cual fue un subproducto inesperado en el primer paso de la reacción, también puede ser exitosamente ciclizado junto con el compuesto de interés (compuesto 2-fluoro) sin la necesidad de una

119
117

purificación intermedia, produciendo los intermediarios antibióticos de quinolona con un alto rendimiento y con condiciones más suaves que las mostradas en la técnica anterior.

Por consiguiente, nos permitimos hacer énfasis sobre el hecho que ninguno de los dos documentos citados por esa oficina revela o sugiere realizar la ciclización de una mezcla de los compuestos reclamados 2-fluoro y 2-etoxi para producir los intermediarios antibióticos de quinolona de la presente invención. Más aún, una persona medianamente versada en la técnica no habría encontrado ningún tipo de información que le hubiera permitido derivar de manera evidente el resultado de la ciclización de ambas especies con alto rendimiento para llegar al producto deseado a partir de lo mostrado en D1 y D2. En consecuencia, la invención del solicitante tiene altura inventiva sobre dichos documentos.

Habiendo atendido cabalmente las objeciones presentadas por ese despacho, atentamente solicitamos se conceda el privilegio de patente de invención a la solicitud en estudio o si el examinador considera que subsisten razones para objetar la presente invención, rogamos expedir otro examen de fondo con los debidos motivos y razones que sustenten su objeción con el fin de que nuestro mandante tenga la posibilidad de exponer sus argumentos con base en la interpretación de los artículos 45 de la Decisión 486 -el cual otorga la facultad al examinador para emitir los exámenes de fondo-, 35 y 59 del Código Contencioso Administrativo que señala que: *"habiéndose dado oportunidad a los interesados para expresar sus opiniones, y con base en las pruebas e informes disponibles, se tomará la decisión que será motivada al menos en forma sumaria si afecta a particulares"* y *"(..) deberá proferirse la decisión definitiva. Esta se motivará en sus aspectos de hecho y de derecho, y en los de conveniencia si es el caso"*, respectivamente (El subrayado es nuestro).

En consecuencia, pedimos a ese despacho pronunciarse en relación con todos los argumentos presentados en este memorial dando estricta aplicación al principio del debido proceso consagrado en el artículo 29 de la Constitución Nacional

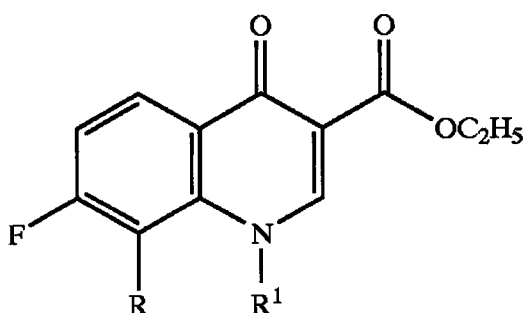
Señor Superintendente,



DILIA MARIA RODRIGUEZ D'ALEMAN
CC. 41.654.882
TP 20824 CSJ

REIVINDICACIONES

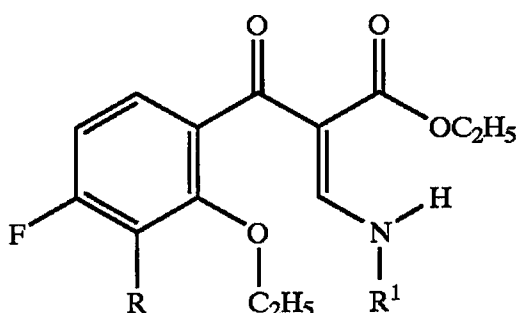
1. Un proceso para preparar un intermedio de
5 antibiótico de quinolona que tiene la fórmula:



caracterizado porque R es alquilo de 1 a 2 átomos de
carbono, fluoroalquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
alquenilo de 2 a 4 átomos de carbono, metoxi, cloro
10 o bromo;

R¹ es una unidad escogida del grupo formado por
alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquenilo de 2 a
3 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de
carbono y fenilo, cada una de las cuales puede ser
15 sustituida por uno o más átomos de flúor; el proceso
comprende el paso de ciclicizar una mezcla de
precursores de quinolona; la mezcla comprende un
intermedio de 2-etoxi sustituido que tiene la
fórmula:

20



en presencia de un agente de sililación.

121
119

2. Un proceso según la reivindicación 1, caracterizado porque R es $-\text{OCH}_3$.

5 3. Un proceso según la reivindicación 1, caracterizado porque R es $-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CHF}_2$ y $-\text{CF}_3$.

4. Un proceso según la reivindicación 1, caracterizado porque R es $-\text{Cl}$.

10

5. Un proceso según la reivindicación 1, caracterizado porque R es $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$.

6. Un proceso de conformidad con la reivindicación
15 1, caracterizado porque la ciclización se realiza en presencia de un solvente seleccionado del grupo formado por cloruro de metileno, diclorometano, hexametilfosforamida, tetrahidrofurano, benceno, tolueno, alcanos y mezclas de éstos.

20

7. Un proceso de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque el agente de sililación se selecciona del grupo formado por clorotrimetilsilano, N,O-
25 bis(trimetilsilil)acetamida, N,O-
bis(trimetilsilil)trifluoroacetamida,
bis(trimetilsilil)urea, hexametiltrisilazano, N-
metil-N-trimetilsililtrifluoroacetamida, 1-
trimetilsilil-imidazol, trimetilsilil
30 trifluormetanosulfonato, ter-
butildimetilclorosilano, 1-(ter-

7

722
120

butildimetilsilil)imidazol, N-ter-butildimetil-N-
metiltrifluoroacetamida, ter-
butildimetilsililtrifluorometanosulfonato, ter-
butilfenilclorosilano, ter-butyl-
5 metoxifenilbrornosilano, dimetilfenilclorosilano,
triethylclorosilano, trimetilsilil
trifluorometanosulfonato y trifenilclorosilano.

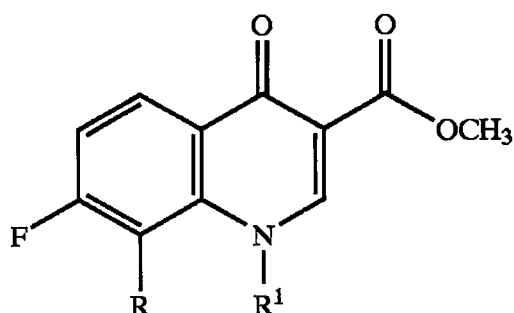
8. Un proceso de conformidad con la reivindicación
10 7, caracterizado porque el agente de sililación es
N,O-bis(trimetilsilil)acetamida.

9. Un proceso de conformidad con la reivindicación
1, caracterizado porque R¹ ciclopropilo, metilo,
15 etilo y bencilo.

10. Un proceso de conformidad con la reivindicación
1, caracterizado porque la ciclización se realiza
mediante reflujo en presencia de un solvente.

20

11. Un proceso para preparar un intermedio de
antibiótico de quinolona que tienen la fórmula:



caracterizado porque R es alquilo de 1 a 2 átomos de
25 carbono, fluoroalquilo de 1 a 2 átomos de carbono,
alqueno de 2 a 4 átomos de carbono, metoxi, cloro

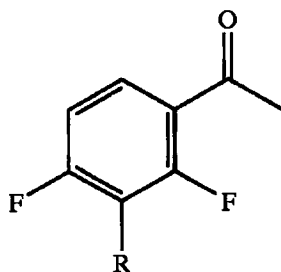
2

123
121

o bromo;

R^1 es una unidad escogida del grupo formado por alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 5 átomos de carbono y fenilo, cada una de las cuales puede ser sustituida por uno o más átomos de flúor; este proceso comprende los pasos de:

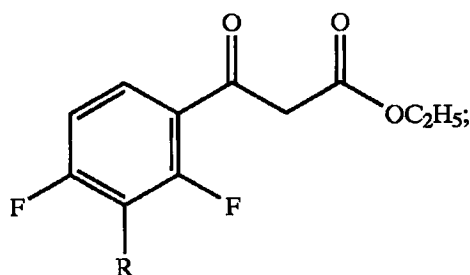
a) Reaccionar una acetofenona que tienen la fórmula



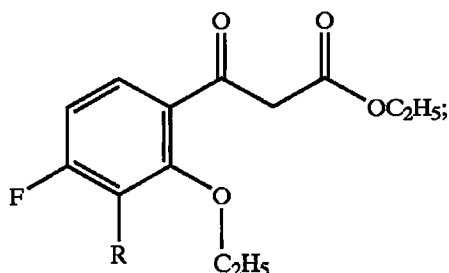
10

con carbonato de dietilo en presencia de una base para formar una mezcla de 4-fluoro β -cetoésteres que tienen la fórmula:

15

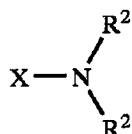


y



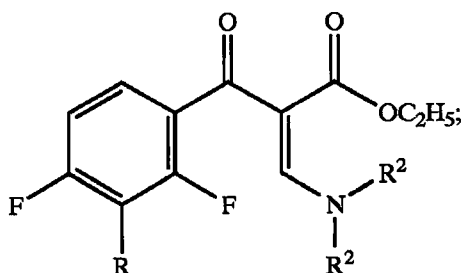
124
122

b) reaccionar dicha mezcla de un aducto de la reacción Knoevenagel que tienen la fórmula:

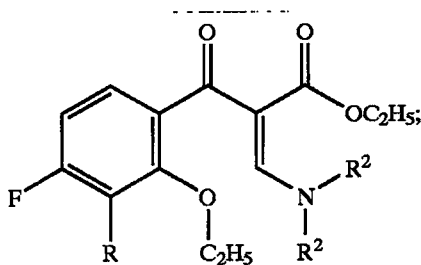


5

en donde R^2 es alquilo de 1 a 4 átomos de carbono lineal o ramificado, fenilo y mezclas de éstos; X es una unidad de aldehído o un equivalente de una unidad de aldehído; para formar una mezcla de
10 intermedios de imina que tiene la fórmula:

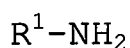


y



15

c) reaccionar la mezcla de intermedios de imina con una mezcla que tiene la fórmula

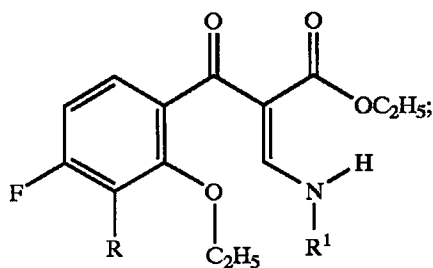
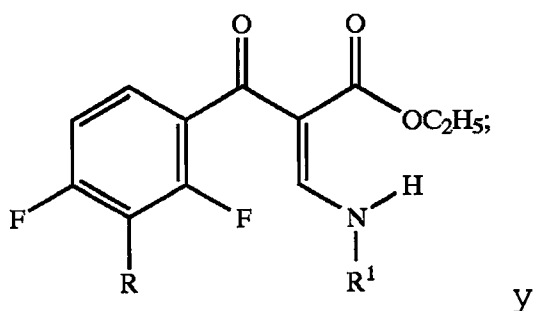


20

para formar una mezcla de intermedios de quinolona

10

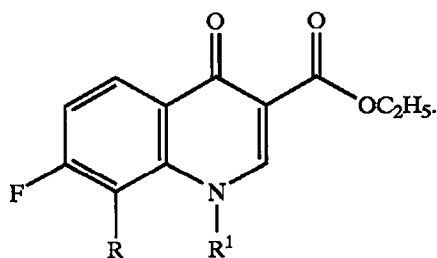
que tienen la fórmula



5

d) ciclizar la mezcla de intermedios de quinolina en presencia de un agente de sililación para formar el intermedio de antibiótico de quinolina que tiene la fórmula:

10



12. Un proceso según la reivindicación 11, caracterizado porque la base en el paso (a) es un hidruro metálico seleccionado del grupo LiH, NaH, KH, CaH₂ y mezclas de éstos.

13. Un proceso según la reivindicación 11,

126
124

caracterizado porque la base en el paso (a) es una base inorgánica escogida del grupo Na_2CO_3 , NaHCO_3 , K_2CO y mezclas de éstos

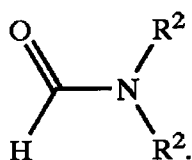
5 14. Un proceso según la reivindicación 11, caracterizado porque la base en el paso (a) es una base orgánica escogida de butil litio y diisopropilamida de litio.

10 15. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el paso (a) comprende reaccionar un mol de un sustituido acetofenona con 2,2 moles de una base y 2,4 moles de carbonato de dietilo.

15

16. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el paso (a) se realiza en presencia de un solvente seleccionado del grupo formado por cloruro de metileno, dicloro-metano, 20 hexametilfosforamida, tetrahidrofurano, benceno, tolueno, alcanos y mezclas de éstos.

17. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque el aducto es un 25 aldehido que tiene la fórmula:

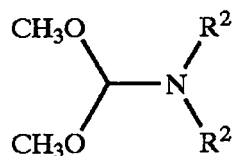


18. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque el aducto es un

12

127
175

dimetilacetal que tiene la fórmula:



caracterizado además porque R^2 es metilo, etilo y mezclas de éstos.

5

19. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el paso (b) se realiza en presencia de tolueno, caracterizado además porque el aducto es un dimetilacetal y caracterizado además porque la mezcla obtenida del paso (a) y el dimetilacetal se calienta para eliminar azeotrópicamente cualquier metanol que se haya formado.

20. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque la amina primaria en el paso (c) es escoge del grupo formado por metilamina, etilamina y ciclopropilamina.

21. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el paso (c) se realiza en presencia de un solvente seleccionado del grupo formado por cloruro de metileno, dicloro-metano, hexametilfosforamida, tetrahidrofurano, benceno, tolueno, aléanos y mezclas de éstos.

22. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado porque el paso (d) se realiza en presencia de un solvente seleccionado del grupo

13

128
126

formado por cloruro de metileno, diclorometano, hexametilfosforamida, tetrahidrofurano, benceno, tolueno, alcanos y mezclas de éstos.

- 5 23. Un proceso de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque el agente de sililación se selecciona del grupo formado por
- clorotrimetilsilano, N,O-
bis(trimetilsilil)acetamida, N,O-
10 bis(trimetilsilil)trifluoroacetamida,
bis(trimetilsilil)urea, hexametiltrisilazano, N-
metil-N-trimetilsililtrifluoroacetamida, 1-
trimetilsilil-imidazol, trimetilsilil
trifluorometanosulfonato, ter-
15 butildimetilclorosilano, 1-(ter-
butildimetilsilil)imidazol, N-ter-butildimetil-N-
metiltrifluoroacetamida, ter-
butildimetilsililtrifluorometano sulfonato, ter-
butilfenilclorosilano, ter-butyl-
20 metoxifenilbromosilano, dimetilfenilclorosilano,
triethylclorosilano, trimetilsilil
trifluorometanosulfonato y trifenilclorosilano.

24. Un proceso según la reivindicación 23
25 caracterizado porque el agente de sililación es N,O-
bis(trimetilsilil)acetamida.

25. Un proceso según la reivindicación 11,
caracterizado porque el paso (d) se lleva a cabo
30 mediante reflujo en presencia de un solvente.

14

129
128

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogada
✓ **DILIA RODRIGUEZ**

ASUNTO	Radicación	05-3900
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	<u>1</u> 05520
	Folios	007

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (Fase Nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	<u>PCT/US2003/024258</u>
Fecha de Presentación Internacional	<u>05/08/2003</u>

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: Folios 5 a 37 como se radicó inicialmente.

Reivindicaciones: Folios 120 a 128 modificado según respuesta del solicitante.

Prioridad: Folio 1 US 60/401,184 del 05/08/2002.

Respuesta del solicitante: Folios 112 a 128.

2. Objeto de la invención

Título: PROCESO PARA PREPARAR INTERMEDIOS PARA ANTIBIOTICOS DE QUINOLONA.

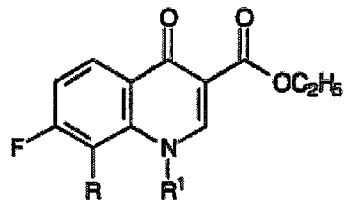
Objeto de la invención: El objeto de la solicitud consiste en un proceso para preparar intermedios de antibióticos de quinolona.

El problema planteado en la solicitud es la necesidad de proveer procesos mejorados para obtener quinolonas.

Para solucionar este problema técnico la solicitud proporciona un nuevo proceso para preparar quinolonas.

EXP 2005 003900

Reivindicaciones 1 a 25: Proceso para preparar un intermedio de antibiótico de quinolona de fórmula:



Que comprende:

- a) A partir de la acetofenona y carbonato de dietilo para formar la mezcla de 4-fluoro-β-cetoésteres
- b) Reacción de dicha mezcla con el X-N(R₂)₂ para formar una mezcla de intermedios de imina.
- c) Reacción de los compuestos de imina con la amina para formar los intermedios de quinolona
- d) Ciclación con un agente de sililación para formar el compuesto final de quinolina

Se catalogó la invención según la IPC en las categorías C07D 215/56 y A61K 31/54.

3. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La reivindicación 1 corresponde al paso d de la reivindicación 11, por lo tanto se puede incluir dicha etapa en un solo proceso y una sola reivindicación independiente.

La reivindicación 11 presenta una inconsistencia ya que ilustra la fórmula estructural del éster metílico de la quinolona y el producto que se obtiene de acuerdo al proceso es el éster **etílico**.

4. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 05/08/2002, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

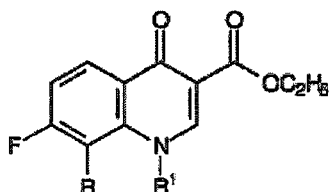
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO 0248113	Cyclization process step in the making of quinolones and naphthyridines	20/06/2002
D2	US 5703231	Process for making antimicrobial compounds	30/12/1997

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D 486)

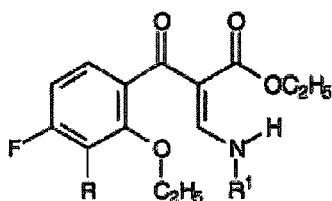
Se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial para establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud.

Novedad: (artículo 16 D 486)

La reivindicación de la solicitud indica un proceso para preparar de fórmula:

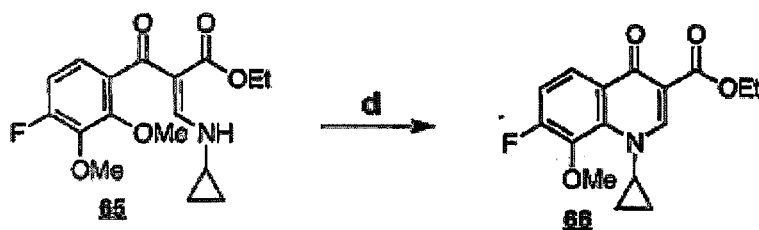


Que comprende ciclar una mezcla que comprende un intermedio de 2-etoxi sustituido de fórmula:



con un compuesto de organosilicio como agente de sililación.

El documento D1 (ejemplo 5, página 88) describe un proceso para obtener una quinolona (66) mediante la ciclación del correspondiente intermedio (65) de acuerdo al siguiente esquema y condiciones de la etapa d:

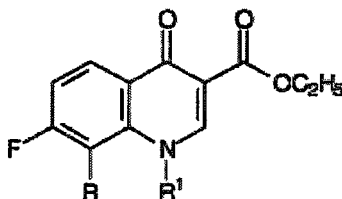


Etapas d: El producto 4 es disuelto en acetonitrilo anhidro (150 mL), se adiciona N,O-bis(trimetilsilil)acetamida (115 g). La solución se agita a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se calienta a reflujo.

Como se puede apreciar, el proceso de la reivindicación 1 de la solicitud es idéntico al divulgado en D1, por lo tanto no cumple con el requisito de novedad.

Nivel Inventivo: (artículo 18 D 486)

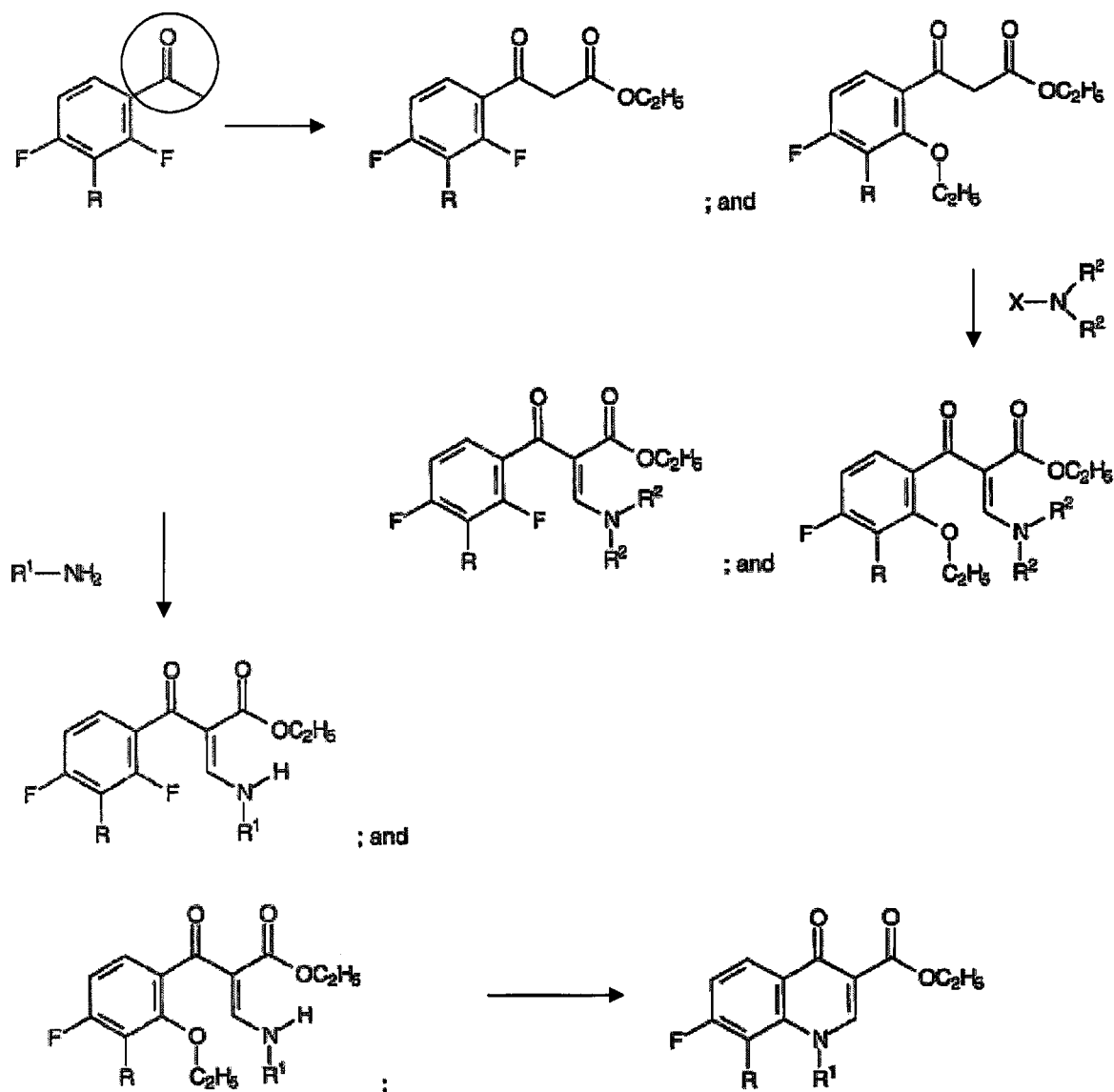
La reivindicación 11 de la solicitud indica un proceso para preparar compuestos de quinolina de fórmula, que comprende:



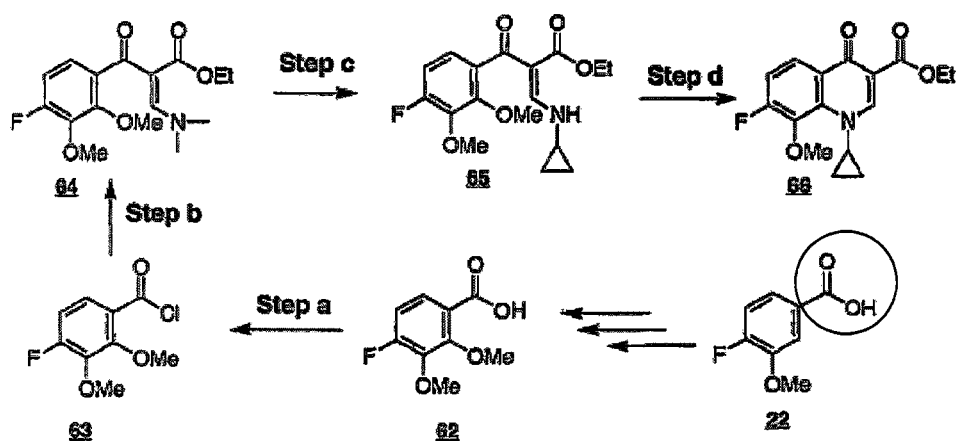
- A partir de la acetofenona y carbonato de dietilo para formar la mezcla de 4-fluoro-β-cetoésteres
- Reacción con el X-N(R₂)₂ para formar una mezcla de intermedios de imina.

- c) Reacción de los compuestos de imina con la amina para formar los intermedios de quinolona
- d) Ciclación con un agente de sililación para formar el compuesto final de quinolona

Dicho proceso se representa en el siguiente esquema:

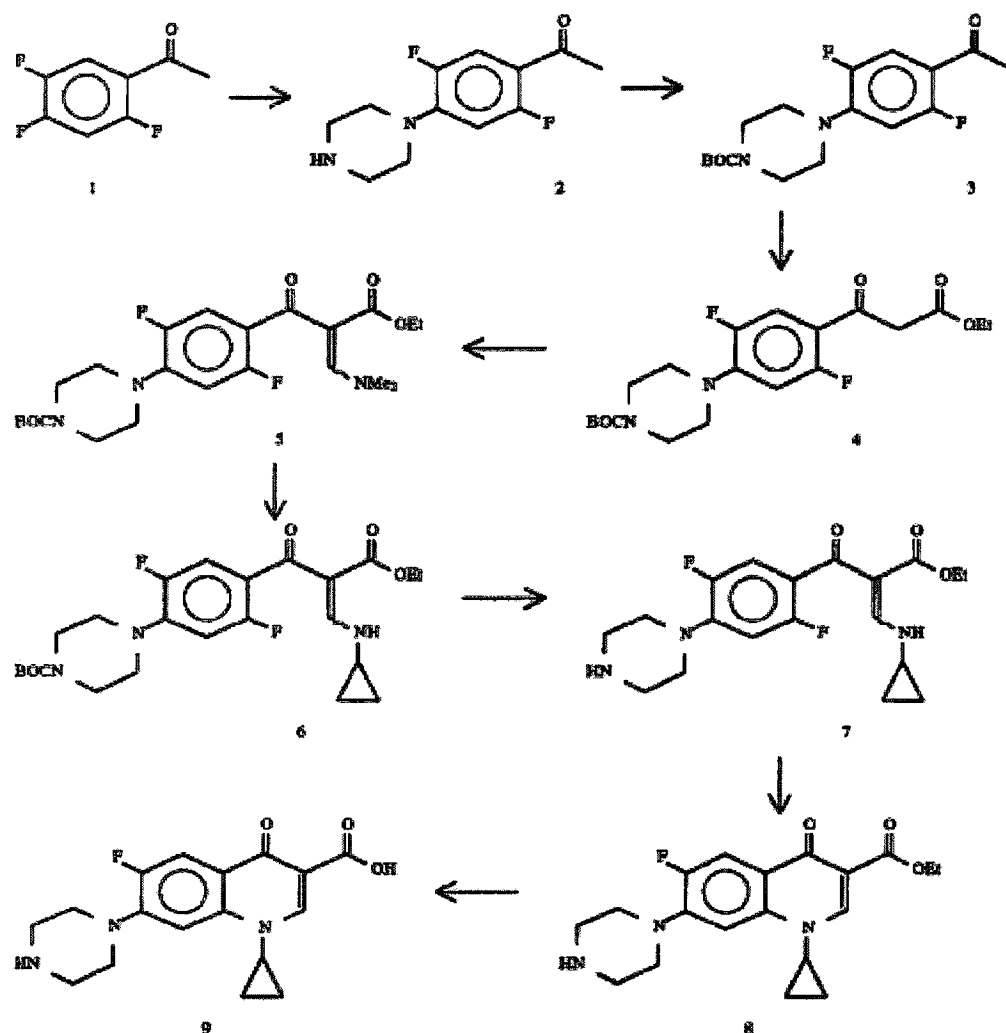


El documento D1 (ejemplo 5) describe un proceso para preparar quinolonas así:



La única diferencia del proceso de la solicitud con respecto al proceso divulgado en D1 es que el compuesto de partida es una difluoroacetofenona en lugar de un ácido benzoico sustituido (22).

El documento D2 (ejemplo 9) describe un proceso para preparar quinolonas a partir de acetofenonas así:



Como se puede apreciar D2 sugiere una trifluoroacetofenona como compuesto de partida en el proceso de obtención de quinolonas.

El problema técnico planteado en la presente solicitud, es decir, proveer un proceso para preparar quinolonas mediante ciclación final con un compuesto de organosilicio, se había resuelto previamente mediante el mismo proceso y condiciones de reacción.

Debido a lo anterior, se considera que el utilizar una acetofenona como compuesto de partida, además de estar sugerido en D2, no le concede al proceso reivindicado un efecto técnico inesperado o ventaja en cuanto a eficiencia y es obvio para un técnico medio versado en síntesis química, por lo tanto el objeto reivindicado no tiene nivel inventivo.

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

El solicitante en su respuesta al concepto No 3140 presenta un nuevo capítulo reivindicatorio modificado y en cuanto a los requerimientos de novedad y nivel inventivo argumenta lo siguiente:

1. " Para que las razones que aduce ese despacho para desvirtuar la novedad fuesen ciertas, seria forzoso que se demostrara que la invención de mi mandante está comprendida en el estado de la técnica de forma total, lo cual no sucede debido a que la presente invención requiere de dos precursores específicos de quinolona en tanto que D1 únicamente revela el segundo precursor con el grupo flúor en la posición 2 del anillo fenílico"

Al respecto cabe resaltar que el precursor revelado en D1 presenta un grupo metoxi en la posición 2 del anillo fenílico **y no un flúor** como afirma el solicitante. De otro lado, el proceso de la reivindicación 1 reclama particularmente la ciclización del derivado 2-etoxi sustituido del cual muestra su fórmula estructural.

Ahora bien, lo que pretende reclamar la solicitud es el **proceso de ciclización** del intermedio 2-etoxi sustituido mediante la reacción con el agente de sililación con reflujo en presencia de un disolvente, proceso que como se indicó en el análisis de novedad es idéntico al divulgado en D1.

2. " El solicitante encontró, que de manera sorprendente se puede realizar la ciclización de dicho subproducto etoxilado en la segunda posición del anillo fenílico mediante una reacción con el aducto de 2-fluoro correspondiente en una reacción llevada en condiciones suaves y de alto rendimiento".

Este despacho no comparte tal afirmación ya que la ciclización del subproducto etoxilado no se da por su reacción con el aducto de 2-fluoro como lo afirma el solicitante, esta ciclización se da mediante la reacción del subproducto etoxilado con el agente de sililación, lo cual está enseñado en D1.

3. " Teniendo en cuenta que D1 no revelaba ni sugería la presencia de este segundo producto, una persona medianamente versada en la técnica no habría encontrado motivación alguna en D2 para solucionar las deficiencias señaladas anteriormente en D1".

Sobre este particular, es claro que el documento D1 revela el subproducto 2-metoxilado y su forma de ciclizarlo de la misma manera como se reivindica en la presente solicitud.

4. " El solicitante encontró de manera sorprendente que el compuesto 2-etoxi actualmente reivindicado, el cual fue un subproducto inesperado en el primer paso de reacción, también puede ser exitosamente ciclizado junto con el compuesto de interés (compuesto 2-fluoro) sin la necesidad de una purificación intermedia".

Al respecto este despacho considera que el problema a resolver por la presente invención está dirigido al subproducto 2-etoxi y su ciclización, lo cual estaba previamente divulgado y resuelto. Ahora bien, encontrar que el compuesto 2-etoxi puede ser exitosamente ciclizado junto con el compuesto 2-fluoro no se puede considerar como un efecto sorprendente, ya que el compuesto 2-fluoro también es ciclizado bajo las mismas condiciones y finalmente se obtiene el mismo producto.

7. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento	Reivindicaciones Afectadas	Requisito que Afecta
D1	WO 0248113	1 a 10 11 a 25	Novedad Nivel Inventivo
D2	US 5703231	11 a 25	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 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.

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 N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
30 ABR. 2010

CONCEPTO TECNICO No. 1332	EXAMINADOR TECNICO Código No. 202077
----------------------------------	--

2