



No. 07-121967- -00002-0000

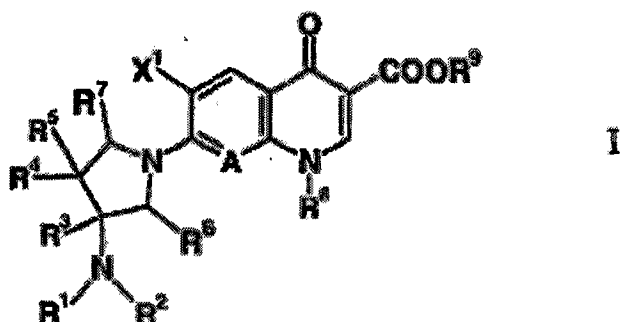
Fecha: 2008-06-20 16:32:45 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 CIOINFORMACION Folios: 15**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES**

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2	SOLICITANTE Nombre: DAIICHI SANKYO COMPANY, LIMITED Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Japón. Dirección: 3-5-1, Nihonbashi-honcho, Chuo-ku, Tokyo 103-8426, Japón Domicilio: Tokyo, Japón Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@camyp.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3	REPRESENTANTE O APODERADO Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: caveller@caveller.com	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: <u>438.019</u> TP <u>31.929</u>
4	Número de expediente: <u>07.121.967</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 29 reivindicaciones y solicito a Su Despacho que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.	
6	Comprobante de pago No. <u>08-48.131</u> Fecha: <u>17 de junio de 2008</u>	
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por \$103.000, por concepto de modificaciones. ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.	
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO FIRMA:  C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929	

842
540

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la siguiente fórmula (I):



una sal, o un hidrato de este, en donde

R¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que contiene de 3 a 6 átomos de carbono, o un grupo carbonilo sustituido derivado de un aminoácido, un dipéptido, o un tripéptido; el grupo alquilo se sustituye opcionalmente con un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de grupo hidroxilo, grupo amino, átomo de halógeno, un grupo alquiltio que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, y un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;

R² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, o un grupo cicloalquilo que contiene de 3 a 6 átomos de carbono; el grupo alquilo se sustituye opcionalmente con un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de grupo hidroxilo, grupo amino, átomo de halógeno, un grupo alquiltio que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, y un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;

R³ representa un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo que contiene de 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenoilo que contiene 2 a 6 átomos de carbono, o un grupo alquinilo que contiene 2 a 6 átomos de carbono; el grupo alquilo se sustituye opcionalmente con un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de grupo hidroxilo, grupo amino, átomo de halógeno, un grupo alquiltio

848
541

que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, y un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;

5 R^4 y R^5 independientemente representan un átomo de hidrógeno, átomo de halógeno, un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo que contiene 2 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo que contiene 2 a 6 átomos de carbono, o un grupo cicloalquilo opcionalmente sustituido que
10 contiene de 3 a 6 átomos de carbono; el grupo alquilo, el grupo alcoxi, el grupo alquenilo, y el grupo alquinilo es un grupo de cadena recta o ramificada; el grupo alquilo se sustituye opcionalmente con un sustituyente seleccionado del grupo que consiste de grupo hidroxilo, grupo amino, átomo de
15 halógeno, un grupo alquiltio que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, y un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono; y con la condición que R^4 y R^5 no son simultáneamente átomo de hidrógeno; o

20 los sustituyentes R^4 y R^5 juntos representan (a) una estructura cíclica de 3- a 6- miembros que incluye el átomo de carbono compartido por R^4 y R^5 para formar una estructura espirocíclica con el anillo pirrolidina, el anillo espiro así formado opcionalmente que contiene un átomo de oxígeno o un
25 átomo de azufre como un átomo miembro del anillo, y opcionalmente se sustituye con un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono que opcionalmente tiene un átomo de halógeno o un sustituyente; o (b) grupo exometileno unido al anillo pirrolidina mediante enlace doble, el grupo
30 exometileno opcionalmente tiene 1 o 2 sustituyentes seleccionados de grupo hidroxilo, grupo amino, átomo de halógeno, un grupo alquiltio que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, y un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;

35 R^6 y R^7 independientemente representan un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;

40 R^8 representa un grupo alquilo sustituido con halógeno que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo sustituido

544
542

con halógeno que contiene de 3 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilo sustituido con halógeno, o un grupo heteroarilo sustituido con halógeno;

5 R⁹ representa un átomo de hidrógeno, grupo fenilo, grupo acetoximetilo, grupo oximetil pivaloilo, grupo etoxycarbonilo, grupo colina, grupo aminoetil dimetilo, grupo 5-indanilo, grupo ftalidinilo, grupo 5-alquil-2-oxo-1,3-dioxol-4-ilmetilo, 3-acetoxi-2-oxobutilo, un grupo alquilo
10 que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoximetilo que contiene 2 a 7 átomos de carbono, o un grupo fenilalquilo que comprende un grupo alquilenos que contiene de 1 a 6 átomos de carbono y grupo fenilo;

15 X¹ representa un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno; y

A representa un átomo de nitrógeno o una porción representada por la fórmula (II):

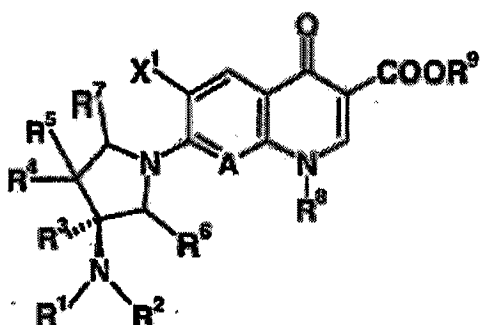


II

20

en donde X² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo alcoxi que contiene de 1 a 6 átomos de carbono, un grupo ciano, átomo de
25 halógeno, un grupo metilo sustituido con halógeno, o un grupo halogenometoxi; o X² junto con R⁸ representan una estructura cíclica que incluye una parte del núcleo, el anillo así formado opcionalmente que contiene un átomo de oxígeno, un átomo de nitrógeno, o un átomo de azufre como un átomo
30 miembro del anillo, y opcionalmente se sustituye con un grupo alquilo que contiene de 1 a 6 átomos de carbono que opcionalmente tiene un átomo de halógeno o un sustituyente.

2. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con la
35 reivindicación 1 en donde el compuesto representado por la fórmula (I) es un compuesto representado por la siguiente fórmula:

545
543

en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , X^1 , y A son como se define en la reivindicación 1.

5

3. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con la reivindicación 1 o 2 en donde R^1 y R^2 en la fórmula (I) son átomos de hidrógeno.

10

4. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde uno de R^1 y R^2 en la fórmula (I) es un átomo de hidrógeno y el otro es un sustituyente seleccionado del grupo metilo, grupo etilo, grupo fluometilo, y grupo ciclopropilo.

15

5. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en donde R^3 en la fórmula (I) es grupo metilo o grupo etilo.

20

6. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde uno de R^4 y R^5 en la fórmula (I) es un átomo de hidrógeno y el otro es un átomo de flúor, grupo metilo, grupo etilo, grupo normal propilo, grupo isopropilo, grupo normal butilo, grupo ciclopropilo, grupo fluorometilo, grupo metoxi, grupo vinilo, o grupo etinilo.

25

7. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde R^4 y R^5 en la fórmula (I) juntos forman anillo ciclopropano o anillo ciclobutano que incluye el átomo de carbono compartido por R^4 y R^5 para formar una estructura espirocíclica.

30

546
54

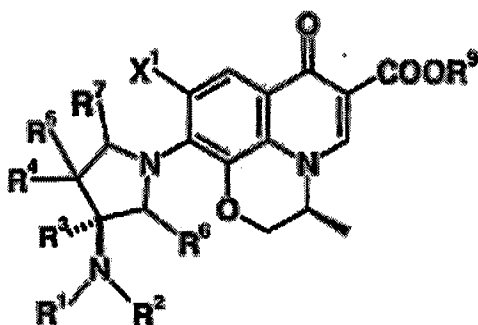
8. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde R^4 y R^5 en la fórmula (I) juntos forman un grupo exoalquileno.
- 5 9. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en donde X^1 en la fórmula (I) es un átomo de flúor.
- 10 10. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en donde A en la fórmula (I) es un átomo de nitrógeno.
- 15 11. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en donde A en la fórmula (I) es una porción representada por la fórmula (II).
- 20 12. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en donde X^2 en la fórmula (II) es grupo metilo, grupo etilo, grupo metoxi, grupo difluorometoxi, grupo ciano, o átomo de cloro.
- 25 13. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en donde X^2 en la fórmula (II) es grupo metilo o grupo metoxi.
- 30 14. El compuesto, una sal, hidrato de este de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 en donde R^8 en la fórmula (I) es un grupo 1,2-cis-2-halogenociclopropilo.
- 35 15. El compuesto, una de las reivindicaciones o un hidrato de este de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 en donde R^8 en la fórmula (I) es un grupo 1,2-cis-2-halogenociclopropilo estereoquímicamente puro.
16. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con la reivindicación 15 en donde el grupo 1,2-cis-2-halogenociclopropilo que es R^8 en la fórmula (I) es un grupo (1R,2S)-2-halogenociclopropilo.

SAS
SAS

17. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con la reivindicación 15 en donde el grupo (1R,2S)-2-halogenociclopropilo que es R^8 en la fórmula (I) es grupo (1R,2S)-2-fluorociclopropilo.

5

18. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con la reivindicación 11 en donde el compuesto de fórmula (I) es representado por la siguiente fórmula:



10

en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , y X^1 son como se define en la reivindicación 1.

- 15 19. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 en donde R^9 en la fórmula (I) es átomo de hidrógeno.

- 20 20. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 19 en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto estereoquímicamente puro.

21. Un compuesto seleccionado de

25

Ácido 7-[3-amino-3,4-dimetilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

30

Ácido 7-[3-amino-3,4-dimetilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

548
540

Ácido (3S)-10-[3-amino-3,4-dimetilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

5

Ácido 7-[3-amino-4-etil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

10

Ácido 7-[3-amino-4-etil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

15

Ácido (3S)-10-[3-amino-4-etil-3-metilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

20

Ácido 7-[3-amino-3-metil-4-isopropil pirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

25

Ácido 7-[3-amino-3-metil-4-isopropil pirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

30

Ácido (3S)-10-[3-amino-3-metil-4-isopropil pirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

35

Ácido 7-[3-amino-4-ciclopropil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

Ácido 7-[3-amino-4-ciclopropil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

549
547

Ácido (3S)-10-[3-amino-4-ciclopropil-3-metilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

5

Ácido 7-[3-amino-3-metil-4-vinilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

10

Ácido 7-[3-amino-3-metil-4-vinilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

15

Ácido (3S)-10-[3-amino-3-metil-4-vinilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

20

Ácido 7-[3-amino-4-metileno-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

25

Ácido 7-[3-amino-4-metileno-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

30

Ácido (3S)-10-[3-amino-4-metileno-3-metilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido [1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

35

Ácido 7-[3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

Ácido 7-[3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

350
548

Ácido (3S)-10-[3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido [1.2.3-de] [1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

5

Ácido 7-[(3R)-3-amino-3-metil-4-metileno pirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

10

Acido 7-(3-amino-4-metoxi-3-metilpirrolidina-1-il)-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

15

Ácido 7-(3-amino-4-metoxi-3-metilpirrolidina-1-il)-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

20

Ácido 7-[(3S,4S)-3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

25

Ácido 7-[(3S,4S)-3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-1-ciclopropil-6-fluoro-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

30

Ácido 7-[(3S,4S)-3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

35

Ácido 7-[(3S,4S)-3-amino-4-fluorometil-3-metilpirrolidina-1-il]-1-ciclopropil-6-fluoro-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

40

Ácido 7-[(3R)-3-amino-4-fluoro-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

881
549

Ácido 7-[(3R)-3-amino-4-fluoro-3-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

5

Ácido 7-[(3S)-3-amino-3-fluorometil-4-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

10

Ácido 7-[(3S)-3-amino-3-fluorometil-4-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

15

Ácido 7-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

20

Ácido 7-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

25

Ácido (3S)-10-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

30

Ácido 7-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-8-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

35

Ácido 7-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-8-il]-6-fluoro-1-5 [(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

Ácido (3S)-10-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-8-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-

\$82
550

de] [1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

5 Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-8-il]-
1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-
oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

10 Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-8-il]-
1-ciclopropil-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-
carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

15 Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-8-il]-
1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metoxi-1,4-dihidro-4-
oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este,

Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metoxi-5-azaespiro[2.4]heptano-8-il]-
1-ciclopropil-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-
carboxílico, una sal, o un hidrato de este. .

20 22. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con
cualquiera de las reivindicaciones 19 a 21 en donde, en el
compuesto de fórmula (I), la configuración absoluta en la
posición 3 en donde el grupo amino se ha sustituido en el
anillo pirrolidina es (3R).

25 23. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con
una de las reivindicaciones 19 a 21 en donde, en el compuesto
de fórmula la configuración absoluta en la posición 3 en
donde el grupo amino se ha sustituido en el anillo
30 pirrolidina es (3S).

24. Un compuesto seleccionado de

35 Ácido 7-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il] -
6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-
4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

40 Ácido 7-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-6-
fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-
4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

883
351

Ácido (3S)-10-[7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

Ácido 7-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-5-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metil-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

Ácido 7-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-5-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-1,4-dihidro-8-metoxi-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

Ácido (3S)-10-[8-amino-8-metil-6-azaespiro[3.4]octano-5-il]-9-fluoro-2,3-dihidro-3-metil-7-oxo-7H-pirido[1.2.3-de][1,4]benzoxazina-6-carboxílico, una sal, o un hidrato de este:

Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-1-[(1R,2S)-2-fluorociclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este;

Ácido 7-[(7S)-7-amino-7-metil-5-azaespiro[2.4]heptano-5-il]-1-ciclopropil-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este; y

Ácido 7-[(3S)-3-amino-3-fluorometil-4-metilpirrolidina-1-il]-6-fluoro-1-[(1R,2S)-2-fluoro-1-ciclopropil]-8-metil-1,4-dihidro-4-oxoquinolina-3-carboxílico, una sal, o un hidrato de este.

25. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 19, 20, y 24 en donde, en el compuesto de fórmula (I), la configuración absoluta en el sitio en donde el grupo amino se ha sustituido en es sustituyente espirobicíclico es (R).

26. El compuesto, una sal, o un hidrato de este de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 19, 20, y 24 en donde, en

552
552

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No 07-121967- -00002-0000

Fecha: 2008-06-20 16:32:45 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra 44 PATENTEYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 329 C/OINFORMACION Folios: 15

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT 800176089-2

RECIBO OFICIAL CAJA : 08 - 48,131
FECHA : JUNIO 17 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADO	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2677868	16/06/2008	34,985,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
12	MARCAS Y LENAS COMERCIALES	103,000.00
	TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TREI MIL PESOS

RESPONSABLE :

20 15869-891-005-1

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 07-121967

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **587** DE

FECHA **18 DE ENERO DE 2008** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **16 DE ABRIL DE 2008**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____ NO X

557
55

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
✓ **EMILIO FERRERO**

ASUNTO	Radicación	07-121967
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	011075
	Folios	04

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

No. Solicitud Internacional PCT/JP2006/310069
Fecha de Presentación Internacional 19/05/2006

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 238 a 505 y 523	como se radicó inicialmente.
Reivindicaciones:	Folios 506 a 522	como se radicó inicialmente
	Folios 542 a 554	modificadas
Dibujos:	Folios 524 a 527	como se radicó inicialmente
Prioridad:	JP 2005-146386,	19 de Mayo de 2005

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque:

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

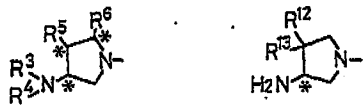
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Derivado de 3-aminopirrolidina tri, tetra-sustituido"

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de obtener compuestos útiles como agentes antibacterianos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto de la fórmula (I).

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/004, A61K 31/4709

		
R ² es hidrógeno, un grupo alquilo (sustituido), un grupo cicloalquilo	Tiene hidrógeno R ³ , R ⁴ son hidrógeno, son alquilo	Tiene hidrógeno o bajo alquilo
R ³ es un grupo alquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo alquenilo, alquinilo, el alquilo está opcionalmente sustituido	Tiene hidrógeno en vez de alquilo, un grupo cicloalquilo, un grupo alquenilo, alquinilo, el alquilo está opcionalmente sustituido	Tiene alquilo
R ⁴ y R ⁵ independientemente es hidrógeno, halógeno, alquilo, alcoxi, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, o un grupo cicloalquilo opcionalmente sustituido, entre otros.	Corresponde sólo con hidrógeno y alquilo (R ⁵ , R ¹² , R ¹³)	Tiene hidrógeno o bajo alquilo
R ⁶ y R ⁷ son un átomo de hidrógeno o un grupo de alquilo	Corresponde con hidrógeno y alquilo	Corresponde con hidrógeno
R ⁸ es alquilo sustituido con halógeno, un grupo cicloalquilo sustituido con halógeno, un grupo fenilo sustituido con halógeno o un grupo heteroarilo sustituido con halógeno	Tiene un grupo ciclo alquilo sustituido con halógeno	Tiene un grupo ciclo alquilo
R ⁹ es hidrógeno, fenilo, acetoximetilo, oximetil pivaloilo, etoxicarbonilo, colina, entre otros	Tiene un grupo -COOH, correspondiendo con hidrógeno	Tiene un grupo -COOH, correspondiendo con hidrógeno
X ¹ es hidrógeno o halógeno	Tiene un átomo de halógeno	Tiene un átomo de halógeno
A es nitrógeno o una porción representada por (II)		
 X ² es hidrógeno, alquilo, alcoxi, ciano, halógeno, metilo sustituido con halógeno entre otros.	A es carbono con hidrógeno	A es carbono con hidrógeno
Hidrógeno adyacente al carbono que tiene X ¹	Tiene un átomo de halógeno	Tiene un átomo de halógeno

El documento D1, considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, pues divulga compuestos ácidos piridona carboxílicos para ser usados como antibacterianos (Ver resumen y reivindicación 1, ver compuestos 13^a, a13b, 18^a,b)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el compuesto de D1 consiste en la presencia específica de sustituyentes R³ como alquilo, A puede ser nitrógeno y la ausencia de un grupo halógeno.

El efecto que logra el incluir, un sustituyente R³ como alquilo, A como nitrógeno y la ausencia de un grupo halógeno, es que se obtienen compuestos alternos, útiles como antibacterianos de gram-positivas y gram-negativas.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto conocido en D1 para "obtener compuestos alternos útiles como antibacterianos de gram-positivas y gram-negativas".

D2 describe una manera de solucionar el problema técnico, mediante compuestos de quinolina sustituidos con un grupo alquilo, entre otros en el anillo de pirrolidina (Ver reivindicación 1, página 42)

La reivindicación es obvia, porque el Experto en la Materia enfrentado al problema de "cómo modificar el compuesto conocido en D2 para "obtener compuestos alternos útiles como antibacterianos de gran-positivas y gran-negativas", emplearía diferentes sustituciones sobre el grupo de pirrolidina dentro de los compuestos que se enseñan en D1, logrando de esta forma los compuestos objeto de esta solicitud.

Por lo cual el compuesto de fórmula I de la reivindicación 1 carece de Nivel Inventivo.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2-29 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

Conclusión:

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

6. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	EP 0341493	1-29	Nivel Inventivo
D2	EP 0242789	1-29	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.

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.

CARLOS DANIEL LEMUS GIRALDO

Profesional Universitario 2044-09 (P)

Con asignación de funciones de la Dirección de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

15 JUL 2011

CONCEPTO TÉCNICO No. 01576	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202070
--------------------------------------	--

561
559

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

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	07-121967
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	01 1076
	Folios	01

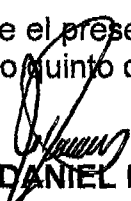
Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 46 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

Solicitud de Suministro de Información

De acuerdo con el Art 46 de la D486, según el cual: "La Oficina Nacional competente podrá requerir el informe de expertos o de organismos científicos o tecnológicos que se consideren idóneos para que emitan opinión sobre la patentabilidad de la invención. Asimismo, cuando lo estime conveniente, podrá requerir informes de otras oficinas de propiedad industrial. De ser necesario, a efectos del examen de patentabilidad y a requerimiento de la oficina nacional competente, el solicitante proporcionará, en un plazo que no excederá de 3 meses, uno o más documentos relativos a una o más solicitudes extranjeras referidas total o parcialmente a la misma invención que se examina: ...b) copia de los resultados de exámenes de novedad o de patentabilidad efectuados respecto a esa solicitud extranjera... Si el solicitante no presentara los documentos requeridos dentro del plazo señalado en el presente artículo la oficina nacional competente denegará la patente"; y considerando que no ha sido posible para esta Oficina encontrar los documentos, siguientes, atentamente se requiere su presentación:

TSUZUKI YASUNORI ET AL: "Synthesis and structure-activity relationships of novel 7-substituted 1,4-dihydro-4-oxo-1-(2-thiazolyl)-1,8-naph thyridine-3-carboxylic acids as antitumor agents. Part 2" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, WASHINGTON, US, vol. 47, no. 8, 8 April 2004 (2004-04-08), pages 2097-2109, XP002475250 ISSN: 0022-2623 [retrieved on 2004-03-06]

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.


CARLOS DANIEL LEMUS GIRALDO

Profesional Universitario 2044-09 (P)

Con asignación de funciones de la Dirección de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
15 JUL. 2011

CONCEPTO TÉCNICO No. 01576	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 2020
--------------------------------------	--

Expediente: 07-121967 Art 46