

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-65672- -2	FECHA: 2015-03-27 17:17:44
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 14
ACT: 430 REQUERSOLICITA	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

Asunto: Radicación: 14-65672- -2
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 430
Oficio: 3356
Folios: 14

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/CN2012/080753				
Fecha de Presentación Internacional	30/08/2012				

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:	Radicado No 14-065672-00000-0000	27/Marzo/2014
Reivindicaciones:	1 – 27 del radicado No14-065672-00000-0000	27/Marzo/2014
Prioridad:	CN PCT/CN2011/001477	31/Agosto/2011
	CN PCT/CN2012/001044	06/Agosto/2012

2. Análisis de la Prioridad

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

3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones

Expediente 14-65672- -2 1er Art 45.

adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

Dado que en la presente solicitud se evidencia pago de tasa por reivindicaciones adicionales, se procede a estudiar las 27 reivindicaciones del capítulo.

Título de la solicitud: "COMPUESTO DE QUINOLONA".

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar compuestos derivados de quinolona que presentan actividad antimicrobiana.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos que tienen la fórmula I y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 215/056 // 271/004; A61K 031/047 // 031/435.

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

El objeto de la reivindicación 27, que se refiere a un método de tratamiento, no es patentable de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de las reivindicaciones 22 – 26 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

6. De la solicitud de patente

Título

El título señala parte de la estructura genérica de los compuestos de la presente invención, pero se sugiere mencionar por lo menos el núcleo farmacofórico que los comprende para darle mayor claridad al mismo.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

El capítulo reivindicatorio no es conciso porque contiene diferentes reivindicaciones independientes, lo cual hace difícil definir cuál es el objeto que se busca proteger.

La reivindicación 1 no es clara y mucho menos concisa cuando menciona lo siguiente:

- Cuando la estructura principal varía sustancialmente por las 22 opciones diferentes del sustituyente R³, obsérvese además que algunas de las 22 opciones además también varían en diferentes tipos de sustituyentes lo cual dificulta entender realmente cual es el objeto que se pretende proteger. El núcleo farmacofórico no presenta una estructura definida y por tanto no se entiende con claridad la invención.
- Además, cuando emplea términos ambiguos e imprecisos tales como: "alquilo", "alcoxi", "haloalcoxi", "alquenilo", "alquinilo", "arilo", "anillo de 5 o 6 miembros sustituido", "un grupo heterocíclico aromático de 5 a 10 miembros", "alqueniloxi", "cicloalquilo", "alquilamino", "dialquilamino", "un grupo amino cíclico sustituido", "grupo heterocíclico aromático de 5 a 10 miembros", "alquilcarbonilo", "cicloalquiloxi",

“fenilcarbonilo”, “cicloalquilcarbonilo”, “grupo heterociclicarbonilo aromático de 5 a 10 miembros”, “arilsulfonilo”, “cicloalquilalquilsulfonilo”, “grupo heterociclicsulfonilo aromático de 5 a 10 miembros”, con los cuales se pueden presentar múltiples opciones de posibles compuestos ya que el núcleo farmacofórico podría contener diversos anillos que no permiten conocer el objeto que se pretende proteger, más aun cuando no se menciona el tipo de heteroátomos que comprenden ni la cantidad de cada uno de los mismos en tales posibilidades. Por tal motivo se obtienen un número indefinido de compuestos que no encuentran soporte en la descripción.

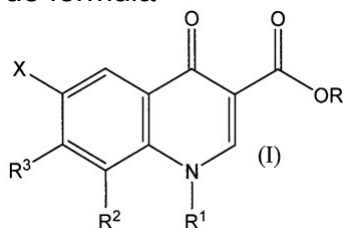
Se sugiere a la solicitante restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados ó probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados en la descripción, como por ejemplo como se revelan específicamente en los ejemplos.

Lo anterior aplica para las reivindicaciones dependientes 3, 7, 9, 13 y 14 que emplean tales términos ambiguos e imprecisos y que se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

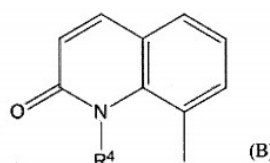
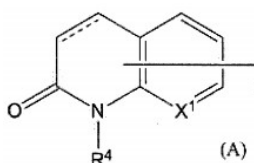
7. Unidad de Invención (Art 25 D 486)

La presente solicitud, no cumple con el requisito de Unidad de Invención (Art 25 D 486), porque se han identificado 15 Grupos Inventivos diferentes que no hacen parte de un único concepto inventivo, los cuales son los siguientes:

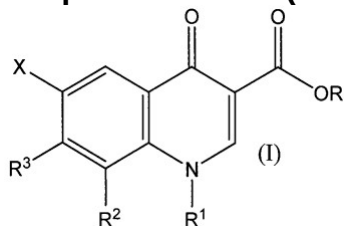
Grupo Inventivo 1 (reivindicación parcial 1, reivindicación 2, 3 y 18 – 21): Compuestos de fórmula



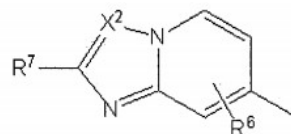
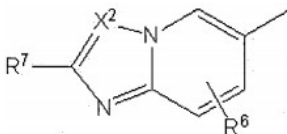
en donde R³ es



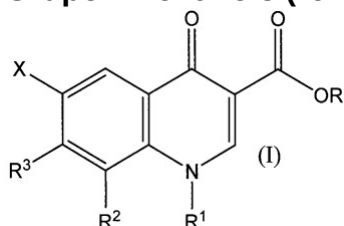
Grupo Inventivo 2 (reivindicación parcial 1, y reivindicación 4): Compuestos de fórmula



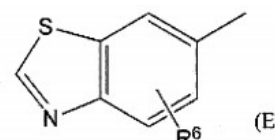
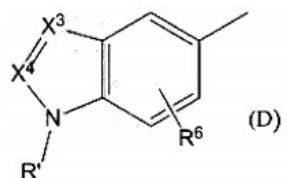
en donde R³ es



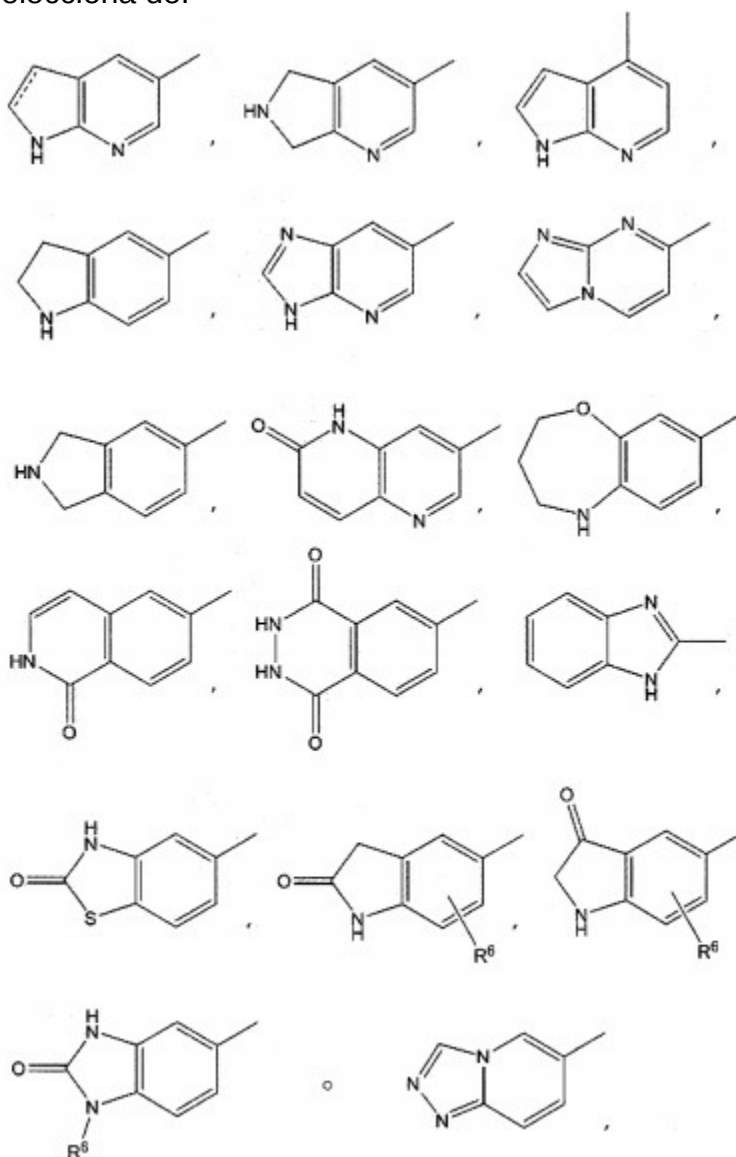
Grupo Inventivo 3 (reivindicación parcial 1, y reivindicación 5): Compuestos de fórmula



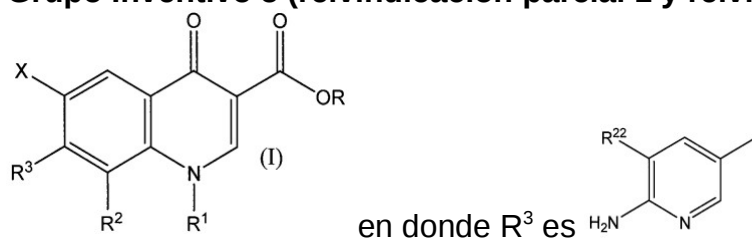
en donde R³ es



Grupo Inventivo 4 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 6): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 se selecciona de:



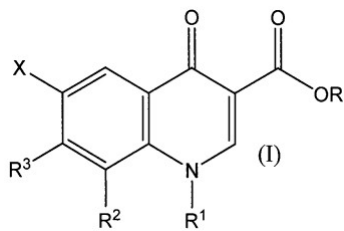
Grupo Inventivo 5 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 7): Compuestos de fórmula



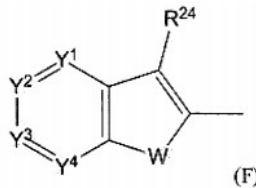
Grupo Inventivo 6 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 8): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es 5-pirimidinilo.

Grupo Inventivo 7 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 9): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es 2-indolilo.

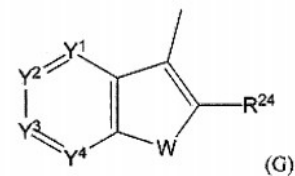
Grupo Inventivo 8 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 10): Compuestos de fórmula



en donde R³ es

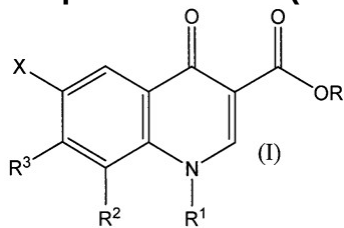


(F)

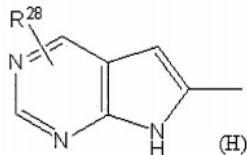


(G)

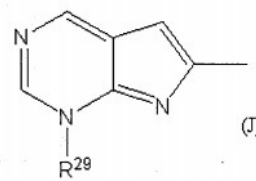
Grupo Inventivo 9 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 11): Compuestos de fórmula



en donde R³ es

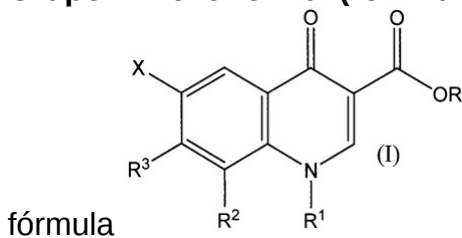


(H)



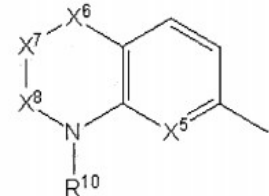
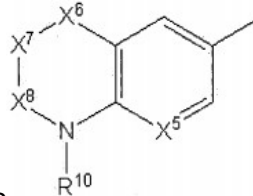
(J)

Grupo Inventivo 10 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 12): Compuestos de

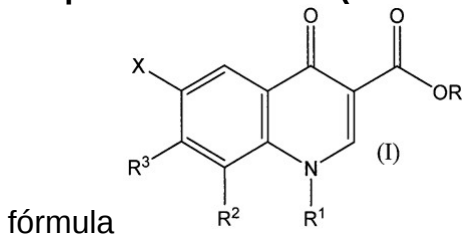


fórmula

en donde R³ es

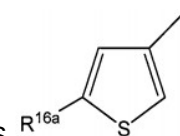


Grupo Inventivo 11 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 13): Compuestos de

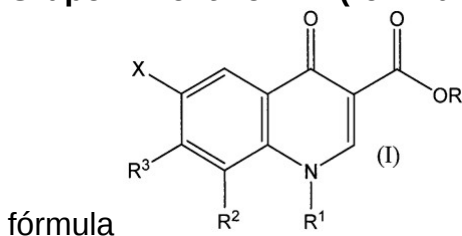


fórmula

en donde R³ es

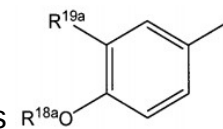


Grupo Inventivo 12 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 14): Compuestos de

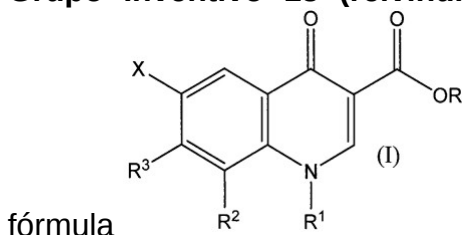


fórmula

en donde R³ es

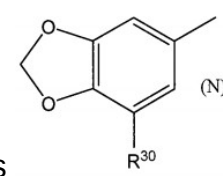


Grupo Inventivo 13 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 15): Compuestos de



fórmula

en donde R³ es

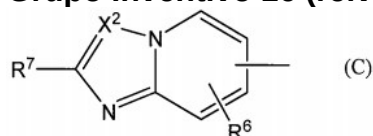


Grupo Inventivo 14 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 16): Compuestos de

fórmula (I) en donde R^3 es naftilo o isocromenilo.

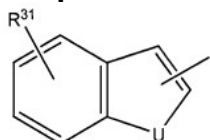
Grupo Inventivo 15 (reivindicación parcial 1 y reivindicación 17): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es quinolilo o isoquinolilo.

Grupo Inventivo 16 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es

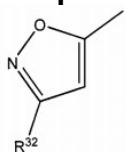


Grupo Inventivo 17 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es 4-piridilo.

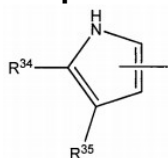
Grupo Inventivo 18 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es



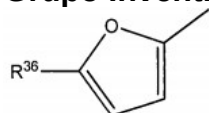
Grupo Inventivo 19 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es



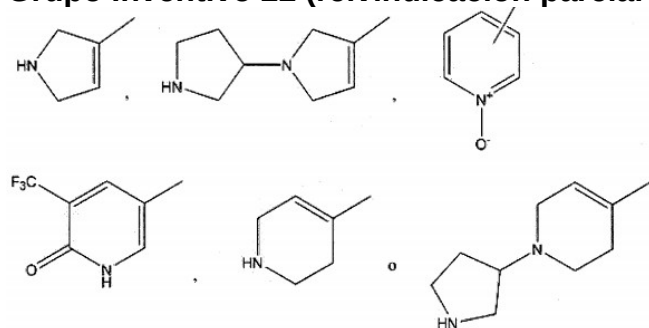
Grupo Inventivo 20 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es



Grupo Inventivo 21 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es



Grupo Inventivo 22 (reivindicación parcial 1): Compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es



Los grupos inventivos 1 (parcial), 5, 10 y 17 se encuentran previamente anticipados en las enseñanzas de D1 – D3.

El problema a ser solucionado en esta invención consiste en proporcionar compuestos derivados de quinolona que presentan actividad antimicrobiana. En la solicitud se presentan 15 posibles soluciones correspondientes a los grupos inventivos identificados anteriormente. No se presenta unidad de invención del grupo inventivo 1 con los otros grupos listados, porque en el estado de la técnica, se encuentra una o más características técnicas esenciales que definen a los otros grupos inventivos en relación con el grupo inventivo 1, por ejemplo cuando R³ es una piridina. En esta solicitud no se puede identificar la característica técnica esencial que sea común a los grupos inventivos mencionados.

Por lo tanto, esta solicitud carece de unidad de invención, los diferentes grupos no ofrecen un concepto inventivo común. Cada uno de los grupos listados se caracteriza por tener su propia característica técnica esencial. Se sugiere presentar las solicitudes divisionales que considere necesarias, ó limitar la solicitud inicial a una sola invención, eliminando de ella las otras invenciones.

8. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 31 de agosto de 2011.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró (encontraron) el (los) siguiente (s) documento (s) que anticipa (n) el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO9907682	"Quinolonecarboxylic acid derivatives or salts thereof"	18/Febrero/1992
D2	EP0343398	"7-Substituted quinolone- and naphthyridinecarboxylic acid derivatives"	29/Noviembre/1989
D3	CN1299356	"Quinolonecarboxylic acid derivatives or salts thereof"	13/Junio/2001

El documento D1 ¹ divulga derivados de quinolona - ácido carboxílico que presentan actividad antimicrobiana.

El documento D2 ² divulga derivados de quinolona 7-aril, 7-heteroaril y naftiridona ácido carboxílico, que presentan actividad antibacteriana.

El documento D3 ³ divulga derivados de quinolona - ácido carboxílico que presentan potente efecto antibacterial.

9. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

Grupo inventivo 10:

1URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=9907682&KC=&locale=en_EP&FT=E)

CC=WO&NR=9907682&KC=&locale=en_EP&FT=E

2URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=EP&NR=0343398&KC=&locale=en_EP&FT=E)

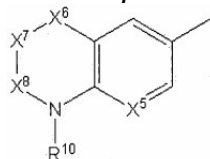
CC=EP&NR=0343398&KC=&locale=en_EP&FT=E

3URL:[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=CN&NR=1299356&KC=&locale=en_EP&FT=E)

CC=CN&NR=1299356&KC=&locale=en_EP&FT=E

La reivindicación 1 consiste en “un compuesto representado por la fórmula (I)...” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 294 (300) del radicado No. 14-065672-00000-0000)

La reivindicación 12 consiste en “El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque



R^3 es un grupo de la fórmula en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 316 (322) del radicado No. 14-065672-00000-0000).

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

Características esenciales	D1
(I)	(pág. 50, comp. 21) Ver además pág. 46, comp. No 10
R es H	H
R^1 es ciclopropilo	
R^2 es alquilo	-CH ₃
X es H	H
R^3 es (11) un grupo de la fórmula: (K) en donde X⁵, X⁷ y X⁸ son CH y X⁶ es O y R¹⁰ es H	

Grupo inventivo 17:

La reivindicación 1 consiste en “un compuesto representado por la fórmula (I)...” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 294 (300) del radicado No. 14-065672-00000-0000).

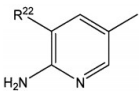
Características esenciales	D2
(I)	(pág. 8, cuarto compuesto) ver también pág. 17, tercer compuesto y ejemplo 15

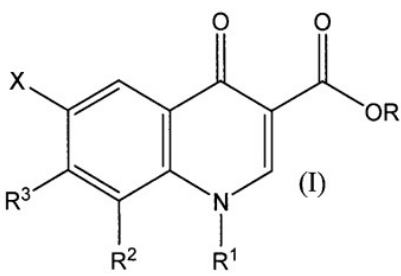
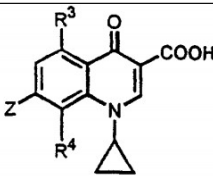
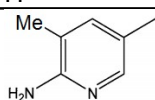
R es H	H
R ¹ es ciclopropilo	
R ² es H	H
X es F	F
R ³ es (6) 4-piridilo	

Grupo inventivo 5:

La reivindicación 1 consiste en “*un compuesto representado por la fórmula (I)...*” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 294 (300) del radicado No. 14-065672-00000-0000).

La reivindicación 7 consiste en “*El compuesto de la reivindicación 1, caracterizado porque R³*

es un grupo de la formula  ” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 313 (319) del radicado No. 14-065672-00000-0000).

Características esenciales	D3
	 No. R ³ R ⁴ Z 19. H Me (5-Me, 6-NH ₂), 3-Pyridyl (ver además compuestos 1-13, 15, 16, 18-23, 25, 26, 77-101 y 107)
R es H	H
R ¹ es ciclopropilo	
R ² es alquilo	R ⁴ es Me
X es H	H
R ³ es 3-piridilo sustituido por dos sustituyentes; uno es NH ₂ y el otro es alquilo	

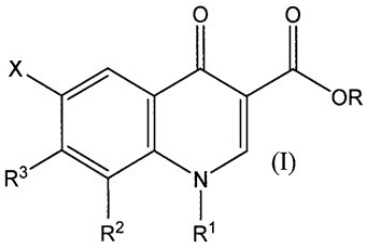
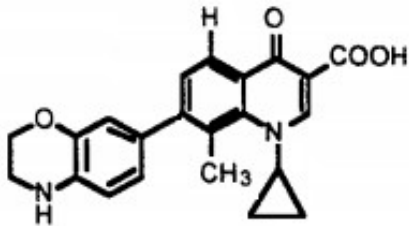
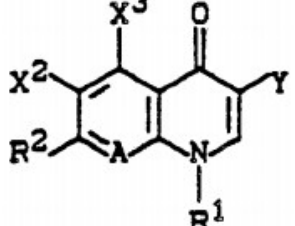
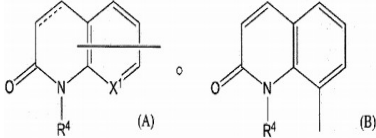
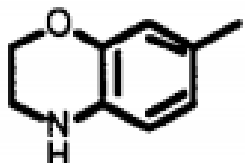
De acuerdo con las tablas anteriores, en las cuales se comparan las características técnicas de las reivindicaciones 1, 7 y 12 con los documentos D1 – D3, se puede observar que la presente invención reclama compuestos previamente revelados en dichos documentos del estado del arte. Por lo tanto las reivindicaciones 1, 7 y 12 no son nuevas, o carecen de novedad.

Nivel inventivo (Art18 D486)

Grupo inventivo 1:

La reivindicación 1 consiste en “*un compuesto representado por la fórmula (I)...*” en donde los sustituyentes son como se encuentran definidos (ver pág. 294 (300) del radicado No. 14-065672-00000-0000).

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

Características esenciales	D1	D2
 (I)	 (pág. 50, comp. 21)	 (reivindicación 1)
R es H	H	Y es COOH
R ¹ es ciclopropilo		R ¹ es ciclopropilo
R ² es alquilo	-CH ₃	No menciona sino H o N
X es H o F	H	F
R ³ es (1) un grupo heterocíclico fusionado de la fórmula:  (A) (B)	No menciona sino: 	R ² es heteroarilo de 3 a 9 átomos de carbono el cual es mono o multisustituido

Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulgan derivados de quinolona - ácido carboxílico que presentan actividad antimicrobiana (D1) y derivados de quinolona 7-aril, 7-heteroaril y naftiridona ácido carboxílico, que presentan actividad antibacteriana (D2).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en la sustitución de R³ que es un grupo heterocíclico fusionado de la fórmula A o B.

Sin embargo, esta diferencia señalada no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos reclamados en esta solicitud, ya que no parecen presentar propiedades superiores en comparación con los compuestos del estado de la técnica cercano.

Es necesario resaltar que en la presente invención se reclaman compuestos con capacidad antimicrobiana, pero no existe sustento para atribuir a tales compuestos una mejoría técnica o efecto técnico superior cuando se realiza la adición de este tipo de anillos. Lo anterior afirmación tiene soporte en el hecho de que las modificaciones de los sustituyentes de compuestos conocidos por su actividad o mecanismo de acción, son posibilidades plenamente conocidas para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con sus conocimientos en química orgánica heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en cualquiera de sus anillos sustituyentes o principales como ocurre con los isómeros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales ⁴, es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los sustituyentes, en anillos o en la posición de éstos se pueden lograr cambios en las propiedades del compuesto íntimamente

⁴ Silverman, R. B., "The organic Chemistry of Drugs Design and Drug Action". Elsevier. Northwestern University. Second Edition. Evanstons Illinois. 2004. pág. 29, table 2.2.

relacionadas con su actividad o con el efecto técnico a esperar como es, por ejemplo, incrementar la potencia o el índice (relación) terapéutica como el LD₅₀, ED₅₀ o el EC₉₀ a partir de algunas modificaciones en la posición de los heteroátomos del anillo principal o en la posición de sus sustituyentes. En la presente invención se propone una modificación estructural que simplemente consiste en modificar algunos átomos o heteroátomos de anillos bicíclicos conocidos, pero que, como se mencionó anteriormente, al no existir una comparación entre el estado del arte y la presente invención se consideran variaciones estructurales de rutina y no se cumple el requisito de nivel inventivo.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo proporcionar compuestos derivados de quinolona que presentan actividad antimicrobiana, alternativos a los ya revelados en el arte previo?

Sin embargo, el documento D2 ya realizaba sugerencias adecuadas para llegar a los compuestos de la presente invención, como se observa en la reivindicación 1, en donde se menciona que R² es heteroarilo de 3 a 9 átomos de carbono y que es mono o multisustituido. Nótese que tales compuestos revelados en D2 también presentan actividad antibacteriana, tal como se propone en la presente invención.

En consecuencia, cualquier persona normalmente versada en la materia al observar los compuestos de la anterioridad D1, y con sus conocimientos básicos y simples en química heterocíclica o en las sustituciones reveladas en D2, habría podido “proponer” la adición de un anillo tal como se contempla para R³, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2, 3 y 18 – 21 no mencionan características inventivas adicionales tampoco se pueden considerar inventivas.

10. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO9907682	1, 2, 3, 7, 12 y 18 – 21	Novedad-Nivel Inventivo
D2	EP0343398	1, 2, 3, 7, 12 y 18 – 21	Novedad-Nivel Inventivo
D3	CN1299356	1 y 7	Novedad

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 del día siguiente de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

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

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2015-03-31

Elaboró: Nelson Ricardo Velasco Gonzalez
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza