

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 14-198156- -2	FECHA: 2015-06-18 15:29:41
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 9
ACT: 519 TRASLADOINFORME	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
CARLOS R. OLARTE GARCIA

Asunto: Radicación: 14-198156- -2
 Trámite: 11
 Evento: 378
 Actuación: 519
 Oficio: 6598
 Folios: 9

Patente de Invención	X			Patente de Modelo de Utilidad	
Vía Nacional					
Vía PCT (Fase Nacional)	X	Capítulo I	X	Capítulo II	
No. Solicitud Internacional	PCT/US2013/028554				
Fecha de Presentación Internacional	01/03/2013				

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 14-198156-00000-0000	08/Septiembre/2014
Reivindicaciones:	1 – 24 del radicado No. 14-198156-00000-0000	08/Septiembre/2014
Prioridad:	US 61 607280	06/Marzo/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 Capitulo 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 14-198156- -2

1er Art 45

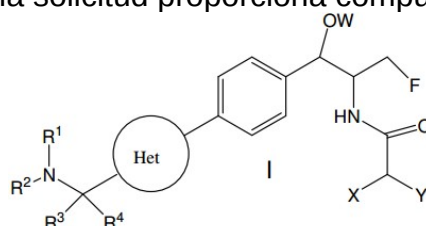
adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada.

A pesar de que en la presente solicitud no se evidencia pago por reivindicaciones adicionales, se procede a estudiar todo el capítulo reivindicatorio.

Título de la solicitud: “ANTIBACTERIANOS DE FENICOL”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en proporcionar derivados de fenicol, adecuados contra infecciones en mamíferos.

Para resolver este problema la solicitud proporciona compuestos de fórmula:



procedimiento para su preparación y composiciones farmacéuticas que los comprenden.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 333/20 // 401/06 // 239/26 // 413/06 // 241/12 // 417/06 // 271/06 // 277/28 // 285/12 // 213/38; A61K 31/4995 // 31/427 // 31/4439 // 31/4245 // 31/4418.

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

El objeto de las reivindicación 24, que se refiere a un método de tratamiento, no es patentable de acuerdo con el Art citado.

5. De la solicitud de patente

Título

El título de la invención, no señala las características principales de la invención o de sus moléculas. Se sugiere realizar las aclaraciones necesarias.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de concisión y claridad por las siguientes razones:

- Porque las siguientes definiciones son demasiado amplias y no permiten entender el objeto de la invención: R₁ y R₂ son cada uno independientemente a. H, b. -alquilo C₁₋₈, opcionalmente sustituido con uno o más OH, -SH, -CN, -NO₂, halo, -NHR₅, -N-alquilo C₁₋₄-R₅, -O-alquilo C₁₋₄, -S-alquilo C₁₋₄, -S(C=O)-alquilo C₁₋₄, -C(=O)NR₅R₅, -SO₂R₅, -SO₂N R₅R₅ o -cicloalquilo C₃₋₆, c. -cicloalquilo C₃₋₈, opcionalmente sustituido con uno a tres R₆, d. -SO₂R₅, -C(=O)NR₅R₅, -SO₂N R₅R₅, -C(=O)OR₅ o -C(=O)R₅, e. resto de anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que tiene opcionalmente de uno a cuatro heteroátomos seleccionados del grupo constituido por N, S y O, en el que el anillo o el átomo está sustituido opcionalmente con uno a tres R₆, o f. R₁ y R₂ tomados conjuntamente con el

Expediente 14-198156- -2

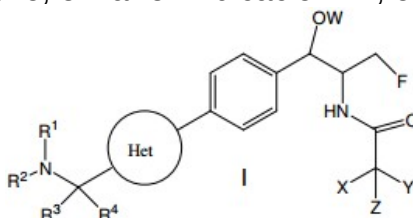
1er Art 45

nitrógeno al que están unidos forman un resto de anillo cíclico o bicíclico de 4 a 11 miembros que tiene opcionalmente uno a dos heteroátomos adicionales seleccionados del grupo constituido por N, S y O, en el que el anillo o el átomo está

opcionalmente sustituido con uno a tres R₆;

- R₃ y R₄ son cada uno independientemente a. -H, b. -alquilo C₁₋₈ opcionalmente sustituido con OH, -SH, halo, -CF₃, -CN, -NO₂, NH₂, -NHR₅, -NHR₅-O-alquilo C₁₋₄, -CH₂-O-CH₃, -S-alquilo C₁₋₄, -S(C=O)alquilo C₁₋₄, -C(=O)NR₅R₅, -C(=O)OH, -SO₂NR₅ o -SO₂R₅, c. -cicloalquilo C₃₋₈, opcionalmente sustituido con uno a tres R₆, d. -C(=O)-alquilo C₁₋₈ en el que el alquilo está opcionalmente sustituido con S(=O)₂R₅, -SO₂NR₅ o -C(=O)R₅, e. resto de anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros que tiene opcionalmente de uno a tres heteroátomos seleccionados del grupo constituido por N, S y O, en el que el anillo heterocíclico está sustituido opcionalmente con uno a tres R₆, f. R₃ y R₄ tomados conjuntamente forman un cicloalquilo C₃₋₈, opcionalmente sustituido con uno a tres R₆; o g. R₃ y R₄ tomados conjuntamente con uno o dos heteroátomos seleccionados del grupo que consta de N, S y O para formar un grupo oxo (=O) o para forman un resto de anillo heterocíclico de 4 a 6 miembros, en el que el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido con uno a tres R₆, con los cuales se pueden presentar diferentes opciones de posibles sustituciones que no permiten reconocer el objeto que se pretende proteger. 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 ejemplos se encuentran en los ejemplos del capítulo descriptivo, en la reivindicación 21, o por ejemplo cuando:



W es	H
X e Y son	Cloruro o fluoruro
Z es	H
Het es	piridinilo, tiofenilo, tiazolilo, tiadiazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, pirimidinilo, pirazinilo, isoxazol, isotiazol o piridazina.
R ₁ y R ₂	son cada uno H
R ₃ y R ₄	se toman conjuntamente para formar un ciclopropilo

La reivindicación 22 hace parte de un solo concepto inventivo con la reivindicación 1, razón por la cual se sugiere modificar el preámbulo con la dependencia necesaria.

6. 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 06 de marzo de 2012.

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:

Expediente 14-198156- -2

1er Art 45

Superintendencia de Industria y Comercio: Cra 13 No. 27- 00 pisos 1, 3, 4, 5, 6, 7 y 10 - PBX: (571) 5870000
E-mail: contactenos@sic.gov.co- Bogotá D.C., Colombia.

Señor ciudadano la entidad le ofrece los siguientes canales para hacer seguimiento a su solicitud así:
Página web: www.sic.gov.co
Centro de atención telefónica en Bogotá: 5920400

Línea gratuita a nivel nacional: 018000 910165
Kiosco Informático Centro Comercial Gran Estación en Bogotá

Ítem	Documento	Título	Fecha de presentación
D1	WO03077828	“Novel florfenicol-type antibiotics”	25/Septiembre/2003

El documento D1 ¹ (resumen y pág. 1) divulga derivados de florfenicol que presentan actividad contra infecciones bacterianas en diversos pacientes mamíferos.

7 . Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel inventivo (Art 18 D486)

La reivindicación 1 consiste en “*Un compuesto de fórmula I...*” en donde los sustituyentes son como se encuentran allí definidos (ver pág. 253 del radicado No. 14-198156-00000-0000).

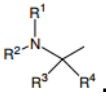
Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1
	(reivindicación 1)
W es H	H
Het es un sistema de anillo cíclico o bicíclico de 4 a 14 miembros que tiene de uno a cinco heteroátomos seleccionados de N, O y S	R⁴ es en donde A¹ es carbono o nitrógeno y A²-A⁵ son C, N, O o S
donde R¹ – R⁴ son H	No menciona particularmente esa fracción pero sí sugiere alquilo C ₁₋₄ NHSO ₂ , alquilo (C ₁₋₄) ₂ NHSO ₂ , alquilo C ₁₋₄ NH, alquilo(C ₁₋₄) ₂ N
F	R ¹ es F
X, Y y Z son H	R ² , R ⁸ y R ³ son H

El documento D1 es considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1, ya que divulga derivados de florfenicol que presentan actividad contra infecciones bacterianas en diversos pacientes mamíferos.

La diferencia entre los compuestos de la invención y los revelados en D1 consiste en la sustitución del heteroarilo, que particularmente propone una amina primaria, secundaria

o terciaria opcionalmente sustituida de la fracción



¹URL:<http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?>

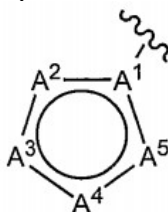
Sin embargo, esta diferencia no concede un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos de la presente invención, ya que no existe soporte comparativo que permita reconocer una mejoría técnica o superior de los compuestos de la presente invención con los que ya se revelan en el estado del arte, que además también actúan contra infecciones bacterianas. Llama la atención, que en la presente invención se afirma (pág. 25 del capítulo descriptivo) que *“Los compuestos de la presente invención se ponen a prueba frente a una selección de organismos gram-negativos y gram-positivos usando las técnicas estándar industriales descritas en M31-A3. Documento Performance Standards for Antimicrobial Disk and Dilution Susceptibility Tests for Bacteria Isolated from Animals; Clinical and Laboratory Standards Institute, Estándar Aprobado-Tercera Edición. Los compuestos de la presente invención demuestran actividad antibacteriana muy buena frente a patógenos BRD, por ejemplo, M. haemolytica, P. multo., H. somnus y M. bovis”*, sin embargo no se reportan datos de concentración mínima efectiva o similares que sirvan para sustentar lo mencionado por la solicitante o un efecto técnico inesperado o sorprendente cuando se realizan las modificaciones propuestas. Por el contrario el documento D1, en la evaluación biológica (pág. 38), sí describe la actividad de los compuestos, contra patógenos específicos y además reporta distintas concentraciones mínimas efectivas que permiten identificar los rangos en los que la actividad de tales compuestos se encuentra. Dado lo anterior no es posible encontrar sustento técnico que permita identificar nivel inventivo de los compuestos de la presente invención, frente a los ya revelados en D1, con igual actividad. En este punto vale la pena anotar, que las modificaciones en los sustituyentes de compuestos conocidos 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 sustituyentes o en los heteroátomos de anillos conocidos, 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 ², es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los sustituyentes, se pueden lograr cambios en las propiedades del compuesto íntimamente 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. Lo anterior es importante, porque en la presente invención simplemente se proponen modificaciones en los sustituyentes de compuestos ya conocidos, pero que como se vio anteriormente, dicha modificación no demostró un efecto técnico inesperado o una ventaja técnica real, por no realizar una adecuada comparación, y por tanto se consideran variaciones estructurales de rutina que no sustentan el requisito evaluado.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo proporcionar derivados de fenicol, adecuados contra infecciones en mamíferos, alternativos a los ya revelados en el arte previo?

El documento D1 ya realiza sugerencias adecuadas para llegar a la presente invención, particularmente revela compuestos que son estructuralmente muy cercanos a los de la presente invención, con igual actividad, y en donde se sugiere sugiere alquilo C₁.

2 **Silverman, R. B.**, “The organic Chemistry of Drugs Design and Drug Action”. Elsevier. Northwestern University, Second Edition. Evanston Illinois. 2004. pág. 29, table 2.2.

$_4\text{NHSO}_2$, alquilo $(\text{C}_{1-4})_2 \text{NHSO}_2$, alquilo C_{1-4}NH , alquilo $(\text{C}_{1-4})_2 \text{N}$, como sustituyentes de los



carbonos del anillo

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, habría podido modificar los sustituyentes del heteroarilo allí propuesto, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la presente solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 2 – 21 y 23 y la reivindicación 22 no mencionan alguna característica inventiva adicional, se considera que tal reivindicación tampoco tiene nivel inventivo.

8. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO03077828	1 – 23	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 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 2015-06-23

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