

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
 Bogotá, D.C.,

Abogada MARGARITA CASTELLANOS

ASUNTO Radicación 09-3378
 Trámite 011
 Evento 378
 Actuación 519
 Oficio
 Folios 007 **2.1 25 6 6**

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

No. Solicitud Internacional PCT/JP2007/148780
 Fecha de Presentación Internacional 22 Junio 2007

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 193 a 417	16/Enero/2009
Reivindicaciones:	Folios 418 a 428	16/Enero/2009
	Folios 446 a 457	13/Octubre/2010
Prioridad:	JP 174331/2006	23/Junio/2006
	JP 220082/2006	11/Agosto/2006
	JP 274143/2006	05/Octubre2006

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: "Compuesto 6-(bencilo sustituido con heterociclo)-4-oxoquinolina y su uso como compuesto inhibidor de integrasa VIH".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proveer un compuesto que tenga una actividad anti-VIH, en particular un compuesto que tiene una actividad inhibidora de integrasa. (Folio 200)

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un compuesto

R6	Átomo de hidrógeno
(R5)m	Átomo de halógeno
m:	1

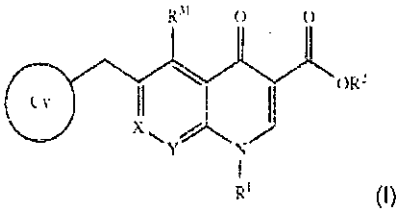
Se requiere al Solicitante hacer las aclaraciones necesarias.

7. Determinación del Estado de la Técnica

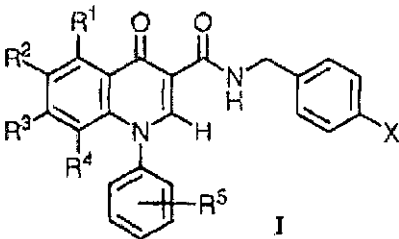
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: Junio 23 de 2006, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	US 20050239819	4-oxoquinoline compounds and utilization thereof as HIV integrase inhibitors	27/Octubre/2005
D2	WO 0198275	1-Aryl-4-oxo-1,4-dihydro-3-quinolinecarboxamides as antiviral agents	27/Diciembre/2001

D1http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20051027&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=2005239819A1&KC=A1&ND=2 Divulga (página 3, párrafo 30) un compuesto de la fórmula (I).



D2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0198275A2&KC=A2&FT=D&ND=&date=20011227&DB=&locale=en_EPDivulga (Página 4, línea 10) un compuesto de la fórmula (I).

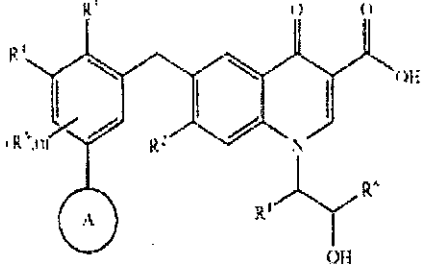
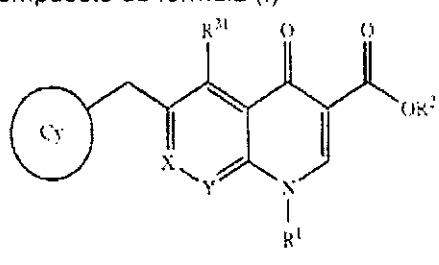
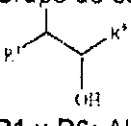


8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto representado por la siguiente fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables o uno de sus solvatos. (Fl. 446)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Un compuesto de formula (I)  (I)	Compuesto de formula (I)  (I)
A: Heterociclo monociclo opcionalmente sustituido.	Cy: Anillo C3-10 opcionalmente sustituido con A A: anillo heterociclo que contiene mínimo un heteroátomo, seleccionado de O, N,S
R2: Átomo de hidrógeno.	R31: Átomo de hidrógeno
Átomo de carbono sustituido con R2 R2: Átomo de hidrógeno.	X: CR32, R32: Átomo de hidrógeno. Y: CR33 R33: Átomo de hidrógeno.
Grupo de estructura  en donde, R1 y R6: Alquilo C1-6	R1: Alquilo C1-10 opcionalmente sustituido con un compuesto seleccionado de B B: alquilo opcionalmente sustituido con compuesto seleccionado de A A: ORa1 Ra1: Átomo de hidrógeno
Grupo de estructura 	R2: Átomo de hidrogeno

Las características **esenciales** del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual da a conocer un compuesto de formula (I), que presenta una estructura 4-oxoquinolina, cuando X y Y se representa por un compuesto CR32 y CR33 respectivamente, en donde R32 y R33 son de manera independiente un. La estructura 4-oxoquinolina es sustituida con un compuesto C-Cy que corresponde a un anillo aromático de 3 a 10 miembros el cual puede estar sustituido con un compuesto A, el cual corresponde a un compuesto heterocíclico que contiene mínimo un heteroátomo seleccionado de O, N o S. La posición 1 de la estructura 4-oxoquinolina se encuentra sustituida con R1 el cual representa un grupo alquilo C1 -10 opcionalmente sustituido con un compuesto A o B, los cuales corresponden un compuesto ORa1 en donde, Ra1 corresponde a un átomo de hidrógeno y B es un grupo alquilo opcionalmente sustituido. R31 corresponde a un átomo de hidrógeno. (Pág. 3, párrafo 30 – 36)

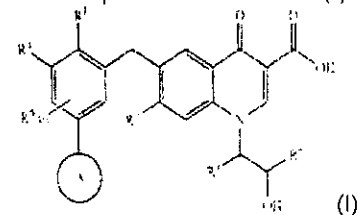
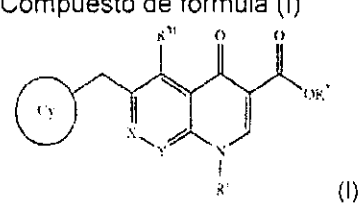
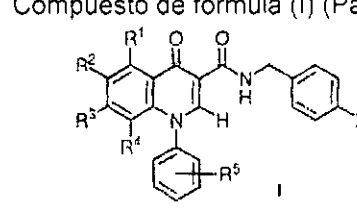
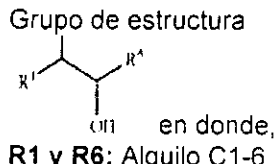
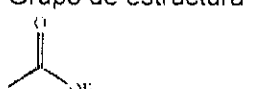
En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva ó carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 2, 4, 6, 9, 11 – 14, 20 y 21, no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto representado por la siguiente fórmula (I) o una de sus sales farmacéuticamente aceptables o uno de sus solvatos. (Fl. 446)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1	D2
Un compuesto de formula (I)  (I)	Compuesto de formula (I)  (I)	Compuesto de fórmula (I) (Pág. 4)  I
A: Heterociclo monociclo opcionalmente sustituido.	Cy: Anillo C3-10 opcionalmente sustituido con A A: anillo heterociclo que contiene mínimo un heteroátomo, seleccionado de O, N,S	R2: Alquilo C1-4 opcionalmente sustituido con R10 R10: Heterociclo o compuesto aromático opcionalmente sustituido o fusionado con un carbociclo.
R2: Átomo de hidrógeno, grupo alquilo C1-4 u OR11 R11: Átomo de hidrógeno, grupo alquilo C1-4	No menciona	R3: Grupo alquilo C1-10, OR11. R11: Átomo de hidrógeno, alquilo C1-7
Átomo de carbono sustituido con R2 R2: Átomo de hidrógeno o grupo alquilo C1-4.	X: CR32, R32: Átomo de hidrógeno. Y: CR33 R33: Átomo de hidrógeno.	Átomo de carbono sustituido con R3 R3: Átomo de hidrógeno o grupo alquilo C1-7
Grupo de estructura  R1 y R6: Alquilo C1-6	R1: Alquilo C1-10 opcionalmente sustituido con un compuesto seleccionado de B B: alquilo opcionalmente sustituido con compuesto seleccionado de A A: ORa1 Ra1: Átomo de hidrógeno	No menciona
Grupo de estructura 	R2: Átomo de hidrogeno	No menciona

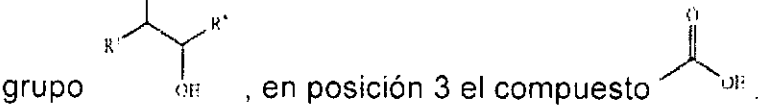
Los documentos D1 y D2 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque

El documento D1 da a conocer un compuesto de formula (I), que presenta una estructura 4-oxoquinolina, cuando X y Y se representa por un compuesto CR32 y CR33 respectivamente, en donde R32 y R33 son de manera independiente un. La estructura 4-oxoquinolina es sustituida con un compuesto C-Cy que corresponde a un anillo aromático de 3 a 10 miembros el cual puede estar sustituido con un compuesto A, el cual corresponde a un compuesto heterocíclico que contiene mínimo un heteroátomo seleccionado de O, N o S. La posición 1 de la estructura 4-oxoquinolina se encuentra sustituida con R1 el cual representa un grupo alquilo C1 -10 opcionalmente sustituido con un compuesto A o B, los cuales corresponden un compuesto ORa1 en donde, Ra1 corresponde a un átomo de hidrógeno y B es un grupo alquilo opcionalmente sustituido. R31 corresponde a un átomo de hidrógeno. (Pág. 3, párrafo 30 – 36)

El documento D2 da a conocer un compuesto de fórmula (I), que presenta en su estructura 4-oxoquinolina sustituida en posición 1 el grupo fenilo, en la posición 3 amida N-susituida y en las posiciones 5, 6, 7 y 8 sustituido con R1, R2, R3 y R4, en donde el sustituyente R3 corresponde a un grupo alquilo C1-7 opcionalmente sustituido con R11 compuesto OR11, en donde R11 corresponde a un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-7

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en D1 consiste en la presencia de un grupo alquilo o OR11 en la posición 7 del anillo de 4-oxoquinolina, en donde R11 corresponde a un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-4.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula (I) de D2 consiste en la presencia de las sustituciones en la posición 1 por un



El efecto que logra el incluir un grupo alquilo C1-4 o un compuesto de fórmula OR11, en donde R11 corresponde a un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-4 es obtener compuestos que presenten actividad anti-VIH.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo modificar el compuesto de fórmula (I) conocido en D1 para obtener compuestos alternativos que presentan actividad anti-VIH".

Sin embargo, la sustitución en posición 7 de la estructura de 4-oxoquinolina de un grupo alquilo C1-4 o OR11, en donde R11 corresponde a un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-7, ya está divulgada en el documento D2. (Pág. 5 – 6)

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría una sustitución con un grupo alquilo C1-4 o OR11, en donde R11 corresponde a un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-7 de D2 en el compuesto de fórmula (I) de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

En conclusión, la reivindicación 1 no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

9. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US 20050239819	1, 2, 4, 6, 9, 11 - 14, 20, 21	Novedad Nivel Inventivo
D2	WO 0198275	1, 5 y 6	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.

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.

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.



JESUS FERNEL GARCÍA GARCÍA
Director de Nuevas Creaciones (C)

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

18 JUL. 2012

Elaborado por: Paola Duarte 
Revisado por: Consuelo Leguizamón Leguizamón 
Aprobado por: Jesús Fernel García García