

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

Rad. PCT/09-112458

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

en ejercicio de sus facultades legales, en especial de las conferidas en el numeral 26 del artículo 3° del Decreto 4886 de 2011, y

CONSIDERANDO:

PRIMERO: Que mediante escrito radicado en esta Superintendencia el 09 de octubre de 2009, con el N° 09-112458-00000-0000, por la(s) sociedad(es) Novoxel, entró a fase nacional la solicitud de patente de invención titulada "NUEVOS COMPUESTOS TRICICLICOS SUSTITUIDOS QUE COMPRENDEN 3 A 5 ÁTOMOS DE NITRÓGENO, DERIVADOS DE UN SISTEMA SATURADO DE 1,3-DIAZEPINA, SU PREPARACIÓN Y SU UTILIZACION COMO MEDICAMENTOS ANTIBACTERIANOS", que corresponde a la solicitud internacional PCT/FR2008/000509 del 04 de noviembre de 2008.

SEGUNDO: Que el extracto de esta solicitud fue publicado en la Gaceta de la Propiedad Industrial N° 622 del 19 de noviembre de 2010, sin que se hubieran presentado oposiciones por parte de terceros.

TERCERO: Que realizado el examen de fondo mediante Oficio N° 17291, notificado por fijación en lista el 02 de octubre de 2012, se requirió a la solicitante en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina para que presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión para la concesión de la patente.

CUARTO: Que la solicitante mediante escrito radicado bajo el N° 09-112458-00007-0000 del 13 de febrero de 2013, respondió oportunamente el requerimiento formulado y presentó nueva(s) reivindicación(es) 1 a 11 que reemplaza(n) las originalmente presentadas, atendiendo de esta manera las observaciones efectuadas en el examen de fondo. Se aceptó el nuevo capítulo reivindicatorio presentado, comoquiera que se ajusta a las prescripciones contenidas en el artículo 34 de la Decisión 486.

QUINTO: Que de acuerdo con el objeto de la solicitud se modifica el título, el cual quedará de la siguiente manera: "COMPUESTOS PIRAZOL[3,4e]DIAZEPIN-6-ONA SUSTITUIDOS QUE PRESENTAN ACTIVIDAD ANTIBACTERIANA Y SU PREPARACIÓN".

SEXTO: Que en virtud de lo dispuesto en el artículo 14 de la Decisión 486 expedida por la Comisión de la Comunidad Andina "Los países miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

SÉPTIMO: Que las reivindicaciones 1 a 11, no cumplen con el requisito de novedad y nivel

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

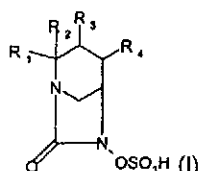
Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

Rad. PCT/09-112458

inventivo. Lo anterior, de acuerdo con las siguientes consideraciones:

6.1. Objeto de la invención

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de suministrar compuestos antibacterianos. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de fórmula general (I).



6.2. Determinación del estado de la técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 12 de abril de 2007, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de cual se invoca prioridad. 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	US2005245505	Novel heterocyclic compounds, method for preparing same and use thereof as medicines, in particular as antibacterial agents	3/noviembre/2005
D2	WO0210172	azabicyclic compounds, preparation thereof and use as medicines, in particular as antibacterial agents	7febrero/2002

El documento D1 ⁽¹⁾ divulga compuestos tricíclicos sustituidos como antibacterianos y SU procedimiento de preparación (Págs. 72 y 73).

El documento D2 ⁽²⁾ divulga compuestos tricíclicos sustituidos como antibacterianos (Cols. 68 y

1 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?FT=D&date=20051103&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=2005245505A1&KC=A1&ND=2)

FT=D&date=20051103&DB=EPODOC&locale=en_EP&CC=US&NR=2005245505A1&KC=A1&ND=2

2 [http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=0210172A1&KC=A1&FT=D&ND=1&date=20020207&DB=EPODOC&locale=en_EP)

CC=WO&NR=0210172A1&KC=A1&FT=D&ND=1&date=20020207&DB=EPODOC&locale=en_EP

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

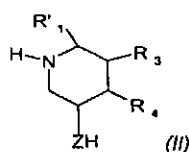
Rad. PCT/09-112458

69).

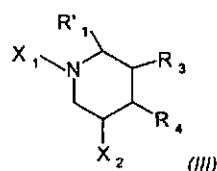
6.3. Novedad.

Según lo dispuesto en el artículo 16 de la Decisión 486: *"Una invención se considerará 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"*.

En el presente caso, el procedimiento de preparación reclamado en la solicitud no es nuevo, teniendo en cuenta que la reivindicación 5 está referida a: *"Un procedimiento para la preparación de los compuestos de fórmula (I), caracterizado porque contiene: a) Una etapa durante la cual se hace reaccionar, con una agente de carbonilación, si llega el caso en presencia de una base, un compuesto de fórmula (II)*



Para obtener un compuesto intermediario de fórmula (III)



b) Una etapa durante la cual se cicla al intermediario obtenido anteriormente, en presencia de una base; y en la que c) Si llega el caso, la etapa a) se precede y/o la etapa b) se sigue por una o varias de la reacciones siguientes, en un orden apropiado: protección de las funciones reactivas, desprotección de las funciones reactivas, esterificación, saponificación, sulfatación, reducción de ésteres, alquilación, carbamoilación, formación de grupo azido, reducción de un azido a amina, salificación, cambio de iones, desdoblamiento o separación de diastereoisómeros" (Pág. 145 del radicado N° 09-112458-00007-0000)

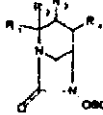
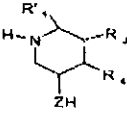
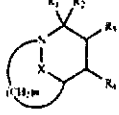
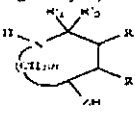
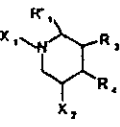
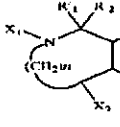
La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 5, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 que representa(n) el estado de la técnica:

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

Rad. PCT/09-112458

Características esenciales	D1
Procedimiento para la preparación de los compuestos de fórmula (I) caracterizado porque comprende:  a) Reacción con un agente de carbonilación, en presencia de una base del compuesto de fórmula (II) 	Procedimiento para la preparación de los compuestos de fórmula (I) caracterizado porque comprende: (Págs. 3 y 4)  Reacción con un agente de carbonilación, en presencia de una base del compuesto de fórmula (II) (Págs. 3 y 4) 
R'1= CN, COOH protegido	R'1= CN, COOH protegido
R'2= OH, COOH protegido	R'2= OH, COOH protegido
R3 y R4 como la fórmula (I)	R3 y R4 como la fórmula (I)
ZH= NHOH protegido	ZH= NHOH protegido
Para obtener un compuesto intermediario de fórmula (III) 	Obtener intermedio fórmula (III) 
X1=H o protector	X1=H o protector
X2=Z-CO-X3	X2=Z-CO-X3
X3= agente carbonilación.	X3= agente carbonilación
b) Ciclación de intermediario en presencia de una base	b) Ciclación de intermediario en presencia de una base
Continuar con una o varias etapas de las reacciones de: protección, esterificación, reducción, entre otras.	Continuar con una o varias etapas de las reacciones de: protección, esterificación, reducción, entre otras. (Págs. 3 y 4)

Las características técnicas esenciales del procedimiento de preparación del compuesto de fórmula (I) habían sido divulgadas previamente en el documento D1 (Págs. 3 y 4), el cual da a conocer un método de preparación a partir de un compuesto de fórmula (II) por reacción con un agente de carbonilación, en presencia de una base; asimismo se divulga la ciclación del intermediario en presencia de una base (Pág. 3). De igual manera se divulga en el esquema de reacción que se puede continuar con una o varias etapas de las reacciones de: protección, esterificación, etc., tal como se presenta en el cuadro anterior.

En consecuencia, la reivindicación 5 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Por su parte, las reivindicaciones dependientes 6 a 9 no mencionan alguna característica que haga nuevo el método de la reivindicación 5, por lo tanto, tampoco cumplen con lo establecido en el mencionado artículo 16 de la Decisión 486.

6.4. Nivel Inventivo.

Según lo dispuesto en el artículo 18 de la Decisión 486: “Se considerará que una invención tiene nivel

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

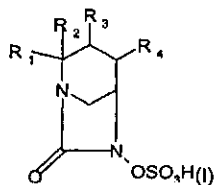
RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

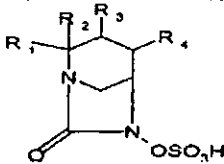
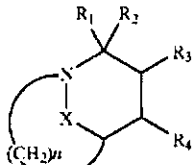
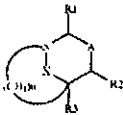
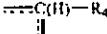
Rad. PCT/09-112458

inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

En el presente caso, el compuesto reclamado en la solicitud no tiene nivel inventivo, teniendo en cuenta que la reivindicación 1 se refiere a: “Compuestos de fórmula general (I), en forma libre, de zwitteriones y en forma de sales con las bases y los ácidos minerales u orgánicos farmacéuticamente aceptables.” (Pág. 6 del radicado N° 09-112458-00007-0000)



La siguiente tabla presenta la comparación entre las características técnicas esenciales de la solicitud estudiada, mencionadas en la reivindicación 1, y las reveladas en el (los) documento(s) D1 y D2 que representa(n) el estado de la técnica:

Características esenciales	D1	D2
Compuesto de fórmula (I) 	Compuesto de fórmula (Pág.1, Párr. 7)  X: COB donde B es N-OSO3H n: 1 ó 2	Compuesto de fórmula (Rv. 1)  A:  X: COB donde B es N-OSO3H n: 1 ó 2
R1: (CH2)n-NH2 o (CH2)n-NR donde R es alquilo	R1: (CH2)n-R5 (Rv. 1)	R1: (CH2)n-NHR donde R es alquilo. (Rv. 1)
R2:Átomo de hidrógeno	R2: Átomo de hidrógeno (Pág., Párr. 19)	Átomo de hidrógeno
R3 y R4: Compuesto pirazolilo.	R3 y R4: Pirazolilo (Rv. 5)	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 divulga la estructura de compuestos tricíclicos sustituidos con actividad como antibacterianos (Págs. 72 y 73).

Adicionalmente, el documento D1 divulga los siguientes compuestos específicos que presentan actividad antibacteriana y confirman la cercanía estructural a los compuestos de la invención: La sal de sodio de trans -1-metil-6-oxo-5-(sulfooxi)-4,5,6,8-tetrahidro-4,7-metano-1H-pirazolo[3,4-e][1,3]-diazepina-8(7H)-carboxamida (Pág. 72; Párr. 2445), y el compuesto la sal de sodio de 1-metil-5-(sulfooxi)-5,6,7,8-tetrahidro-4,7-metano-4H-pirazolo[3,4e][1,3]-diazepina6(1H)-ona (Pág. 72; Párr. 2448).

Por su parte, el documento D2 divulga la estructura de compuestos tricíclicos sustituidos como

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

Rad. PCT/09-112458

antibacterianos (Cols. 68 y 69).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la estructura pirazol [3,4e][1,3]diazepina, divulgada en el documento D1 corresponde a que la invención presenta en el radical R1 un grupo de fórmula (CH₂)_n-NHR, en donde R corresponde a un grupo alquilo C1-3.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y la estructura del documento D2 consiste en que la invención presenta un compuesto heterociclo, pirazol, en la unión de los radicales R3 y R4.

El hecho de incluir un grupo (CH₂)_n-NHR, en donde R corresponde a un grupo alquilo C1-3, en el radical R1, no evidencia un efecto técnico inesperado o sorprendente asociado a la actividad antibacteriana.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: cómo modificar los compuestos de fórmula (I) conocidos en el documento D1 para conseguir compuestos tricíclicos sustituidos alternativos con actividad como antibacterianos.

Sin embargo, la utilización del grupo (CH₂)_n-NHR, en donde R corresponde a un grupo alquilo C1-3, en el radical R1, ya se encuentra divulgada en el documento D2 (Col. 71).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir el grupo (CH₂)_n-NHR, en donde R corresponde a un grupo alquilo C1-3, en el radical R1, divulgado en el documento D2 en los compuestos tricíclicos divulgados en el documento D1.

Ahora bien, considerando que la actividad se debe al núcleo farmacofórico de la molécula y las modificaciones realizada sobre la estructura, no ocasiona una variación importante en su actividad, una persona normalmente versada en la materia, incluiría una sustitución sobre la estructura conocida en el documento D1, con la expectativa razonable de conservar la actividad antibacteriana de los compuestos de la invención, razón por la cual es considerado obvio y por lo tanto sin altura inventiva.

Adicionalmente, el documento D1 da a conocer compuestos útiles como antibacterianos, los cuales presentan actividad sobre las sepas *S. aureus*, *S. pyogenes*, *E. coli*, *E. cloacae*, (Pág. 72; Párr. 2454), y enseña la concentración mínima inhibitoria (CMI) expresada en µg/ml, para los compuestos triciclos sustituidos, que presentan cercanía estructural con los compuestos de la solicitud estudiada;

De acuerdo con el argumento de la solicitante donde refiere que la solicitud es una selección del documento US2005245505, es oportuno aclarar que si bien es un compuesto seleccionado de una lista de posibilidades, en el documento D1 se evidencia el grupo farmacofórico que se conserva en los compuestos de la presente solicitud, y que su actividad antibacteriana era esperada ya que los compuestos divulgados en el estado de la técnica presentan un amplio espectro, razón por la cual, dentro de las competencias de una persona versada en la materia está evaluar la actividad antibacteriana de un compuesto frente a diferentes cepas de microorganismos, así de esta manera el problema técnico planteado en la presente solicitud puede ser resuelto con los compuestos divulgados en las anterioridades, entonces concluye que la selección reivindicada es obvia y no presenta un efecto técnico inesperado.

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RESOLUCIÓN No: 43770

Por la cual se deniega una patente de modelo de utilidad

Rad. PCT/09-112458

En conclusión, teniendo en cuenta que los argumentos de la solicitante no desvirtúan de manera alguna las objeciones a la patentabilidad ya sustentadas, el Superintendente de Industria y Comercio,

RESUELVE:

ARTÍCULO PRIMERO: Denegar la patente de invención a la creación titulada "COMPUESTOS PIRAZOL[3,4e]DIAZEPIN-6-ONA SUSTITUIDOS QUE PRESENTAN ACTIVIDAD ANTIBACTERIANA Y SU PREPARACIÓN".

ARTÍCULO SEGUNDO: Notificar el contenido de la presente resolución a la(s) sociedad(es) Novexel, entregándole(s) copia de la misma y advirtiéndole(s) que contra ella(s) procede el recurso de reposición, ante el Superintendente de Industria y Comercio, el cual podrá ser interpuesto en el momento de la notificación o dentro de los cinco (5) días hábiles siguientes a ella.

NOTIFÍQUESE Y CÚPLASE
Dada en Bogotá D.C., el 30 Jul 2013

EL SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO,



PABLO FELIPE ROBLEDO DEL CASTILLO

Doctor(a)

MAURICIO PATIÑO BONNET

info@prietocarrizosa.com

notificaciones@prietocarrizosa.com

Elaboró: Diego Armando Galvis Sanchez ✓
Revisó: Jeny Paola Villate Becerra ✓
Revisó: Jose Luis Salazar Lopez ✓
Aprobó: Jose Luis Londoño Fernandez ✓