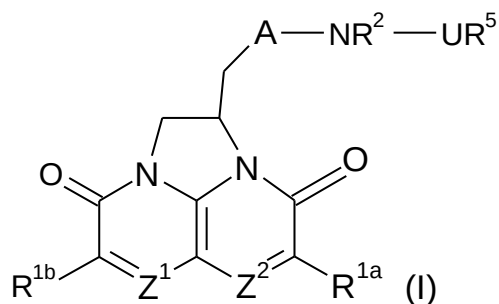


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO

(Examen de Forma)

1. Un compuesto de Fórmula (I):

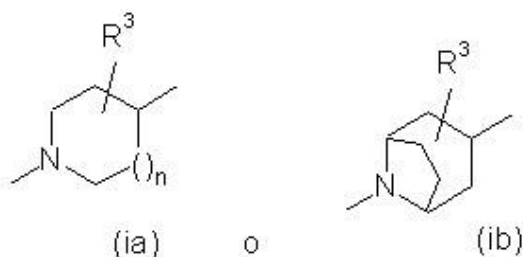


en la que:

Z^1 y Z^2 se seleccionan, de manera independiente, entre CH y N;

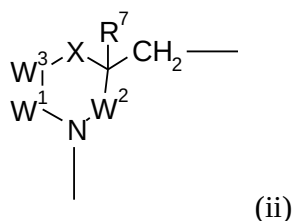
R^{1a} y R^{1b} se seleccionan, de manera independiente, entre hidrógeno; halógeno; ciano; alquilo (C_{1-6}); alquiltio (C_{1-6}); trifluorometilo; trifluorometoxi; carboxi; hidroxilo opcionalmente sustituido por alquilo (C_{1-6}) o alquilo (C_{1-6}) sustituido por alcoxi (C_{1-6}); alquilo (C_{1-6}) sustituido por alcoxi (C_{1-6}); hidroxialquilo (C_{1-6}); un grupo amino opcionalmente sustituido en N por uno o dos grupos alquilo (C_{1-6}), formilo, alquilcarbonilo (C_{1-6}) o alquilsulfonilo (C_{1-6}); y aminocarbonilo en el que el grupo amino está opcionalmente sustituido por alquilo (C_{1-4}); siempre que R^{1a} y R^{1b} sean H cuando Z^2 o Z^1 sea N, respectivamente;

R^2 es hidrógeno o alquilo (C_{1-4}), o junto con R^6 forma Y como se define más adelante; A es un grupo (i):



en los que: R^3 es como se ha definido para R^{1a} y R^{1b} o es oxo y n es 1 o 2:

o A es un grupo (ii)



W^1 , W^2 y W^3 son CR^4R^8

o W^2 y W^3 son CR^4R^8 y W^1 representa un enlace entre W^3 y N.

X es O, CR^4R^8 o NR^6 ;

un R^4 es como se ha definido para R^{1a} y R^{1b} , y el resto y R^8 son hidrógeno o un R^4 y R^8 son conjuntamente oxo y el resto son hidrógeno;

R^6 es hidrógeno o alquilo (C_{1-6}); o junto con R^2 forma Y;

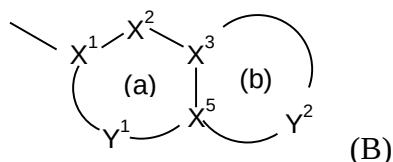
R^7 es hidrógeno; halógeno; hidroxilo opcionalmente sustituido por alquilo (C_{1-6}); o alquilo (C_{1-6});

Y es $CR^4R^8CH_2$; $CH_2CR^4R^8$; $(C=O)$; CR^4R^8 ; $CR^4R^8(C=O)$; o $(C=O)CR^4R^8$;

o cuando X es CR^4R^8 , R^8 y R^7 representan conjuntamente un enlace;

U se selecciona entre CO, y CH_2 y

R^5 es un sistema de anillos bicíclico carbocíclico o heterocíclico opcionalmente sustituido (B):



que contiene hasta cuatro heteroátomos en cada anillo, en el que

al menos uno de los anillos (a) y (b) es aromático;

X^1 es C o N cuando forma parte de un anillo aromático, o CR^{14} cuando forma parte de un anillo no aromático;

X^2 es N, NR^{13} , O, $S(O)_x$, CO o CR^{14} cuando forma parte de un anillo aromático o no aromático, o puede ser además $CR^{14}R^{15}$ cuando forma parte de un anillo no aromático;

X^3 y X^5 son, de manera independiente, N o C;

Y^1 es un grupo enlazador de 0 a 4 átomos, seleccionándose cada uno de los átomos, de manera independiente, entre N, NR^{13} , O, $S(O)_x$, CO y CR^{14} cuando forma parte de un anillo aromático o no aromático, o pudiendo ser además $CR^{14}R^{15}$ cuando forma parte de un anillo no aromático;

Y^2 es un grupo enlazador de 2 a 6 átomos, seleccionándose cada uno de los átomos de Y^2 , de manera independiente, entre N, NR^{13} , O, $S(O)_x$, CO, CR^{14} cuando forma parte de un anillo aromático o no aromático, o pudiendo ser además $CR^{14}R^{15}$ cuando forma parte de un anillo no aromático;

cada uno de R^{14} y R^{15} se selecciona, de manera independiente, entre: H; alquiltio (C_{1-4}); halo; carboxialquilo (C_{1-4}); alquilo (C_{1-4}); alcoxicarbonilo (C_{1-4}); alquilcarbonilo (C_{1-4}); alcoxi (C_{1-4})-alquilo (C_{1-4}); hidroxil; hidroxialquilo (C_{1-4}); alcoxi (C_{1-4}); nitro; ciano; carboxi; amino o aminocarbonilo opcionalmente mono- o di sustituido por alquilo (C_{1-4}); o

R^{14} y R^{15} pueden representar conjuntamente oxo;

cada R^{13} es, de manera independiente, H; trifluorometilo; alquilo (C_{1-4}) opcionalmente sustituido por hidroxil, alcoxi (C_{1-6}), alquiltio (C_{1-6}), halo o trifluorometilo; alqueno (C_{2-4}); alcoxicarbonilo (C_{1-4}); alquilcarbonilo (C_{1-4}); alquilsulfonilo (C_{1-6}); aminocarbonilo en el que el grupo amino está opcionalmente mono- o di sustituido por alquilo (C_{1-4}); y

cada x es, de manera independiente, 0, 1 o 2.

o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo,
para su uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae*.

2. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que, en el compuesto de Fórmula I:

(iv) Z^1 y Z^2 son ambos CH;

(v) Z^1 es N y Z^2 es CH; o

(vi) Z^1 es CH y Z^2 es N.

3. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que R^{1a} es hidrógeno y R^{1b} es hidrógeno como se define en el compuesto de Fórmula I.

4. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que, en el compuesto de Fórmula I:

A es (ia), n es 1 y R^3 es H o hidroxil en la posición 3;

A es (ii), X es CR⁴R⁸ y R⁸ es H y R⁴ es H o OH; o

A es (ii), X es O, R⁷ es H y W¹, W² y W³ son cada uno CH₂,

5. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que A es piperidin-4-ilo o pirrolidin-4-ilmetilo como se define en el compuesto de Fórmula I.

6. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que U es CH₂ como se define en el compuesto de Fórmula I.

7. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que, en el compuesto de Fórmula I:

R⁵ es un anillo heterocíclico aromático (B) que tiene de 8 a 11 átomos en el anillo que incluyen de 2 a 4 heteroátomos, de los cuales al menos uno es N o NR¹³ en el que Y² contiene de 2 a 3 heteroátomos, uno de los cuales es S y de 1 a 2 son N, con un N enlazado a X³, o

el anillo heterocíclico (B) tiene el anillo (a) aromático seleccionado entre benzo, pirido, piridazino y pirimidino opcionalmente sustituidos y el anillo (b) no aromático, e Y² tiene de 3 a 5 átomos, que incluyen al menos un heteroátomo, con O, S, CH₂ o NR¹³ enlazado a X⁵ donde R¹³ es distinto de hidrógeno, y bien NHCO enlazado a través de N a X³, u O, S, CH₂ o NH enlazado a X³.

8. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que, en el compuesto de Fórmula I:

R⁵ se selecciona entre:

3-oxo-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-*b*][1,4]oxazin-6-ilo;

3-oxo-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-ilo;

2,3-dihidro-[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilo;

[1,3]oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilo;

6-fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-7-ilo;

2,3-dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilo;

3,4-dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilo;
5-fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-7-ilo;
5-carbonitro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-7-ilo; o
2,3-dihidro-benzo[1,4]dioxin-6-ilo.

9. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo con la Reivindicación 1, en el que, en el compuesto de Fórmula I:

A se selecciona entre:

1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;
1-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2,3,5-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(5,6,7,8-Tetrahidro-3-isoquinolinilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(6,7-Dihidro-5*H*-ciclopenta[*c*]piridin-3-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(1,3-Dihidrofuro[3,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1*R*)-1-({4-[(3,4-Dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
7-[(1-[(4,9-Dioxo-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-1-il)metil]-4piperidinil}amino)metil]-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-5-carbonitrilo;

1-[(4-{[(3-Oxo-3,4-dihidro-2*H*-1,4-benzotiazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*S*)-2-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-({4-[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*S*)-2-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]dioxino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-({4-[(2,3-Dihidro[1,4]oxatiíno[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil]amino)-4-metil-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-({4-Metil-4-[(1,3)oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(2*R*)-2-({4-[(2,1,3-Benzotiadiazol-5-ilmetil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-[(4-{[(7-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-({4-[(3,4-Dihidro-2H-[1,4]oxatiepino[2,3-c]piridin-8-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-({4-[(1,3)Oxatiolo[4,5-c]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-[(4-{[(3-Oxo-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-b][1,4]tiazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-({4-[(2,3-Dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(8-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Cloro-3-oxo-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(4-Cloro-7-oxo-6,7-dihidro-1H-pirimido[5,4-b][1,4]oxazin-2il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Oxo-6,7-dihidro-1H-pirimido[5,4-b][1,4]tiazin-2-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-({4-[(1,2,3-Benzotiadiazol-5-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-({4-[(2,3-Dihidro-1-benzofuran-5-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4H,9H-imidazo[1,2,3-ij]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-({4-[(3,4-Dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-({4-[(2,3-Dihidrofuro[2,3-c]piridin-5-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-({4-[(3,4-Dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-({4-[(2,3-Dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-[(4-{[(8-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

7-[(1-[(2R)-3,8-Dioxo-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-2-il]metil}-4piperidinil)amino]metil}-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-5-carbonitrilo;

(2R)-2-({4-[(2,3-Dihidrofuro[2,3-*c*]piridin-5-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-({4-[(2,3-Dihidro-1,4-benzodioxin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-({4-[(1,2,5-Tiadiazolo[3,4-*b*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(4-Fluoro-1*H*-bencimidazol-2-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(2*S*)-2-({[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]metil}-4morfolinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona; (1R)-1-[(2*S*)-2-({[(7-Cloro-3-oxo-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]oxazin-6il)metil]amino}metil)-4-morfolinil]metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8naftiridin-4,9-diona;

(2R)-2-({4-[(1,2,5-Tiadiazolo[3,4-*b*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-({4-[(3,4-Dihidro-2*H*-cromen-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-({4-[(2,3-Dihidro-1-benzofuran-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-({4-[(3,4-Dihidro-2*H*-cromen-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(2R)-2-[(4-{[(5-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

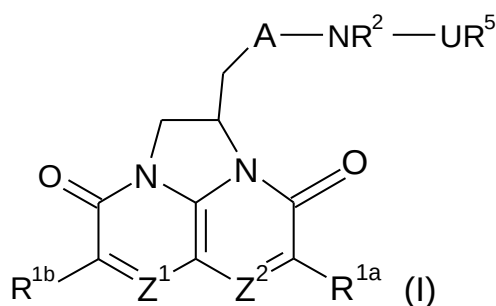
(1R)-1-[(2*S*)-2-({[(7-fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}metil)-4morfolinil]metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(3*S*)-3-({[(1,3)Oxatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]metil}-1pirrolidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

7-[(1-[(1R)-3,8-Dioxo-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-1-il]metil}-4piperidinil)amino]metil}-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-5-carbonitrilo;

(1R)-1-[(4-{[(7-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;
(1R)-1-[(4-{[(8-Fluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;
(1R)-1-[(4-{[(2-Oxo-2H-cromen-7-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1R)-1-[(4-{[(2-oxo-2H-cromen-7-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1R)-1-[(4-{[(2-oxo-2H-cromen-7-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
(1R)-1-[(4-{[(3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;
o 1-[(4-{[(3-Oxo-3,4-dihidro-2*H*-1,4-benzotiazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona; o una base libre de un compuesto de la Tabla 1; o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.

10. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* que comprende administrar una composición farmacéutica que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de Fórmula (I) a un sujeto en necesidad de ello:

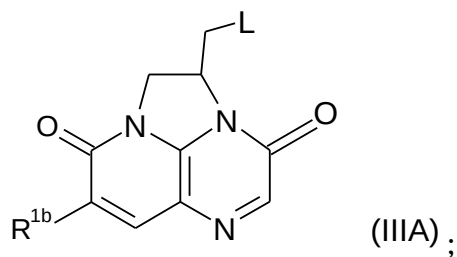


en la que:

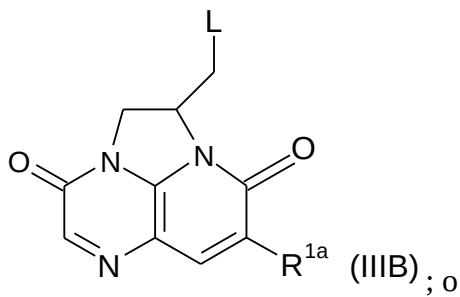
los sustituyentes A, R^{1a}, R^{1b}, R², R⁵, Z¹ y Z² son como se define en la Reivindicación 1; y excipiente/s farmacéuticamente aceptable/s.

11. Un compuesto de:

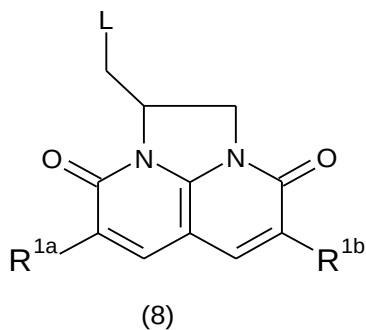
Fórmula (IIIA):



Fórmula (IIIB):



Fórmula (8):

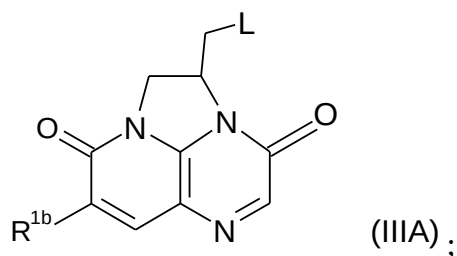


en las que:

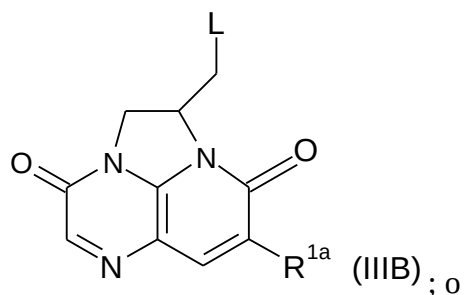
L es $-A-N(R^{20})R^{2'}$ y R^{20} es hidrógeno, $R^{2'}$ es R^2 o un grupo convertible en el mismo y A, R^2 , R^{1a} y R^{1b} son como se definen en la Reivindicación 1, para el uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae*

12. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* que comprende administrar una composición farmacéutica que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de:

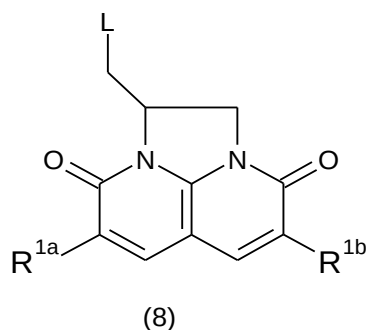
Fórmula (IIIA):



Fórmula (IIIB):



Fórmula (8):

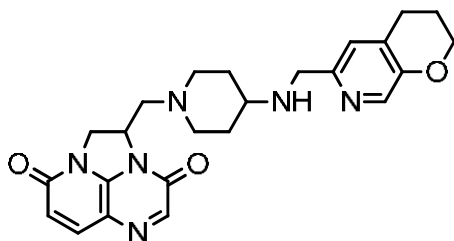


en las que:

L es $-A-N(R^{20})R^{2'}$ y R^{20} es hidrógeno, $R^{2'}$ es R^2 o un grupo convertible en el mismo y A, R^2 , R^{1a} y R^{1b} son como se definen en la Reivindicación 1; y excipiente/s farmacéuticamente aceptable/s a un sujeto en necesidad de ello.

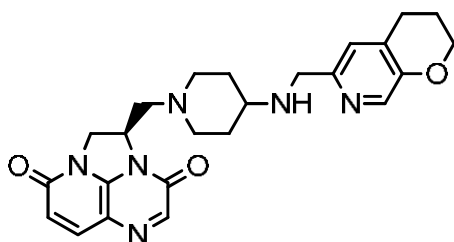
13. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo a la Reivindicación 1, el cual se selecciona desde:

2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona



; y

(2R)-2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona

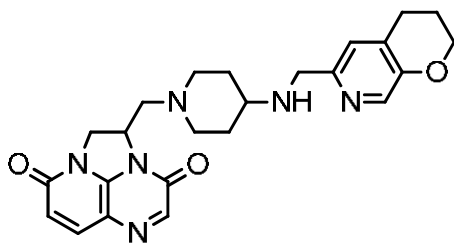


; y

una sal farmacéuticamente aceptable de los mismos.

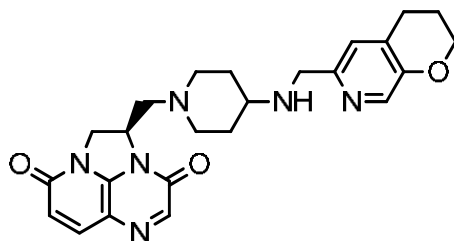
14. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo a la Reivindicación 1, el cual se selecciona desde:

2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona



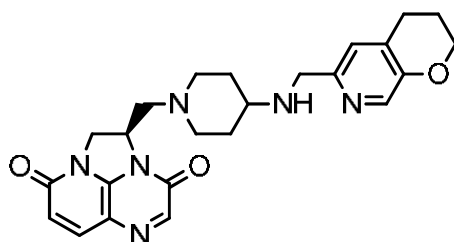
; y

(2R)-2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona



15. Un compuesto para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo a la Reivindicación 13, el cual se selecciona desde una sal de:

(2R)-2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona

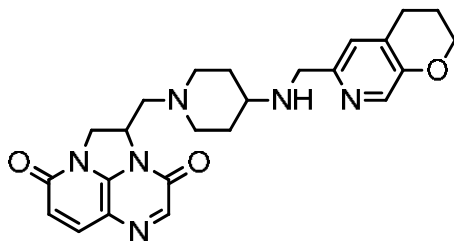


con un ácido seleccionado desde clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico, fosfórico, acético, fumárico, succínico, maleico, cítrico, benzoico, p-toluenosulfónico, metanosulfónico, naftalenosulfónico, o tartárico.

16. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo a la Reivindicación 10, en donde dicha composición farmacéutica comprende:

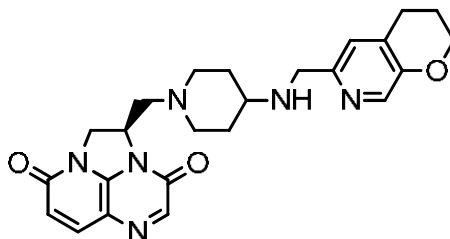
un compuesto seleccionado desde:

2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona



;

(2R)-2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona:



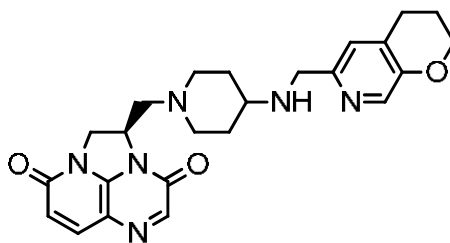
; y

una sal farmacéuticamente aceptable del mismo; y
excipientes farmacéuticamente aceptables.

17. Una composición farmacéutica para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae* de acuerdo a la Reivindicación 10, en donde dicha composición farmacéutica comprende:

un compuesto seleccionado desde:

(2R)-2-({4-[(3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3H,8H-2a,5,8a-triazaacenaftilen-3,8diona:



; y

una sal farmacéuticamente aceptable con un ácido seleccionado desde clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico, fosfórico, acético, fumárico, succínico, maleico, cítrico, benzoico, p-toluenosulfónico, metanosulfónico, naftalenosulfónico, o tartárico; y
excipientes farmacéuticamente aceptables.

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re.: Expediente No. NC2017/0001658

Solicitud de Patente de Invención titulada: “COMPUESTOS TRICÍCLICOS QUE CONTIENEN NITRÓGENO PARA EL TRATAMIENTO DE LA INFECCIÓN POR NEISSERIA GONORRHOEAE”

Solicitante: GLAXOSMITHKLINE INTELLECTUAL PROPERTY DEVELOPMENT LIMITED.

Nuestra Ref.: P2017/000013

RESPUESTA AL OFICIO No. 3109, NOTIFICADO EL 06 DE MARZO DE 2017
(EXAMEN DE FORMA)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo de prórroga previsto en el artículo 39 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado al momento de radicar la solicitud. Así entonces, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto se realizan las siguientes modificaciones:

- se modifica el preámbulo de las Reivindicaciones 1 a 17, para reclamar ahora compuestos o composiciones para uso en el tratamiento de la infección por ***Neisseria gonorrhoeae***;
- la nueva Reivindicación 13, tiene soporte en las antiguas Reivindicaciones 13 y 16 ;

- la nueva Reivindicación 14 tiene soporte en las antiguas Reivindicaciones 14 y 17.
- la nueva Reivindicación 15 tiene soporte en la antigua Reivindicación 16 y en la Página 16 Líneas 31 a 38 del Capítulo Descriptivo.
- la nueva Reivindicación 16 tiene soporte en las antiguas Reivindicaciones 15 y 18.
- la nueva Reivindicación 17 tiene soporte en la antigua Reivindicación 16 y en la Página 16 Líneas 31 a 38 del Capítulo Descriptivo

Valga anotar que la modificación efectuada al Capítulo Reivindicatorio cumple a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que ésta de ninguna manera implica una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud original.

2. a- El Examinador señala que de acuerdo a la tasa pagada por el solicitante el examen de patentabilidad se realizará únicamente sobre las 10 primeras reivindicaciones.

b- Llamo respetuosamente la atención del Examinador sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto que comprende 17 reivindicaciones en total. Por consiguiente, se adjunta el recibo de pago siete (7) reivindicaciones adicionales. De esta manera, solicito respetuosamente que todas las reivindicaciones sean tenidas en cuenta por la SIC al momento de realizar el examen de fondo de la presente solicitud.

3. a- El Examinador indica que el Resumen no divulga de manera completa el objeto de la invención, sus elementos característicos y el campo de aplicación.

b- En respuesta al requerimiento del Examinador, me permito anexar al presente memorial un resumen modificado en el cual ahora se mencionan el objeto de la invención y sus elementos característicos, por lo cual considero superada la objeción del Examinador en cuanto a este respecto.

4. a- El Examinador indica que las Reivindicaciones 1 a 10 corresponden a materia no patentable

b- i) En primer lugar, sea esta la oportunidad de manifestar respetuosamente que cualquier requerimiento relacionado con la patentabilidad del Capítulo Reivindicatorio en

la etapa del examen de forma (Art. 38 D486) resulta irregular, pues dicho examen de forma solamente pretende la verificación de requerimientos específicos listados en los Artículos 26 y 27 de la Decisión 486, y no un análisis de fondo de la solicitud en virtud del Artículo 45 (por ejemplo, análisis de la claridad, soporte o unidad de invención).

Es decir, en relación con la evaluación de requisitos de forma, la Decisión 486 sólo se refiere al cumplimiento de las disposiciones de los Artículos 26 y 27, tal como que la solicitud **contenga** una o más reivindicaciones, **independientemente** del contenido técnico o extensión de las mismas.

Lo anterior se encuentra claramente establecido en el Manual Andino de Patentes (MAP), en donde establece con respecto al Examen de Forma que “*En el examen de forma, el examinador de forma **no realiza un examen profundo para verificar el contenido**, claridad y comprensión de la descripción; es esencial sin embargo que el documento sea suficientemente legible*”¹. De hecho, el MAP establece respecto al Examen de Forma que dicho examen consiste en la **verificación** de: Petitorio, Descripción, Reivindicaciones, Dibujos, Resumen, Poderes (si fuere el caso), Copia del contrato de acceso o de uso de conocimiento tradicionales (si fuere el caso), Certificado de depósito del material biológico (si fuere el caso), Documento de cesión de derechos del inventor al solicitante e Idioma.²

Es más, respecto al examen de forma de las reivindicaciones, el MAP establece que “*En esta etapa del examen, de igual manera que para la descripción, **no se analizan la claridad ni concisión de las reivindicaciones**. Basta con que el examinador de forma reconozca algo que parezca un capítulo reivindicatorio, estos requisitos se vuelven importantes en el momento de entrar a analizar la solicitud en el examen de fondo ya que mediante ellas se medirá la extensión de la patente*”³ (énfasis fuera de texto). Por lo tanto, si bien, con el fin de facilitar el trámite proporcione **voluntariamente** un **Capítulo Reivindicatorio Modificado** en el que se eliminan algunas reivindicaciones, considero que este requerimiento en esta etapa del trámite es injustificado y se extralimita según las disposiciones legales aplicables y por el contrario señalo que la claridad o patentabilidad de las reivindicaciones **no deben** ser estudiadas durante el examen de forma y no le corresponde al solicitante pronunciarse sobre ello en esta etapa del trámite.

¹ Comunidad Andina de Naciones, Manual Andino de Patentes, 2004, Capítulo II, Sección 5.2

² Ibídem, Sección 5, subsecciones 5.1 a 5.10, p. 25 a 28

³ Ibídem. Sección 5.3.

ii) Vale la pena resaltar además que el Solicitante **no ha pedido** **formalmente que la SIC examine si la invención es patentable**, tal como lo establece el Artículo 44 de la Decisión 486, el cual señala que “*Dentro del plazo de seis meses contados desde la publicación de la solicitud, independientemente que se hubieren presentado oposiciones, **el solicitante deberá pedir que se examine si la invención es patentable**. Los Países Miembros podrán cobrar una tasa para la realización de este examen. Si transcurriera dicho plazo sin que el solicitante hubiera pedido que se realice el examen, la solicitud caerá en abandono*”.

En este sentido, dado que la solicitud **no ha sido publicada** y **el solicitante tampoco ha solicitado que se realice el examen de patentabilidad**, **ni mucho menos se ha pagado la tasa para realizar dicho examen**, respetuosamente considero que el Solicitante no debe pronunciarse sobre aspectos relacionados con la patentabilidad en respuesta al examen de forma, y por el contrario, sólo está en la obligación de responder a aquellas objeciones enmarcadas bajo los Artículos 38 y 39 de la Decisión 486.

4. Por todo lo anterior, considero que las objeciones presentadas por el Examinador en su examen de forma han sido resueltas y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho tenga por cumplidos los requisitos de forma y proceda con la publicación de la solicitud de acuerdo con el Artículo 40 de la Decisión 486.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

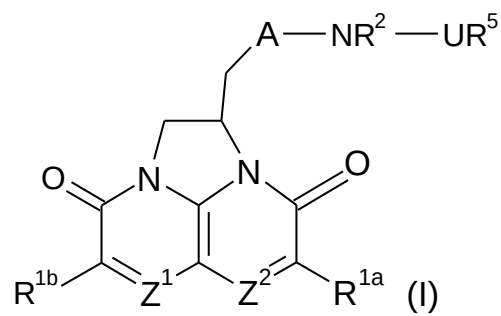
Anexos:

- Capítulo Reivindicatorio Modificado.
- Recibo de pago por siete (7) Reivindicaciones adicionales

**COMPUESTOS TRICÍCLICOS QUE CONTIENEN NITRÓGENO PARA EL
TRATAMIENTO DE LA INFECCIÓN POR NEISSERIA GONORRHOEAE**

RESUMEN

La presente invención se refiere a compuestos tricíclicos que contienen nitrógeno de formula (I) o a sales farmacéuticamente aceptables y/o N-óxidos de los mismos y las correspondientes composiciones farmacéuticas



para uso en el tratamiento de la infección por *Neisseria gonorrhoeae*.