

|                                                   |                                            |
|---------------------------------------------------|--------------------------------------------|
| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO          |                                            |
| RAD: 10-1339- -8                                  | FECHA: 2013-02-12 10:07:47                 |
| 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 PRESENTACION                             |                                            |

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020  
Bogotá, D.C.,  
  
Abogado(a)/Señor(a)  
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA  
info@castellanosyco.co

Asunto:      Radicación:      10-1339- -8  
                 Trámite:            11  
                 Evento:            378  
                 Actuación:           519  
                 Oficio:                    2566  
                 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/EP2008/005589 |            |   |                               |  |
| Fecha de Presentación Internacional | 09/07/2008        |            |   |                               |  |

1. Documentos estudiados

|                           |                     |               |
|---------------------------|---------------------|---------------|
| Descripción:              | Folios 79-144 y 149 | 7/enero/2010  |
|                           | Folios 195-249      | 28/enero/2013 |
| Reivindicaciones:         | Folios 145-148      | 7/enero/2010  |
|                           | Folios 250-253      | 28/enero/2013 |
| Prioridad: GB 0713479,4   | Folio 1             | 11/julio/2007 |
| Respuesta del solicitante | Folios 183-194      | 28/enero/2013 |

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.

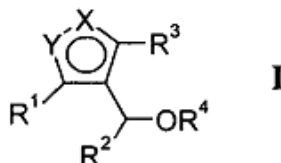
3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capitulo primero del Título 10 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 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.

Título de la solicitud: Derivados de isotiazol y pirazol como fungicidas. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a derivados de fórmula (I) que tienen actividad fungicida.



El problema técnico planteado en la presente solicitud de patente se refiere a la necesidad de diseñar nuevos derivados fungicidas con un alto nivel de actividad contra malezas resistentes. Para solucionar ese problema técnico la solicitud plantea derivados de fórmula (I).

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C07D 401/06, A01N 43/40.

#### 4. De la solicitud de Patente

##### Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El solicitante hizo caso omiso de las observaciones realizadas en cuanto a la concisión y el sustento en la descripción del capítulo reivindicatorio, y el nuevo capítulo reivindicatorio presenta las mismas falencias.

Esta Oficina reitera que el nuevo capítulo reivindicatorio es demasiado amplio y no cumple con el requisito de concisión; asimismo se considera una generalización que no se encuentra enteramente soportada en la descripción. Son tantas las posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I) (debido a la gran cantidad y variedad de sustituyentes) que la descripción no divulga de manera suficientemente clara y completa la materia divulgada en las reivindicaciones; es más, la descripción sólo presentó ensayos que demuestran actividad para compuestos específicos y evidentemente la generalidad presentada en el capítulo reivindicatorio se aleja de esos ejemplares.

Más aún, el nuevo capítulo reivindicatorio es incluso más amplio que el anterior, dado que incluye no solamente derivados de isotiazol, sino derivados de pirazol.

Nuevamente se llama la atención del solicitante en cuanto a que los significados de los radicales definidos deberán ser limitados a aquellos que se encuentren enteramente soportados en la descripción, tal como se relaciona en la siguiente tabla:

| Sustituyente | Significado soportado en la descripción                |
|--------------|--------------------------------------------------------|
| $R^1$        | 4-Cl-Ph, 2-tiofenilo, 2-F-Ph, 2,4-F <sub>2</sub> -Ph   |
| $R^2$        | 3-Pi                                                   |
| $R^3$        | Ph, 4-Cl-Ph, 2,4Cl <sub>2</sub> -Ph, 4-Br-Ph, 4-Cl-Ph, |
| $R^4$        | H                                                      |
| $R^5$        | Metilo                                                 |

Es importante indicar que no sólo no se encuentra ninguna razón técnica para tratar de proteger una extrapolación o generalización tan amplia a partir de estructuras específicas mucho más simples, sino que no se encuentra sustento en la descripción para tratar de proteger combinaciones que incluyen un ingrediente fungicida conocido adicional. Sírvase suprimir la nueva reivindicación 9 puesto que no esta sustentada en la descripción.

Asimismo, el solicitante deberá suprimir las expresiones “alquilo, alquenilo, alquinilo, heterociclilo, trialquilsililo, arilalquilo, ariloxialquilo, ariltioalquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional, un grupo que en condiciones biológicas puede disociarse para formar un alcohol en esta posición, una sal o N-óxido del mismos, un portador o diluyente aceptable para uso en agricultura, para uso farmacéutico” puesto que son imprecisas y no permiten definir el objeto y el alcance de la invención específicamente. El solicitante deberá limitar el alcance de la invención, de lo contrario se le negara la patente.

En consecuencia, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión, claridad y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486.

**5. Determinación del Estado de la Técnica**

Considerando que la fecha de la solicitud prioritaria es 11 de julio de 2007 se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

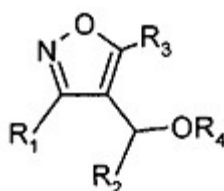
| Nº | Documento      | Título                                                                                                                                | Fecha de publicación |
|----|----------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1 | WO2006031631   | Substituted isoxazoles as fungicides                                                                                                  | 23/marzo/2006        |
| D2 | DE10034129     | New 3-substituted benzyloxy-pyrazole derivatives, useful as pesticides, particularly fungicides and insecticides for plant protection | 28/junio/2001        |
| D3 | WO0155142      | Isothiazole derivatives and their use as pesticides                                                                                   | 2/agosot/2001        |
| D4 | WO 2004/080972 | <a href="#">Pirazole modulators of atp-binding cassette transporters</a>                                                              | 23/septiembre/2004   |

El solicitante podrá consultar los documentos citados en las siguientes direcciones URL:  
[http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/citedDocuments?CC=WO&NR=2009007098A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090115&DB=EPODOC&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/citedDocuments?CC=WO&NR=2009007098A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=20090115&DB=EPODOC&locale=en_EP)

D4:[http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=WO2004080972&ST=advanced&locale=en\\_EP&DB=EPODOC](http://worldwide.espacenet.com/searchResults?compact=false&PN=WO2004080972&ST=advanced&locale=en_EP&DB=EPODOC)

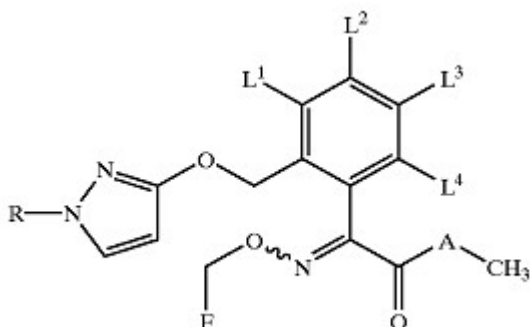
El documento D1 hace referencia a derivados de isoxazol de formula (I) y su uso como

fungicidas.

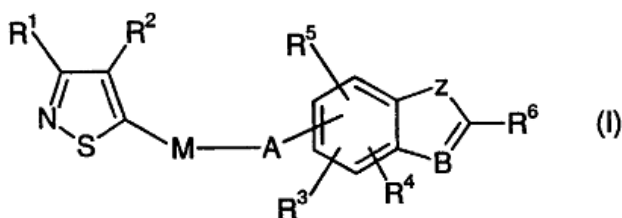


**I**

El documento D2 hace referencia a pirazolil bencil eteres de formula (I) y su uso como pesticidas.

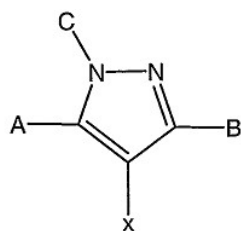


El documento D3 hace referencia a derivados de isotiazol de formula (I) y su uso como pesticidas.



**(I)**

El documento D4 hace referencia a derivados de pirazol de formula (I) como moduladores de la actividad de los transportadores ABC.

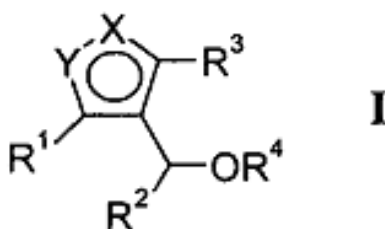


**(I)**

## 6. Examen de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

La solicitud de patente en estudio presenta en su reivindicación 1 un compuesto de fórmula (I):



Donde:

X es S, N o NR<sup>5</sup> e Y es N o NR<sup>5</sup>.

R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> son arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional.

R<sup>2</sup> es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional

R<sup>4</sup> es hidrógeno o acilo

R<sup>5</sup> es hidrógeno o alquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional; (...)

O donde

X es N e Y es NR<sup>5</sup>.

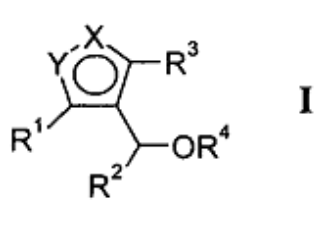
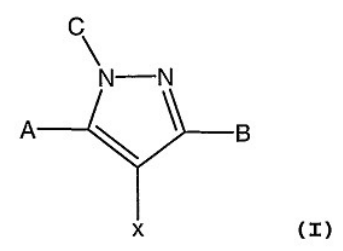
R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> son arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional.

R<sup>2</sup> es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional

R<sup>4</sup> es hidrógeno o acilo

R<sup>5</sup> es hidrógeno o alquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional; (...) (folios 251-251).

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 estado de la técnica.

| Características esenciales de la invención                                                                                                      | Características esenciales del documento D4                                                                                        |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|  <p style="text-align: center;"><b>I</b></p>                 |  <p style="text-align: center;"><b>(I)</b></p> |
| X es N o NR <sup>5</sup> e Y es N o NR <sup>5</sup> .<br>R <sup>1</sup> y R <sup>3</sup> son arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional. | Reivindicación 1<br>derivado de pirazol<br>C es H                                                                                  |

|                                                                                                                                                                           |                                                                                                                                                                                                                                       |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| R2 es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional<br>R4 es hidrógeno o acilo<br>R5 es hidrógeno o alquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional; (...) | A y B pueden ser independientemente arilo o heteroarilo, opcionalmente sustituidos.<br>X es R2<br>R2 es una cadena alifática C1, sustituida con R4 y R5<br>R4 es Or6, R6 es H<br>R5 es arilo o heteroarilo, opcionalmente sustituidos |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

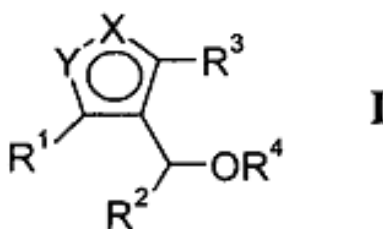
Las características esenciales del derivado de pirazol de la reivindicación 1 ya habían sido divulgadas previamente en el documento D4, tal como lo muestra la tabla comparativa anterior (reivindicación 1).

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 4 y 6 a 7 no mencionan alguna característica que haga el compuesto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

#### Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

La solicitud de patente en estudio presenta en su reivindicación 1 un compuesto de fórmula (I):



Donde:

X es S, N o NR5 e Y es N o NR5.

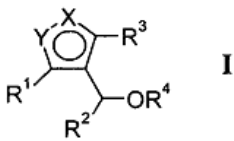
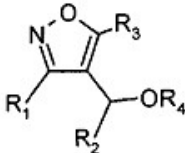
R1 y R3 son arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional.

R2 es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional

R4 es hidrógeno o acilo

R5 es hidrógeno o alquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional; (...)

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 estado de la técnica.

| Características esenciales de la invención                                                                                                                                                                                                                                     | Características esenciales del documento D1                                                                                                                                                |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <br><b>I</b>                                                                                                                                                                                  |                                                                                                         |
| X es S, N o NR5 e Y es N o NR5.<br>R1 y R3 son arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional.<br>R2 es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional<br>R4 es hidrógeno o acilo<br>R5 es hidrógeno o alquilo, arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional; (...) | R1 y R3 pueden ser independientemente arilo o heteroarilo, opcionalmente sustituidos.<br><br>X es R2<br>R2 es arilo o heteroarilo, sustituido en forma opcional<br>R4 es hidrógeno o acilo |

El documento D1 se consideran el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque:

El documento D1 divulga derivados de isoxazol de formula (I) que tienen una buena actividad fungicida contra diferentes malezas.

La diferencia entre D1 y la presente solicitud de patente radica en el anillo heterociclo, de isoxazol en D1 a pirazol o isotiazol en esta solicitud.

Sin embargo, no se encuentra evidencia técnica donde se demuestre que la diferencia estructural frente a los compuestos conocidos en estado del arte provoque algún efecto técnico para la amplia gamma de compuestos reclamados.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos derivados conocidos desde D1 para obtener derivados alternativos?

No obstante, las modificaciones realizadas resultan ser modificaciones estructurales evidentes para un técnico medio, dado que los derivados pirazol e isotiazol son agentes fungicidas exitosos, tal como lo presentan por ejemplo el documento D2 o D3. Los documentos citados divulgan derivados pirazol sustituidos (en D2) o isotiazol (en D3) que tiene actividad fungicida, en un núcleo central equivalente al reclamado en esta solicitud. Mas aún estos grupos –isotiazol, pirazol, isoxazol- son estructuralmente equivalentes o también llamados isósteros y el reemplazo de uno por otro es una práctica común en el arte.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, plantearía dicha sustitución alternativa con toda expectativita de éxito de obtener derivados novedosos, pero con una buena actividad fungicida. Por lo esta Oficina considera que los derivados de interés se derivan de manera obvia del estado del arte, no provocan ningún efecto técnico sorprendente o inesperado y definitivamente carecen de nivel inventivo.

Análogamente, las composiciones de las reivindicaciones 8 y 9 se derivan de manera

evidente del estado del arte, no representan un salto cualitativo en la técnica y también carecen de nivel inventivo.

Se le aclara al solicitante que los ensayos adicionales presentados, muestran un comportamiento mejorado para uno o dos compuestos muy específicos, en un sistema biológico muy específico, que definitivamente no es evidencia técnica suficiente para asegurar que los derivados de la generalidad reclamada sean fungicidas superiores a los ya descritos en el arte.

Se le aclara al solicitante que esta Oficina es consiente que los derivados conocidos desde D2 o D3 son de estructura diferente a los derivados acá reclamados, no obstante dichos documentos resultan relevantes, porque pertenecen al mismo campo de la tecnología (agentes fungicidas) e incluyen estructuras, si bien diferentes, cercanas a los derivados de interés de esta solicitud. Cualquier técnico medianamente versado en la materia tendría toda la información suficiente a partir de la combinación de enseñanzas de los documentos D1 y D2 o D1 y D3 para reemplazar el anillo de isoxazol, por un anillo de pirazol o isotiazol con la plena expectativa de éxito de encontrar una buena actividad fungicida.

Esta Oficina ratifica que la materia reclamada en el nuevo capítulo reivindicatorio, no es concisa, no se encuentra enteramente sustentada en la descripción y carece de nivel inventivo, tal como se explicó anteriormente.

## 7. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

| N° | Documento N°   | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|----|----------------|----------------------------|----------------------|
| D1 | WO2006031631   | 1-9                        | Nivel Inventivo      |
| D2 | DE10034129     | 1-9                        | Nivel Inventivo      |
| D3 | WO0155142      | 1-9                        | Nivel Inventivo      |
| D4 | WO 2004/080972 | 1-4 y 6-7                  | 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 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 2013-02-19

Elaboró: Sandra Isabel Calderon Rodriguez  
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Roza