

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

132
17
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 04-086944-00006-0000

SECRETARÍA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
FOLIO 11

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E. S. D.

Ref: Expediente No. 04-086.944

Solicitud de Patente de Invención para: **O-CICLOPROPIL-CARBOXANILIDAS Y SU USO COMO FUNGICIDAS**

Solicitante: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio No. 8146 notificado por fijación en lista el 20 de junio de 2008 correspondiente al examen de fondo, estando dentro del término legal en los siguientes términos:

Claridad de las reivindicaciones

Argumenta su Despacho: "la cantidad de sustituyentes es especulativa ya que no están enteramente sustentados mediante ejemplos en la descripción... así mismo, los sustituyentes que son restos de hidrocarburos son demasiados para la poca cantidad de ejemplos que demuestran la actividad... la palabra halo debe especificarse por halógeno... el método de la reivindicación 10 no comprende etapas ni pasos para obtener un producto...".

Con el fin de superar las objeciones sobre las reivindicaciones, presento a consideración del señor examinador un nuevo pliego reivindicatorio compuesto 8 reivindicaciones donde se han realizado las modificaciones que expongo a continuación:

La nueva reivindicación 1 se refiere a una combinación de las reivindicaciones previas 1 y 2 con el grupo Het debidamente limitado a pirrolilo, pirazolilo, tiazolilo sustituidos. Además, los términos "halo" y "opcionalmente sustituido" han sido reemplazados por sus significados específicos como se definieron en las páginas 1-3 de la descripción. Las nuevas reivindicaciones 2 a 5 corresponden a las reivindicaciones anteriores 3 a 6.

La reivindicación 6 es una nueva reivindicación que se relaciona con el compuesto específico de fórmula (1), la (2-biciclopropil-2-il-fenil) amida del ácido 3-difluoro metil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico cuyo sustento se encuentra en el compuesto No. 2.34, divulgado en las tablas 2 y 7 de la descripción. Pongo de presente a su Despacho que dicha modificación no introduce materia nueva a la solicitud y que se encuentra debidamente sustentada en la descripción. Igualmente, las nuevas reivindicaciones 7 y 8 corresponden a las reivindicaciones previas 7 y 9, respectivamente.

137
127

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

En conclusión, el nuevo pliego reivindicatorio es claro y debidamente sustentado en los ejemplos en vista de las modificaciones realizadas.

La objeción sobre la reivindicación 10 debe tenerse como superada toda vez que dicha reivindicación ha sido eliminada.

Con respecto a la objeción sobre el término "halo", éste ha sido sustituido por su significado de acuerdo a la descripción.

Unidad de invención

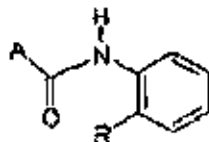
Argumenta su Despacho: "El proceso de la reivindicación 8 para preparar el compuesto de fórmula (II) no guarda unidad de invención con el compuesto de fórmula (I) de las reivindicaciones 1 a 6".

Teniendo en cuenta que la reivindicación 8 ha sido eliminada del capítulo reivindicatorio, la objeción por unidad de invención debe tenerse como superada.

Novedad

Argumenta su Despacho: "Cada uno de los documentos citados en el estado del arte afecta la novedad del compuesto de fórmula (I)".

Con respecto a la novedad de la presente invención, pongo de presente a su Despacho que el nuevo pliego reivindicatorio es novedoso con respecto al arte previo dado que ninguno de los documentos divulga los compuestos reivindicados en la presente invención. De hecho, el documento D1 describe carboxanilidas de fórmula general:



En donde A se selecciona de 8 sistemas de anillos, incluyendo pirazoles y tiazoles, y los sustituyentes orto R cubren una gran variedad de radicales que abarcan desde alquilo C_{2-12} sustituido a fenilo sustituido, incluyendo cicloalquilo C_{3-6} no sustituido o sustituido con alquilo (ver columna 1, línea 38).

Por el contrario, los compuestos de acuerdo a la presente reivindicación 1 representan una selección extremadamente limitada de lo divulgado en D1 (documento analizado por el señor examinador). En particular, el sustituyente orto de la anilida es un grupo ciclopropilo sustituido. Este patrón de sustitución específica de los compuestos de acuerdo a la presente invención no es divulgado ni sugerido por D1 y por lo tanto, la presente invención es novedosa.

Adicionalmente, pongo de presente a su Despacho que según el Manual Andino de Patentes¹:

"Para determinar la novedad de la invención, se debe comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contengan explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención. El examen de novedad se efectúa comparando elemento por elemento de la invención tal como está definido por las reivindicaciones con los del estado de la técnica".

¹ Manual Andino de Patentes. Análisis de novedad. Pg. 65.

CASTELLANOS & CO.

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

De lo anterior se concluye entonces que la presente invención es novedosa toda vez que el patrón de sustitución específica anteriormente descrito de los compuestos de acuerdo a la presente invención no es divulgado por ninguna de las anterioridades de manera explícita.

Nivel inventivo:

Argumenta su Despacho: "El nivel inventivo se ve afectado porque en todos los documentos citados del estado de la técnica se sugiere usar compuestos del mismo tipo que los compuestos de fórmula (I) en calidad de plaguicidas con diferencias insignificantes que habrían sido derivadas por parte de un técnico medio en la materia".

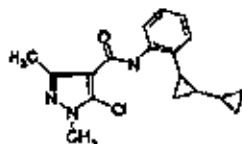
Los compuestos estructuralmente más cercanos del documento D1 son los compuestos de números 10.50 y 9.50. En estos compuestos, el grupo A es pirazollo (compuesto número 10.50) o tiazolilo (compuesto número 9.50) y el sustituyente R es un grupo ciclopropilo no sustituido. Por lo tanto, la única diferencia estructural entre dichos compuestos y los compuestos de la presente invención es la presencia de un sustituyente en el grupo ciclopropilo.

Para demostrar que los compuestos de acuerdo a la invención son superiores que los compuestos del documento D1, me permito presentar ejemplos biológicos comparativos en los cuales la actividad fungicida de los compuestos 10.50 y 9.50 de D1 se comparan con la de los compuestos de acuerdo a la presente invención.

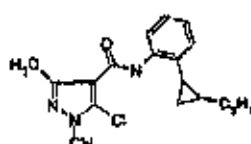
En los ejemplos comparativos se ha ensayado la actividad fungicida contra *Puccinia Recondita* (roya marrón) en trigo. Esta es una de las enfermedades de trigo más significativas en todo el mundo. En condiciones cálidas y húmedas, esta enfermedad progresa muy rápidamente y las infecciones tempranas causan cuantiosas pérdidas mediante la rápida reducción de la capacidad fotosintética. Por lo tanto, es muy deseable proveer un compuesto fungicida que sea capaz de combatir efectivamente esta enfermedad.

Ejemplo comparativo No. 1

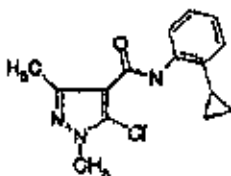
Se compara la actividad fungicida de los compuestos donde "Het" es pirazol. La actividad del compuesto número 2.36 de la presente invención (tabla 2, páginas 6-9 de la descripción) y el compuesto A ([2-(2-etil-ciclopropil)-fenil] amida del ácido 5-cloro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico, incluido en la presente invención), es comparado con la actividad del compuesto número 10.50 de D1. Como se muestra en las siguientes fórmulas estructurales, la única diferencia entre la presente invención y los compuestos del arte previo es la presencia de un sustituyente en el anillo orto-ciclopropilo.



Compuesto 2.36 de la presente invención



Compuesto A de la presente invención



Compuesto 10.50 de D1

CASTELLANOS & CO.

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

El Método de medida de acción contra *Puccinia recondita* (roya marrón) en trigo fue el siguiente: se colocaron segmentos de hoja de trigo (cv Kanzler) sobre agar en placas multipocillo (formato de 24-pocillos) y se trataron con los compuestos a ensayar formulados (2% Dimetilsulfóxido, 0,025% Tween 20) mediante rociado (Spray). Los compuestos se ensayaron a una variedad de niveles de aplicación, dichos niveles se muestran en partes por millón (ppm) en la tabla. Después del secado, los discos de hojas se inocularon con una suspensión de esporas del hongo (45.000 conidios/ml). Después de un período de incubación de 8 días a 19°C y 75-90% de humedad relativa la incidencia de enfermedad se evaluó como porcentaje de enfermedad con respecto al control (0= sin control de *Puccinia recondita*, valores de 80% a 90% significan de buen a muy buen grado de control, 100%= control completo).

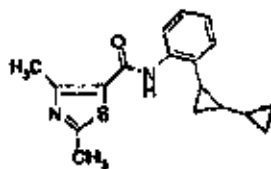
Los resultados obtenidos fueron los siguientes:

Compuesto No.	ppm			
	200	60	20	6
2.36 (presente invención)	100	100	100	100
A (presente invención)	100	100	100	100
10.50 (arte previo)	100	100	0	0

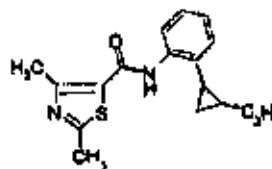
Este ejemplo muestra la actividad fungicida superior de ambos compuestos de acuerdo a la reivindicación 1. En efecto, se demuestra que el compuesto 2.36 y el compuesto A son efectivos para el control de *Puccinia Recondita* a niveles de aplicación de 20 ppm y 6 ppm, mientras que el compuesto número 10.50 de acuerdo a D1 es totalmente inefectivo a dichas concentraciones.

Ejemplo comparativo No. 2

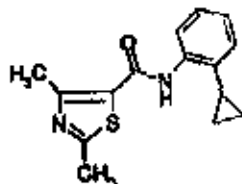
Se compara la actividad de los compuestos donde "Het" es tiazol. La actividad de los compuestos 4.20 y 4.1 de acuerdo a la presente invención (ver la tabla 4, páginas 10-12 de la descripción) se compara con la actividad del compuesto número 9.50 de D1. La característica estructural distintiva entre los compuestos de la invención y el compuesto del arte previo es la presencia de un sustituyente en el anillo orto ciclopropilo.



Compuesto 4.20 de
la presente invención



Compuesto 4.1 de
la presente invención



Compuesto 9.50 de D1

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

El Método de medida de acción contra *Puccinia recondita* (roya marrón) en trigo fue el explicado en el Ejemplo comparativo No. 1.

Los resultados obtenidos fueron los siguientes:

Compuesto No.	ppm			
	200	60	20	6
4.20 (presente invención)	100	100	100	100
4.1 (presente invención)	100	100	100	20
9.50 (arte previo)	100	80	0	0

Este ejemplo también muestra que la actividad fungicida superior de los compuestos de la presente invención. En efecto, los compuestos 4.20 y 4.1 son capaces de controlar *Puccinia Recondita* a un nivel de aplicación de 20 ppm, mientras que el compuesto 9.50 de acuerdo a D1 es totalmente inefectivo a esta concentración.

Concluyendo, si el sustituyente del grupo ciclopropilo de los compuestos de la presente invención es reemplazado por hidrógeno (como en D1) la actividad fungicida del compuesto es reducida drásticamente. La información biológica comparativa proporcionada muestra que sorprendente e inesperadamente la presencia de un anillo ciclopropilo sustituido lleva a una actividad sustancialmente mejorada.

Por otra parte, dado que las nuevas reivindicaciones 2 a 5 dependen de la reivindicación novedosa e inventiva 1, estas reivindicaciones también son novedosas e inventivas.

De modo similar, dado que la reivindicación 7 está dirigida a un intermediario nuevo para su uso en la preparación de un compuesto de la reivindicación novedosa e inventiva 1, este intermediario no puede considerarse obvio en base al arte previo. La reivindicación 8 tampoco es obvia dado que el arte previo no divulga una composición conteniendo los compuestos nuevos e inventivos de la reivindicación 1.

En conclusión, solicito a su Despacho conceder el privilegio de patente a la presente invención toda vez que las objeciones planteadas por su Despacho han sido claramente superadas.

De la Señora Jefe,


Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. 39.779.654 de Usaquén

T.P.A. No. 70819 del C. Sup. de la Judicatura

Calle 94 A No. 7 A - 09

Teléfonos: 610 74 20

Bogotá, D.C., 28 OCT. 2008

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Dirección: Schwarzwaldallee 245,
CH-4058 Basilea
Suiza

Domicilio: CH-4058 Basilea
Suiza

Lugar de Constitución: Suiza

Teléfono:
E-mail:

Fax:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual _____

Número _____

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección: Calle 94 A No. 7 A-09

Teléfono: 610 7420 Fax: 610 0706

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual TPA 70.819

Número 39'779.654

④

Número de Expediente:

04.086.944

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo capítulo reivindicatorio sobre el cual solicito que se realice el examen de patentabilidad.

⑥

Comprobante de pago No.

08-84.301

Fecha

24 de octubre de 2008

⑦

Anexos:

☒ Comprobante de pago de la tasa.

☐ Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.

☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

☒ Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS A.

FIRMA


CC 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 OSJ

1108
138

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 04-086944-00006-0000

COPIA PARA EL REGISTRO DE LA OFICINA DE REGISTRO DE MARCAS Y LEMAS
DE LA PATENTE DE MARCAS Y LEMAS
CALLE 144 BARRIO SAN JUAN DE LOS RIOS - BOGOTA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - B4,301
FECHA : OCTUBRE 24 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PASO	BANCO	CUENTA	No. PASO	FECHA PGO	Vr. PASO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	01245452	23/10/2008	6,212,900.00

***** CONCEPTO *****

CANT. REENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MOALIZAS Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	103,000.00
	TOTAL :	\$ 103,000.00

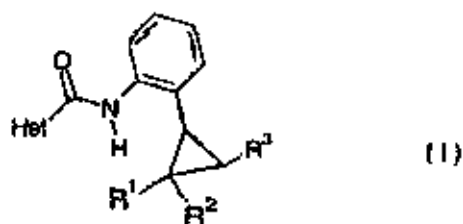
SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



Het es pirrolilo, pirazolilo o tiazolilo, estando cada uno sustituido con grupos R^4 , R^5 y R^6 ;

R^1 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

R^2 es hidrógeno, flúor, cloro o bromo;

R^3 es alquilo C_{2-12} opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; alqueno C_{2-12} opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; alquino C_{2-12} opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; cicloalquilo C_{3-12} opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; fenilo opcionalmente sustituido, en donde, cuando

presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxil, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; o heterociclilo opcionalmente sustituido; en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxil, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , y $HC(OR')=N$; R' y R'' son, independientemente, hidrógeno o alquilo C_{1-4} ; y R^4 , R^5 y R^6 se seleccionan, de manera independiente, entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , alcoxi(C_{1-4}) alquilo(C_{1-4}) y haloalcoxi(C_{1-4}) alquilo(C_{1-4}), siempre que por lo menos uno de R^4 , R^5 y R^6 no sea hidrógeno; y halo es flúor, cloro o bromo.

2. Un compuesto de fórmula (I) según se reivindica en la reivindicación 1, donde R^1 es hidrógeno o flúor.

3. Un compuesto de fórmula (I) según se reivindica en la reivindicación 1, ó 2, donde R^2 es hidrógeno o flúor.

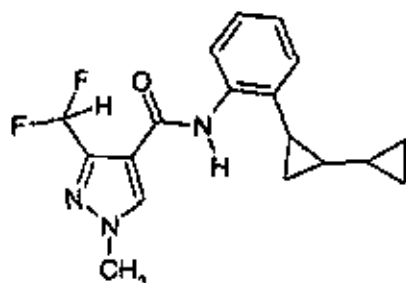
4. Un compuesto de fórmula (I) según se reivindica en la reivindicación 1, 2, ó 3, donde R^3 es alquilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-8} opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxil, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; fenilo opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxil, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , $HC(OR')=N$ y $R'R''NN=C(H)$; tienilo opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente

14

opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , y $HC(OR'')=N$; o furilo opcionalmente sustituido, en donde, cuando presente, cada sustituyente opcional es seleccionado independientemente de flúor, cloro, bromo, hidroxilo, ciano, alcoxi C_{1-4} , $C=O$, formilo, nitro, alcoxi C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , alquiltio C_{1-4} , haloalquiltio C_{1-4} , y $HC(OR'')=N$; R' y R'' son, independientemente, hidrógeno o alquilo C_{1-4} .

5. Un compuesto de fórmula (I) según se reivindica en la reivindicación 1, 2, 3, ó 4, donde R^4 , R^5 y R^6 se seleccionan, de manera independiente, entre hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} y alcoxi(C_{1-4}) alquilo(C_{1-4}); siempre que por lo menos uno de R^4 , R^5 y R^6 no sea hidrógeno.

6. El compuesto (2-biciclopropil-2-il-fenil) amida del ácido 3-difluoro metil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico que tiene la fórmula:



7. Un compuesto de fórmula (II):



14

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C., 2009-12-11

Abogada

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

(Apoderada)

Solicitante: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

ASUNTO

Radicación 04-86944

Trámite 011

Evento 379

Actuación 430

Oficio - - 140

Folios 004

Patente de Invención



Patente de Modelo de Utilidad



Vía Nacional



Vía PCT (fase nacional)



Cap. I



Cap. II



No. Sol. Internacional

PCT/IB03/00687

Fecha de Presentación Interna.

2003-02-21

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 le comunica:

1. Modificaciones no aceptadas

No se acepta el nuevo capítulo reivindicatorio porque en él se ha introducido materia que no se había divulgado en la solicitud tal como originalmente fue aceptada. Los significados originales del sustituyente R3 en la fórmula I eran: alquilo C2-12 opcionalmente sustituido, alquenilo C2-12 opcionalmente sustituido, alquinilo C2-12 opcionalmente sustituido, cicloalquilo C3-12 opcionalmente sustituido, fenilo opcionalmente sustituido o heterocíclico opcionalmente sustituido. En el capítulo reivindicatorio allegado mediante oficio de 2008-10-28 los sustituyentes de R3 son radicales o grupos que no se mencionan de ninguna manera en el primer capítulo reivindicatorio ni en el capítulo descriptivo, como por ejemplo el grupo nitro, los grupos $(HC(OR')=N, R'R''NN=C(H),$ ciano, etc. Tales sustituciones constituyen una ampliación de la materia a proteger porque no se habían divulgado previamente.

2. Documentos estudiados

Descripción: folios 51 a 92 (como se radicó inicialmente)

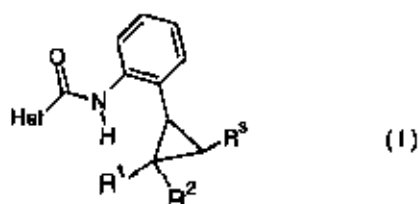
Reivindicaciones (10): folios 93 a 95 (como se radicó inicialmente)

Prioridad: Reino Unido 0205127.4 de 2002-03-05 y 0300705.1 de 2003-01-13

3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: O-Ciclopropil-carboxanilidas y su uso como fungicidas

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en: un compuesto de fórmula (I)



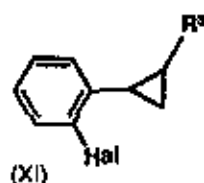
Het es un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene uno a tres heteroátomos, en donde cada uno se selecciona de manera independiente entre oxígeno, nitrógeno y azufre; el anillo está sustituido con grupos R4, R5 y R6; R1 es hidrógeno o halo (sic); R2 es hidrógeno o halo (sic); R3 es alquilo C2-12 opcionalmente sustituido, alquenilo C2-12 opcionalmente sustituido, alquínilo C2-12 opcionalmente sustituido, cicloalquilo C3-12 opcionalmente sustituido, fenilo opcionalmente sustituido o heterocíclico opcionalmente sustituido; y R4, R5 y R6 se seleccionan de manera independiente entre hidrógeno, halo (sic), ciano, nitro, alquilo C1-4, haloalquilo C1-4, alcoxi C1-4 alquilo (C1-4) y haloalcoxiC1-4alquilo(1-4), siempre que por lo menos uno de R4, R5 y R6 no sea hidrógeno.

Reivindicación 7: Un compuesto de fórmula (II):

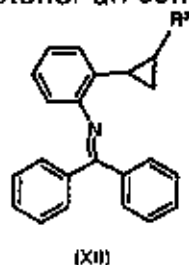


Donde R3 se define según lo expuesto en la reivindicación 1

Reivindicación 8: un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (II) que comprende una etapa de uso de un sistema Pd(II)catalizador-ligando, donde el ligando se selecciona de una fosfina adecuada "estéricamente demandante", para hacer reaccionar un compuesto de fórmula (XI)



Con benzofenona imina, en forma opcional, en presencia de una base, a fin de obtener un compuesto de fórmula (XII)



Donde Hal es bromo o yodo; y R3 tiene el significado ya expuesto.

El problema planteado en esta solicitud es el uso del compuesto reivindicado para prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos.

La invención se catalogó como A61K31/165, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

4. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Debido a que no se aceptaron las modificaciones presentadas por la solicitante en el capítulo reivindicatorio, se mantienen las mismas objeciones que para el primer

requerimiento hecho por esta oficina, a saber: la cantidad de sustituyentes es especulativa ya que no están enteramente sustentados mediante ejemplos en la descripción. Por ejemplo, el sustituyente Het puede ser un anillo heterocíclico con uno a tres heteroátomos cada uno seleccionado de manera independiente entre oxígeno, nitrógeno y azufre. Tal reivindicación es demasiado amplia y resulta especulativa al no haberse ensayado toda esa cantidad de posibilidades, menos con la cantidad de sustituyentes R4, R5 y R6. Así mismo, los sustituyentes que son restos de hidrocarburos con hasta 12 átomos de carbono son demasiados para la relativamente poca cantidad de ejemplos que demuestran la actividad.

El método de la reivindicación 10 no comprende etapas ni pasos ni una sucesión lógica de actividades para obtener algún producto sino tan solo el uso de destino final del compuesto (I).

Debido a que en castellano la palabra "halo" (sin anteponerla a otro nombre químico, sola, no como prefijo) significa círculo de luz difusa en torno de un cuerpo luminoso, debe especificarse que se trata de halógeno para que no quede lugar a confusión alguna.

5. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Debido a que no se aceptaron las modificaciones presentadas por la solicitante en el capítulo reivindicatorio, se mantienen las mismas objeciones que para el primer requerimiento hecho por esta oficina, a saber: El proceso de la reivindicación 8 para preparar el compuesto de fórmula (II) no guarda unidad de invención con el compuesto con fórmula (I) de las reivindicaciones 1 a 6. Mientras que el compuesto de fórmula (II) es un compuesto intermedio en la preparación del compuesto de fórmula (I) y tienen unidad de invención, el proceso para preparar el compuesto intermedio de fórmula (II) ya no tiene unidad de invención con el compuesto (I) porque éste es precisamente el objeto de la solicitud y el proceso no necesariamente conduce al dicho compuesto (I).

6. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha tomada en cuenta para determinar el estado de la técnica es 2002-03-05 que corresponde a la fecha de prioridad.

Tomando en cuenta la fecha para determinar el estado de la técnica se citan los siguientes documentos sólo en relación con los compuestos, ya que no se tomó en consideración el método de preparación del compuesto (I):

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US 5,330,995	Anilide derivatives and their use for combating botrytis	1994-07-19
D2	JP 2129171	Pyrazolecarboxanilida derivative and agent for controlling harmful life	1990-05-17
D3	WO 0153259	Pyrrrolecarboxamides	2001-07-26

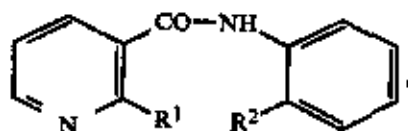
7. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Nivel inventivo (artículo 18 D486)

El nivel inventivo de los objetos reivindicados se ve afectado porque en todos los documentos citados del estado de la técnica se sugiere usar compuestos del mismo tipo que los compuestos de fórmula (I) en calidad de plaguicidas, más específicamente fungicidas, con diferencias insignificantes que habrían sido

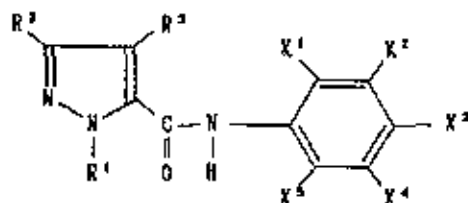
derivadas de manera evidente por parte de un técnico medianamente versado en la materia. Incluso, los compuestos que quedaron por fuera del alcance de la protección solicitada debido a la modificación hecha por la solicitante muestran una actividad similar a la de los compuestos reivindicados.

En D1 se habían divulgado compuestos de fórmula



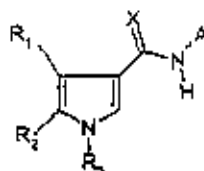
Cuando R² es cicloalquilo, es decir un ciclopropilo, el compuesto es muy similar a los compuestos ensayados por la solicitante y presenta una actividad similar a éstos.

En D2 ya se habían divulgado compuestos de la fórmula



en la cual los sustituyentes pueden adoptar significados muy cercanos a los que tiene el compuesto reivindicado en la presente solicitud en estudio; aquí también los compuestos tienen actividad similar a los reivindicados.

En D3 se habían divulgado compuestos de la fórmula



Donde A es un arilo ortosustituido (posiblemente por ciclopropilo) y X es oxígeno. De esa manera, coincide con los compuestos divulgados en la presente solicitud en estudio que presentan actividad similar, pero que fueron excluidos por la solicitante en su modificación al capítulo reivindicatorio. No obstante, los compuestos reivindicados se derivan de manera evidente del estado de la técnica porque tanto su estructura principal como todos sus posibles sustituyentes se sugieren en cada uno de los documentos citados.

8. Respuesta de la solicitante

Los datos allegados por el solicitante para demostrar altura inventiva son el resultado de un solo ensayo para cada uno de dos tipos de compuesto en el que se ha modificado el sustituyente en el ciclopropilo pero no puede afirmarse que dicho resultado puede extrapolarse a todos los compuestos reivindicados, más aún cuando no se ha definido claramente la materia que se desea proteger. Por otra parte, el hecho que la actividad biológica se presente también a bajas concentraciones, de 20 y 6 ppm, ni siquiera estaba contemplado como un objetivo de la invención o problema técnico a resolver por la invención en estudio. En la descripción de la solicitud en estudio se afirma simplemente que los compuestos reivindicados muestran "fuerte eficacia" sin relacionarla de ninguna manera con la concentración, como uno de sus ventajas. Por lo tanto, las pruebas ahora allegadas apuntan a un

problema técnico distinto del que se había propuesto originalmente en la solicitud. Este cambio de problema técnico podría considerarse como un giro inesperado en la solicitud y para poder reconocer los resultados de las pruebas como válidas, dichas pruebas tendrían que realizarse por parte de una tercera parte, un organismo independiente, como por ejemplo un laboratorio debidamente reconocido y acreditado.

9. Conclusión:

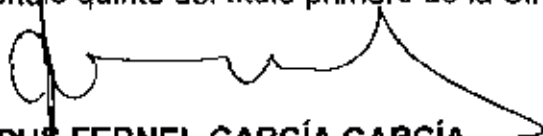
Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	US 5,330,995	1 a 10	Novedad y nivel inventivo
D2	JP 2129171	1 a 10	Novedad y nivel inventivo
D3	WO 0153259	1 a 10	Novedad y nivel inventivo

10. Notificación

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 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.

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 N° 10 de 2001.


JESUS FERNEL GARCÍA GARCÍA
Director Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
18 ENE 2010

CONCEPTO TÉCNICO No. 4413	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202043
-------------------------------------	--