

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO	
RAD: 12-131428- -4	FECHA: 2013-12-13 17:33:22
DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES	EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I
TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II	FOLIOS: 12
ACT: 519 PRESENTACION	

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado(a)/Señor(a)
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

Asunto: Radicación: 12-131428- -4
Trámite: 11
Evento: 378
Actuación: 519
Oficio: 23101
Folios: 12

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/US211/020351				
Fecha de Presentación Internacional	06/01/2011				

1. Documentos estudiados

Descripción:	Rad. N° 12-131428--00000-0000	3/Agosto/2009
Reivindicaciones:	Rad. N° 12-131428--00000-0000	3/Agosto/2009
Prioridad:	US 61/293,014	7/Enero/2011

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 capítulo 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: “Tiazolo 5,4-D Pirimidinas Y Su Uso Como Agroquímicos”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de nuevos compuestos agroquímicos con actividad superior a los ya conocidos en el estado de la técnica.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona nuevos compuestos del tipo tiazolo[5,4-d]pirimidinas como agroquímicos.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A 01 N 043/090.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literales (c) y (d))

Artículo 20.- No serán patentables:

c) las plantas, los animales y los procedimientos esencialmente biológicos para la producción de plantas o animales que no sean procedimientos no biológicos o microbiológicos;

d) los métodos terapéuticos o quirúrgicos para el tratamiento humano o animal, así como los métodos de diagnóstico aplicados a los seres humanos o a animales.

El objeto de las reivindicaciones 18 y 19 no son patentables de acuerdo con los Art citados, por cuanto están referidas a:

- Reivindicación 18: Una “semilla” tratada con un compuesto de la reivindicación 1.
- Reivindicación 19: Un tratamiento a un animal con un compuesto de la reivindicación 1.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

La reivindicación 15 se refiere a un proceso para el control de plagas, que comprende aplicar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 a un área donde se desea el control de parásitos; Es evidente que la llamada etapa de “*que comprende aplicar*” corresponde a la forma de usar un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, aunque en su preámbulo se reclame como proceso. Se le aclara al solicitante que un proceso cuya única etapa corresponde a una aplicación, dicha aplicación es un uso. Por lo tanto dicho proceso de la Reivindicación 15 no es patentable de acuerdo con el artículo 14.

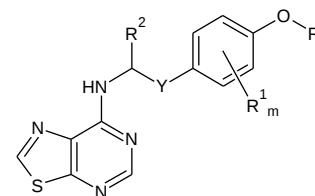
6. De la solicitud de patente

Titulo

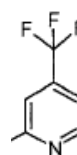
El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque hace referencia al uso del compuesto, por lo cual se sugiere al solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

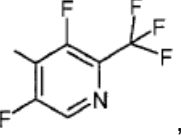
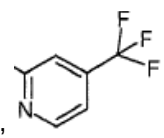
Las reivindicaciones 1 y 20, son muy amplias y no son concisas, puesto que presenta diferente posibilidad de compuestos a partir de un sin número de radicales, según lo presentado en el capítulo descriptivo, lo que tiene sustento es:

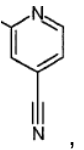
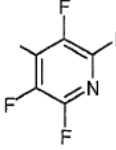
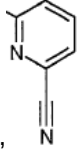
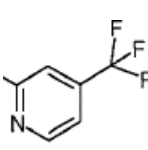
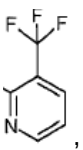
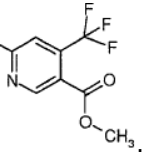
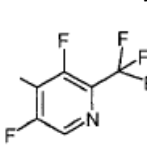
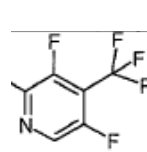
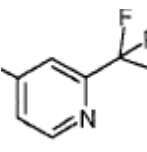
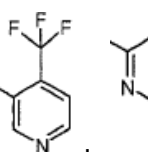
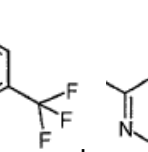
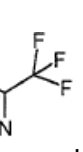
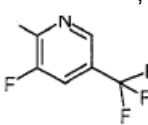


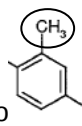
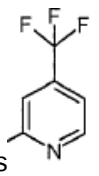
En el caso de la reivindicación 1: Compuesto de Formula (I) donde:

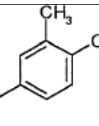
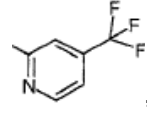
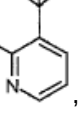
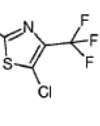
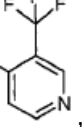
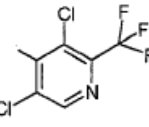
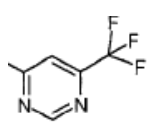


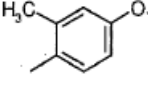
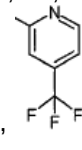
1. Cuando m: 0, Y: Enlace Directo C-C y R²: -CH₃ → R es CH₃, H, (Compuestos Ej. 1, 34 y 35).

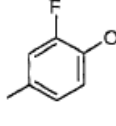
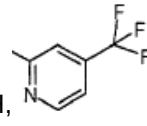
2. Cuando $m: 0$, $Y: -CH_2-$ y $R^2: -CH_3 \rightarrow R$ es  , H,  (Compuestos Ej. 14, 15 y 18).

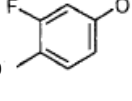
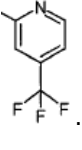
3. Cuando $m: 0$, $Y: -CH_2-$ y $R^2: -H \rightarrow R$ es  , H,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  . (Compuestos Ej. 2, 3, 5-8, 16, 33, 36, 40, 43, 50, 52 y 61).

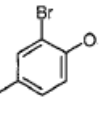
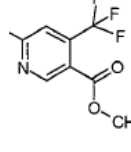
4. Cuando $m: 1$, $R^1: -CH_3$ ubicado en el fenilo  , $Y: -CH_2O-$ y $R^2: -H \rightarrow R$ es  , H.
5. Cuando $m: 1$, $Y: -CH_2-$ y $R^2: -H$, R^1 está definido entre las siguientes categorías:

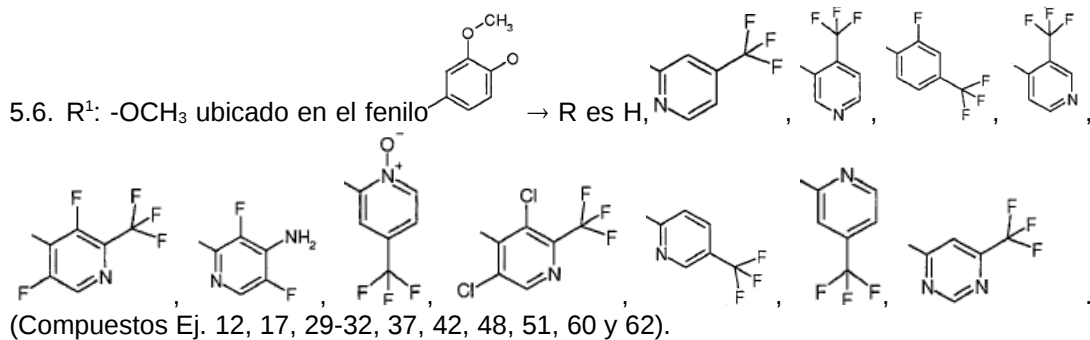
- 5.1. $R^1: -CH_3$ ubicado en el fenilo  $\rightarrow R$ es $-CH_3$, H,  ,  ,  ,  ,  ,  . (Compuestos Ej. 19, 20, 23, 24, 46-47, 49, 53 y 54).

- 5.2. $R^1: -CH_3$ ubicado en el fenilo  $\rightarrow R$ es $-CH_3$, H,  (Compuestos Ej. 56, 57 y 59).

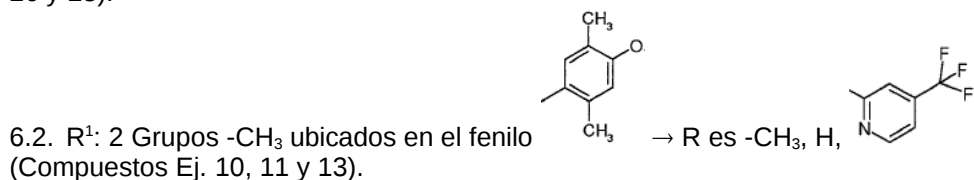
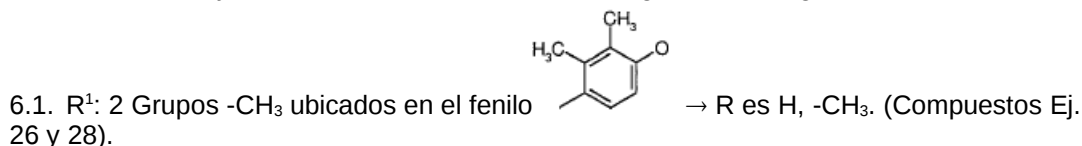
- 5.3. $R^1: -F$ ubicado en el fenilo  $\rightarrow R$ es $-CH_3$, H,  . (Compuestos Ej. 38, 39 y 41).

- 5.4. $R^1: -F$ ubicado en el fenilo  $\rightarrow R$ es $-CH_3$, H,  . (Compuestos Ej. 55, 58 y 63).

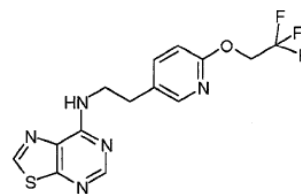
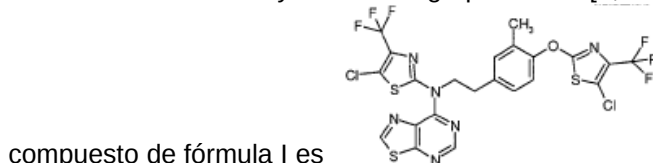
- 5.5. $R^1: -Br$ ubicado en el fenilo  $\rightarrow R$ es $-CH_3$, H,  . (Compuestos Ej. 21, 25 y 27).



6. Cuando m: 2, Y: -CH₂- y R²: -H, R¹ está definido entre las siguientes categorías:



7. Cuando la amina adyacente al grupo tiazolo[5,4-d]pirimidina no está sustituido por H, el



En el caso de la reivindicación 20: Compuesto de Fórmula (Compuestos Ej. 4).

Ahora bien los ejemplos son de carácter ilustrativo y no limitativo, asumir que todas las posibilidades de compuestos que desea reivindicar presentan una actividad similar o mejorada sin comprobarlos, sería una afirmación de carácter especulativo, esto se ve reflejado en los Ensayos Realizados, donde no todos los compuestos presentan una actividad contra las enfermedades causadas por hongos, los cuales se pueden observar en la tabla 3, en donde claramente, solo los compuestos 7 a 9, 13, 18, 23-24, 27, 33, 35-37, 40-43, 46, 52-53, 59, 61 y 62 presentan una efectividad superior al 80% en contra todos los hongos ensayados (PSPECU/ PUCCRT/ PYRIOR/ SEPTTR) y en la tabla 4 donde solo los compuestos 2, 4 y 43 muestran 100% de mortalidad contra *Caenorhabditis elegans*.

De esta manera se requiere al solicitante que modifique las reivindicaciones 1 y 20, y sus respectivas dependientes a lo realmente sustentado en la capítulo descriptivo.

El término “por lo menos” (Reiv. 16, 17) es impreciso, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica. Se sugiere sustituirlo por un término preciso o un rango concreto.

Dentro del Capítulo reivindicatorio, se observa que se hace referencia a sustituyentes que se encuentran definidos de manera correcta en la descripción, así entonces se requiere que defina de manera precisa los sustituyentes que son, puesto que la definición de los mismos, como se observa en la descripción no es precisa, por lo cual no permite distinguir la invención del estado de la técnica.

Descripción (Art 28 D 486)

La descripción no es clara porque la información que contiene no permite que el la persona del oficio normalmente versada en la materia pueda comprender el problema técnico y la solución aportada por la invención. Puesto que los compuestos 53 y 54 son los mismos, pero presentan diferente actividad según la tabla 3 de la descripción. Esto genera confusión y no se sabe en realidad acerca de la veracidad de los resultados, se requiere entonces al solicitante que realice las modificaciones pertinentes.

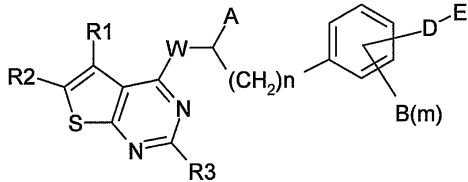
7. Determinación del Estado de la Técnica

El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de la cual se invoca prioridad, es decir, el 7 de Enero de 2011. Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontró el siguiente documento que anticipa el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	Inoue et al. (Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 1958, 6, pp. 352-355).	Studies on Pyrimidine Derivatives. VI. Synthesis of Thiazolo [5, 4-d] pyrimidines and Related Compounds. (6).	1958
D2	WO2007046809	THIENO-PYRIMIDINE COMPOUNDS HAVING FUNGICIDAL ACTIVITY	26/Abril/2007

El documento D1¹ divulga la síntesis de compuestos derivados de pirimidina más específicamente la síntesis de tiazolo[5,4-d]pirimidina (Ver Documento entero).

El documento D2² divulga compuestos del tipo tieno[2,3-d]pirimidinas de fórmula (I)



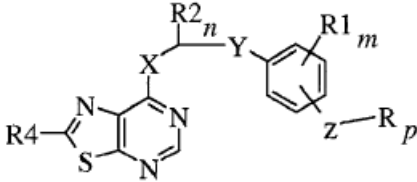
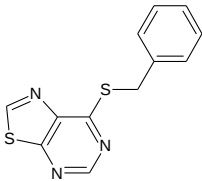
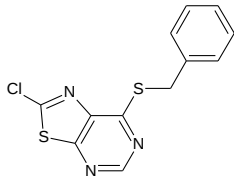
que tienen actividad fungicida (Ver Abstract)

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en *un compuesto de fórmula I-A...* (Pág. 159 Rad. N° 12-131428--00000-0000).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D1	
Un compuesto de fórmula (I-A): 	 Compuesto XIII [Pág. 355]	 Compuesto XV [Pág. 355]
R es H, un alquilo inferior, fenilo, N-óxido de piridina, o un heterociclo que comprende un solo anillo de 5 ó 6 miembros, en donde alquilo inferior, fenilo, N-óxido de piridina, o heterociclo de un solo anillo de 5 ó 6 miembros se sustituyen opcionalmente con halo, alquilo inferior, alcoxi inferior, benciloxi, alquenilo inferior, alquinilo inferior, haloalquilo, haloalcoxi, NO ₂ , CN, alcocarbonilo inferior, alcanoílo inferior, alquilo inferior-SO _q , y aldoximas y alquioximas inferiores sustituidas opcionalmente en oxígeno por alquilo inferior	H	H

1 Ver Documento Anexo D1
 2http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=WO&NR=2007046809A1&KC=A1&FT=D&ND=4&date=20070426&DB=EPODOC&locale=en_EP

Z es H, un enlace simple C-C, CH ₂ , NH, O, S, CH ₂ O, OCH ₂ , CH ₂ CH ₂ O, u OCH ₂ CH ₂	enlace simple C-C	enlace simple C-C
m es 4;	4	4
p es 0 ó 1;	0	0
q es un número entero de 0 a 2;	0	0
R ¹ es independientemente H, halo, alquilo inferior, alquenilo inferior, alquinilo inferior, hidroxi , alcoxi inferior, haloalquilo, haloalcoxi, NO ₂ , CN, alcanoílo inferior, alcoxycarbonilo inferior, mercapto, alquiltio inferior, aldoximas y alquioximas inferiores sustituidas opcionalmente en oxígeno por un alquilo inferior;	H	H
Y es un enlace simple C-C, C(R ⁵ _n)O o C(R ⁵ _n);	enlace simple C-C	enlace simple C-C
n es 2;	2	2
R ² son independientemente H o alquilo inferior;	H	H
R ⁴ es H, halógeno, alquilo inferior, alcoxi inferior o haloalquilo inferior;	H	Cl
X es NR ³ , O, y S, donde R ³ se selecciona de H, alquilo inferior, alcanoílo inferior, alcoxycarbonilo inferior, hidroxi, alcoxi inferior, alquilo inferior-SO _q , fenilo-SO _q o fenilo-SO _q sustituido.	S	S

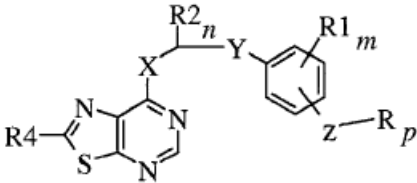
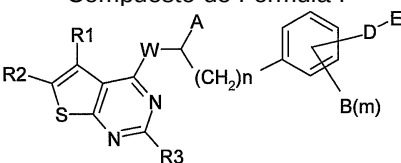
De acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 1 con la anterioridad D1, se concluye que el producto de fórmula I-A descrito en la reivindicación 1, ya era conocido en el estado de la técnica como se evidencia con la anterioridad encontrada. Por lo tanto la reivindicación 1 esta reivindicación no es nueva.

Las reivindicaciones dependientes 7 y 8 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Nivel inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en *un compuesto de fórmula I-A...* (Pág. 159 Rad. N° 12-131428--00000-0000).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

Características esenciales	D2
Un compuesto de fórmula (I-A): 	Compuesto de Fórmula I 
R es H, un alquilo inferior, fenilo, N-óxido de piridina, o un heterociclo que comprende un solo anillo de 5 ó 6 miembros, en donde alquilo inferior, fenilo, N-óxido de piridina, o heterociclo de un solo anillo de 5 ó 6 miembros se sustituyen opcionalmente con halo, alquilo inferior, alcoxi inferior, benciloxi, alquenilo inferior, alquinilo inferior, haloalquilo, haloalcoxi, NO ₂ , CN, alcoxycarbonilo inferior, alcanoílo inferior, alquilo inferior-SO _q , y aldoximas y alquioximas inferiores sustituidas opcionalmente en oxígeno por alquilo inferior	E: (-C(O) _p -R' p: 0 o 1 R': fenilo, furanilo, piridinilo, N-óxido de piridina, pirimidina, piridazina, entre otros.
Z es H, un enlace simple C-C, CH ₂ , NH, O, S, CH ₂ O, OCH ₂ , CH ₂ CH ₂ O, u OCH ₂ CH ₂	D: O, NH o S
m es 4;	m: 0 a 4
p es 0 ó 1;	1
R ¹ es independientemente H, halo, alquilo inferior, alquenilo inferior, alquinilo inferior, hidroxi , alcoxi inferior, haloalquilo, haloalcoxi, NO ₂ , CN, alcanoílo inferior, alcoxycarbonilo inferior, mercapto, alquiltio inferior, aldoximas y alquioximas inferiores sustituidas opcionalmente en oxígeno por un alquilo inferior;	B: Halógeno, alquilo, haloalquilo y haloalcoxi.
Y es un enlace simple C-C, C(R ⁵ _n)O o C(R ⁵ _n);	-(CH ₂) _n -
n es 2;	n: 0 a 3
R ² son independientemente H o alquilo inferior;	A: H o Alquilo
R ⁴ es H, halógeno, alquilo inferior, alcoxi inferior o haloalquilo inferior;	R2:

R ⁵ son independientemente H o alquilo inferior; y	H
X es NR ³ , O, y S, donde R ³ se selecciona de H, alquilo inferior, alcanóilo inferior, alcóxicarbonilo inferior, hidroxí, alcoxi inferior, alquilo inferior-SO _q , fenilo-SO _q o fenilo-SO _q sustituido.	W: NH o O

El documento D2 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un compuesto de Fórmula (I) donde los sustituyentes significan como se observa en la tabla anterior.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el compuesto de D2 consiste en que el anillo que se encuentra fusionado con la pirimidina es un tiofeno mientras que para la presente invención es 1,3-Tiazol.

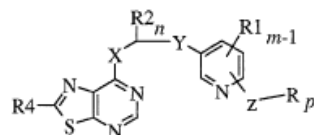
No existe evidencia que las diferencias estructurales entre el compuesto de D2 y el compuesto de la reivindicación 1 introduzcan un efecto técnico inesperado, que represente para la persona de nivel medio versada en la materia una mejor eficiencia como agente agroquímico.

Hay casos en compuestos donde se presenta bioisosterismo, que es el efecto q se presenta entre grupos o sustituyentes que tienen similitudes físicas o químicas que produce en general similar propiedades biológicas (*Silverman B. Richard (2004). The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action. p 29. Elsevier Academic Press*), para este caso en el estado del arte se encontró que anillos aromáticos el grupo –N= mimetiza muy bien el comportamiento de un grupo –CH= y viceversa (*Galvis P. Juan A. (2004). Panorama actual de la química farmacéutica. p 281 – 282. Universidad de Sevilla*).

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: “cómo modificar estructuralmente el compuesto conocido en D2 para hacerlo más eficiente como compuesto agroquímico”.

En consecuencia, el experto en la materia, modificaría estructuralmente el tieno-pirimidina del compuesto de D2, sustituyendo el tiofeno por un grupo tiazol para tener un compuesto núcleo estructural del tipo tiazolo 5,4-D pirimidina y de esta manera llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Puesto que las reivindicaciones 2 a 19 no mencionan características adicionales que hagan inventiva la invención tampoco puede considerarse que presenten nivel inventivo.



La reivindicación 20 que enseña un compuesto de fórmula (I-B) también carece de nivel inventivo en vista de D2, puesto que sería evidente para una persona versada en la materia modificar el grupo fenilo en el compuesto de formula I conocido en D2 por una piridina, ya que por bioisosterismo la piridina mimetiza muy bien el comportamiento de un grupo fenilo³. Por lo cual se considera obvia.

9. Conclusión

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Inoue et al. (Chemical & Pharmaceutical Bulletin, 1958, 6, pp. 352-355).	1, 7 y 8	Novedad
D2	WO2007046809	1-20	Nivel inventivo

³ Silverman B. Richard (2004). The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action. p 29. Elsevier Academic Press).Bioisosterism. Páginas 29 a 32.

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 del día siguiente 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 2013-12-17

Elaboró: Jhonattan Sanchez Sanchez
Revisó: Gloria Jacqueline Alfonso Rozo

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
CONSULTA DE DOCUMENTOS