

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALVARO CORREA ORDOÑEZ

ASUNTO	Radicación	06 77161
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	
	Folios	008

1 2 4 2 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/EP2005/00063 3	
Fecha de Presentación Internacional	22/Enero/2005	

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 69 a 204	04/Agosto/2006
Reivindicaciones:	Folios 205 a 231	04/Agosto/2006
	Folios 271 a 279	28/Diciembre/2010
Respuesta del solicitante:	Folios 266 a 270	28/Diciembre/2010
Prioridad:	DE 12004011006.9	6/Marzo/2004

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta 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

Título de la solicitud: “Derivados de N-(2-(hidroximetil)fenil)-1Hpirazol-4-carboxamida y compuestos emparentados como productos activos microbicidas para el empleo en la protección de las plantas y de los materiales”.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la infestación por microorganismos de plantas.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona nuevas carboxamidas, varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra los microorganismos indeseables".

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N 43/56.

4. De la Solicitud de Patente

Título

El título corresponde con el objeto de la solicitud.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

En la reivindicación 1 se presentan diversas funciones orgánicas a manera de significados para los radicales R₂,R₃,R₄,R₅, R₆ y R₇, estos radicales no se encuentran presentes en los compuestos de la fórmula (I), por lo que deberían omitirse en el capítulo reivindicatorio ya que le restan claridad y concisión al mismo. De otra parte, en los significados establecidos para los grupos M y A de los compuestos de fórmula (I), se ha establecido que A corresponde al grupo pirazol y M es un grupo fenilo; estas estructuras deberían estar representadas en los compuestos de fórmula (I) ya que corresponden a un solo grupo.

Los agentes para la lucha contra los microorganismos indeseables presentados en la reivindicación 3, corresponden a composiciones las cuales se caracterizan por los componentes que las constituyen y las proporciones en las que estos se encuentren.

El procedimiento para la obtención de agentes corresponde a una mezcla convencional de los componentes y no presentan características técnicas que lo diferencien de mezclas convencionales que se encuentren reportadas en el estado de la técnica.

5. Determinación del Estado de la Técnica

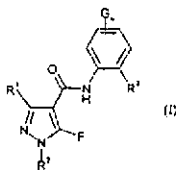
El estado de la técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: Marzo 6 de 2004, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO 03/010149 A1	Pyrazolylcarboxanilides as fungicides	06/Febrero/2003

D1
<http://patentscope.wipo.int/search/en/detail.jsf?docId=WO2003010149&recNum=1&tab=PCTDocuments&maxRec=1&office=&prevFilter=&sortOption=&queryString=wo%2F2003%2F010149>

D1 divulga (abstract) novedosas pirazolilcarboxanilidas de fórmula (I), varios métodos para la producción de dichos materiales y los usos de ellos en el

tratamiento de microorganismos indeseables. La invención también revela novedosos intermediarios y la producción de los mismos.



6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en: “Carboxamidas de la fórmula (I)” (Folio 205).

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Carboxamidas de la fórmula (I) (I)	Pirazolilcarboxanilidas de fórmula (I) (I)
A tiene el significado de la fórmula A1 (A1) R ¹² significa hidrógeno, alquilo, metoxi , etoxi R ¹⁴ significa hidrógeno, metil, etil, propil, isopropil haloalquilo, hidroxietilo, ciclopropilo. R ¹³ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo	El grupo pirazol se encuentra fijo en los compuestos de fórmula (I), se encuentra sustituido con flúor y también presenta los sustituyentes. R ¹ y R ² , donde R ¹ = H.alquilo, halógeno, alcoxi C ₁ -C ₄ , R ² = H, haloalquilo, alquilo C ₁ -C ₄ , cicloalquil C ₃ -C ₆ . Flúor se encuentra como un radical sustituyente fijo en el grupo pirazol.
R ¹ significa hidrógeno, alquilo C ₁ -C ₆ , alquilsulfinilo C ₁ -C ₄ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₄ , alcoxi C ₁ -C ₃ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , entre otros	El grupo amida se encuentra fijo en la estructura.
M significa fenilo R8 significa hidrógeno, flúor, cloro	El grupo fenilo se encuentra fijo en la estructura. G significa halógeno, alquilo.
L ¹ significa alquileno C ₁ a C ₁₀ (alcanodillo)	R ₃ significa alquilo C ₂ -C ₂₀ o cicloalquilo sustituido
Q significa O, S, SO,SO ₂ o NR ₉ L ² significa enlace directo SiR ₁₀ R ₁₁ o CO R significa alquilo C ₁ -C ₆ , alcoxi C ₁ -C ₆ ,alquiltio C ₁ a C ₃ , haloalquil C ₁ a C ₄ , cicloalquil C ₃ a C ₆	No divulga

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga los compuestos de fórmula (I), que presentan las siguientes características: el grupo pirazol se encuentra fijo en los compuestos de fórmula (I), se encuentra sustituido con flúor y también presenta los sustituyentes R^1 y R^2 , donde $R^1 = H, \text{alquilo, halógeno, alcoxi } C_1-C_4$, $R^2 = H, \text{haloalquilo, alquilo } C_1-C_4, \text{ cicloalquil } C_3-C_6$. Flúor se encuentra como un radical sustituyente fijo en el grupo pirazol. G significa halógeno, alquilo. R3 significa alquilo C_2-C_{20} o cicloalquilo sustituido. (páginas 1 a 2).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos definidos en D1 consiste en que el nitrógeno de la amida no se encuentra sustituido como si se presenta en los compuestos de la solicitud con la presencia del sustituyente R1.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en el radical sustituyente $-Q-L^2-R$.

Estos radicales no introducen ningún efecto técnico en los compuestos de la solicitud ya que la actividad que dichos compuestos presentan es microbicida al igual que los compuestos de D1.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular la así: "cómo obtener compuestos alternativos que contengan el radical R1 y $-Q-L^2-R$ para aumentar actividad microbicida".

Sin embargo, la presencia del radical sustituyente R1 o de $-Q-L^2-R$ en los compuestos de fórmula (I), no proporciona un efecto sorprendente ya que conservan la misma actividad microbicida divulgada en D1 y en la solicitud no se demuestra que dicha actividad sea superior con respecto a los compuestos de D1. Cabe resaltar que en los ejemplos no se presentan resultados de ensayos realizados con compuestos cuyo radical R1 tenga un significado diferente a hidrógeno.

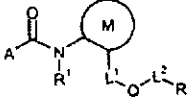
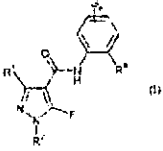
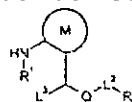
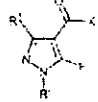
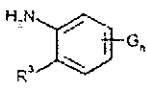
En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría los radicales R1 y $-Q-L^2-R$ para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Conclusión:

La reivindicación 1 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 2 consiste en: *"Un proceso para sintetizar las carboxamidas de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque a) se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II) con derivados de anilina de fórmula (III)..."*.

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Proceso para sintetizar las carboxamidas de fórmula (I)  (I)	Proceso para sintetizar pirazolilcarboxanilidas de fórmula (I)  (I)
a) Se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II)  (II) X¹ representa halógeno o hidroxilo Con derivados de anilina de la fórmula (III)  (III)	a) Se hacen reaccionar carboxamidas de fórmula (II)  (II) Con compuestos de fórmula (III)  (III)

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga un proceso de síntesis en el cual las carboxamidas de fórmula (II) reaccionan con compuestos de fórmula (III). (página 3, líneas 1 a 17).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 2 y el proceso de síntesis de la anterioridad D1 consiste en que los derivados de anilina de fórmula (III) de la solicitud presentan el radical -Q-L²-R donde Q significa O, S, SO, SO₂ o NR₉ L² significa enlace directo SiR₁₀R₁₁ o CO y R significa alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁ a C₃, haloalquil C₁ a C₄, cicloalquil. Mientras que los compuestos de fórmula (III) de D1 presentan los radicales sustituyentes Gn y R3; donde Gn significa halógeno, alquilo y R₃ significa alquilo C₂-C₂₀ o cicloalquilo sustituido.

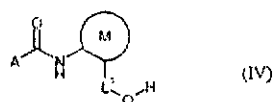
El hecho de que los compuestos de fórmula (III), que actúan como reactivos en el proceso de síntesis, presenten el radical -Q-L²-R no le confieren a la reacción de síntesis una mayor eficiencia o un efecto técnico sorprendente.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: "cómo obtener procesos de síntesis de compuestos de fórmula (I) a partir del derivado de anilina de fórmula (III) que contenga el radical -Q-L²-R".

Sin embargo, la presencia del radical sustituyente -Q-L²-R en los compuestos derivados de anilina de fórmula (III), no proporciona un efecto sorprendente en el proceso de síntesis y en la anterioridad D1 se divulga la reacción de carboxamidas de fórmula (II) con derivados de anilina de fórmula (III). Las carboxamidas contienen un átomo de halógeno por medio del cual se realiza la unión con el grupo amina del derivado de anilina para obtener los compuestos de fórmula (I). Este mecanismo de reacción es el mismo que se emplea para la obtención de los compuestos de fórmula (I) de la solicitud, lo cual representa una clara sugerencia para que una persona de nivel medio versada en la materia empleara el proceso de síntesis divulgado en D1.

En la reivindicación 2 también se presentan los procesos de síntesis (b) y (c) los cuales consisten en:

Proceso (b) se hacen reaccionar carboxanilidas de la fórmula (IV)

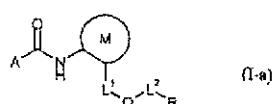


con un compuesto de la fórmula (V)



Donde Y significa halógeno, trifluormetilsulfonilo, metilsulfonilo o 4-metilfenilsulfonilo

Proceso (c) se hace reaccionar carboxamidas de la fórmula (I-a)



Con halogenuros de la fórmula (VI)



X² significa cloro, bromo o yodo

R¹-A significa alquilo C₁-C₈, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄.

Estos procesos consisten en una sustitución nucleofílica en la cual un halógeno es reemplazado por un grupo nucleófilo generalmente en un alcano, siguiendo la reacción general: $\text{Nu}^- + \text{CH}_3\text{X} \rightarrow \text{NuCH}_3 + \text{X}^-$

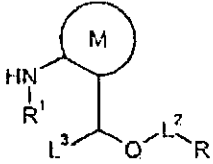
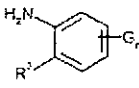
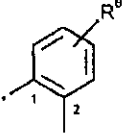
Esta es una reacción convencional de química orgánica que una persona de nivel medio versada en la materia emplearía para obtener los compuestos objeto de la solicitud.

Conclusión:

La reivindicación 2 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La reivindicación 5 consiste en: "*Derivados de anilina de la fórmula (III)*".

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Derivados de anilina de la fórmula (III)  (III)	Derivados de anilina de fórmula (III).  (III).
R ¹ significa hidrógeno, alquilo C ₁ -C ₆ , alquilsulfinilo C ₁ -C ₄ , alquilsulfonilo C ₁ -C ₄ , alcoxi C ₁ -C ₃ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , entre otros	El grupo amina se encuentra fijo en la estructura.
M significa fenilo 	El grupo fenilo se encuentra fijo en la estructura. G significa halógeno, alquilo.
L ³ significa hidrógeno o alquilo C ₁ -C ₉	R ₃ significa alquilo C ₂ -C ₂₀ o cicloalquilo sustituido
Q significa O, S, SO, SO ₂ o NR ₉ L ² significa enlace directo SiR ₁₀ R ₁₁ o CO R significa alquilo C ₁ -C ₆ , alcoxi C ₁ -C ₆ , alquiltio C ₁ a C ₃ , haloalquil C ₁ a C ₄ , cicloalquil C ₃ a C ₆	No divulga

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 5 porque divulga los compuestos derivados de anilina de fórmula (III), que presentan las siguientes características: El grupo amina se encuentra fijo en la estructura al igual que el grupo fenilo. G significa halógeno, alquilo. R3 significa alquilo C₂-C₂₀ o cicloalquilo sustituido. (páginas 1 a 2).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 5 y los compuestos definidos en D1 consiste en que el nitrógeno de la amida no se encuentra sustituido como si se presenta en los compuestos de la solicitud con la presencia del sustituyente R1. La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y los compuestos de D1 consiste en el radical sustituyente L³-Q-L²-R.

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular la así: “cómo obtener compuestos derivados de anilina de fórmula (III) que contengan los radicales R1 y L³-Q-L²-R “.

Sin embargo, la presencia del radical sustituyente R1 o de L³-Q-L²-R en los compuestos de fórmula (III), no proporciona un efecto sorprendente ya que estos compuestos se encontraban revelados en la anterioridad D1 y los compuestos que forman en el proceso de síntesis (compuestos de fórmula I) presentan la misma actividad microbicida que los compuestos revelados en D1.

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría los radicales R1 y -Q-L²-R para llegar así al objeto de la reivindicación 5 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

Para una persona de nivel medio versada en la materia es obvio derivar de manera evidente los compuestos de fórmula (III), a partir de las enseñanzas

presentadas en la anterioridad D1.

Conclusión:

La reivindicación 5 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumple con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

7. Conclusión

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

Item	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO 03/010149 A1	1 a 5	Nivel Inventivo

8. Respuesta a los argumentos del señor solicitante

El solicitante en su memorial de respuesta, presenta los cambios realizados al capítulo descriptivo, el cual fue aceptado por esta oficina.

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.

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.


JESÚS FERNEL GARCÍA

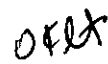
Director de Nuevas Creaciones (E)

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

18 JUL. 2012

Elaborado por Andrea Mojica

Revisado por Ana Delia Pinzón

Revisado por Gloria Jacqueline Alfonso 

Aprobado por Jesús Fernel García