

Doctor
José Luis Salazar
Director de División de Nuevas Crea
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA
E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-133430- -00006-0000

Fecha: 2014-09-17 16:35:44 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 17

Referencia: Expediente No. 13.133.430
Solicitud de Patente de Invención titulada: "N-
hetarilmetilpirazolilcarboxamidas"

Solicitante: Bayer Intellectual Property GmbH

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 26
DEL 1 DE JULIO DE 2014, OFICIO NO. 7675 (EXAMEN DE FONDO)

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término legal:

1. Objeciones del Examinador

1.1 Reivindicaciones

En relación con las reivindicaciones su Despacho considera que:

1.1.1. El método de la reivindicación 13 corresponde al uso del compuesto de fórmula (I), mencionado en la reivindicación 1 para controlar hongos fitopatógenos de los cultivos. Es evidente que la llamada etapa de "aplicar una cantidad eficaz... del compuesto de las reivindicaciones 1 – 11 en el suelo..." corresponde a la forma de usar los compuestos de fórmula (I), aunque en su preámbulo se reclame como método. Se le aclara al solicitante que un método cuya única etapa corresponde a una aplicación, dicha aplicación es un uso.

Por lo tanto dicho método no es patentable de acuerdo con el artículo 14.

1.1.2. Las reivindicaciones 1 – 12 no se encuentran debidamente soportadas en la descripción puesto que en las realizaciones preferidas sólo hace referencia aparentemente a la preparación y actividad de los compuestos mencionados en la tabla 1, lo cual no evidencia la actividad de todos los compuestos sino que se hace una generalización de manera especulativa. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable cantidad de acuerdo al tipo de compuestos que ha sido sintetizado y probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados en el capítulo descriptivo. (...)

El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción.

1.1.3. La reivindicación 12 hace referencia a una composición pero no se mencionan los componentes y las proporciones de los mismos, por lo tanto se sugiere mencionar cuales son los componentes y sus proporciones. Además no se encuentra debidamente sustentada puesto que en las realizaciones preferidas no se menciona la actividad de dichas composiciones con sus respectivas proporciones.

1.2 Novedad

El Examinador plantea que, después de realizada la búsqueda de anterioridades, encontró documentos que afectan la novedad de las reivindicaciones 1-3, 6, 7, 11 y 12 de la presente solicitud.

Particularmente, el Examinador considera que los documentos WO2006120224 (D1), WO2009016220 y WO2007087906 (D3) afectan la novedad de la presente solicitud por cuanto:

“Es posible concluir que las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente y de manera independiente en D1, D2 y D3 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 1 con cada una de las anterioridades D1, D2 y D3, se concluye que el

compuesto de fórmula (I) descrito en la reivindicación 1, ya era conocido en el estado de la técnica.

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado de forma independiente en el documento D1, el documento D2 y el documento D3.

Las reivindicaciones dependientes 2, 3, 6, 7 y 11 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

Es posible concluir que las características esenciales de la composición de la reivindicación 12, habían sido divulgadas previamente y de manera independiente en D1, D2 y D3 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 12 con cada una de las anterioridades D1, D2 y D3, se concluye que la composición descrita en la reivindicación 12, ya era conocido en el estado de la técnica.

En consecuencia, la reivindicación 12 carece de novedad, según lo divulgado de forma independiente en el documento D1, el documento D2 y el documento D3.”

1.3 Nivel Inventivo

Sobre el requisito del nivel inventivo, el Examinador establece que una persona del nivel técnico medio, versada en la materia, ensayaría las soluciones que se proponen en los documentos D1, D2 y D3 y llegaría de manera obvia a la solución que se propone en la presente solicitud. Particularmente, el Examinador considera que las reivindicaciones 4 - 5 y 8 - 10 carecen de nivel inventivo debido a las enseñanzas contenidas en dichos documentos.

El Examinador establece:

“La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 4 y el compuesto del documento D1 consiste en la definición del radical XI es F, mientras que en D1 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en

D1. La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 4 y el compuesto del documento D2 consiste en la definición del radical X1 que se especifica que solo es F, mientras que en D2 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en D2.

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 4 y el compuesto del documento D3 consiste en la definición del radical X1 que se especifica que solo es F, mientras que en D3 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en D3.

El efecto que lograría las diferencias estructurales, en cuanto a especificar más y seleccionar un sustituyente de la estructura central, antes mencionadas en el compuesto de fórmula I de la reivindicación 4, en cuanto a su eficiente acción como fungicidas, no puede ser determinado toda vez que no existe alguna evidencia que indique que dichas diferencias estructurales, otorgan al compuesto ahora reivindicado una ventaja técnica sobre los compuestos ya conocidos en la anterioridad D1 o D2 o D3.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a los compuestos conocidos según D1 o D2 o D3 para que presenten una mayor actividad respecto a los compuestos ya conocidos y una eficacia al menos equivalente a la ya conocida.

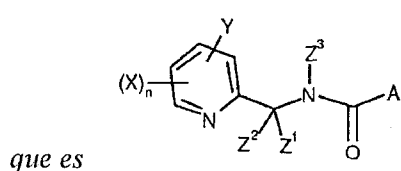
Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivara de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 4 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 o D3 toda vez que las diferencias se limitan en seleccionar un halógeno de lo ya divulgado, para definir el un solo sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad fungicida y de evitar el desarrollo de cepas resistentes.

Puesto que la reivindicación dependiente 5 no menciona características inventivas adicionales, tampoco puede ser considerada inventiva.

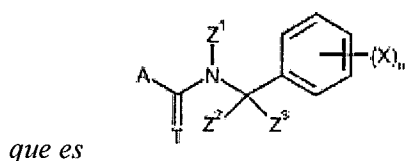
Conclusión:

Las reivindicaciones 4 y 5 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18)(...).

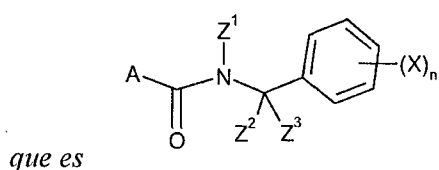
La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 8 y el compuesto del documento D1 consiste en la definición del radical B, mientras que en D1 se menciona



La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 8 y el compuesto del documento D2 consiste en la definición del radical B, mientras que en D2 se menciona



La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 8 y el compuesto del documento D3 consiste en la definición del radical B, mientras que en D3 se menciona



El efecto que lograría las diferencias estructurales, en cuanto a especificar más y seleccionar un sustituyente de la estructura central, antes mencionadas en el compuesto de fórmula I de la reivindicación 8, en cuanto a su eficiente acción como fungicidas, no puede ser determinado toda vez que no existe alguna evidencia que indique que dichas diferencias estructurales, otorgan al compuesto ahora reivindicado una ventaja técnica sobre los compuestos ya conocidos en la anterioridad D1 o D2 o D3.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a los compuestos conocidos según D1 o D2 o D3 para que presenten una mayor actividad

respecto a los compuestos ya conocidos y una eficacia al menos equivalente a la ya conocida.

Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivara de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 8 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 o D3 toda vez que las diferencias se limitan en seleccionar un halógeno de lo ya divulgado, para definir el un solo sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad fungicida y de evitar el desarrollo de cepas resistentes.

Puesto que las reivindicaciones dependientes 9 y 10 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas.

Conclusión:

Las reivindicaciones 8 – 10 cumplen el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18)."

2. Argumentos a favor de la patentabilidad de la solicitud

2.1 Reivindicaciones

En respuesta a las observaciones de su Despacho el solicitante ha decidido presentar un nuevo capítulo reivindicatorio en el cual se atienden todas y cada una de las observaciones.

La reivindicación 1 se ha corregido sobre la base de los compuestos descritos como activos en la solicitud tal como se presentó y en los datos adicionales que aquí se incluyen.

Las reivindicaciones 11 y 12 se han eliminado.

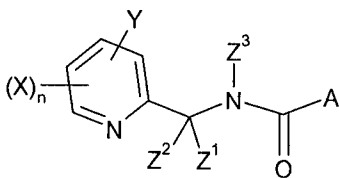
De otro lado Q se ha modificado de tal forma que entre otros se ejemplifique con el ejemplo C57.

2.2 Novedad

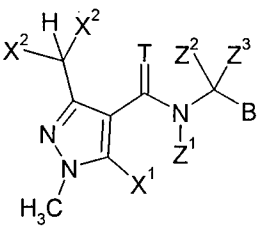
La novedad de una solicitud está legalmente definida en el Artículo 16 de la Decisión 486 así: *“una invención se considerará nueva, cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso de la prioridad reconocida...”*

En virtud de la anterior definición, consideramos que los documentos D1, D2 y D3 no constituyen documentos del arte previo que afecten la novedad de la presente solicitud.

D1 (WO2006120224) describe los compuestos de fórmula:



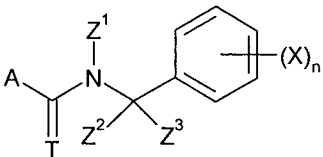
La presente invención cubre los compuestos de fórmula:



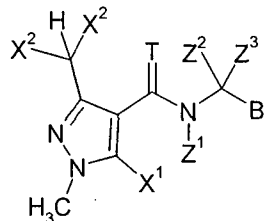
(I) en donde B no es un anillo de 2-piridilo (ver la condición de la reivindicación 1).

Los compuestos de la presente invención son nuevos en vista de D1.

D2 (WO2009016220) describen los compuestos de fórmula:



La presente invención cubre los compuestos de fórmula:

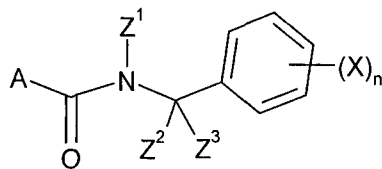


(I) en donde B representa un anillo de 5, 6, 9, 10 miembros, monocíclico o bicíclico fusionado, saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende de 1 hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste de N, O, S, que pueden ser sustituidos por hasta 6 grupos X que pueden ser iguales o diferentes; con la condición de que B no sea un anillo de 2-piridilo y que B no sea un anillo de 1,3-benzodioxolilo cuando Z1 representa un grupo cicloalquilo sustituido o sin sustituir.

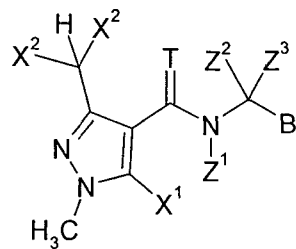
De acuerdo con esto, B en los compuestos de la presente invención es un heterociclo monocíclico o bicíclico fusionado que comprende de 1 a 4 heteroátomos, no un anillo de fenilo.

De acuerdo con lo anterior la presente invención es nueva con relación a D2.

D3 (WO2007087906) describe los compuestos de fórmula



Tal como se explicó anteriormente, la presente invención cubre los compuestos de fórmula:



(I) en donde B no es un fenilo.

Los compuestos de la presente invención son nuevos en vista de D3.

2.3 Nivel inventivo

El nivel inventivo de una solicitud se encuentra definido en el Artículo 18 de la Decisión 486 y se establece cuando *“si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”*.

Contrario a lo que plantea el Examinador, el documento del arte previo citado no afecta el nivel inventivo de la presente solicitud por cuanto no es posible derivar la presente invención a partir de las enseñanzas presentadas en los documentos D1, D2 o D3.

Su Despacho considera que los documentos D1, D2 y D3 son los documentos de la técnica anterior más cercanos a la definición de la reivindicación 4, por las siguientes razones:

- La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 4 y el compuesto de los documentos D1, D2 y D3 consiste en la definición del radical X1 que se especifica que solo es F, mientras que en D1, D2 y D3 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona un halógeno específico.

El solicitante esta en desacuerdo con que la diferencia mencionada por su Despacho sea la única de acuerdo con la explicación anteriormente dada.

Además de la característica técnica mencionada por su Despacho, la presente invención difiere de D1, D2 y D3 por una diferencia técnica sustantiva adicional que es que B no es un grupo 2-piridilo (comparado con D1), ni un anillo de fenilo (comparado con D2 y D3).

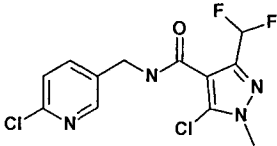
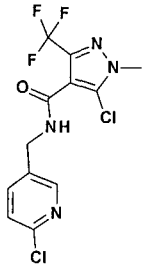
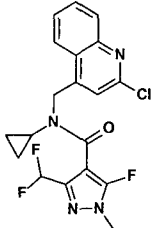
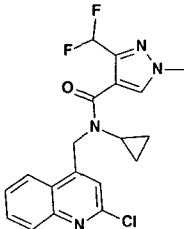
De acuerdo con lo anterior, los compuestos de la presente invención difieren de los compuestos descritos en D1, D2 y D3 por al menos dos características técnicas sustantivas que son:

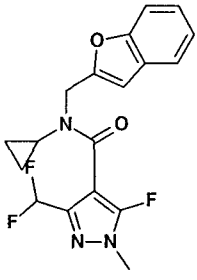
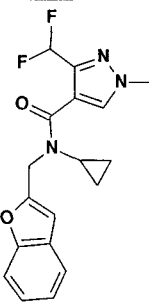
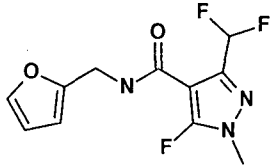
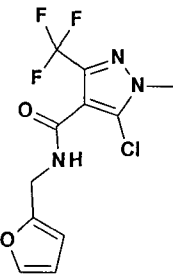
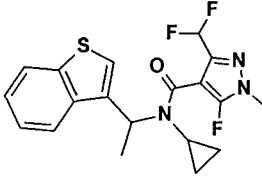
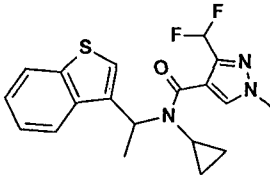
- la presencia de un grupo 1-metil-3-(difluoro or dicloro)metil-5-(cloro or fluoro)-4-pirazolilo en los compuestos de la invención, mientras dicho grupo no aparece en los compuestos descritos de manera específica en D1, D2 y D3, y

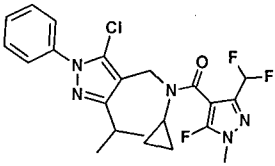
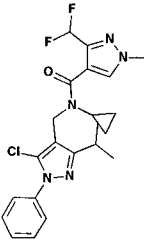
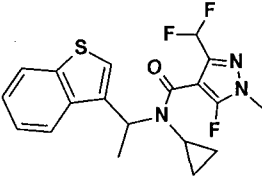
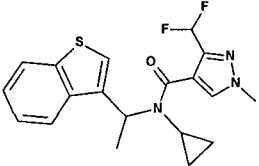
- la naturaleza de B que no es un anillo de 2-piridilo comparado con D1, ni un anillo de fenilo, comparado con D2 o D3.

La solicitud de patente tal como se presentó muestra numerosos datos comparativos que muestran que los compuestos de la invención exhiben una eficacia sorprendentemente mejor que los compuestos que difieren solamente por la ausencia de dicho grupo 1-metil-3-(difluoro o dicloro)-4-pirazolilo presente en los compuestos de la invención, que es una de las dos diferencias entre la presente invención y los compuestos descritos en D1, D2 o D3.

Dichos datos comparativos presentes en la solicitud tal como se presentó se resumen como sigue:

Compuesto	Estructura	prueba	Eficiencia
69 de la invención		Ejemplo A de la presente solicitud de patente (tabla A2)	70 %
5-cloro-N-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida			0 %
138 de la invención		Ejemplo B de la presente solicitud de patente (tabla B2)	95 %
N-[(2-cloroquinolin-4-il)metil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamide			0 %

71 de the invencion		Ejemplo B de la presente solicitud de patente (tabla B3)	95 %
N-(1-benzofuran-2-ilmetil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida			0%
10 de la invención		Ejemplo B de la presente solicitud de patente (tabla B4)	100 %
5-chloro-N-(2-furylmethyl)-1-methyl-3-(trifluorometil)-1H-pirazole-4-carboxamide			0 %
85 de la invención		Ejemplo D de la presente solicitud de patente (tabla D2)	99 %
N-[1-(1-benzo-tiofen-3-il)etil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida			21 %

169 de la invención		Ejemplo D de la presente solicitud de patente (tabla D3)	99% (100 ppm) 56% (10 ppm)
N-[(5-cloro-3-isopropil-1-fenil-1H-pirazol-4-il)metil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida			53% (100 ppm) 4 % (10 ppm)
85 de la presente solicitud		Ejemplo J de la presente solicitud de patente (tabla J2)	100 %
N-[1-(1-benzo-tiofen-3-il)etil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazole-4-carboxamida			20 %

Para resumir, no solo los compuestos de la presente invención exhiben al menos dos características técnicas principales distintivas comparados con los compuestos descritos en D1, D21 o D3, cuando uno de dichas dos diferencias técnicas es la presencia de un grupo 1-metil-3-(difluoro or dicloro)metil-5-(cloro or fluoro)-4-pirazolilo en los compuestos de la invención, sino que ellos exhiben una eficacia sorprendentemente mejor que los compuestos de la técnica anterior que difieren por la ausencia de dicho grupo 1-metil-3-(difluoro or dicloro)metil-5-(cloro or fluoro)-4-pirazolilo.

Los compuestos de la presente invención son inventivos sobre D1, D2 y D3.

En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas en el presente documento y en consecuencia, se otorgue el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

Atentamente,



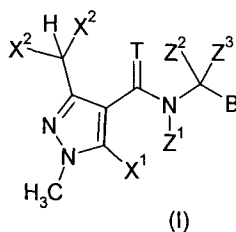
ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexos: Datos de prueba adicionales (2 páginas)
Capítulo reivindicatorio modificado

BOGRAC/BOGDMS-#2327711-V1-P2013_000020-MEMORIAL_DE_RESPUESTA_A_AUTOD_E_FONDO.DOC

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



en la que

- T representa O o S;
- X^1 y X^2 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o de flúor;
- Z^1 representa un átomo de hidrógeno, alquilo(C_1-C_8) sin sustituir; cicloalquilo(C_3-C_7) sin sustituir;
- Z^2 y Z^3 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; sustituido por un átomo de halógeno o alquilo(C_1-C_8) sin sustituir; o
- Z^2 y Z^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un cicloalquilo(C_3-C_7) sustituido o sin sustituir;
- B representa un anillo bicíclico condensado o monocíclico de 5, 6, 9 o 10 miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende de 1 hasta 4 heteroátomos seleccionados de la lista que consiste en N, O, S, que puede estar sustituido con hasta 6 grupos X que pueden ser iguales o diferentes; con la condición que B no sea un anillo 2-piridilo, y que B no sea un anillo 1,3-benzodioxolilo cuando Z^1 represente un grupo ciclopropilo sustituido o sin sustituir; X representa un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8) no sustituido; halogenoalquilo(C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alqueno(C_2-C_8) sin sustituir; alcoxi(C_1-C_8) no sustituido; halogenoalcoxi(C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C_1-C_8)-sulfanilo no sustituido; cicloalquilo(C_3-C_7) no sustituido; halógenocicloalquilo(C_3-C_7) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; tri(alquil(C_1-C_8))silo no sustituido; fenilo que puede estar sustituido con hasta 6 grupos Q que pueden ser iguales o diferentes; o
- dos sustituyentes X junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos pueden formar un carbociclo saturado, de 5 elementos; o
- Z^3 y el sustituyente X próximos al punto de unión del grupo B, junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos pueden formar un carbociclo parcialmente saturado de 5, 6 ó 7 miembros sustituido con alquilo (C_1-C_8) o sin sustituir parcialmente saturado y Z^2 es como se describe en la presente memoria;

- Q representa independientemente un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈) no sustituido;

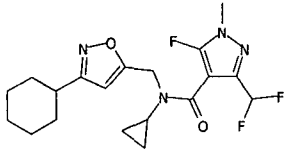
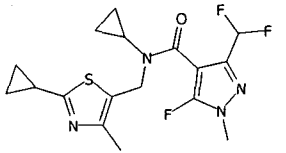
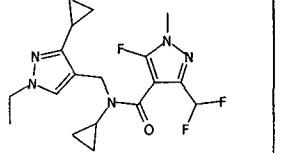
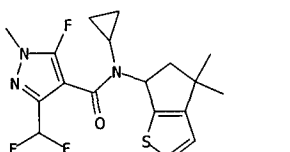
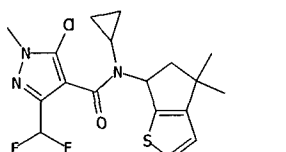
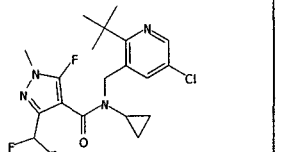
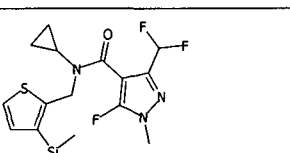
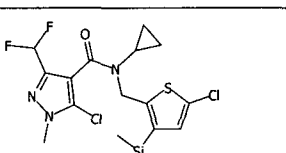
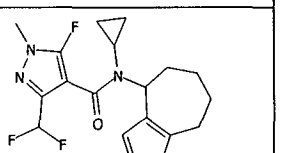
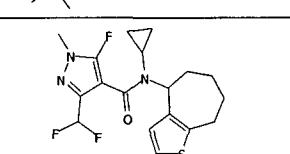
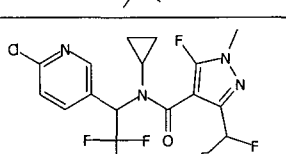
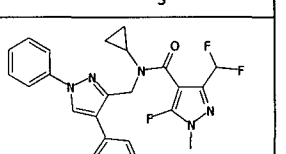
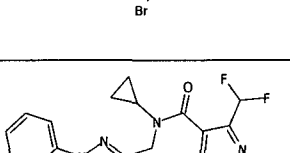
así como sales de los mismos.

2. Un compuesto según la reivindicación 1 en donde Z¹ representa un ciclopropilo no sustituido, un átomo de hidrógeno, un metilo o un etilo.
3. Un compuesto según la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en donde T representa O.
4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en donde X¹ representa un átomo de flúor.
5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que X² representa un átomo de flúor.
6. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en donde Z² y Z³ representan independientemente un átomo de hidrógeno o un metilo.
7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 en donde Z² representa un átomo de hidrógeno y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un metilo.
8. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en donde B representa un anillo tienilo sustituido o sin sustituir; un anillo benzotienilo sustituido o sin sustituir; un anillo quinolinilo sustituido o sin sustituir; un anillo isoquinolinilo sustituido o sin sustituir; o un anillo benzofurano sustituido o sin sustituir.
9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en donde B representa un anillo tienilo sustituido o sin sustituir;
10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en donde B representa un anillo benzotienilo sustituido o sin sustituir;
11. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que X representa independientemente un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈) no sustituido; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈) sin sustituir o halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

BM_RAC/BOGDMS-#2327798-V1-P2013_000020-NUEVO_CAPÍTULO_REIVINDICATORIO_DOCX

Additional data

Table 1 : chemical structures

C1		C8		C15	
C38		C39		C43	
C44		C47		C49	
C50		C55		C57	
C61					

Biological data

In vivo preventive test on *Sphaerotheca fuliginea* (cucumber)

The test is performed as described in example A of the application as filed.
Under these conditions, good (at least 70%) to total protection is observed at a dose of 500 ppm of active ingredient with the following compounds: C15, C38, C43, C44, C49, C50, C55, C57

in vivo preventive test on *Alternaria solani* (tomato)

The test is performed as described in example B of the application as filed.
Under these conditions, good (at least 70%) to total protection is observed at a dose of 500 ppm of active ingredient with the following compounds: C1, C8, C15

in vivo preventive test on *Pyrenophora teres* (barley)

The test is performed as described in example C of the application as filed.

Under these conditions, good (at least 70%) to total protection is observed at a dose of 500 ppm of active ingredient with the following compounds: C1, C8, C15, C38, C43, C44, C61

in vivo protective test on *Uromyces appendiculatus* (beans)

The test is performed as described in example I of the application as filed.

Under these conditions, good (at least 70%) to total protection is observed at a dose of 500 ppm of active ingredient with the following compounds: C38, C43, C44, C47, C49, C50

in vivo protective test on *Puccinia triticina* (wheat)

The test is performed as described in example J of the application as filed.

Under these conditions, good (at least 70%) to total protection is observed at a dose of 500 ppm of active ingredient with the following compounds: C38, C39, C43, C44, C47, C49, C50