



No 07-129345-00001-0000

PAIS: COLOMBIA / CIUDAD: BOGOTA / DEPT: BOGOTA / CATEGORIA: INVENTOS / TIPO: PATENTE / LUGAR: OFICINA NACIONAL / SOLICITANTE: OLARTE RAISBECK FRIERI MOURE & CASTRO LTDA / FECHA: 2007-07-20 / PAGINA: 2

709
200
1

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref: Expediente No. 07-129.345

Solicitud de patente de invención titulada: "ARILPIRAZOLES SUSTITUIDOS".

Solicitante: PFIZER LIMITED.

Nuestra Ref.: P2007/000202

SOLICITUD DE EXAMEN DE PATENTABILIDAD SEGÚN
EL ARTÍCULO 44 DE LA DECISION 486, GACETA No. 590

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado del solicitante, respetuosamente me permito solicitar que se examine si la invención reúne los requisitos de patentabilidad previstos en la misma, dando cumplimiento a lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la comisión de la Comunidad Andina. Adjunto recibo por el monto de \$420.000 pesos para cubrir la tasa correspondiente, según la Resolución 44372 del año 2007.

Atentamente.

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Recibo por \$420.000 pesos

OLARTE RAISBECK FRIERI MOURE & CASTRO LTDA

295
201
2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 07-129345-00001-0000

RECEIVED 04/15/2008 14:00:29
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
BOGOTA, COLOMBIA
FOLIO 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 30,026
FECHA : ABRIL 14 DE 2008

===== CONSIGNACION =====

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
OLARTE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	1483385	14/04/2008	10,690,000.00

===== CONCEPTO =====

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	420,000.00
		TOTAL :	\$ 420,000.00

SOM: CUATROCIENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

206
202



DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 07-129345

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 590 DE

FECHA 31 DE MARZO DE 2008 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL 27 DE JUNIO DE 2008

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO X

103
104

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



FIGURE 1

(43) International Publication Date
7 July 2005 (07.07.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/060749 A1

(51) International Patent Classification²: **A01N 43/56**
C07D 231/38, 401/04, 401/12, 403/12

Research and Development, Ramsgate Road, Sandwich,
Kent CT13 9NJ (GB). **WALSHE, Nigel, Derek, Arthur**
[IE/GB]; Pfizer Global Research and Development, Rams-
gate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).

(21) International Application Number:
PCT/IB2004/004193

(22) International Filing Date:
15 December 2004 (15.12.2004)

(74) Agents: **WOOD, David, J. et al.**; Pfizer Research and
Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ
(GB).

(23) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0329314.9 (8 December 2003 (18.12.2003) GB

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AI, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PY, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(71) Applicant (for GB only): **PFIZER LIMITED** (GB/GB);
Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Applicant (for all designated States except GB, US):
PFIZER, INC. [US/US]; 235 East 42nd Street, New York,
NY 10017 (US).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **BILLEN, Denis**
[BE/GB]; Pfizer Global Research and Development,
Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB). **CHUBB,**
Nathan, Anthony, Logan [GB/GB]; Pfizer
Global Research and Development, Ramsgate Road,
Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB). **GETHIN, David, Mor-**
ris [GB/GB]; Pfizer Global Research and Development,
Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB). **HALL,**
Kim, Thomas [GB/GB]; Pfizer Global Research and
Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ
(GB). **ROBERTS, Lee, Richard** [GB/GB]; Pfizer Global

Published:

— with international search report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: SUBSTITUTED ARYL-PYRAZOLES AS PARASITICIDAL AGENTS

(57) Abstract: This invention relates to a range of i-aryl-4-cyclopropylpyrazoles in which there is at least one fluorine attached to the cyclopropyl ring, to compositions comprising such compounds, processes to their synthesis and their use as parasitocides.

WO 2005/060749 A1

SUBSTITUTED ARYLPYRAZOLES AS PARASITICIDAL AGENTS

This invention relates to pyrazole derivatives having parasitocidal properties. The compounds of interest are fluorinated cyclopropylarylpyrazoles and, more particularly, the invention relates to 1-aryl-4-cyclopropylpyrazoles in which there is at least one fluorine attached to the cyclopropyl ring.

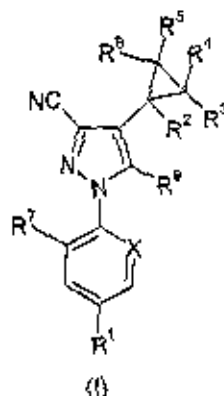
International Patent Application Publication No. (WO) 9824767, European Patent Application Publication No. (EP) 933363 and EP957094 describe 4-cyclopropyl arylpyrazoles having parasitocidal activity for the control of arthropods.

The prior art compounds do not always demonstrate good activity or a long duration of action against parasites. Similarly, some parasitocidal agents are useful only for a narrow spectrum of parasites. It is an aim of the present invention to overcome various disadvantages of or improve on the properties of prior art compounds. Thus it is an aim of the invention to provide an arylpyrazole which has improved activity relative to prior art compounds against parasites. The compounds of the present invention have especially good ability to control a broad spectrum of arthropods as shown by the results of tests demonstrating their potency and efficacy. In particular, the compounds of the present invention are significantly more active against fleas than similar prior art compounds.

It is a further aim to provide compounds with a long duration of action. Most preferably, the compounds control infestation by arthropods for a period of at least twenty-eight days. The extended duration of action is generally attributed to an extended half life of the compound in vivo in the host mammal.

It is also desirable that the compounds of the present invention should have an improved pharmacokinetic profile, improved safety, improved persistence and improved solubility.

Thus, according to the present invention, there is provided a compound of formula (I):



5 wherein:

R^1 is CF_3 , OCF_2H , OCF_3 , $-SCF_3$, $-SOCF_3$, $-SO_2CF_3$, or SF_5 ;

R^2 is H, fluoro, or C_{1-4} alkyl optionally substituted by 1 to 5 halogen atoms independently selected from chloro and fluoro;

10 R^3 , R^4 , R^5 , and R^6 independently represent H, C_{1-4} alkyl optionally substituted by 1 to 5 halogen groups independently selected from chloro and fluoro, or a chloro or fluoro;

R^7 is Cl or fluoro;

X is CR^8 or N where R^8 is Cl or fluoro; and

R^9 is NR^aR^b ;

15 R^a is selected from hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{3-6} cycloalkyl, $C(O)OC_{1-6}$ alkyl and C_{1-6} alkanoyl, wherein each of the above groups may include one or more optional substituents where chemically possible independently selected from halo, phenyl, hydroxy, $-C(O)OH$, $-C(O)OC_{1-6}$ alkyl, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} haloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{1-6} alkoxy, C_{1-6} haloalkoxy, amino, C_{1-6} alkyl amino and di C_{1-6} alkyl amino;

20 R^b is selected from hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, C_{1-6} alkanoyl and $C(O)OC_{1-6}$ alkyl, wherein each of the above groups may include one or more optional substituents where chemically possible independently selected from, halo, phenyl,

210
206

hydroxy, -COOH, -C(O)O C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₈ cycloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, amino, C₁₋₆ alkyl amino and di C₁₋₆ alkyl amino;

or R^a and R^b together with the N atom to which they are attached may form a three to seven - membered heterocyclic ring containing one or more further N, O or S atoms and wherein said heterocyclic ring may bear one or more optional substituents selected from oxo, halo, het, phenyl, hydroxy, -COOH, -C(O)O C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₈ cycloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, amino, C₁₋₆ alkyl amino and di C₁₋₆ alkyl amino; and

het represents a four- to seven-membered heterocyclic group, which is aromatic or non-aromatic and which contains one or more heteroatoms selected from nitrogen, oxygen, sulfur and mixtures thereof, and wherein said heterocyclic ring is optionally substituted, where the valence allows, with one or more substituents selected from halo, cyano, nitro, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, OC(O)C₁₋₆ alkyl, C(O)C₁₋₆ alkyl, C(O)OC₁₋₆ alkyl and NR^cR^d, where R^c and R^d are independently selected from hydrogen, C₁₋₆ alkyl and C₂₋₆ alkenyl, wherein each of the above groups may include one or more optional substituents where chemically possible independently selected from halo, phenyl, hydroxy, -COOH, C(O)OC₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ alkyl, C₁₋₆ haloalkyl, C₃₋₈ cycloalkyl, C₁₋₆ alkoxy, C₁₋₆ haloalkoxy, amino, C₁₋₆ alkyl amino and di C₁₋₆ alkyl amino; or a pharmaceutically acceptable salt or prodrug thereof;

with the proviso that at least one of R², R³, R⁴, R⁵, or R⁶ is fluoro.

In the compounds according to formula (I), C₁₋₆ haloalkyl or C₁₋₆ haloalkoxy means a C₁₋₆ alkyl or C₁₋₆ alkoxy substituted by 1 to 5 chloro or fluoro groups chosen independently. Also, 'halo' means a group selected from fluoro, bromo, chloro, bromo or iodo.

Suitably, R¹ is CF₃ or SF₅, preferably CF₃.

Suitably R² is CF₃ or CHF₂, preferably CF₃. In an alternative suitable embodiment, R² is fluoro.

21
207

for the treatment of a parasitic infestation; and
a method of treating a parasitic infestation in a mammal which comprises treating
said mammal with an effective amount of a compound of formula (I), or a
pharmaceutically acceptable salt thereof, or a pharmaceutically acceptable solvate
5 of either entity, or a pharmaceutical composition containing any of the foregoing.

According to another aspect of the present invention, there is provided a method for
the control of arthropod, plant nematode or helminth pests at a locus which
comprises the treatment of the locus (e.g. by application or administration) with an
10 effective amount of a compound of general formula I, or a pesticidally acceptable
salt thereof.

The present invention includes all pharmaceutically acceptable isotopically-labelled
compounds of formula (I) wherein one or more atoms are replaced by atoms
15 having the same atomic number, but an atomic mass or mass number different from
the atomic mass or mass number usually found in nature.

Examples of isotopes suitable for inclusion in the compounds of the invention
include isotopes of hydrogen, such as ^2H and ^3H , carbon, such as ^{11}C , ^{13}C and ^{14}C ,
20 chlorine, such as ^{36}Cl , fluorine, such as ^{18}F , iodine, such as ^{123}I and ^{125}I , nitrogen,
such as ^{13}N and ^{15}N , oxygen, such as ^{15}O , ^{17}O and ^{18}O , phosphorus, such as ^{32}P ,
and sulphur, such as ^{35}S .

Compounds of the invention can also be mixed with one or more biologically active
25 compounds or agents including insecticides, acaricides, anthelmintics, fungicides,
nematocides, antiprotozoals, bactericides, growth regulators, entomopathogenic
bacteria, viruses or fungi to form a multi-component pesticide giving an even
broader spectrum of pharmaceutical, veterinary or agricultural utility. Thus, the
present invention also pertains to a composition comprising a biologically effective
30 amount of compounds of the invention and an effective amount of at least one
additional biologically active compound or agent and can further comprise one or

22
205

more of surfactant, a solid diluent or a liquid diluent. Specific further active compounds include those described in UK Patent Application No. GB0406137.0, at pages 37 to 41.

↑
WO2005/090313

- 5 Compounds of the invention intended for pharmaceutical use may be administered as crystalline or amorphous products. They may be obtained, for example, as solid plugs, powders, or films by methods such as precipitation, crystallization, freeze drying, or spray drying, or evaporative drying. Microwave or radio frequency drying may be used for this purpose.

10

They may be administered alone or in combination with one or more other compounds of the invention or in combination with one or more other drugs (or as any combination thereof). Generally, they will be administered as a formulation in association with one or more pharmaceutically acceptable excipients. The term

15 "excipient" is used herein to describe any ingredient other than the compound(s) of the invention. The choice of excipient will to a large extent depend on factors such as the particular mode of administration, the effect of the excipient on solubility and stability, and the nature of the dosage form.

- 20 Pharmaceutical compositions suitable for the delivery of compounds of the present invention and methods for their preparation will be readily apparent to those skilled in the art. Such compositions and methods for their preparation may be found, for example, in 'Remington's Pharmaceutical Sciences', 19th Edition (Mack Publishing Company, 1985).

25

With respect to their use in mammals, the compounds may be administered alone or in a formulation appropriate to the specific use envisaged, the particular species of host mammal being treated and the parasite involved.

- 30 The methods by which the compounds may be administered include oral administration by capsule, bolus, tablet, powders, lozenges, chews, multi and

209
213

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 74 75 76 77 78 79 80 81 82 83 84 85 86 87 88 89 90 91 92 93 94 95 96 97 98 99 100

(43) International Publication Date
29 September 2005 (29.09.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/090313 A1

(51) International Patent Classification²: C07D 231/40,
231/42, 231/50, 401/12, 417/04, 403/12, 413/12, 417/12,
A01N 43/56, A61K 31/415, A61P 33/00

(73/GB): Pfizer Global Research and Development, Rams-
gate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).

(21) International Application Number:
PCT/GB2005/000597

(74) Agents: WOOD, David, J. et al.; Pfizer Research and
Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ
(GB).

(22) International Filing Date: 7 March 2005 (07.03.2005)

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AB, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GR, GU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0406137.0 18 March 2004 (18.03.2004) GB
60/571,415 13 May 2004 (13.05.2004) US

(71) Applicant (for GB only): PFIZER LIMITED (GB/GB);
Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13 9NJ (GB).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, MD, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Applicant (for all designated States except GB, US):
PFIZER INC. [US/US]; 235 East 42nd Street, New York,
NY 10017 (US).

(72) Inventors; and

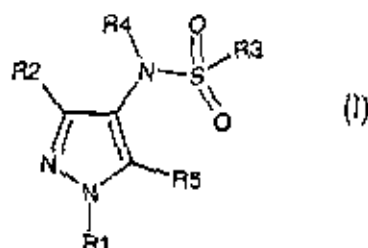
Published:
— with international search report

(75) Inventors/Applicants (for US only): CRITCHER,
Douglas, James (GB/GB); Pfizer Global Research and
Development, Ramsgate Road, Sandwich, Kent CT13
9NJ (GB). LAURET, Christelle (FR/GB); Pfizer Global
Research and Development, Ramsgate Road, Sandwich,
Kent CT13 9NJ (GB). WALSH, Nigel, Derek, Arthur

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 2005/090313 A1

(54) Title: N-(1-ARYLPYRAZOL-4L)SULFONAMIDES AND THEIR USE AS PARASITICIDES



(57) Abstract: The invention relates to a sulfonamide compound of formula
(I) or a pharmaceutically, veterinary or agriculturally acceptable salt or sol-
vate thereof, where the groups R¹-R⁵ are described in the description, to com-
positions comprising such compounds, processes for their synthesis and their
use as parasiticides.

Compounds of this invention can also be mixed with one or more biologically active compounds or agents including insecticides, acaricides, anthelmintics, fungicides, nematocides, antiprotozoals, bactericides, growth regulators, entomopathogenic bacteria, viruses or fungi to form a multi-component pesticide giving an even broader spectrum of pharmaceutical, veterinary or agricultural utility. Thus the present invention also pertains to a composition comprising a biologically effective amount of compounds of the invention and an effective amount of at least one additional biologically active compound or agent and can further comprise one or more of surfactant, a solid diluent or a liquid diluent.

The following list of biologically active compounds together with which the compounds of the invention can be used is intended to illustrate the possible combinations, but not to impose any limitation.

For example, compounds of the present invention may be co-administered or used in combination with anthelmintic agents. Such anthelmintic agents include, compounds selected from the macrocyclic lactone class of compounds such as ivermectin, avermectin, abamectin, emamectin, eprinomectin, doramectin, selamectin, moxidectin, nemadectin and milbemycin derivatives as described in EP-357460, EP-444964 and EP-594291. Additional anthelmintic agents include semisynthetic and biosynthetic avermectin/milbemycin derivatives such as those described in US-5015630, WO-9415944 and WO-9522552. Additional anthelmintic agents include the benzimidazoles such as albendazole, cambendazole, fenbendazole, flubendazole, mebendazole, oxfendazole, oxibendazole, parbendazole, and other members of the class. Additional anthelmintic agents include imidazothiazoles and tetrahydropyrimidines such as tetramisole, levamisole, pyrantel pamoate, oxantel or morantel.

Compounds of this invention may also be used in combination with derivatives and analogues of the paraherquamide/marcfortine class of anthelmintic agents, as well as the antiparasitic oxazolines such as those disclosed in US-5478855, US-4639771 and DE-19520936.

Compounds of this invention may be co-administered or used in combination with derivatives and analogues of the general class of dioxomorpholine antiparasitic agents

as described in WO-9615121 and also with anthelmintic active cyclic depsipeptides such as those described in WO-9611945, WO-9319053, WO-9325543, EP-626375, EP-382173, WO-9419334, EP-382173, and EP-503538.

- 5 Compounds of this invention may be co-administered or used in combination with other ectoparasiticides; for example, fipronil; pyrethroids; organophosphates; insect growth regulators such as lufenuron; ecdysone agonists such as tebufenozide and the like; neonicotinoids such as imidacloprid and the like.

- 10 Other examples of such biologically active compounds include but are not restricted to the following:

Organophosphates: acephate, azamethiphos, azinphos-ethyl, azinphos-methyl, bromophos, bromophos-ethyl, cadusafos, chlorethoxyphos, chlorpyrifos, 15 chlorfenvinphos, chlormephos, demeton, demeton-S-methyl, demeton-S-methyl sulphone, dialifos, diazinon, dichlorvos, dicrotophos, dimethoate, disulfoton, ethion, ethoprophos, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fensulfothion, fenthion, flupyrzofos, fonofos, formothion, fosthiazate, heptenophos, isazophos, isothioate, isoxathion, malathion, methacriphos, methamidophos, methidathion, methyl-parathion, 20 mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, paraoxon, parathion, parathion-methyl, phenthoate, phosalone, phosfolan, phosphocarb, phosmet, phosphamidon, phorate, phoxim, pirimiphos, pirimiphos-methyl, profenofos, propaphos, proetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridapenthion, quinalphos, sulprophos, temephos, terbufos, tebupirifos, tetrachlorvinphos, thimeton, triazophos, trichlorfon, 25 vamidothion.

Carbamates: alanycarb, aldicarb, 2-sec-butylphenyl methylcarbamate, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, cloethocarb, ethiofencarb, fenoxycarb, fenthioncarb, furathiocarb, HCN-801, isoprocarb, indoxacarb, methiocarb, methomyl, 5- 30 methyl-m-cumenylbutyryl(methyl)carbamate, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, thiofanox, triazamate, UC-51717

Pyrethroids: acrinathin, allethrin, alphametrin, 5-benzyl-3-furylmethyl (E) - (1R)-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, bifenthrin, β -

25
211

cyfluthrin, cyfluthrin, α -cypermethrin, β -cypermethrin, bioallethrin, bioallethrin((S)-cyclopentylisomer), bioresmethrin, bifenthrin, NCI-85193, cycloprothrin, cyhalothrin, cythuthrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenethrin, esfenvalerate, ethofenprox, fenfluthrin, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, fluvalinate (D isomer),
 5 imiprothrin, cyhalothrin, λ -cyhalothrin, permethrin, phenothrin, prallethrin, pyrethrins (natural products), resmethrin, tetramethrin, transfluthrin, theta-cypermethrin, silafluofen, τ -fluvalinate, tefluthrin, tralomethrin, Zeta-cypermethrin.

Arthropod growth regulators: a) chitin synthesis inhibitors: benzoylureas:
 10 chlorfluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron, buprofezin, diofenolan, hexythiazox, etoxazole, chlorfentazine; b) ecdysone antagonists: halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide; c) juvenoids: pyriproxyfen, methoprene, fenoxycarb; d) lipid biosynthesis inhibitors: spiroticlofen

Other antiparasitics: acequinocyl, amitraz, AKD-1022, ANS-118, azadirachtin, Bacillus thuringiensis, bensultap, bifenazate, binapacryl, bromopropylate, BTG-504, BTG-505, camphechlor, cartap, chlorobenzilate, chlordinform, chlorfenapyr, chromafenozide, clothianidine, cyromazine, diacloden, diafenthiuron, DBI-3204,
 20 dinactin, dihydroxymethyldihydroxypyrrolidine, dinobuton, dinocap, endosulfan, ethiprole, ethofenprox, fenazaquin, flumite, MTL-800, fenpyroximate, fluacrypyrim, flubenzimine, flubrocycythrinate, flufenzine, flufenprox, fluproxyfen, halofenprox, hydramethylnon, IKI-220, kanemite, NC-196, neem guard, nidnorterturan, nitenpyram, SD-35651, WL-108477, pirydaryl, propargite, protrifenbute, pymethroline, pyridaben,
 25 pyrimidifen, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofen, silomadine, spinosad, tebufenpyrad, tetradifon, tetranactin, thiacloprid, thiocyclam, thiamethoxam, tolfenpyrad, triazamate, triethoxyspinosyn, trinactin, verbutin, vertalec, YI-5301

30 Fungicides: acibenzolar, aldimorph, ampropylfos, andoprime, azaconazole, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, bialaphos, blastocidin-S, Bordeaux mixture, bromuconazole, bupirimate, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, chlorfenazole, chloroneb, chloropicrin, chlorothalonil, chlozolinate, copper oxychloride, copper salts,

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS R. OLARTE

ASUNTO	Radicación	07-129345
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	519
	Oficio	15
	Folios	15

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional: PCT/IB2006/001579
Fecha de Presentación Internacional: 2006-06-06

Como resultado del Examen de Fondo realizado, con fundamento en el Artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 115-192 y 199	2007-12-06
Reivindicaciones:	Folios 193-198	2007-12-06
Prioridad: US11/153103	Folio 1	2005-06-15

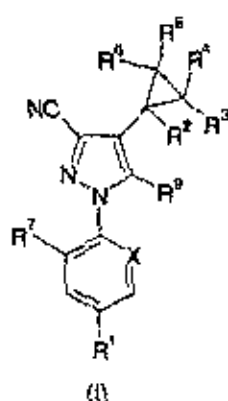
2. Análisis de la Prioridad

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

Título de la solicitud: Arilpirazoles sustituidos. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a derivados de pirazol de fórmula (I) que tiene propiedades parasiticidas, específicamente a derivados 1-aril-4-ciclopropil pirazoles fluorados.



El problema técnico planteado en la presente solicitud de patente se refiere a la necesidad de diseñar nuevos derivados de pirazol con actividad parasitocida mejorada y un espectro de acción de artrópodos más amplio. Para solucionar ese problema técnico la solicitud plantea derivados 1-aryl-4-ciclopropil pirazoles fluorados.

El objeto de la presente solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N43/56; C07D401/04; C07D401/12; C07D403/12; C07D413/04.

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

El uso de la reivindicación 12 no es patentable de acuerdo con el artículo 14 de la Decisión 486.

5. De la solicitud de Patente

Título

Se requiere al solicitante que modifique el título de la invención haciendo referencia específica a la materia que se desea proteger, es decir, el compuesto de interés específicamente definido.

Descripción (artículo 28)

La descripción resulta ser insuficiente para el amplio alcance que tiene el capítulo reivindicatorio. Se le recuerda al solicitante que la descripción debe ser una divulgación suficiente y adecuada para la materia que se está reclamando, pero definitivamente el alcance de la misma, va mucho más allá de aquella materia que se encuentra enteramente soportada en la descripción.

Se llama la atención al solicitante respecto a los ensayos biológicos presentados y la poca información que se obtiene de ellos. Se le aclara al solicitante que la comparación "todos los compuestos ejemplificados de la presente invención que se ensayaron tienen valores de DE80 para pulgas, menores o iguales a 3, a diferencia de los compuestos comparadores relevantes de la técnica anterior..." no refleja algún efecto técnico inesperado o sorprendente. Un estudio biológico debe mostrar un manejo de datos adecuado, donde se demuestren realmente diferencias significativas.

En este mismo sentido se observa además que la descripción no presenta como objeto de la invención una combinación entre los derivados de fórmula (I) de interés con uno o mas agentes antiparasitarios adicionales, ni tampoco divulga la forma de ejecutar la invención en el sentido de una combinación o algún ejemplo biológico que demuestre la actividad de una combinación. Mas aun, siendo completamente estrictos, la descripción indica frente a la definición del objeto de la invención y del problema técnico que *"es un objeto de la invención proporcionar un aripirazol que tenga mejor actividad que los compuestos de la técnica anterior"* *"es otro objeto proporcionar compuestos con una duración de la acción prolongada"* *"es deseable que los compuestos de la presente invención tengan un mejor perfil farmacológico"* y frente a la solución aportada indica que *"los compuestos de la presente invención son significativamente mas activos"* Así entonces, es mas que claro que la presente invención se refiere a la necesidad de compuestos mas activos y supera ese problema técnico por medio de los aripirazoles de fórmula (I), es decir, el objeto de la invención así definido se refiere al compuesto de fórmula (I).

Sobra aclarar que aunque en el folio 136 se indica que los compuestos de la invención pueden combinarse con otros agentes conocidos en el arte, dicha combinación es simplemente una opción, pues el problema técnico ya se había superado únicamente mediante los derivados de fórmula (I) sin ser combinados.

Por lo tanto, esta oficina considera que la información presentada en la descripción es insuficiente para el amplio alcance que tiene el capítulo reivindicatorio, y además considera que no hay ninguna razón técnica para aceptar una extrapolación tan amplia a una eventual combinación con algún otro ingrediente activo.

En consecuencia la descripción no cumplió con el requisito de claridad y/o divulgación completa de acuerdo al art. 28 de la Decisión 486 y el art. 22 del Tratado PCT.

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El capítulo reivindicatorio es demasiado amplio y no cumple con el requisito de concisión; asimismo se considera una generalización que no se encuentra enteramente soportada en la descripción.

Pese a que la reivindicación 1 presenta la materia de invención como una combinación entre el compuesto de fórmula (I) y uno o más agentes terapéuticos distintos, no se encuentra ningún soporte en la descripción para reclamar una combinación con otro ingrediente activo que ni siquiera esta definido.

Así entonces, de acuerdo con lo indicado anteriormente la materia reclamada se considera una generalización sin ningún soporte en la descripción.

Ahora bien, sírvase suprimir las expresiones *"cuando sea químicamente posible, sal farmacéuticamente aceptable o pro fármaco del mismo, uno o mas agentes terapéuticos distintos"* puesto que son imprecisas y no permiten definir el objeto y el alcance de la invención específicamente.

En resumen, el solicitante deberá limitar el alcance de su invención a aquella materia que se encuentre enteramente sustentada.

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

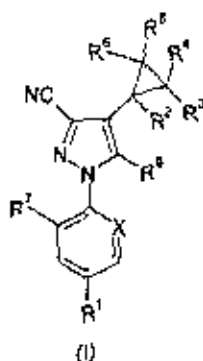
6. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de la solicitud prioritaria 2005-06-15 se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
	WO/2005/066749		2005-07-07
D1	Equivalente vía nacional CO05-59293	Substituted arylpyrazoles as parasitocidal agents	Fecha de prioridad 2003-12-18

- El solicitante podrá consultar los documentos citados en la siguiente URL's
D1: http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EP&DOC=EP0000000&II=0&N=D=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050707&CC=WQ&NR=2005060749A1&KC=A1

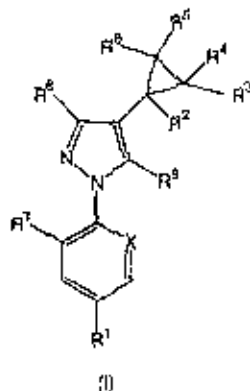
El documento D1 hace referencia a 1-aril-4-ciclopropil-pirazoles de fórmula (I), composiciones que los contienen, procesos de síntesis para su obtención y su uso como parasitocidas.



7. Examen de patentabilidad (artículo 14 D486)

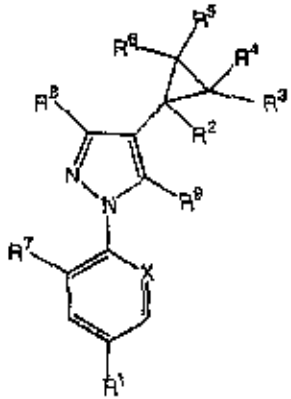
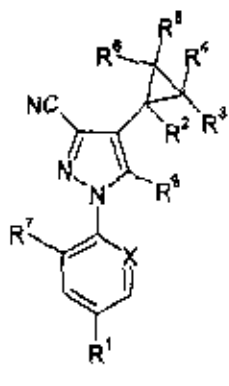
Novedad (artículo 16 D486)

La solicitud de patente en estudio presenta en su reivindicación 1 un producto de combinación que comprende, un compuesto de fórmula (I):



Con uno o más agentes terapéuticos

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

Características esenciales de la invención	Características esenciales del documento D1
Producto de combinación que comprende:	Combinaciones que comprenden:
Compuesto de fórmula (I)  (I)	Compuesto de fórmula (I)  (I)
Con uno o más agentes terapéuticos	Con uno o más compuestos biológicamente activos.

Las características esenciales del producto de combinación de la reivindicación 1 habían sido divulgadas completamente en el documento D1, el cual enseña compuestos de fórmula (I) con un patrón de sustitución idéntico a los derivados de fórmula (I) de esta solicitud (folios 220 a 226 de la solicitud colombiana 06-59293) y combinaciones de ellos con los mismos agentes terapéuticos considerados en esta solicitud (folio 141 de la solicitud colombiana 06-59293, referencia GB0406137,0 equivalente a WO2005/090313).

En consecuencia, la reivindicación 1 no es nueva, según lo divulgado en el documento D1.

Asimismo, las reivindicaciones dependientes 2-11 y 13 no mencionan alguna característica que haga nuevo al producto de combinación de la reivindicación 1, por lo cual se considera que tampoco son nuevas.

8. Conclusión

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

Nº	Documento Nº	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2005060749 Equivalente vía nacional CO06-59293	1-13	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

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.



JOSE LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director de Nuevas Creaciones (C)

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

_____ **03 Feb. 2012**

Elaborado por: Sandra Isabel Calderón.

Revisado por: Jacqueline Alfonso *OK*

Aprobado por: José Luis Salazar.