

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020  
Bogotá, D.C.,

Abogado  
ALVARO CORREA ORDOÑEZ

|        |            |           |
|--------|------------|-----------|
| ASUNTO | Radicación | 08 008493 |
|        | Trámite    | 011       |
|        | Evento     | 378       |
|        | Actuación  | 519       |
|        | Oficio     |           |
|        | Folios     | 005       |

**05570**

|                                     |                                     |                                                            |
|-------------------------------------|-------------------------------------|------------------------------------------------------------|
| Patente de Invención                | <input checked="" type="checkbox"/> | Patente de Modelo de Utilidad                              |
| Vía Nacional                        |                                     |                                                            |
| Vía PCT (Fase Nacional)             | <input checked="" type="checkbox"/> | Capítulo I <input checked="" type="checkbox"/> Capítulo II |
| No. Solicitud Internacional         | PCT/EP2006/00720<br>3               |                                                            |
| Fecha de Presentación Internacional | 21/Julio/2006                       |                                                            |

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 59 a 100  | 29/Enero/2008 |
| Reivindicaciones: | Folios 101 a 106 | 29/Enero/2008 |
| Prioridad:        | JP 2005-220049   | 29/Julio/2005 |

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: "Insecticidas de 3 acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)".

El problema planteado en esta solicitud consiste en la infestación por insectos de diferentes ambientes.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona nuevos compuestos derivados de 3-acilaminobenzanilidas para ser usados como insecticidas.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A01N 37/22

**4. No es una invención (Art 15 D 486 literales (a) – (f))**

El objeto de la reivindicación 15 no se considera una invención, de acuerdo con el Art citado.

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

El uso de las reivindicaciones 7, 9 a 11 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

**6. De la Solicitud de Patente**

**Título**

El título corresponde con el objeto de la solicitud.

**Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)**

El procedimiento que se enseña en la reivindicación 6 no presenta características técnicas por medio de las cuales sea posible diferenciar el procedimiento que el solicitante propone con una aplicación convencional de un principio activo sobre el lugar o especie que sea de interés. Se le recuerda al solicitante que en términos de patentes los procedimientos se caracterizan por medio de una serie de pasos y en el procedimiento de la solicitud solamente se esta presentando la aplicación de los principios activos.

En las reivindicaciones 12 a 14 se están presentando métodos de tratamiento para semillas y plantas transgénicas; estos métodos no presentan características técnicas, solamente se esta enunciando que estos materiales biológicos se tratan con las composiciones que contienen los principios activos de la solicitud.

**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 prioridad: 29 de Julio del 2005, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Item | Documento                                                                                                   | Título                                                         | Fecha de Publicación |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1   | US 3328410                                                                                                  | Naphthindolizinedione and benzonaphthindolizinedione pigments. | 27/Junio/1967        |
| D2   | Organic Chemistry<br>Sixth Edition<br>Pearson Prentice<br>Hall<br>L.G. Wade.<br>Capitulo 19, página<br>893. | Acylation of an amine by an acid chloride                      | 2006                 |

D1[http://www.google.com/patents?id=mutgAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=US3328410&hl=en&sa=X&ei=7NFtT\\_P6C8PeggeOzNFr&ved=0CDQQ6AEwAA](http://www.google.com/patents?id=mutgAAAAEBAJ&printsec=frontcover&dq=US3328410&hl=en&sa=X&ei=7NFtT_P6C8PeggeOzNFr&ved=0CDQQ6AEwAA)

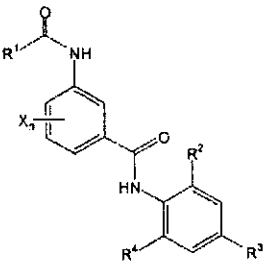
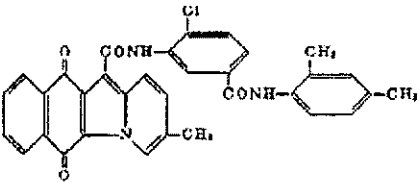
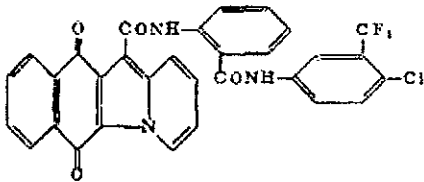
divulga (abstract) compuestos basados en heterociclos orgánicos con capacidad colorante, en particular estructuras de pigmentos de naftindolizinedion carboxiarilamida y los procesos para producción de ellos.

8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

La reivindicación 1 consiste en: "Nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)"

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

| Características <b>esenciales</b>                                                                                                                                                                                                                                                               | D1                                                                                                                                                                                                          |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Nuevas 3-acilaminobenzanilidas de la fórmula (I)<br>                                                                                                                                                          | Benzanilidas de la fórmula:<br><br> |
| R <sup>1</sup> significa fenilo que puede estar sustituido o un grupo de anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, que puede estar sustituido, que contiene al menos un heteroátomo elegido entre N, O y S.                                                                                       |                                                                                                                                                                                                             |
| R <sup>2</sup> significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halogenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                                             |
| R <sup>3</sup> significa halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 hasta 6 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquilsulfonilo con 1 hasta 6 átomos de carbono |                                                                                                                                                                                                             |
| R <sup>4</sup> significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono, o halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono.                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                                             |
| X significa halógeno, alquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                                             |
| n valor entre 0 ó 1                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                             |

Las características **esenciales** de los compuestos de la solicitud de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, en esta anterioridad se presentan compuestos de benzanilidas (columna 20, renglones 50 a 60, ejemplo 26 y columna 21, renglones 4 a 11 ejemplo 27) que presentan la misma estructura general de los compuestos de la solicitud y que corresponde a acetilamino N-fenilbenzamida. Así mismo, en la anterioridad D1 también se presentan los mismos radicales sustituyentes, ya que el radical R1 de la solicitud Expediente 08 008943 1er Art 45

puede tener el significado de un grupo de anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros que puede estar sustituido y tiene un átomo de nitrógeno, como se puede apreciar en los compuestos de la anterioridad D1 éste radical corresponde a un pirrol el cual se encuentra sustituido por un fenilo y un grupo naftalendiona.

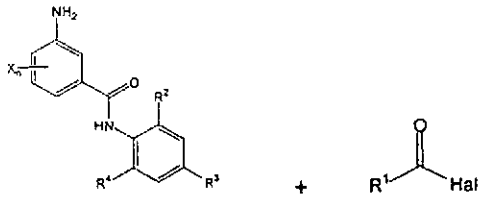
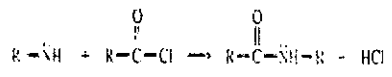
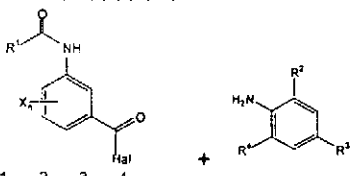
De otra parte, los radicales sustituyentes para la fenilbenzamida propuestos en la solicitud se encuentran revelados en la anterioridad D1, ya que se esta considerando que los radicales R2,R3 y R4 pueden tomar los significados de halógeno, alquilo o halogenoalquilo y para los compuestos de la anterioridad D1 en estas posiciones se encuentran grupos metilo y halógenos como cloro.

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

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

La reivindicación 4 consiste en dos procedimientos para la preparación de los compuestos de la fórmula (I)

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

| Características <b>esenciales</b>                                                                                                                                                                                                                                     | D2                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>Se hace reaccionar :</p> <div></div> <p>R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X y n son los mismos definidos precedentemente. Hal significa halógeno.</p> | <p>Acilación de aminas por cloruros de ácido.</p> <p>Las aminas primarias y secundarias reaccionan con haluros de ácidos para formar amidas. Esta reacción es una sustitución acil nucleofílica. En este caso la amina reemplaza el ión cloruro:</p> <div></div> |
| <p>Se hace reaccionar:</p> <div></div> <p>R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X y n son los mismos definidos precedentemente. Hal significa halógeno.</p>  | <p>La amina ataca mucho más fácil un cloruro de ácido que un grupo carbonilo, aldehído o cetona; esto debido a la electronegatividad del átomo de cloro. Debido al intermediario tetraedral que forma el cloro, éste es un buen grupo saliente.</p>                                                                                                  |
| <p>Reacción en presencia de disolventes inertes, y en caso dado, en presencia de una base y de un catalizador de transferencia de bases.</p>                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |

Los procesos de síntesis presentados corresponden a una acilación de aminas por haluros de ácido ya que para formar los compuestos de fórmula (I) (acilaminobenzanilidas), en los dos mecanismos propuestos se proponen una sustitución acil nucleofílica; en donde la amina reemplaza al haluro, esta reacción se favorece por la electronegatividad del haluro. Estos procesos de síntesis se habían divulgado en D2, y pertenecen al campo técnico de la química orgánica y

es una reacción convencional entre las aminas y los haluros de ácido. De tal manera que una persona de nivel medio versada en la materia puede derivar el mecanismo de síntesis propuestos a través de lo divulgado en el estado del arte. Por lo tanto los procesos de síntesis presentados en la reivindicación 4, carecen de nivel inventivo.

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

| Item | Documento                                                   | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|-------------------------------------------------------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | US 5'789.567                                                | 1-3                        | Novedad              |
| D2   | Organic Chemistry<br>Sixth Edition<br>Pearson Prentice Hall | 4                          | Nivel Inventivo      |

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.



**JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
Director de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 11 ABR. 2012

Elaborado por Andrea Mojica

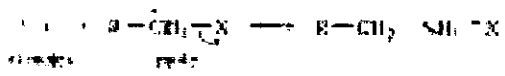
Revisado por Gloria Jacqueline Alfonso 

Aprobado por José Luis Salazar

PROBLEM 19-15

Propose a mechanism to show the statistical alkylation that forms the quaternary ammonium cation.

2. *Reaction with primary amines is favored.* Because acylation is irreversible and takes less time, for a given  $R-X$ , it is convenient to use a very large excess. Addition of a primary alkyl halide to a large excess of ammonia forms the primary amine, and the predominance of alkylation in excess basic ammonia is simply allowed to happen.

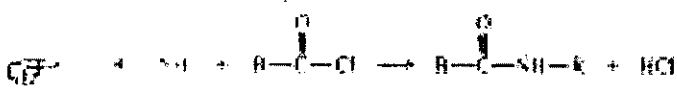


PROBLEM 19-16

Show how you would use direct alkylation to synthesize the following compounds:  
(a) benzyltrimethylammonium chloride    (b) 1-propylamine    (c) benzylamine

Primary and secondary amines react with acid chlorides to form amides. This reaction is a nucleophilic acyl substitution: the replacement of a leaving group on a carbonyl carbon by a nucleophile. We will study nucleophilic acyl substitution in detail in Chapter 20. In this case, the amine replaces chloride ion.

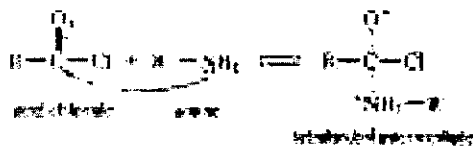
19-13  
Acylation of Amines  
by Acid Chlorides



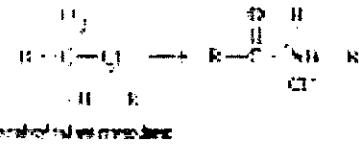
The amine attacks the carbonyl group of an acid chloride much like it attacks the carbonyl group of a ketone or aldehyde. The acid chloride is more reactive than a ketone or an aldehyde because the electronegative chlorine atom draws electron density away from the carbonyl carbon, making it more electrophilic. The chlorine atom on the tetrahedral intermediate is a good leaving group. The tetrahedral intermediate expels chloride to give the amide. A base such as pyridine or NaOH is often added to neutralize the HCl produced.

MECHANISM 19-3      Acylation of an Amine by an Acid Chloride

Step 1: A nucleophilic amine attacks the strongly electrophilic carbonyl group of the acid chloride.



Step 2: The intermediate eliminates chloride ion.



(Continued)