

Señor Director

DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

Referencia: Expediente No. NC2016/0000472

Asunto: Solicitud de patente para: MEZCLAS Y COMPOSICIONES
FUNGICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN 5-FLUORO-4-
IMINO-3-METIL-1-TOSIL-3,4-DIHIDROPIRIMIDIN-2(1H)-ONA Y
UN INHIBIDOR DE LA BIOSÍNTESIS DE ESTEROL PARA EL
CONTROL FÚNGICO

Solicitante: ADAMA MAKHTESHIM LTD.

Fecha de solicitud: 29 de julio de 2016

RESPUESTA AL PRIMER EXAMEN DE FONDO

Yo, ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI, identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, doy respuesta al Oficio 15876, notificado por fijación en lista el 08 de noviembre de 2017, para el cual solicité prórroga el 06 de febrero de 2018.

I. MODIFICACIONES AL CAPÍTULO REIVINDICATORIO

En respuesta al examen de patentabilidad, el solicitante decide aportar un Capítulo Reivindicatorio Modificado conformado por 15 reivindicaciones de las que se realizaron las siguientes modificaciones:

- Se eliminaron las antiguas Reivindicaciones 5 a 12;
- Se limita el alcance de la proporción de los compuestos de la composición a 1:27 a 787:1, dicha modificación tiene soporte entre la página 20, línea 22 a la página 21, línea 1 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluyen las nuevas Reivindicaciones 2 y 3 que reclaman modalidades particulares de la proporción de concentración de los ingredientes de la

“EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS”

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Código Postal 110221 - Tel. (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 42 A No. 1 - 25 - Torre 4 - Oficina 303 - Código Postal 050021 - Tel: (57-4) 520 4760 - COLOMBIA
BARRANQUILLA - Calle 64 No. 50-22 - Código Postal 080002 - Barrio El Prado - Tel. (57-5) 3 51 64 40 - COLOMBIA

composición 1:4 y 787:1 (R. 2) y 1:27 y 120:1 (R. 3), que tiene soporte en la página 21, líneas 10 a 14 y 14 a 18 del Capítulo Descriptivo, respectivamente

- Se incluye la nueva Reivindicación 4 que lista los posibles inhibidores de biosíntesis de esterol, que tiene soporte en la página 1, líneas 18 a 24 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 6 que reclama una modalidad particular de la selección de inhibidor de biosíntesis de esterol, específicamente entre protioconazol y difenoconazol. Dicha modificación tiene soporte en la antigua Reivindicación 4 y la Reivindicación 17 del texto originalmente publicado;
- Se corrige la modalidad (b) de la nueva Reivindicación 7 (antigua Reivindicación 3) en la que anteriormente repetía la modalidad (a). A saber, la modalidad (b) indica que el inhibidor de biosíntesis de esterol es epoxiconazol y la proporción de concentración del Compuesto de la Fórmula I a epoxiconazol es entre 3.6:1 y 20:1. Dicha modificación además tiene soporte en la página 4, líneas 7 a 9 del Capítulo Descriptivo;
- La nueva Reivindicación 8 corresponde a la antigua Reivindicación 4;
- Se incluye la nueva Reivindicación 9 que reivindica que el adyuvante de la composición es un tensioactivo adyuvante, y dicha modificación tiene soporte en la página 46, líneas 2 a 3;
- Se incluye la nueva Reivindicación 10 que reclama tensioactivos adyuvantes particulares como nonilfenoles etoxilados, alcoholes etoxilados sintéticos o naturales, sales de los ésteres o ácidos sulfosuccínicos, siliconas orgánicas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales. Dicha modificación tiene soporte en la página 46, líneas 2 a 14 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 11 que reivindica diferentes formas de la formulación tal como una solución, polvo, granular, polvo humectable, concentrado capaz de fluir, concentrado emulsionable, suspensión concentrada, suspensión acuosa o emulsión. Dicha modificación tiene soporte en la página 47, líneas 17 a 21 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 12 que reclama una composición en donde:
 - la concentración de la composición fungicida sinérgica en el polvo humectable es entre 10% a 90% en peso. Dicha modificación tiene soporte en la página 41, líneas 21 a 23 del Capítulo Descriptivo;
 - la concentración de la composición fungicida sinérgica en el concentrado emulsionable es de 10% a 50% en peso. Dicha

modificación tiene soporte en la página 41, líneas 13 a 15 del Capítulo Descriptivo;

- la concentración de la composición fungicida sinérgica en forma granular es de 0.5% a 10% en peso. Dicha modificación tiene soporte en la página 45, líneas 5 a 9 del Capítulo Descriptivo;
- la concentración de la composición fungicida sinérgica en el polvo es de 1% a 10% en peso. Dicha modificación tiene soporte en la página 45, líneas 20 a 25 del Capítulo Descriptivo; o
- la concentración de la composición fungicida sinérgica en la suspensión acuosa es de 5% a 70% en peso. Dicha modificación tiene soporte en la página 44, líneas 15 a 18 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 13 que reclama tipos de formulación para aplicación secuencial, en una mezcla de tanque o en una formulación con uno o más otros fungicidas. Dicha modificación tiene soporte en la página 36, líneas 12 a 18 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 14 que reclama una modalidad particular sobre el porcentaje en peso de una o más composiciones sinérgicas con otro compuesto pesticida. Dicha modificación tiene soporte en la página 46, líneas 15 a 17 del Capítulo Descriptivo;
- Se incluye la nueva Reivindicación 15 que indica la naturaleza del compuesto pesticida, en donde éste puede ser fungicidas, insecticidas, nematocidas, acaricidas, artropodicidas y bactericidas. Dicha modificación tiene soporte en la página 46, líneas 19 y 20 del Capítulo Descriptivo.
- Todas las reivindicaciones, así como sus relaciones de dependencia, fueron reenumeradas de acuerdo con los cambios anteriormente mencionados.

Esta modificación se ajusta al Artículo 34 de la Decisión 486 de 2000, ya que no constituye una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

II. EN CUANTO A REIVINDICACIONES RELATIVAS A UN USO

1. El Examinador señala que las Reivindicaciones 5 a 13 reclaman usos.

2. Considero superada la anterior objeción en tanto las Reivindicaciones 5 a 12 fueron eliminadas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, tal como lo mencioné en el numeral I del presente memorial.

3. Por otra parte, deseo aclarar que la antigua Reivindicación 13 reclamaba una modalidad particular de la composición, ya que el término “*aplicada*” es alusiva al tipo de composición, ya bien sea una suspensión acuosa o una emulsión. Por lo tanto, considero superada dicha objeción.

III. EN CUANTO AL TÍTULO

1. El Examinador señala que el título no corresponde con el objeto de la solicitud porque no menciona las características técnicas esenciales de la invención.

2. Atendiendo a la amable sugerencia del Examinador, se ha modificado el título de la presente invención de tal forma que ahora lee:

“MEZCLAS Y COMPOSICIONES FUNGICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN 5-FLUORO-4-IMINO-3-METIL-1-TOSIL-3,4-DIHDROPIRIMIDIN-2(1H)-ONA Y UN INHIBIDOR DE LA BIOSÍNTESIS DE ESTEROL PARA EL CONTROL FÚNGICO”

Por consiguiente, considero superada toda objeción relacionada con el título.

IV. EN CUANTO A LA CLARIDAD

1. El Examinador considera que el Capítulo Reivindicatorio no es claro ni conciso por las siguientes razones:

- (i) no es clara ya que el supuesto objeto de la invención, según lo que se encuentra en el capítulo descriptivo (pág. 1, líneas 10 y 11) es proporcionar una composición fungicida, pero como se encuentra la reivindicación 1, en el preámbulo, se menciona una “*mezcla sinérgica*”, mezcla que carece de claridad porque no es entendible como un producto tangible susceptible de reproducción a nivel industrial.
- (ii) la reivindicación 1 no es concisa porque se pretende reivindicar un grupo de principios activos por su función de “*inhibición de biosíntesis de estero*l

fungicida” y no menciona a qué tipo de agentes activos está haciendo referencia.

- (iii) es necesario modificar la Reivindicación 1 e indicar la cantidad tanto de principio activo como de excipientes en términos de porcentaje y de acuerdo a lo que se encuentra en el capítulo descriptivo.

2. En primer lugar, llamo respetuosamente la atención del Examinador sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, y las drásticas limitaciones que se realizaron en éste. Ahora bien, en cuanto a la objeción (i), deseo aclararle al Examinador que cualquier persona medianamente versada en la materia entiende que cuando se habla de una mezcla fungicida sinérgica, como bien su nombre lo dice, hace referencia a una combinación de dos o más ingredientes (mezcla) con actividad en contra de hongos (fungicida) cuya actividad combinada tiene no un efecto aditivo sino un efecto potencializado (sinérgico). Ahora bien, teniendo eso claro, el Capítulo Descriptivo le da al lector un contexto, que en el presente caso es proporcionar control de cualquier patógeno fúngico de plantas (Página 1). Por otra parte, aprovecho para recordarle al Examinador que las reivindicaciones no deben tomarse como texto aislado, sino que debe leerse en el contexto de la invención, por lo que resulta completamente evidente para cualquier persona medianamente versada en la materia que la aplicación industrial de la mezcla de la presente invención es, como mencioné anteriormente, en el control fúngico de plantas, que a su vez tiene aplicación en el agro.

Por otra parte, el Solicitante desea aclarar que el párrafo [0007] indica que:

“De acuerdo con una modalidad ejemplar de la presente descripción, se proporciona una mezcla fungicida sinérgica que incluye una cantidad efectiva como fungicida del compuesto de la Fórmula I, y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste de un inhibidor de la biosíntesis de esterol fungicida (SBI).”

Por consiguiente, es claro que el material de la presente invención provee de mezclas sinérgicas fungicidas del compuesto de fórmula I y al menos un inhibidor de biosíntesis de esterol.

Además, el párrafo [0055] indica lo siguiente:

“[E]n una modalidad, la proporción de concentración del compuesto de la Fórmula I en donde el efecto fungicida es sinérgico con los otros fungicidas en aplicaciones protectoras se encuentra dentro del intervalo de aproximadamente 1:272 y aproximadamente 787:1.”

De acuerdo con la modificación, la Reivindicación 1 describe los ingredientes que comprenden la mezcla fungicida sinérgica (es decir, un Compuesto de Fórmula I y un inhibidor de la biosíntesis de esteroides), así como las proporciones del Compuesto de Fórmula I y el inhibidor de la biosíntesis de esteroides (es decir, una relación de concentración de el Compuesto de Fórmula I al inhibidor de la biosíntesis de esteroles entre 1:27 y 787: 1) en el que el compuesto de Fórmula I y el inhibidor de la biosíntesis de esteroles son sinérgicos.

El Solicitante también añadió nuevas Reivindicaciones dependientes 2 y 3, que reclaman la relación de concentración del Compuesto de Fórmula I al inhibidor de la biosíntesis de esteroides en el que el compuesto de Fórmula I y el inhibidor de la biosíntesis de esteroles son sinérgicos en las aplicaciones protectora y curativa, respectivamente.

3. En respuesta a la opinión del Examinador de que el término "*inhibidor de biosíntesis de esteroles*" no es conciso porque identifica agentes por función, el Solicitante señala respetuosamente que "*inhibidores de biosíntesis de esteroides*" es una clase de compuestos reconocidos en la técnica que cualquier persona medianamente versada en la materia es capaz de determinar el significado. El Solicitante dirige respetuosamente la atención del Examinador a la Lista de Códigos FRAC 2010, adjunta como **Anexo 1**, que divulga los inhibidores de biosíntesis de esteroides como una clase distinta y conocida de fungicidas.

El Comité de Acción de Resistencia a Fungicidas (FRAC – por sus siglas en inglés), un Grupo Técnico Especialista de Crop Life International (CLI – por sus siglas en inglés), una asociación que promueve tecnologías agrícolas tales como pesticidas y biotecnología vegetal, desarrolló una tabla de fungicidas comerciales ordenados por su modo de acción y resistencia riesgo (es decir, la lista de códigos FRAC). La página 7 de la Lista de códigos de FRAC contiene fungicidas cuyo modo de acción bioquímico implica la inhibición de la biosíntesis de esteroides en las membranas fúngicas. Dentro de esta lista hay 4 grupos fungicidas diferentes que se dirigen a sitios dentro de la ruta de biosíntesis de esteroides e

inhiben la biosíntesis de esteroides en membranas fúngicas, que son las 4 clases de inhibidores de la biosíntesis de esteroides (es decir, SBI: Clase I a Clase IV).

El término "*inhibidor de biosíntesis de esteroides*" está tan bien reconocido en la técnica que se abrevia como "*OSE*" en la Lista de códigos de FRAC. Como tal, una persona medianamente versada en la materia estaría razonablemente informada del significado de este término y entendería razonablemente que la Reivindicación 1 no reivindica un grupo de compuestos para su función, sino que reivindica un grupo de fungicidas por su clase.

4. En respuesta a la posición del Examinador de que un adyuvante o portador agrícolamente aceptable puede tener múltiples definiciones, algunas de las cuales supuestamente no están respaldadas en la Descripción, el Solicitante señala respetuosamente que los párrafos [0068] - [0078] revelan ejemplos de los tipos de adyuvantes o vehículos agrícolamente aceptables que pueden incluirse en la composición. Con base en los ejemplos descritos en los párrafos [0068] - [0078] de la memoria descriptiva, una persona medianamente versada en la materia estaría razonablemente informada de otros adyuvantes o vehículos que pueden usarse en la composición. Por lo tanto, el Solicitante respetuosamente sostiene que la expresión "*un adyuvante o portador aceptable en agricultura*" que se cita en la Reivindicación 8 presentada actualmente es clara.

V. ARTE PREVIO

El Examinador considera que hay un documento relevante para la evaluación de patentabilidad de la presente invención. A saber, el Examinador señala que D1, referido al documento US2011263627 titulado "*N3-Substituted-N1-sulfonyl-5-fluoropyrimidinone derivatives*" divulga derivados de N1-sustituidas-N1-sulfonil-5-fluoropirimidinonas y sus derivados y al uso de estos compuestos como fungicidas.

VI. EN CUANTO AL NIVEL INVENTIVO

1. El Examinador considera que la presente invención definida en la Reivindicación 1 carece de nivel inventivo a la luz de D1. A saber, el Examinador considera D1 como el arte previo más cercano ya que éste divulga derivados de N1-sustituidas-N1-sulfonil-5-fluoropirimidinonas y sus derivados, al uso de estos compuestos como fungicidas y a

composiciones farmacéuticas que los contemplan en combinación con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y mezclas sinérgicas de los mismos.

La diferencia entre la formulación de la invención y las reveladas en D1, consiste en el sustituyente metilo en la posición 4 del fenilo.

El efecto técnico que se obtiene con esta diferencia es proporcionar mezclas sinérgicas con actividad antifúngica.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: *“¿cómo proporcionar una composición antifúngica que comprenda un compuesto de fórmula I y otros fungicidas adicionales?”*

Sin embargo, el mismo documento D1 ya realiza claras sugerencias para llegar a la presente invención porque divulga un compuesto estructuralmente muy cercano al de fórmula (I) de la presente invención, junto con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y mezclas sinérgicas de los mismos. Entre las posibilidades se encuentran epoxiconazol, ciproconazol, miclobutanil, metconazol, propiconazol, protioconazol, fluquinconazol, flutriafol y difenoconazol (párr. [0044]). Los compuestos de Fórmula I y el compuesto pesticida en la combinación pueden estar presentes en una relación en peso de 1:100 a 100:1. (párr. [0043]).

En este punto es importante mencionar, que en la presente invención se reclaman compuesto con actividad antifúngica, pero no existe sustento para atribuir a tal compuesto de fórmula (I) una mejoría técnica o efecto técnico superior, cuando se realiza la sustitución de metilo propuesta. Lo anterior afirmación tiene soporte en el hecho de que las modificaciones de los sustituyentes de compuestos conocidos por su actividad o mecanismo de acción, son posibilidades plenamente conocidas para la persona del oficio normalmente versada en la materia, quien con sus conocimientos en química orgánica heterocíclica y a partir de la bibliografía básica puede realizar cambios en cualquiera de los sustituyentes, como ocurre con los isómeros clásicos en donde los grupos y átomos univalentes pueden ser reemplazados como una opción alternativa de modificación de sustituyentes funcionales 2, es decir, que se sabe que con algunas modificaciones en los sustituyentes, en anillos o en la posición de éstos se pueden lograr cambios e las propiedades del compuesto íntimamente relacionadas con su actividad o con el efecto técnico a esperar como es, por ejemplo, incrementar la potencia o el índice (relación)

terapéutica como el LD50, ED50 o el EC90 a partir de algunas modificaciones en la posición de los heteroátomos del anillo principal o en la posición de sus sustituyentes. En la presente invención se propone una modificación estructural que simplemente consiste en adicionar un metilo en el anillo fenilo del compuesto ya conocido, pero que, como se mencionó anteriormente, al no existir una comparación entre el estado del arte y la presente invención se consideran variaciones estructurales de rutina y no se cumple el requisito de nivel inventivo.

En consecuencia, cualquier persona normalmente versada en la materia al observar los compuestos de la anterioridad D1, y con sus conocimientos básicos y simples en química heterocíclica, habría podido “proponer” una modificación simple de metilo en el anillo fenilo, como una alternativa para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud.

2. En primer lugar, el Solicitante señala respetuosamente que el compuesto de fórmula I estaba abarcado por el género de compuestos descritos en D1, pero no se ejemplificó específicamente en D1. La divulgación de un género no puede presentar automáticamente obvias reivindicaciones dirigidas a especies, especialmente si el género cubre numerosas especies y para llegar a las especies reivindicadas se requiere seleccionar y combinar varios sustituyentes de una lista de alternativas cuando no hay enseñanza explícita para las selecciones y combinaciones requeridas. No hay ninguna razón registrada para que una persona medianamente versada en la materia haya sido motivada para seleccionar el compuesto de la presente invención. D1 no enseñó explícitamente una ventaja particular de seleccionar un sustituyente metilo en la posición 1 fenilo y el Examinador no ha proporcionado ningún soporte sobre por qué una persona medianamente versada en la materia habría estado motivada a realizar esta selección.

En segundo lugar, D1 generalmente se describe, *"Los compuestos de la presente descripción también se pueden combinar con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y mezclas sinérgicas de los mismos"* (párrafo [0044] de D1 – Mi traducción). Con base a esta descripción, una persona medianamente versada en la materia no podría esperar razonablemente que cada compuesto perteneciente al género descrito en D1 sea sinérgico con cada uno de los segundos agentes enumerados en el párrafo [0044] a cualquier relación de proporción.

En tercer lugar, el Solicitante modificó la Reivindicación 1 para reclamar, *"donde la relación de concentración del Compuesto de Fórmula I con el inhibidor de la biosíntesis de*

esteroles está entre 1:27 y 787: 1", que es el rango de relaciones de concentración en el que el Compuesto de Fórmula I al inhibidor de la biosíntesis de esteroides son sinérgicos (párrafo [0056] de la presente invención). Tal intervalo no se describió en D1 y una persona medianamente versada en la materia no esperaría razonablemente que el Compuesto de Fórmula I y el inhibidor de la biosíntesis de esteroides exhibirían un efecto fungicida sinérgico en este intervalo específico.

Por consiguiente, una persona medianamente versada en la materia no podría esperar razonablemente que la selección específica del compuesto de Fórmula I de la presente solicitud, que no se describió específicamente en D1, la selección específica de un inhibidor de la biosíntesis de esteroides como el segundo agente activo, y el intervalo específico de relaciones de concentración del Compuesto de Fórmula I con respecto al inhibidor de la biosíntesis de esteroides daría como resultado mezclas y composiciones con efecto fungicida sinérgico. Por lo tanto, el Solicitante respetuosamente sostiene que la presente invención es inventiva sobre D1.

Así las cosas, la Guía de la SIC establece que las invenciones carecen de nivel inventivo cuando *"(...) en el estado de la técnica en su conjunto hay un segundo documento que contiene una enseñanza que indicaría (no sólo que podría indicar, sino que indicaría) a la persona medianamente versada en la materia, enfrentada al problema técnico, cómo modificar o adaptar el estado de la técnica más cercano para resolver el problema, de la forma reivindicada, sin realizar una actividad inventiva"*.¹ En el presente caso, es evidente que las características técnicas esenciales de la invención no se podían prever a partir de las enseñanzas del arte previo citado por el Examinador sin llevar a cabo actividad inventiva.

En conclusión, cualquier persona medianamente versada en la materia reconocería que la presente invención es inventiva, sumado al hecho que el arte previo en efecto no es suficiente para brindar indicaciones acerca de la posibilidad de desarrollar la invención de manera específica, por lo que la presente invención reviste de nivel inventivo.

Finalmente, deseo agregar que la presente invención fue concedida por las oficinas de patentes de Eurasia (201691346). Ahora bien, a pesar de que las decisiones en otras jurisdicciones no tienen un carácter vinculante que obligue a la Superintendencia de Industria y Comercio (SIC) a tomar las mismas decisiones, es importante resaltar que los

¹ Guía de la SIC. Sección 2.13.5.1

estándares de patentabilidad, en particular de nivel inventivo, son semejantes a nivel mundial y las decisiones en otros países sí dan luces e indicios acerca de la patentabilidad de una invención, como sucede en el presente caso.

VII. PETICIÓN

1. Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por la Dirección de Nuevas Creaciones, se solicita proceder al otorgamiento de la solicitud de patente.

2. De manera subsidiaria, y en caso de que la Dirección de Nuevas Creaciones tenga observaciones adicionales a la patentabilidad del invento, solicito emitir un nuevo requerimiento en el marco del Artículo 45 de la Decisión 486 de 2000.

VIII. ANEXOS

1. Capítulo Reivindicatorio Modificado conformado por 15 reivindicaciones.
2. Recibo de pago correspondiente a la tasa por dos reivindicaciones adicionales.
3. Recibo de pago correspondiente a la tasa por segundo examen de patentabilidad.
4. Anexo 1 - Lista de Códigos FRAC 2010

Señor Director,

ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI

C.C. 79.780.910 de Bogotá

T.P. 114.908

COLO-22969-0841-0003-7

SAR\SAR\ID-300162\WPC22969

No. M-2018-300162\SAR