

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Señor
BAYER CROPS SCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

TÍTULO DE LA SOLICITUD: **“BENZOSULTAMAS Y SUS ANÁLOGOS Y SUS USOS COMO FUNGICIDAS”**

NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2017/066510

FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 3 de julio de 2017.

PRIORIDADES: 04/07/2016, EP (EUROPATENT ORGANIZATION(EPO)), 16290128.4
22/12/2016, EP (EUROPATENT ORGANIZATION(EPO)), 16290247.2

Como resultado del examen de patentabilidad realizado a la solicitud indicada en la referencia, atendiendo a lo consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, se le comunica que esta Dirección ha encontrado que la materia objeto de solicitud no cumple con algunos requisitos establecidos en la Decisión, con fundamento en los siguientes aspectos:

1. Modificaciones presentadas (Art. 34 Decisión 486)

Se aceptan las modificaciones radicadas el 5 de febrero de 2019, bajo el número NC2019/0001052, por ajustarse a los requisitos legales.

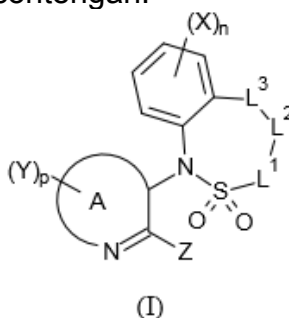
2. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada al momento de realizar el examen de patentabilidad consagrado en el artículo 45 de la Decisión 486.

Por lo tanto, se estudiarán las reivindicaciones 1 a 16 del radicado N° NC2019/0001052 del 5 de febrero de 2020.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar compuestos activos fungicidas y composiciones útiles para el control de hongos fitopatógenos en plantas

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona un compuesto de fórmula I y composiciones que lo contengan.



Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

2.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

Las reivindicaciones 1 a 10, 12, 13, 16 no son concisas porque las definiciones de A, Z, X, Y, L¹, L² y L³ son géneros funcionales, como se encuentran redactadas presentaría un sin número de compuestos, se requiere restringir a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentren debidamente sustentados.

Los ejemplos mencionan que:

A es quinolin opcionalmente sustituido con fluor, oxo, CH₃; piridopirazinilo; pirrolopirazinilo, piridilo, naftiridilo, triazolopirimidino, tienopiridilo o dihidrociclopentapiridilo;

Z es hidrogeno;

X es halógeno, -OCH₃, CH₃, 3-(2-trimetilsililetin-1ilo), trifluorometoxi, trifluorometil, etinilo, -(prop-1-en-2-ilo), -ciclopropilo, fenilo, -(6-cloropiridin-3-ilo), -(1-etoxieten-1-ilo) y -C(O)CH₃;

Y son los sustituyentes mencionados en A;

L1 es CH(CH₃), C(CH₃)₂, CH(isopropilo), CH₂, C(etilo)₂, C(Me)(4-NO₂fenilo), , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 

L2 es CH₂, C=O, CF₂, C(CH₃)₂, O, CH(OH), CCH₃(F), CCH₃(OCH₃), CCH₃(OH), CH(OCH₃), CH(F), S o CH(fenilo), , , ,  y;

L3 es N(CH₃), NH, CH₂ o C(CH₃)₂.

Adicionalmente, si el capítulo reivindicatorio es conciso no se requiere mencionar que compuestos son excluidos de la presente invención, un compuesto debe ser caracterizado de forma positiva, es decir por lo que es y no por lo que no es, se requiere reescribir las reivindicaciones.

Corregir las siguientes frases “*compuestos de fórmula (VIa) y (VIa)*”, “*compuestos de fórmula (VIIa)*” de la reivindicación 16 porque se repite el número de la formula o la figura no corresponde al número indicado.

3. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 4 de julio de 2016 que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:



Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Estado de la técnica			
Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	WO2008073956	“Cyclic sulfonamide derivatives and methods of their use”	19 de junio de 2008
D2	Debnath S., Malakar S., Mondal S.	“Synthesis of 1, 2-Benzothiazine 1, 1-Dioxide Derivatives by Intramolecular Heck Cyclization”	24 de junio de 2016

El documento D1¹ divulga un compuesto derivado de benzosultamas cíclicas sustituidas en el N heterociclo con biciclos, un proceso de síntesis y composiciones que lo comprenden, útiles para el tratamiento o prevención de enfermedades (resumen; pág. 6, líneas 2, 11, 13, 14 y 24; pág. 7, líneas 3 a 5, 9 a 11, 17 a 20 y 21 a 23; págs. 48 a 58; pág. 119, ej. 57 y reiv. 37).

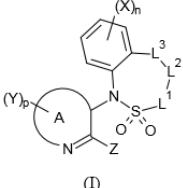
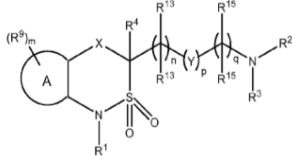
El documento D2² divulga proceso de síntesis de benzosultamas cíclicas que comprende la etapa de ciclación (resumen).

4. Examen de Patentabilidad (Art. 14 Decisión 486)

4.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de fórmula (I)” (Radicado N° NC2019/0001052 del 5 de febrero de 2020).

Tabla 1. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

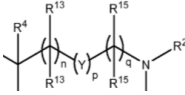
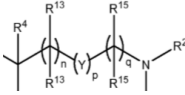
Características esenciales	D1
Un compuesto de fórmula (I):  sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, metaloides e isómeros ópticamente activos o geométricos. Donde;	Un compuesto de fórmula (I):  Donde; (pág. 6, línea 2),
A es un anillo heterociclilo bicíclico fusionado.	R ¹ es heteroarilo (pág. 6, línea 13),
Z es H, halógeno, alquilo; alquenilo; alquinilo opcionalmente sustituidos con halógenos, alcoxi, carbonilo, hidroxí-imino; alcoxycarbonilo; carbamoilo; amino; sulfanilo; sulfinilo y sulfonilo, cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heterociclilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, dialquilcarbamoilo, amino, sulfanilo, ciano y nitro.	Es hidrogeno (pág. 119, ej. 57),
X es halógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo opcionalmente sustituidos con halógenos, amino, sulfanilo, sulfinilo o sulfonilo; cicloalquilo, cicloalquenilo, arilo, heterociclilo, formilo, carbamoilo, alquilcarbamoilo, amino, ciano y nitro.	R ⁹ es C ₁ -C ₆ alquilo, alcoxi, halógeno, H, CF ₃ , OCF ₃ , heteroarilo, -OH o nitro (pág. 7, líneas 9 a 11),

¹https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=WO&NR=2008073956A2&KC=A2&FT=D&ND=3&date=20080619&DB=&locale=en_EP

²Recuperado desde: <https://www.thieme-connect.com/products/ejournals/html/10.1055/s-0035-1562440>.

Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Y es halógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo opcionalmente sustituidos con halógenos y/o alcoxilo, hidroxiimino, amino, sulfanilo, sulfinilo o sulfonilo, cicloalquilo; cicloalquenilo; hidroxilo; arilo; heterociclilo; amino; sulfanilo; ciano o nitro.	R ¹ está sustituido con R ⁵ , donde R ⁵ es C ₁ -C ₆ -alquilo, halógeno, alcoxi, CF ₃ , OCF ⁻ , -OH o nitro (pág. 7, líneas 3 a 5),
L ¹ es carbociclo, heterociclo, biciclo, heterobiciclo, espiro[n ¹ .n ²]-alquilo, metilideno o CR ¹ aR ¹ b donde: R ¹ a y R ¹ b es H, halógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos con halógenos y/o alcoxilo; heterociclilo.	 Es  , donde R ⁴ es H, R ² es hidrogeno o alquilo, R ¹³ es H o alquilo y R ¹⁵ es H o alquilo (pág. 6, líneas 2, 14 y 24; pág. 7, líneas 21 y 23),
L ² es un enlace directo, carbociclo, heterociclo, biciclo[m ¹ .m ² .0]-alquilo, heterobiciclo[m ¹ .m ² .0]-alquilo, espiro[n ¹ .n ²]-alquilo, heteroespiro[n ¹ .n ²]-alquilo, metilideno o CR ² aR ² b, O, NR ² c, C=N-OR ² d, S, S(O) o SO ₂ ; donde R ² a y R ² b es H; halógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo opcionalmente sustituidos con halógenos y/o alcoxilo o un cicloalquilo; arilo; heterociclilo; hidroxilo o heterociclil-C ₁ -C ₈ -alcoxibicíclico.	X es C(R ¹¹) ₂ o N(R ¹²), donde R ¹¹ es H, alquilo o halógeno y R ¹² es H, alquilo o arilo (pág. 6, línea 11, pág. 7, líneas 17 a 20),
L3 es un enlace directo, biciclo[m ¹ .m ² .0]-alquilo, CR ³ aR ³ b, C(=O), O, NR ³ c, C=N-OR ³ d, S, S(O) o SO ₂ ; donde R ³ a y R ³ b es H; halógeno; alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, opcionalmente sustituido con halógenos y/o alcoxilo; arilo, heterociclilo.	Es un enlace directo (pág. 6, línea 2).

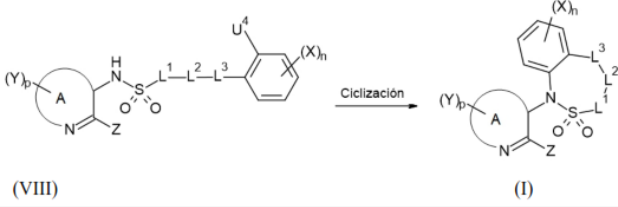
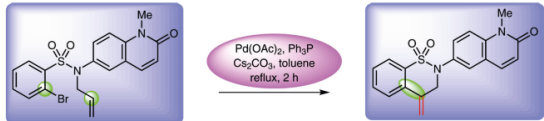
De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en el documento D1, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

Adicionalmente, el documento D1 menciona un proceso de síntesis para el compuesto y composiciones que lo comprenden (págs. 48 a 58 y reiv. 37).

Las reivindicaciones dependientes 2 a 16 tampoco cumplen con el requisito de novedad.

La reivindicación 15 consiste en: “Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I)” (Radicado N° NC2019/0001052 del 5 de febrero de 2020).

Tabla 2. Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

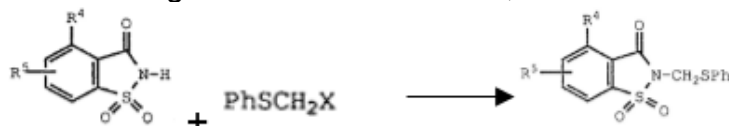
Características esenciales	D2
Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, caracterizado porque comprende: ... el paso de realizar una reacción de ciclización intermolecular:	Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I), caracterizado porque comprende: (resumen). el paso de realizar una reacción de ciclación intermolecular:
	 (resumen, pág. 3545 y 3546).

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del proceso para sintetizar el compuesto de fórmula I de la reivindicación 15 habían sido divulgadas previamente en el documento D2, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva (resumen).

Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Adicionalmente, es conocido en el estado de la técnica la etapa de adición de un radical arilo al nitrógeno de benzosultamas, como se muestra a continuación:



, donde X es un halógeno (pág. 15 y

16)³.

La reivindicación dependiente 16 tampoco cumple con el requisito de novedad.

5. Conclusión con respecto a novedad

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	Novedad	1 a 16	Novedad
D2	Novedad	15 a 16	Novedad

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de 2000, 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.

Si como respuesta a este requerimiento, el solicitante modifica: i) el capítulo reivindicatorio, ii) la descripción de la invención a proteger, iii) o presenta un nuevo capítulo reivindicatorio deberá observar las instrucciones contenidas en el numeral 1.2.2.1.1., del Capítulo Primero del Título X de la Circular Única y la Dirección de Nuevas Creaciones seguirá el procedimiento descrito en el numeral 1.2.2.5.1.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 6.2 del Capítulo Sexto del Título I de la Circular Única, informándoles que contra el mismo no procede recurso alguno en actuación administrativa.



Edna Marcela Ramirez Orozco
DIRECTORA DE NUEVAS CREACIONES

³https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/originalDocument?CC=CA&NR=2054653A1&KC=A1&FT=D&ND=3&date=19920502&DB=&locale=en_EP



Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0001052		1°	x	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2017/066510		3 de julio de 2017							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad			Presentación		
04/07/2016				x					
Solicitante									
BAYER CROPSOURCE AKTIENGESSELLSCHAFT									
Reivindicaciones que no son objeto de búsqueda por:									
Art. 14	-	Art. 15	-	Art. 20	-	Art. 25 (Falta de unidad de invención)		-	

CRITERIOS DE BÚSQUEDA	
Reivindicaciones objeto de búsqueda	1 a 16
Palabras clave utilizadas	Benzosultams OR "analogues benzothiazine" OR "1,2-benzothiazine-1,1-Dioxide Derivatives" AND quinoline AND fungicides "Heterocyclic compounds, nitrogen-sulfur" AND fungicides Benzotiazina AND quinolina AND fungicida
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 215/18, A01N 43/42, A01N 43/60, A01N 43/80, C07D 215/44, C07D 417/04, C07D 241/44, C07D 419/04, C07D 275/06
	CPC:

DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES (Documentos patente, Literatura no patente (LNP): Artículos, catálogos, etc.)					
Informes de búsqueda / Bases de datos consultadas	N° de solicitud de patente / N° de patente / Autor LNP ⁽¹⁾	Fecha de Publicación /Presentación (DD/MM/AAAA)	Reivindicaciones /Secuencias afectadas	Citas relevantes del estado de la técnica	Categoría del documento citado ⁽²⁾
Espacenet	WO2008073956	19/06/2008	1 a 16	Resumen; pág. 6, líneas 2, 11, 13, 14 y 24; pág. 7, líneas 3 a 5, 9 a 11, 17 a 20 y 21 a 23; págs. 48 a 58; pág. 119, ej. 57 y reiv. 37	X
Espacenet	CA2054653	2/05/1192	14 a 16	Páginas 15 y 16	X
STN	(1)	27/03/2016	14 a16	Resumen	X
SIPI	12008649	20/02/2012	-	-	A
Patbase	WO2004074280	2/09/2004	-	-	A
Patbase	US5132304	21/07/1992	-	-	A
Orbit	WO2009094445	30/07/2009	-	-	A
STN	(2)	2015	-	-	A
STN	(3)	2015	-	-	A
Googlepatent	WO2015141867	24/09/2015	-	-	A

(1) Debnath S., Malakar S., Mondal S. Regioselective Synthesis of 1, 2-Benzothiazine 1, 1-Dioxide Derivatives by Intramolecular Heck Cyclization, *Synthesis* 2016. pags. 3544 a 3550; recuperado desde: <https://www.thieme-connect.com/products/ejournals/html/10.1055/s-0035-1562440>.

(2) Debnath S. y Mondal S, One-pot Sonogashira coupling-cyclization toward regioselective synthesis of benzosultam, *The Journal of Organic Chemistry*, págs. 1 a 31; recuperado desde: <https://pubs.acs.org/doi/10.1021/acs.joc.5b00274>.

(3) Mi P., Liao P., Tu T. y Bi X., Decarbonylative CC Bond-Forming Reactions of Saccharins by Nickel Catalysis: Homocoupling and Cycloaddition; *ChemPubSoc Europe*; 2015; pags. 1 a 6; recuperado desde: <https://onlinelibrary.wiley.com/doi/abs/10.1002/chem.201406227>.

Oficio N° 200076 de 22 de abril de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

(2) Categorías de documentos citados	
“A” Documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante. “E” Solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación Internacional o en fecha posterior. “L” Documento citado para llamar la atención sobre por ejemplo, dudas acerca de una reivindicación de prioridad o para determinar la fecha de publicación de otra cita, siempre van acompañados de una explicación, por la cual se citan. “O” Documento del tipo actas de conferencia, este tipo de documentos siempre estará acompañado por otra letra que indique la pertinencia del documento, por ejemplo, O, X, O, Y o bien O, A. “P” Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	“T” Documento publicado en fecha posterior a la de presentación o la de prioridad de la solicitud internacional y no entra en conflicto con dicha solicitud, pero puede ser útil para la mejor comprensión del principio o teoría en que se basa la invención, o para demostrar que el razonamiento o los hechos en los que se basa dicha invención son incorrectos. “X” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado. “Y” Documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.
Fecha del reporte de búsqueda: (01/04/2020)	
Examinador: NINI JOHANA SCARPETA ROMERO	