

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 11420 de 11 de septiembre 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: 4/07/2016, 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 23 de julio de 2020, bajo el número NC2019/0001052, por ajustarse a los requisitos legales.

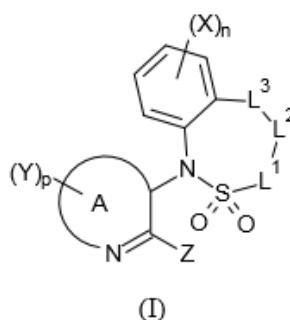
2. Objeto de la invención

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 11 del radicado N° NC2019/0001052 del 23 de julio 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° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

La expresión: "o" de la reivindicación 10 precediendo una característica no es limitativo, porque hace opcional la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente.

4. 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:

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
D3	Moutrille C. y Zard S. Z.	"A new approach for the ortho-substitution of anilines and for the synthesis of indolines"	2004
D4	Ueda T., Konishi H. y Manabe K.	Palladium-Catalyzed Reductive Carbonylation of Aryl Halides with N-Formylsaccharin as a CO Source	2013

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

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

El documento D3³ menciona un compuesto derivado de benzosultamas cíclicas sustituidas en el N heterociclo (pág. 2).

El documento D4⁴ divulga un proceso de síntesis de benzosultamas N sustituidas con un biciclo (pág. 8614).

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

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>.

³Recuperado desde: <https://www.sciencedirect.com/science/article/abs/pii/S0040403904009153>

⁴Recuperado desde: <https://onlinelibrary.wiley.com/doi/abs/10.1002/anie.201303926>

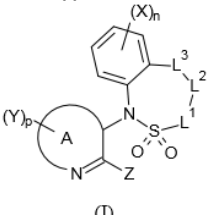
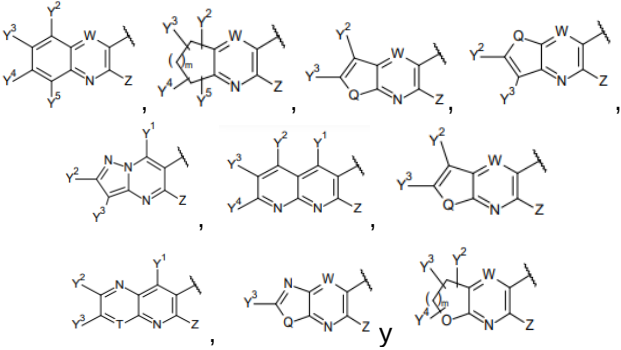
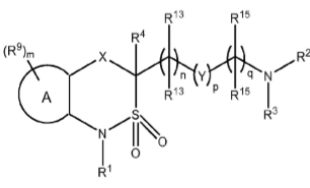
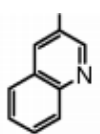
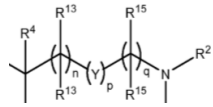
Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

5.1. Novedad (Art 16 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de fórmula (I)...” (Radicado N° NC2019/0001052 del 23 de julio 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):  (I) sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, metaloides e isómeros ópticamente activos o geométricos. Donde; A es  W es CY1 o N; T es CY4 o N; Q es O, S, o NY6; Y6 es H o metilo; Y1, Y2, Y3, Y4 y Y5 es independiente H o Y; Y es halógeno, metilo, halogenometilo, ciclopropilo, hidroxilo, metoxi, etoxycarbonilo o ciano; m es 1 o 2; y Z es H, halógeno, metil, halogenometil.	Un compuesto de fórmula (I):  Donde; (pág. 6, línea 2), R1 es  Los equivalentes a W, Y1 y Z son C, H e H respectivamente (pág. 119, ej. 57).
n es 0 o 1;	n es 0 o 1 (pág. 119, ej. 57).
X es halógeno; C1-C8-alquilo, halogenometil, halógeno metoxi, C2-C8-alquenilo, C2-C8 alquinilo, ciclopropilo, C1-C8-alcoxi, fenilo, heteroarilo, metilcarbonilo o trimetilsililo;	R9 es halógeno, metil o fenilo (pág. 112, ej. 51; pág. 116, ej. 53 y pág. 117, ej. 54).
L¹ es CR^{1a}AR^{1b} donde: R^{1a} y R^{1b} es H, halógeno; C1-C8-alquilo, C1-C8-halogenoalquilo o C2-C8-halogenoalquenilo, prop-2-in-1-ilo, propinilo, fenilo, fenil-C1-C8-alquilo, heteroarilo de 6 miembros con 1 a 4 heteroátomos de N, O y S, heterociclil-C1-C8-alquilo no saturado 5 o 6 miembros con 1 heteroátomo de N, O y S, o R1a y R1b junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un carbociclo o heterociclo saturado o parcialmente saturado de 3 a 6 miembros con 1 heteroátomo de N, O y S, o un indano, un espiro[n1.n2]-C5-C11-alquilo, donde n1 ≥ 2 y n1 + n2 = entre 4 y 10, un 2-oxaespiro[3.3]heptano, o un grupo metilideno sustituido con un di-C1-C8-alquil-amino;	Es , donde se selecciona un heterociclil-C2-C3-alquilo (pág. 6, línea 2; pág. 138, ej. 76; pág. 139, ej. 77);
L² es un enlace directo, CR^{2a}R^{2b}, C(=O), O, C=N-OR^{2d}, S donde R^{2a} y R^{2b} son independientemente H, halógeno, metilo, fenilo, hidroxilo, metoxi, aliloxi, propiniloxi, benciloxi opcionalmente sustituido por C1-C6-alquilo, ciano, halógeno, C1-C6-alquilsulfonilo, C1-C6-halogenoalquilsulfonilo, fenilo, benzoilo, metoxi, halogenometilo, C1-C6-halogenoalcoxi o fenoxi, naftalenil-metoxi, heterociclilmetoxi y	X es C(R¹¹)₂ o N(R¹²) o O (pág. 6, línea 11 y pág. 119, ej. 57);

Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

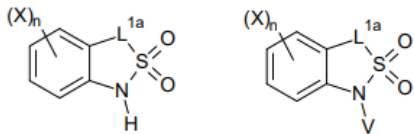
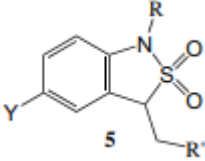
heterocicliometoxi bicíclico, o R2a y R2b junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo metilideno; R2d se selecciona entre el grupo que consiste en átomo de hidrógeno, C1-C8-alquilo, C2-C8-alquenilo, fenil-C1-C8-alquilo;	
L3 es un enlace directo, CR ^{3a} R ^{3b} , NR ^{3c} , con la condición de que L2-L3no representan un grupo peroxo [O-O], donde R ^{3a} , R ^{3b} y R ^{3c} son independientemente H.	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.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 9 tampoco cumplen con el requisito de novedad.

La reivindicación 11 consiste en: “Un compuesto caracterizado porque se selecciona...” (Radicado N° NC2019/0001052 del 23 de julio de 2020).

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

Características esenciales	D3
Un compuesto de fórmula (IIIa) y (IVa)  (IIIa) (IVa) y sus sales aceptables, Donde;	Un compuesto de fórmula 1a:  Donde; (pág. 4631);
X es halógeno; C1-C8-alquilo, halogenometil o halogenometoxi de hasta 3 átomos de halógeno, C2-C8-alquenilo, C2-C8 alquinilo, ciclopropilo, C1-C8-alcoxi, fenilo, heteroarilo de de 6 miembros con 1 a 4 heteroátomos de N, O y S, metilcarbonilo o trimetilsililo;	Y es halógeno (pág. 4632);
n es 0 o 1;	n es 0 o 1 (pág. 4632)
L1a representa CR1aR1b con R1a y R1b de acuerdo con la reivindicación 1 con la condición de que al menos uno de R1a o R1b no es un átomo de hidrógeno; y	L1a equivale a –C-CH2-R’ (pág. 2)
V es un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un C1-C6-alquilsulfonilo no sustituido o sustituido, un trifluorometilsulfonilo, un fenilsulfonilo no sustituido o sustituido, un C1-C6-alcoxycarbonilo no sustituido o sustituido, un benciloxycarbonilo no sustituido o sustituido o un aliloxycarbonilo;	R es bencilo o H (pág. 4632)

De acuerdo con la tabla anterior, las características esenciales del compuesto de la reivindicación 11 habían sido divulgadas previamente en el documento D3, por lo tanto, la materia reivindicada no es nueva.

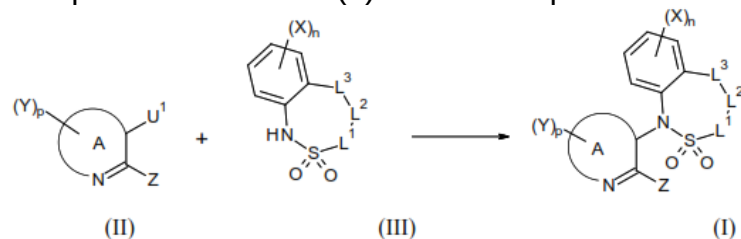
5.2. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 10 consiste en: “Un proceso para preparar un compuesto de fórmula (I)...” (Radicado N° NC2019/0001052 del 23 de julio de 2020).

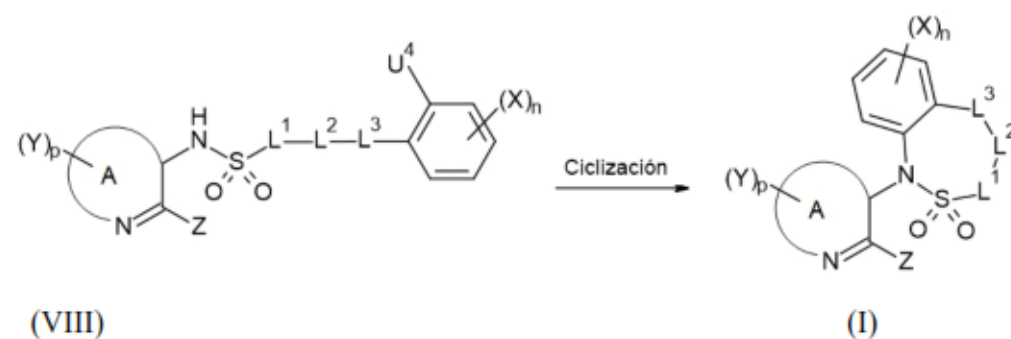
Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Dicho proceso se puede llevar a cabo mediante el paso de hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula (III)

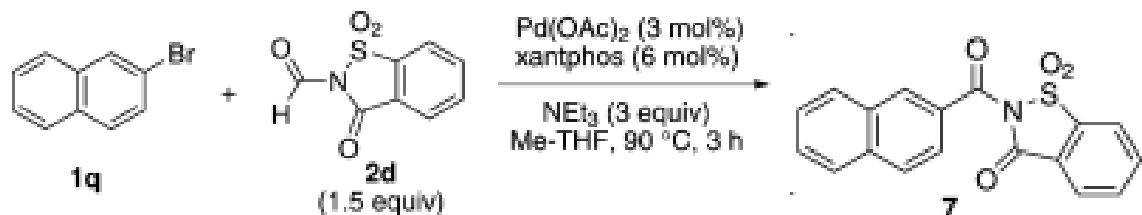


ó mediante, el paso de realizar una reacción de ciclización intermolecular:



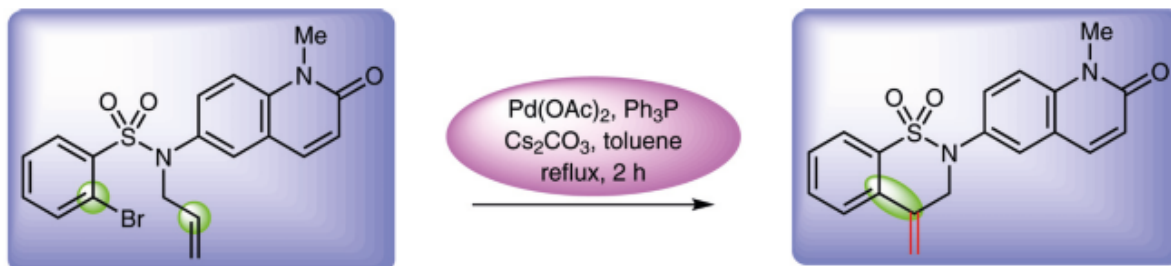
No obstante, cualquiera de estos dos etapas ya se habían dado a conocer en estado de la técnica.

La publicación de Ueda. Et al. 2013, ya había dado a conocer una reacción equivalente a la primera opción de la reivindicación 10, así:



(pág. 8614).

Mientras que la publicación de Debnath. Et al. 2016, ya había dado a conocer una reacción equivalente a la opción de la reivindicación 10, al realizar una reacción de ciclación intermolecular, así:



(resumen, pág. 3545 y 3546).



Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Al comparar cada uno de estos documentos, con cada una de las opciones que presenta la reivindicación 10, se observa que la diferencia radica en el patrón de sustitución particularmente en que el radical A es un biciclo que contiene N y está unido en la posición 3. No obstante, no se observa un efecto técnico asociado a la diferencia.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el proceso de síntesis conocido en D2 o en D4 con el fin de tener un proceso alternativo?

Sin embargo, el incluir un radical A que es un biciclo que contiene N en la posición 3, ya está divulgado en el documento D1 que se refiere a compuestos derivados de benzosultamas cíclicas sustituidas en el N heterociclo con biciclos (pág. 119, ej. 57).

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia estaría motivada a incluir el biciclo que contiene N en la posición 3 como en D1 en el proceso de D2 o en el proceso de D4, para así llegar al objeto de la reivindicación 10. Por lo cual se considera obvia.

6. Conclusión con respecto a novedad y/o nivel inventivo

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

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO2008073956	1 a 9	Novedad
		10	Nivel Inventivo
D2	Debnath S., Malakar S., Mondal S.	10	Nivel inventivo
D3	Moutrille C. y Zard S. Z.	11	Novedad
D4	Ueda T., Konishi H. y Manabe K.	10	Nivel inventivo

7. Respuesta a los argumentos del solicitante

Argumentos respecto a D1

El solicitante argumenta que D1 no afecta la novedad de la presente solicitud ya que L1 en los compuestos de formula (I) no pueden representar un alquil-amino, como lo enseña el documento D1.

Se aclara al solicitante que contrario a lo que manifiesta, D1 si afecta la novedad de la presente solicitud, toda vez que enseña que el equivalente a L1 del compuesto de fórmula (I) es un alquilo donde R2 y R3 se unen al nitrógeno para formar un anillo heterociclo que comprende heteroátomos como N, O, S o SO₂ (pág. 43, líneas 22 a 24; pág. 74, ej. 6; pág. 97, ej. 29).

Argumentos respecto a D2

El solicitante sostiene que D2 no describe la ciclación del compuesto de fórmula (VIII) ni la obtención del compuesto de fórmula (I), por esta razón sostiene que D2 no afecta la novedad de la presente solicitud.

Oficio N° **11420** de **11 de septiembre de 2020**

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

Se aclara al solicitante que tiene razón D2 no enseña exactamente un compuesto de fórmula (VIII), sin embargo, enseña un proceso de ciclación de un compuesto similar al de fórmula (VIII), la diferencia es que el radical A esta unido en la posición 3 respecto al N del anillo, por esta razón D2 no afecta la novedad de la presente invención, pero si el nivel inventivo (ver ítem 5.2).

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



Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2019/0001052		1°		2°	X	3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional:							
PCT/EP2017/066510		3/07/2017							
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 11
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 9 10	Resumen; pág. 6, líneas 2, 11 y 13; pág. 7, líneas 3 a 5 y 9 a 11; págs. 48 a 58; pág. 119, ej. 57 y reiv. 37	X Y
Espacenet	(1)	2004	11	Página 2	X
STN	(2)	27/03/2016	10	Resumen	Y
STN	(3)	2013	10	Página 8614	Y
STN	(4)	2015	-	-	A
SIPI	12008649	20/02/2012	-	-	A
Patbase	WO2004074280	2/09/2004	-	-	A
Orbit	WO2009094445	30/07/2009	-	-	A
Googlepatent	WO2015141867	24/09/2015	-	-	A

(1) Moutrille C. y Zard S. Z., A new approach for the ortho-substitution of anilines and for the synthesis of indolines, *Tetrahedron Letters* 45 2016, págs. 4631 – 4634; recuperado desde: <https://www.sciencedirect.com/science/article/abs/pii/S0040403904009153>

(2) 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>

(3) Ueda T., Konishi H. y Manabe K., Palladium-Catalyzed Reductive Carbonylation of Aryl Halides with N-Formylsaccharin as a CO Source, *Angewandte*, vol. 52, 2013, págs. 8611-8615; recuperado desde: <https://onlinelibrary.wiley.com/doi/abs/10.1002/anie.201303926>

Oficio N° 11420 de 11 de septiembre de 2020

Ref. Expediente N° NC2019/0001052

(1) Mi P., Liao P., Tu T. y Bi X., Decarbonylative CC Bond-Forming Reactions of Saccharins by Nickel Catalysis: Homocoupling and Cycloaddition; <i>ChemPubSoc Europe</i> ; 2015; pags. 1 a 6; recuperado desde: https://onlinelibrary.wiley.com/doi/abs/10.1002/chem.201406227 .	
(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: (1/09/2020)	
Examinador: NINI JOHANA SCARPETA ROMERO	