

REPÚBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

Señor(a)
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

TÍTULO DE LA SOLICITUD: “**DERIVADOS HETEROBICÍCLICOS MICROBICIDAS**”
NÚMERO DE SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/EP2016/068890
FECHA DE PRESENTACIÓN INTERNACIONAL: 8 de agosto de 2016.
PRIORIDAD(ES): 12/08/2015, EP (EUROP PATENT ORGANIZATION (EPO)), 15180771.6

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 15 de junio de 2018, bajo el número NC2018/0001266, por ajustarse a los requisitos legales.

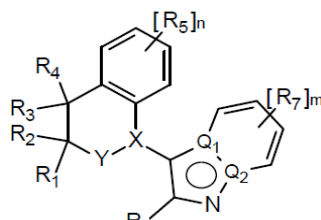
2. Objeto de la invención

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 13 del radicado N° NC2018/0001266 del 15 de junio de 2018.

El problema planteado en esta solicitud consiste en la necesidad de proporcionar principios activos, con actividad microbicida, en particular actividad fungicida, que puedan ser empleados en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimentarios recolectados, semillas o materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos, en particular hongos.

Para resolver este problema técnico, la solicitud en estudio proporciona compuestos derivados de heterobicíclicos de acuerdo con la Formula (I) y composiciones que los contienen.



Formula (I)



Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

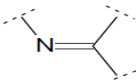
Ref. Expediente N° NC2018/0001266

3. De la solicitud de patente

3.1. Reivindicaciones (Art. 30 Decisión 486)

- La reivindicación 1 no es concisa porque las definiciones de R1 y R2, R3 y R4, R5, R6 y R7 abarcan una amplia variabilidad estructural, lo que da pie a compuestos que no se encuentran comprendidos dentro del objeto de la solicitud, generando que se incremente de forma considerable su complejidad, y por lo tanto no permite establecer el real alcance de lo que se protege; se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado o probado de acuerdo con lo enseñado en la siguiente Tabla 1:

Tabla 1. Ejemplos de los radicales soportados

Radical	Soporte de los ejemplos presentados
Q1	C, N
Q2	C, N
Y-X	G1 
R1 y R2	-Me, ciclobutil, ciclopropil, H
R3 y R4	-Me, -OH, Br, C=O, ciclobutil, ciclopropil, F, H o -NOCH ₃
R5	-Me, Br, Cl, F, H, I
R6	-Me, H
R7	-C≡CH, -CF ₃ , -Et, -Me, -OCH ₂ C≡CH, -OMe, -OH, -SCH ₃ , , ciclopropil, CN, Cl, F, Br, I, O-CHF ₂ , -H

El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción.

- Las expresiones: "*preferentemente*" y "*preferiblemente*" (Reivindicaciones 1, 7-10) precediendo una característica no son limitativas, porque hacen opcional la característica y no limita el alcance de la reivindicación. Se sugiere incluir las características opcionales o preferentes en una reivindicación dependiente. .
- En la reivindicación 11 la palabra “átamo” es incorrecta. Se sugiere reemplazarla por “átomo”.

3.2. Descripción (Art. 28 Decisión 486 literal (c))

- En la Pág. 33, Línea 10, después del número 195 hace falta la palabra “componentes”.
- En la Tabla E (Pág. 155) no aparecen los ejemplos E76 y E77, se sugiere eliminar la referencia que se hace de estos en los ejemplos biológicos (Pág. 162, 163, 164, 165 y 167).
- La descripción emplea las unidades hectárea (ha) (Pág. 101, Línea 15, 16). Se sugiere hacer la conversión de unidades al Sistema Internacional (m²).

4. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha para determinar el estado de la técnica es el 12 de agosto de 2015, que corresponde a la fecha de presentación de la solicitud de prioridad.

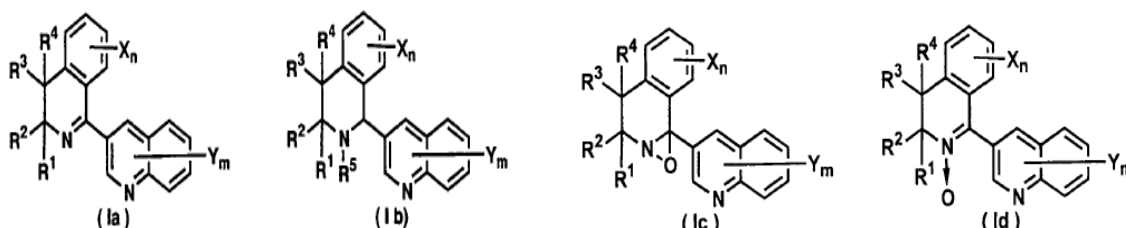
Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

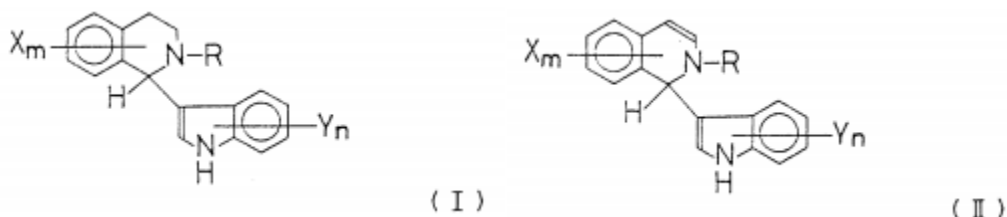
Consultadas las fuentes de información con que se cuenta, se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Ítem	Documento	Título	Fecha de Publicación
D1	US2008275242	“3-(DIHYDRO(TETRAHYDRO)ISOQUINOLIN-1-YL)QUINOLINE COMPOUND”	06 de noviembre de 2008
D2	JPS62294679	“NOVEL ISOQUINOLINE DERIVATIVE ”	22 de diciembre de 1987

D1¹ divulga compuestos que ejercen excelentes actividades fungicidas contra diversas enfermedades de las plantas y son útiles como ingredientes activos de pesticidas que permiten el control del añublo del arroz, incluso en dosis bajas. Compuestos representados por las fórmulas generales (1a) a (1d) o sus sales (Resumen).



D2² divulga un compuesto expresado por la fórmula I o II (X es alquilo, halógeno o nitro; Y es alquilo, halógeno, nitro, amino, OH o carboxi; R es alquilo; m y n son 0-2). Empleado como germicida agrícola u hortícola o intermedio del mismo (Resumen).



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

5.1. Nivel Inventivo (Art. 18 Decisión 486)

La reivindicación 1 consiste en: “Un compuesto de fórmula (I)” (Radicado N° NC2018/0001266 del 15 de junio de 2018).

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

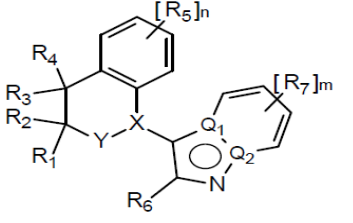
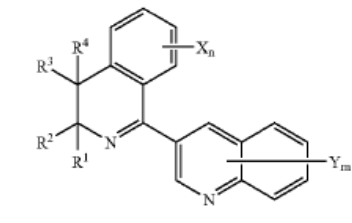
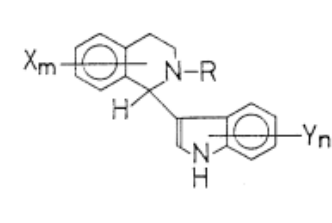
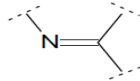
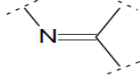
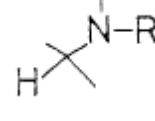
Características esenciales	D1	D2
----------------------------	----	----

¹https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20081106&CC=US&NR=2008275242A1&KC=A1

²https://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=19871222&CC=JP&NR=S62294679A&KC=A

Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

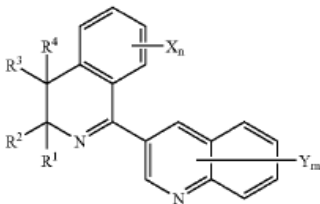
 Compuesto de Formula (I)	 Compuesto I(a) (Reivindicación 1)	 Formula I (Reivindicación 1)
Q1 es un átomo de nitrógeno Q2 es un átomo de carbón o Q1 es un átomo de carbono Q2 es un átomo de nitrógeno	_____	átomo de carbono (Reivindicación 1)
Y-X representa un radical G1: 	 (Reivindicación 1)	 (Reivindicación 1)
R1 y R2= hidrógeno o alquilo C1-C4, en el que el grupo alquilo esta no sustituido o sustituido con 1 a 3 sustituyentes: halógeno y alcoxi C1-C6, entre otros. juntos con el átomo de carbono al cual se encuentran unidos representan un grupo cicloalquilo C3-C5	R1 y R2= pueden ser iguales o diferentes y representan un grupo alquilo C1-C6 que puede estar sustituido con 1 a 3 sustituyentes: halógeno, grupo alcoxi C1-C6, grupo alquiltio C1-C6. juntos representan un grupo cicloalquilo C3-C10. (Reivindicación 1)	X= en la fórmula es una grupo alquilo, halógeno o grupo nitro
R3 y R4= hidrógeno, halógeno, alquilo C1-C4 y cicloalquilo C3- C4, en el que los grupos alquilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos por halógeno, alcoxi C1- C3 entre otros. Junto con el átomo de carbono al que están unidos representan C=O, C=NORd o cicloalquilo C3- C6 cicloalquilo están no sustituidos o sustituidos con 1 a 3 sustituyentes entre otros.	R3 y R4= hidrógeno; un grupo alquilo C1- C6 que puede estar sustituido con 1 a 3 sustituyentes, seleccionados de halógeno, grupo alcoxi C1-C6. Junto representan un grupo cicloalquilo C3-C10 que puede estar sustituido con 1 a 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, grupo alquilo C1-C6, Grupo alcoxi C1-C6 (Reivindicación 1)	X= en la fórmula es una grupo alquilo, halógeno o grupo nitro

Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

R5= halógeno, ciano, alquilo C1-C4, cicloalquilo C3-C4, alcoxi C1-C3, alqueniloxi C3-C6, alquiniloxi C3-C6, fenilo, heteroarilo (en donde el heteroarilo es piridilo, tiazonilo o oxazonilo entre otros. n es 0, 1 o 2	X= halógeno; un grupo alquilo C1- C6, un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo fenoxi; un grupo arilo que puede estar sustituido con 1 a 6 grupo aralquilo, grupo arilo y grupo heteroarilo. n representa un número entero de 0 to 4 (Reivindicación 1)	X= en la fórmula es una grupo alquilo, halógeno o grupo nitro n son números enteros de 0 a 2 (Reivindicación 1)
R6= es hidrógeno, fluor, cloro, o metilo R7= ciano, halógeno, alquilo C1- C4, haloalquilo C1-C4, alquinilo C2-C3, alquiltío C1-C4 o cicloalquilo C3-C4; y m es 0, 1 o 2; o una sal o N-óxido del mismo	Y= halógeno, un grupo alquilo C1- C6, un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo hidroxilo; m representa un número entero de 0 a 6 (Reivindicación 1)	Y= representa un grupo alquilo, un halógeno, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxil o un grupo carboxil, m son números enteros de 0 a 2 (Reivindicación 1)

D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga compuestos que ejercen excelentes actividades fungicidas contra diversas enfermedades de las plantas y son útiles como ingredientes activos de pesticidas que permiten el control del añublo del arroz incluso en dosis bajas, representados por la fórmulas general 1(a) o sus sales (Resumen). Los compuestos pueden usarse como agentes antimicrobianos agrohortícolas y son superiores como agentes antimicrobianos agrohortícolas ya que demuestran efectos sobresalientes contra varios patógenos de plantas sin causar daño a la planta huésped (Párr.0991).



Formula 1 (a)

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto de fórmula I(a) divulgado en D1 es el anillo bicíclico con el que está sustituido la isoquinolina.

No hay efecto asociado a variar el anillo bicíclico con el que está sustituido la isoquinolina, para toda la generalidad reclamada. Si bien en la descripción (Pág. 162) se realizan ensayos contra *Botrytis cinerea* donde se observa un control de al menos un 80% a 20 ppm, y en D1 (Párr. 0983) se realizan ensayos contra *Botrytis cinerea* presentando control a 300 ppm; dichos compuestos evaluados en la presente solicitud solo representan a una pequeña parte del alcance de la protección de la reivindicación 1. Por lo tanto, no existe alguna evidencia que indique que dicha generalidad reclamada tenga alguna ventaja

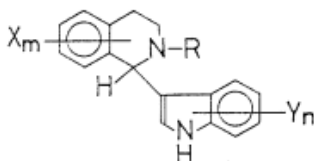
Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

técnica en su actividad fungicida sobre los compuestos fungicidas ya conocidos en la anterioridad D1.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar los compuestos conocidos en D1 con el fin de obtener compuestos con actividad fungicida alternativos?

Sin embargo, reemplazar el anillo bicíclico que sustituye la isoquinolina en compuestos fungicidas, ya está divulgado en D2 que se refiere a un nuevo derivado de isoquinolina que de fórmula general I, que es útil como fungicida para agricultura y horticultura o un intermedio de los mismos (Resumen). El compuesto es eficaz contra la úlcera bacteriana de la mandarina y la enfermedad de la mancha negra de la mandarina por hongos filamentosos, que son enfermedades importantes de la mandarina (Párr. 0001). Los compuestos fueron probados contra tizón de arroz, plaga de pepino y manchas solares, en concentraciones de aproximadamente 1000 ppm se obtuvo una supresión de hasta el 83% (Ejemplos, Pág. 815-816). Es importante resaltar que si bien el biciclo enseñado en D2 no es el mismo que es reclamado en la presente solicitud, son estructuralmente similares al ser isómeros³. Se reitera que no es posible establecer un efecto sorprendente para toda la generalidad reclamada.



Formula I

En consecuencia, la persona normalmente versada en la materia, estaría motivada a incluir el anillo bicíclico que sustituye a isoquinolina de D2 junto con modificaciones rutinarias en el compuesto de fórmula (I) de D1, para así llegar al objeto de la reivindicación 1. Por lo cual se considera obvia.

Las reivindicaciones dependientes 2 a 12 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al producto de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no tienen nivel inventivo.

Asimismo, se señala que la composición que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I) reclamada en la reivindicación 13 no tiene nivel inventivo, porque los compuestos de fórmula (I); están sugeridos en el estado de la técnica (D1, Reivindicación 1, 12); D2, (1, Párr. 0001) y porque no hay evidencia del efecto técnico logrado por la composición reivindicada.

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	US2008275242	1 a 13	Nivel Inventivo
D2	JPS62294679	1 a 13	Nivel inventivo

³ Koyanagi, T. et al. (1995) Bioisosterism in Agrochemicals. Synthesis and Chemistry of Agrochemicals IV. Capítulo 2, pp 15-24. <https://pubs.acs.org/doi/abs/10.1021/bk-1995-0584.ch002>

Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

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 el 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 de esta Superintendencia. De igual forma, deberá tener presente que de conformidad con el literal a) del numeral 1.2.2.5.1. de la norma ibidem, será necesario acreditar el pago de la tasa por concepto de modificación a solicitudes en trámites, de conformidad con el valor establecido en la resolución de tasas vigentes.

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° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

INFORME DE BÚSQUEDA
EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Solicitud No.		Examen de patentabilidad							
NC2018/0001266		1°	X	2°		3°		Revoca	
Solicitud Internacional No.		Fecha solicitud internacional: (DD/MM/AÑO)							
PCT/EP2016/068890		8 de agosto de 2016							
Fecha de determinación estado de la técnica (DD/MM/AÑO)				Prioridad		Presentación			
12 de agosto de 2015				X					
Solicitante									
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG									
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	1-13
Palabras clave utilizadas	Búsqueda por estructura, heterobicyclic, microbiocidal, fungicidal activity, pesticide, fungicide, composition, agricultural, horticulture
Clasificaciones utilizadas para la búsqueda	CIP: C07D 471/04, A01N 43/52
	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⁾
ISA	EP1736471	27/12/2006	-	-	A
	WO2016156085	06/10/2016	-	-	A,P
STNext	JPS62294679	22/12/1987	1-13	(Reivindicación 1, Ejemplos, Pág. 815-816, Párr. 0001)	Y
	WO2007011022	25/01/2007	-	-	A
	JP2007217353	30/08/2007	-	-	A
	US2008275242	06/11/2008	1-13	(Reivindicación 1, Párr. 0991)	Y
Patbase	JP2011506417	3/03/2011	-	-	A
	US2009111805	30/04/2009	-	-	A
	US2007275962	29/11/2007	-	-	A
	US3755365	1973-08-28	-	-	A
Orbit	EP3582616	25/12/2019	-	-	A,P
	EP2517562	31/10/2012	-	-	A
	EP1427415	16/06/2004	-	-	A
	TW200740788	1/11/2007	-	-	A
⁽¹⁾ Cita completa literatura no patente (LNP)					
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Volumen (Número), pp-pp.					

Oficio N° 1599 de 8 de febrero de 2021

Ref. Expediente N° NC2018/0001266

O	
Apellido, A. A. (Fecha). Título del artículo. Nombre de la revista. Recuperado de http://xxxxxxx.	
(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: (22/01/2021)	
Examinador: Nubia Milena Pinzón Ibañez	