

SEÑOR MINISTRO DE COMERCIO, INDUSTRIA Y TURISMO
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
E. S. D.

812 831 831 803

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 00-083069- -00023-0000

Fecha: 2009-11-05 15:24:49 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 2 PATENTES Eve: 1 REGDEPOSITO
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 21

Ref.

EXPEDIENTE

00 083069

PATENTE

DERIVADOS (TIONA) AMINOQUINAZOLINONA
SUSTITUIDOS O SALES DE LOS MISMOS,
COMPUESTOS INTERMEDIOS DE LOS MISMOS,
CONTROLADORES DE PLAGAS Y UN METODO PARA
UTILIZACION DE LOS MISMOS

CLASE

A01N 43/54

SOLICITANTE

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

TRAMITE

PATENTE

EVENTO

REGISTRO

ACTUACION

RECURSO DE REPOSICIÓN
RESOLUCIÓN No. 49912 DE SEPTIEMBRE 30 DE 2009

El suscrito GERMAN A. CUBILLOS MENDOZA, abogado en ejercicio, con C.C. N° 19'397.479 de Bogotá y T.P. N° 38.422 del C. S. de la J. actuando en mi calidad de apoderado de la sociedad NIHON NOHYAKU CO., LTD., sociedad domiciliada en Tokio, Japón, por el presente y dentro del término legal interpongo el recurso de reposición contra la Resolución de la referencia, por medio de la cual se niega la patente de invención del rubro, a fin de que se revoque y en su lugar se conceda el privilegio de la patente de invención, de conformidad con los siguientes argumentos y alegatos:

1. De conformidad con el **Artículo 34.-** El solicitante de una patente podrá pedir que se modifique la solicitud en cualquier momento del trámite. La modificación no podrá implicar una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

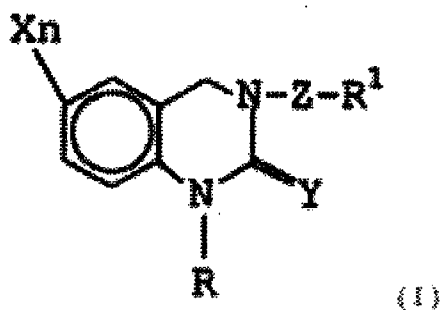
Del mismo modo, se podrá pedir la corrección de cualquier error material."

Avalado por la norma mencionada, presento nuevo capítulo reivindicatorio como sigue:

824832
2006
804

REIVINDICACIONES

1. Un derivado aminoquinazolinona sustituido caracterizado porque está representado por la fórmula general (I), o una sal del mismo con un ácido mineral o un átomo de metal alcalino:

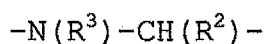


en donde R es un átomo de hidrógeno ó COCH_3

R^1 es un grupo 3-piridilo;

Y es un átomo de oxígeno,

Z es



(en donde R^2 y R^3 es un átomo de hidrógeno),

X es un grupo de $i\text{-C}_3\text{F}_7$; y n es un entero de valor 1.

2. Una composición que comprende como ingrediente activo de 0,01 a 50% por peso de un derivado aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo según se indica en la reivindicación 1 y un vehículo inerte.

2. En relación al numeral 2. "Modificaciones no aceptadas" de la Resolución recurrida, dice esta que no se acepta el último pliego de reivindicaciones presentado el 15 de Septiembre de 2008 (folios 758 y 759) porque la reivindicación 1 incluye nuevamente el significado $-\text{N}=\text{CH}$ para Z, el cual fue objetado en los requerimientos de fondo.

837807
8378
805

Ello significa que quedan en firme las anteriores modificaciones hechas a esta solicitud en relación a las reivindicaciones, es decir, las presentadas el día tres de Abril de 2008.

Hemos modificado la presente reivindicación 1 con limitación de Xn a 6-i-C₃F₇.

A partir de esas últimas modificaciones, también limitamos la invención que se establece en la reivindicación 1 solo a los compuestos Nos. 200 y 448 según figura en las tablas de la presente Descripción.(VER ANEXO 1)

Renunciamos al compuesto No. 22 porque dicho compuesto tiene N=CH como Z. (VER ANEXO 2).

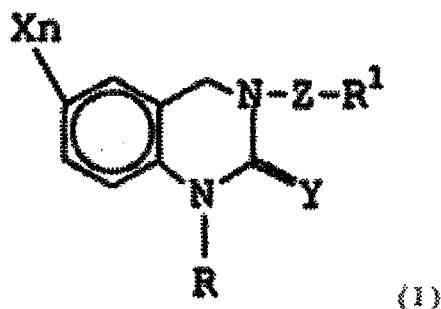
Por su parte, la anterior reivindicación 2 ha sido eliminada, de modo que cualquier objeción al respecto queda superada.

3. En relación al numeral 3 de la Resolución en mención, subtulado "No se cumple con el artículo 28":

La presente Descripción si divulga que se prefieren los compuestos que tienen 6-i-C₃F₇ como Xn en comparación con los otros, tal como se explica a continuación;

- 3.1. La presente Descripción señala a folio 83 que los compuestos Nos. 6, 18, 22, 26, 184, 200, 204 y 208 demostraron excelente efecto insecticida contra las tres plagas de insectos probadas, es decir, el pulgón verde del duraznero (**GPA**) Green Peach Afid,(Mizus Persicae), la langosta marrón de arroz (**BPH**) Brown Plant Hopper (**Nilaparvata Lugens**) y la mosca blanca de invernadero(**GWF**) Greenhouse White Fly(**Trialeouros vaporarium**), mientras que los de los Nos. 14, 38, 78, 86 y 90 fueron eficaces solo contra la mosca blanca de invernadero, y además a menor grado.
- 3.2. La siguiente tabla resume los resultados de las pruebas insecticidas que se mencionan arriba en relación con sus estructuras químicas, en particular, el sustituyente en la posición 6, es decir "Xn" en el anillo de quinazolina de la fórmula (I);

05/2008
4
864
82



Compuesto No.	Xn	R	R ¹	Y	Z	Efecto insecticida		
						GPA	BPH	GWF
6	6-Br	H	3-piridil	O	-N=CH-	A	A	A
18	6-C ₂ F ₅					A	A	A
22	6-i-C ₃ F ₇					A	A	A
26	6-n-C ₆ F ₁₃					A	A	A
30	6-OCF ₃					A	A	A
184	6-Br				-N-CH ₂ -	A	A	A
200	6-i-C ₃ F ₇					A	A	A
204	5-n-C ₆ F ₁₃					A	A	A
208	6-OCF ₃					A	A	A
10	6-i				-N=CH-	- ^a	-	B-D
14	6-CF ₃					-	-	B-D
38	6-OCHF ₂					-	-	B-D
78	6-COOC ₂ H ₅					-	-	B-D
86	6-Ph					-	-	B-D
90	6-(4-Cl-Ph)					-	-	B-D

a: No se describe en la Descripción

Debe observarse que todos los compuestos que se describen como insecticidas contra al menos una de las plagas de insectos probadas, solo los que tienen 6-Br (Compuestos Nos. 6 y 184), 6-OCF₃ (Compuestos Nos. 30 y 208) y 6-i-C₃F₇ (Compuestos Nos. 22 y 200) como Xn demostraron efecto insecticida Grado A contra las tres plagas de insectos probadas. Por lo tanto, una persona versada en la técnica puede dilucidar de estos resultados que al menos los compuestos que tengan 6-Br, 6-OCF₃ o 6-i-C₃F₇ como Xn deben ser compuestos preferibles de la fórmula (I).

- 3.3. Al mismo tiempo, la presente Descripción hace una lista de compuestos específicos en las Tablas 3 y 4, en los cuales los compuestos que tienen 6-i-C₃F₇ como Xn son más abundantes en número:

Las tablas incluyen 27 compuestos (Nos. 22, 278, 178.6, 200, 426, 430, 434, 437, 438, 440, 444, 448, 452, 456, 460, 464, 484 a 494) mientras que con respecto a los compuestos que tienen 6-Br o 6-OCF₃, que son los otros dos sustituyentes preferibles como se indican arriba, solo 10 compuestos se aparecen específicamente.

Así, una persona versada entendería naturalmente que de los tres sustituyentes preferibles para Xn, es decir: 6-Br, 6-OCF₃ y 6-i-C₃F₇, 6-i-C₃F₇ serían los más preferibles comparando los números de los compuestos específicos que figuran en la presente Descripción.

- 3.4. Tal entendimiento no es para nada contradictorio con lo que se describe en la Descripción con respecto a los sustituyentes preferibles para Xn.

Nótese que el "grupo halo-alquilo (C₁-C₆)" que abarca 6-i-C₃F₇, se menciona como uno de los sustituyentes preferibles de X(n) en folio 16, penúltima y última línea de la presente Descripción.

- 4.0. Lo anterior coincide con los resultados de otra prueba insecticida contra las cinco especies de plagas de insectos que adjuntamos en nuestro memorial del 3 de Abril de 2008;

Prueba Comparativa Adjunta – Ejemplos 1-2 y Conclusión presentada el 3 de Abril de 2008.

Presentamos la Prueba Comparativa adjunta – Ejemplos 1-2 y Conclusión (VER ANEXO 3)

- 4.1. El Ejemplo 1 de la Prueba Comparativa sirve para demostrar la actividad controladora deseable de los compuestos que contengan un grupo i-C₃F₇ como sustituyente X de varios insectos dañinos.
- 4.2. En la Tabla 1 del Ejemplo 1 de la Prueba Comparativa, los últimos ocho compuestos ubicados en la parte de debajo de la Tabla, son representativos de los compuestos reivindicados, los cuales contienen un grupo i-C₃F₇ como sustituyente X. Tal como se observa en la Tabla 1, estos compuestos muestran la mejor clasificación "A" para todos los cinco insectos que se usaron en la prueba.
- 4.3. En la Tabla 1 del Ejemplo 1 de la Prueba Comparativa, los primeros diez compuestos ubicados en la parte superior de la Tabla, son representativos de los compuestos estructuralmente cercanos que describe la técnica anterior, los cuales contienen un grupo diferente del grupo i-C₃F₇ como sustituyente X. Tal como se observa en la Tabla 1, estos compuestos muestran resultados no deseables a *Stenchaetothrips biformis*, *Trialeurodes vaporariorum* y *Pseudaulacaspis pentagona*.
- 4.4. Por lo tanto, los compuestos reivindicados que contengan el grupo i-C₃F₇ como sustituyente X tienen un espectro insecticida mucho más amplio que los compuestos que describe la técnica anterior.
- 4.5. En la Tabla 1 no se observa ninguna diferencia clara en actividad insecticida frente a un áfido del algodón y áfido del repollo en tan alta concentración de 10 ppm. Con el fin de comparar la actividad insecticida en el *Stenchaetothrips biformis*, *Trialeurodes vaporariorum* y *Pseudaulacaspis pentagona* de los compuestos reivindicados y los compuestos estructuralmente más cercanos que describe con mayor precisión la técnica anterior se hizo la Prueba Comparativa con el Ejemplo 2.
- 4.6. En el Ejemplo 2 de la Prueba Comparativa, los compuestos de prueba 1-3 son representativos de los compuestos que se reivindican en la presente invención, los cuales contienen un grupo i-C₃F₇ como sustituyente X. Tal como se observa en la Tabla 2, muestran valores LC₉₀ estimados muy pequeños. Esto significa que son efectivos en una cantidad pequeña.
- 4.7. Por el contrario, en el Ejemplo 2 de la Prueba Comparativa, los compuestos Comparativos 1-3 son representativos de los compuestos estructuralmente más cercanos que describe la técnica anterior, que contienen un grupo CF₃ como sustituyente X. Tal como se observa en la Tabla 2, estos compuestos muestran

grandes valores LC_{90} estimados. Esto significa que no son efectivos en una pequeña cantidad.

- 4.8. Los compuestos reivindicados exhiben una actividad de 3 a 100 veces más alta a estos insectos que los compuestos comparativos en cualquier conjunto de comparación.

Por lo tanto, los compuestos que se reivindican en la presente invención tienen excelentes efectos provechosos que no se esperaron de la técnica anterior.

Es decir, solo los compuestos que tenían 6-i- C_3F_7 como Xn demostraron excelente actividad insecticida contra las cinco especies probadas.

- 4.9. Además, comparando con los compuestos que tenían 6-Br (tercer compuesto de arriba a abajo) o 6- OCF_3 (sexto compuesto de arriba a abajo) que figuran en la tabla 1, compilando los resultados de prueba arriba mencionados contra cinco especies de insectos, el que tenía 6-i- C_3F_7 como Xn (el compuesto al final) demostró un espectro insecticida mucho más amplio:
- 4.10. Los dos compuestos anteriores demostraron eficacia Grado A contra el áfido del algodón (**Aphis gossypii**) y el áfido del repollo (**Brevicoryne brassicae**), pero ninguna eficacia contra el gorgojo del arroz (**Stenchaetothrips biformis**), la mosca blanca de invernadero (**Trialeurodes vaporarum**) y el áfido blanco del duraznero (**Pseudalacaspis pentagona**). (Ver ANEXO 3)

Reiteramos que la presente Descripción sí divulga que los compuestos que tienen 6-i- C_3F_7 como Xn son los compuestos preferibles.

5. Contrario a lo afirmado en la Resolución, emplear $COCH_3$ para R según aparece en el compuesto No. 448 es una materia técnica conocida con referencia a las descripciones en D2 pero se limita al caso donde Xn no es 6-i- C_3F_7 .
- 5.1. Confirmamos que dicho documento divulga que acilo, que abarca $COCH_3$, es el mejor sustituyente en el átomo de nitrógeno en la posición 1 del anillo de quinazolina entre los sustituyentes investigados según se ejemplifica en la **Figura 2** del mismo.
- 5.2. Sin embargo, debe observarse que dicha teoría es únicamente aplicable a los compuestos que tienen un sustituyente diferente de 6-i- C_3F_7 como Xn debido a que D2 no hace ninguna mención acerca de la superioridad de 6-i- C_3F_7 , y mucho menos a la combinación del mismo con $COCH_3$ para R.
- 5.3. En este campo técnico es bien conocido que un compuesto que tenga un sustituyente para una cierta posición puede perder en forma drástica la actividad biológica si uno de los otros sustituyentes ha cambiado. Es decir, mencionar un cierto sustituyente únicamente para una posición no predice para nada la mejor combinación de los sustituyentes y sus posiciones.
6. En cuanto a D1, dicho documento tampoco menciona nada acerca de la superioridad de 6-i- C_3F_7 y su combinación con $COCH_3$ para R.

Lo anterior concuerda con nuestro anterior argumento de que $COCH_3$ para R siendo una materia técnica conocida, no destruiría un paso inventivo de la presente invención debido a que los presentes compuestos pueden asegurar un paso inventivo empleando 6-i- C_3F_7 como Xn. Por el contrario, la presente invención podría

B5780
7007
828

distinguirse además de la técnica anterior por la combinación de COCH_3 o H para R y 6-i- C_3F_7 para Xn.

7. Objeción en relación con el Artículo 28

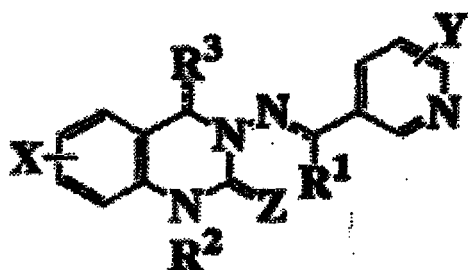
- 7.1. Tal como lo explicamos arriba, de hecho, la Descripción contiene suficiente divulgación y soporte técnico en el sentido de que los compuestos reivindicados son ventajosos sobre los que no tienen 6-i- C_3F_7 como Xn.
- 7.2. Además, según se explica arriba, una persona versada puede dilucidar de la presente Descripción que los compuestos en la modificación propuesta tienen una mejor eficacia que los otros que no tengan 6-i- C_3F_7 como Xn.
- 7.3. La Resolución indica que "la descripción de la solicitud no divulga o contiene un soporte técnico suficiente para indicar que los compuestos más preferidos de todos los compuestos reivindicados son los que tienen el sustituyentes $\text{X}=\text{i-C}_3\text{F}_7$ "
- 7.4. Podemos admitir que no hay descripciones explícitas de modo que "el compuesto más preferido de todos los compuestos que se reivindican sean los que tienen el sustituyente $\text{X}=\text{i-C}_3\text{F}_7$ ".
- 7.5. Pero en referencia al Artículo 28, que indica que "la Descripción divulgará la invención en forma suficientemente clara y completa para que se entienda y para que una persona versada en la técnica pueda ejecutarla" no hay duda con respecto a la divulgación suficiente de la presente Descripción.
- 7.6. Nótese que, tal como se explica arriba, una persona versada en este campo técnico puede entender fácilmente que el sustituyente $\text{X}=\text{i-C}_3\text{F}_7$ es al menos uno de los mejores sustituyentes debido a que la presente Descripción contiene ejemplos de trabajo y actividad insecticida de los compuestos que tienen $\text{X}=\text{i-C}_3\text{F}_7$, de modo que pueda ejecutarlos fácilmente.

8. Nivel Inventivo

- 8.1. Es cierto que D2 describe compuestos similares a los que se reivindican en la presente solicitud. Sin embargo, dicho documento no menciona nada acerca de 6-i- C_3F_7 como Xn.

Dicho documento tampoco divulga el grupo haloalquilo para X y una posición preferible del mismo en el anillo de benceno. Es más, D2 describe H como el mejor sustituyente de X.

Figura 2 en D2



R1 : H > CH₃
R2 : alkyl $\neq$ alkoxycarbonyl $\neq$ acyl
R3 : H > alkyl, oxo
X : H $\neq$ halo $\neq$ alkyl $\neq$ alkoxy
Y : H > halogen, alkoxy etc.
Z : O $\neq$ S
imino form $\neq$ reduced form

Figure 2. Structure - activity relationship of 3-aminoquinazolinone derivatives.

A este respecto, la enseñanza de D2 se aparta de los compuestos inventivos de la presente invención que tengan 6-i-C₃F₇ como Xn.

Por lo tanto, D2 está lejos de describir o sugerir los compuestos que se reivindican en la presente invención, y por lo tanto, dicho documento no es para nada destructivo del nivel inventivo de la presente invención.

- 8.2. La invención que describe D1 puede abarcar los compuestos de la presente invención pero únicamente de manera formal: sustancialmente, D1 no enseña o sugiere emplear 6-i-C₃F₇ para Xn tal como se explica abajo.
- 8.3. D1 no describe compuestos específicos que tengan 6-i-C₃F₇ como Xn. Lo que es peor, dicho documento no menciona 6-i-C₃F₇ ni siquiera grupos haloalquilo como sustituyentes preferibles de X.
- 8.4. Por ejemplo, dicho documento menciona "átomo de halógeno, un grupo alquilo (C₁₋₆) o un grupo metilendioxi" como sustituyentes preferidos de X sin ninguna indicación de sus posiciones. (Ver página 4, líneas 35 a 36 de D1).
(EP 0 735 035 A1) que dice textualmente: "... each of X's is a halogen atom, a (C₁₋₆) alkyl group or a methylenedioxy group.. ."
- 8.5. Observamos que D1 menciona compuestos que tienen 6-CF₃ como Xn (Compuesto No. 51) cuyo radical también cae dentro del grupo de haloalquilos como 6-i-C₃F₇.
- 8.6. Sin embargo, D1 no menciona nada acerca de las propiedades físicas, actividad biológica o un método de producción de dichos compuestos.
- 8.7. Por lo tanto, D1 no enseña o sugiere sustancialmente emplear 6-i-C₃F₇ para Xn; D1 no destruye para nada el nivel inventivo de la presente invención.
- 8.8. Aún sin ninguna descripción explícita referente a la ventaja de los compuestos de la presente invención sobre la técnica anterior, una persona versada debe entender a partir de la presente Descripción y D1 que de hecho, los compuestos de la presente invención tienen ventaja en términos de un efecto insecticida sobre la mosca blanca

~~24/11~~
11
23
031

ANEXO 1