



No. 10-043233- -00007-0000

Fecha: 2013-05-20 14:32:43 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 523 RESPUESTA Folios: 13

Señor Director

**División de Nuevas Creaciones**

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. 10 043233

Solicitud de Patente de invención para: “**DERIVADOS ESPIROHETEROCICLICOS DE PIRROLIDINDIONA**”

Solicitante: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

**RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO**

Yo, **Margarita Castellanos Abondano**, identificada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio **No.2559** notificado por fijación en lista del 19 de febrero de 2013, en los siguientes términos:

De la solicitud de patente

El Examinador señala lo siguiente:

- “El método de las reivindicaciones 7 y 8, corresponde al uso del compuesto de formula (I), mencionado en la reivindicación 1 para combatir y controlar pestes”.
- “La reivindicación 1 no se encuentra debidamente soportada en la descripción puesto que en las realizaciones preferidas sólo se hace referencia aparentemente a la preparación y actividad de los compuestos

mencionados en la tabla 1, lo cual no evidencia la actividad de todos los compuestos”.

- “En la reivindicación 1 se menciona el término “grupo de latenciación”, el cual no es claro y por lo tanto no se sabe a qué se está haciendo referencia, se debe cambiar por un término más común”.
- “La reivindicación 3 hace referencia a una composición pero no se mencionan los componentes y las proporciones de los mismos, por lo tanto se sugiere mencionar cuales son los componentes y sus proporciones”.

Con el fin de atender las observaciones formuladas a este respecto, y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 14 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas de la siguiente manera:

- Se ha redactado nuevamente el pliego reivindicatorio, de conformidad con las sugerencias del Señor Examinador y se ha limitado de forma significativa el alcance del mismo de acuerdo con la materia de invención que se encuentra debidamente soportada en la descripción.
- En particular, la reivindicación 1 del nuevo pliego reivindicatorio ahora incluye las definiciones de los distintos sustituyentes de acuerdo con lo revelado en las tablas 1, A, B, C, D, E y F de la descripción original.
- La reivindicación 3 ahora especifica los componentes y proporciones de la composición reivindicada y por lo tanto, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada. Dicha modificación se encuentra sustentada en las páginas 44 y 45 de la descripción de la presente solicitud.
- Las reivindicaciones 7 y 8 han sido redactadas nuevamente y ahora especifican más de una etapa del método para combatir y controlar plagas, de conformidad con las enseñanzas de la descripción (ver páginas 46-47 de la memoria descriptiva).

Así entonces, teniendo en cuenta las anteriores aclaraciones y las modificaciones efectuadas al capítulo reivindicatorio, consideramos que las objeciones que por claridad hizo su Despacho quedan superadas ya que el nuevo capítulo reivindicatorio se encuentra redactado en los términos sugeridos por su Despacho y el mismo es ahora claro, conciso y la materia reivindicada se encuentra debidamente soportada en la descripción.

#### Nivel inventivo

Su Despacho concluye que los documentos US2004009999 (D1) y US6114374 (D2) afectan el nivel inventivo de las reivindicaciones 1,3-6,9-13 respectivamente de la presente solicitud. Su Despacho enuncia:

- “La persona de nivel medio versada en la materia derivaría de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 1 de la presente solicitud a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 toda vez que las diferencias se limitan a especificar un sustituyente en un anillo sin cambiar los otros anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad pesticida”.
- “La persona del nivel medio versada en la materia derivaría de manera obvia la composición descrita en la reivindicación 3 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 toda vez que las diferencias se limitan en el compuesto de formula (I), más específicamente en especificar la definición de un sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad pesticida”.
- Asimismo, señala que la persona de nivel medio versada en la materia derivaría de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 9, 10, 11, 12 o 13 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 toda vez que las diferencias se limitan a especificar la definición de un sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en la obtención de compuestos de formula I.

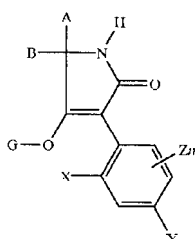
En cuanto a las objeciones del examinador deseamos poner de presente lo siguiente:

De acuerdo con el artículo 18 de la Decisión 486:

**“Artículo 18.-** *Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.*

De conformidad con el anterior artículo, se exponen a continuación las razones por las cuales la presente invención posee nivel inventivo frente a las enseñanzas de los documentos D1 y D2:

D1 y D2 enseñan (entre otros) compuestos con la siguiente estructura:



donde A y B junto con el átomo de carbono al cual están unidos pueden representar un ciclo de 5-6 miembros (sustituido o no sustituido) que está interrumpido por al menos un heteroátomo que es S, O o N. Cuando el heteroátomo es N, entonces el N siempre está unido a un átomo de C.

La diferencia entre los documentos D1 o D2 y la materia de invención reivindicada en el nuevo pliego reivindicatorio, consiste en que el heteroátomo en el ciclo es N y un O está unido al heteroátomo N.

El efecto obtenido a partir de estas diferencias es que los compuestos reivindicados presentan actividad biológica, es decir, actividad pesticida/insecticida tal como se muestra en el Ejemplo 3 de la descripción originalmente presentada.

El problema técnico a ser resuelto consiste por lo tanto, en encontrar otros

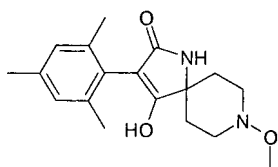
compuestos con actividad pesticida/insecticida. Este problema es el que precisamente soluciona la presente invención debido a que proporciona compuestos que de forma inesperada presentan índices de muerte de plagas más alto en comparación con un ciclohexilo (ver los resultados del ejemplo B16-B20). Estos resultados muestran que unos pocos cambios pueden afectar la actividad de una molécula.

Así entonces, la persona versada en la materia no puede realizar "simples" modificaciones de los sustituyentes y tener la seguridad de que las moléculas funcionarán como pesticidas/insecticidas efectivos, en particular porque los documentos citados D1 y D2 no presentan ejemplos de resultados biológicos usando compuestos que contienen piperidilo.

De lo anterior, es claro que una persona versada en la materia no se vería motivada a elegir específicamente los compuestos de piperidilo que no parecen tener ventaja alguna de acuerdo con las enseñanzas de los documentos D1 o D2 y adicionalmente, modificar los sustituyentes para obtener los compuestos reivindicados. En efecto, se necesita realizar y ensayar cientos de compuestos para hallar un subgrupo específico de compuestos que funcione de forma mejorada en comparación con los compuestos del estado de la técnica. No es una cuestión de hacer sólo una modificación "obvia" de los sustituyentes, para lo cual el experto no posee enseñanza o ninguna motivación particular, con alguna expectativa de obtener los resultados deseados.

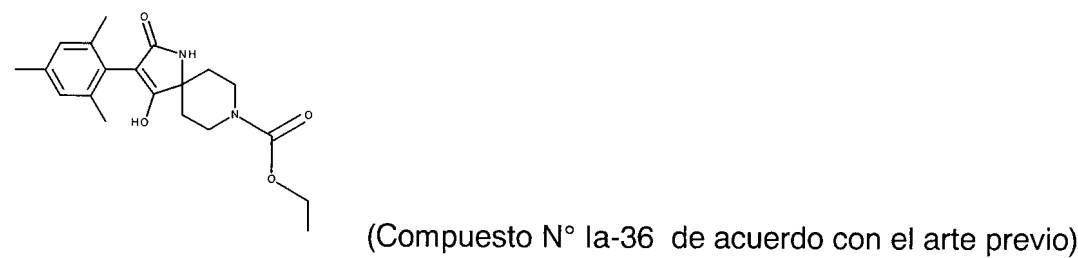
En línea con lo señalado anteriormente, se incluye la siguiente información adicional que muestra que los espirociclos>N-OR son mucho más activos que los espirociclos>N-CO<sub>2</sub>-R correspondientes tal como se muestra a continuación:

- **Ejemplo B25: Comparación de la actividad insecticida de compuestos de acuerdo con la invención con el espirociclo que contiene O:**



(Compuesto N° C2 de acuerdo con la invención)

Compuesto N°C2 de la Tabla C de acuerdo con la invención descrita en la página 100 de WO09/049851 comparado con,



Tal compuesto es revelado en WO95/01358 (equivalente a US 2004-009999, es decir, D1) en página 57, Tabla 1f.

- **Actividad contra *Myzus persicae* (áfido de durazno verde)(población mixta, actividad de contacto de alimentación/residuales, preventiva):**

Se ubicaron discos de hoja de girasol en agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y fueron pulverizadas con soluciones de ensayo. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con una población de áfidos de edades mixtas. Después de un período de incubación de 6 días, se evaluó la mortalidad en las muestras.

Los resultados se muestran en la Tabla B25a:

Tabla B25a: Actividad contra *Myzus persicae* (áfido de durazno verde)

| Compuesto:             | Concentración (ppm) | Mortalidad (%)<br>contra<br><i>Myzus persicae</i> |
|------------------------|---------------------|---------------------------------------------------|
| C2<br>(esta invención) | 12.5                | 100                                               |
| 1a-36<br>(arte previo) | 12.5                | 0                                                 |

- **Actividad contra *Myzus persicae* (áfido de durazno verde) (población mixta, actividad sistémica/de alimentación, curativa)**

Se colocan raíces de plántulas de arveja, infestadas con una población de áfidos

de edades mixtas directamente en las soluciones de ensayo. Luego de 6 días, se evalúa la mortalidad en muestras.

Los resultados se muestran en la Tabla B25b:

Tabla B25b: Actividad contra *Myzuspersicae* (áfido de durazno verde)

| Compuesto:             | Concentración<br>(ppm) | Mortalidad (%)<br>contra<br><i>Myzuspersicae</i> |
|------------------------|------------------------|--------------------------------------------------|
| C2<br>(invención)      | 1.5                    | 100                                              |
| Ia-36<br>(arte previo) | 1.5                    | 0                                                |

- Actividad contra *Thripstabaci* (Trips de la cebolla) (Población mixta, actividad de contacto de alimentación/residual, preventiva).

Se ubicaron discos de hoja de girasol en agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y fueron pulverizadas con soluciones de ensayo. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con una población de trips de edades mixtas. Después de un período de incubación de 6 días, se evaluó la mortalidad en las muestras.

Los resultados se muestran en la Tabla B25c:

Tabla B25c: Actividad contra *Thripstabaci* (Trips de la cebolla)

| Compuesto:             | Concentración<br>(ppm) | Mortalidad (%)<br>contra<br><i>Thripstabaci</i> |
|------------------------|------------------------|-------------------------------------------------|
| C2<br>(invención)      | 200                    | 100                                             |
| Ia-36<br>(arte previo) | 200                    | 50                                              |

Las Tablas B25a aB25c muestran que el compuesto C2 de la presente invención ejerce una acción insecticida sobre *Myzus persicae* y *Thrips tabaci* sustancialmente mejor que el compuesto del arte previo. Este efecto mejorado no era esperado en base a la similitud entre estos compuestos, lo cual es una muestra de la actividad inventiva de los compuestos reivindicados.

Así entonces, teniendo en cuenta que las enseñanzas de las anterioridades D1 y D2 citadas por su Despacho no llevan a un técnico versado en la materia a obtener los compuestos acá reivindicados toda vez que no enseñan ni sugieren como un todo las características técnicas esenciales de los mismos y que los compuestos reivindicados presentan un efecto mejorado e inesperado en comparación con compuestos estructuralmente similares del estado de la técnica, es claro que a partir de dichos documentos no era posible para un técnico medio obtener de manera obvia y/o evidente la presente invención.

Concesión de una solicitud foránea:

Aunque compartimos la opinión de su Despacho, en cuanto a que la concesión de una solicitud de patente en otros países, equivalente a la solicitud Colombiana, no obliga a su Despacho a otorgar el privilegio de patente para la misma invención, sí constituye un antecedente favorable para el estudio de patentabilidad que respetuosamente solicitamos tener en cuenta.

Por lo tanto, informamos a su Despacho que la presente invención ha sido otorgada por la Oficina de Argelia, Belice, Europea, Georgia, Irán, Marruecos, México, Nueva Zelandia, Pakistán, Ucrania, Estados Unidos, Uzbekistán y Sudáfrica.

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 30 y 18 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se proceda con la concesión de la presente solicitud.

Anexos

Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 14 reivindicaciones.

Señor Director,

  
Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. **39.779.654** de Usaquén

T.P.A. No. **70.819** de **C.S.J.**

Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.

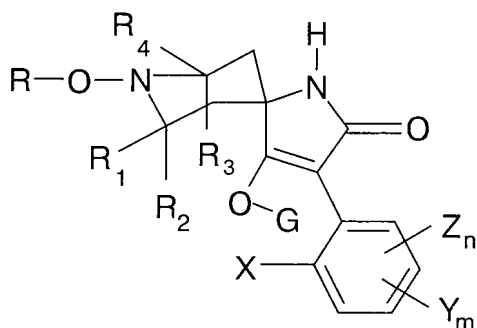
Tel.: 7560770

Bogotá D.C.

**20 MAYO 2013**

## REIVINDICACIONES

### 1. Compuestos de la fórmula I



(I) ,

donde

X , Y y Z, independientemente entre sí, son H, Cl, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, Br, 4-Cl-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>, C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>, F, ciclo-C<sub>3</sub>,

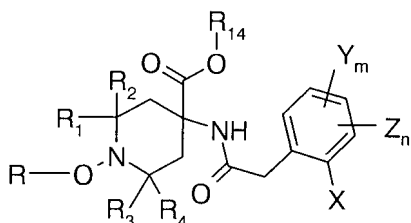
m y n, son, independientemente entre sí 1 o 2,

G es hidrógeno, C(=O)O-CH<sub>3</sub>, C(=O)O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, C(=O)O-n-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, C(=O)O-i-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, C(=O)O-alilo, C(=O)O-vinil, C(=O)O-propargilo, C(=O)O-t-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>, C(=O)-t-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>, C(=O)N(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CN), C(=O)NH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>), C(=O)NH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)<sub>2</sub>, SO<sub>2</sub>-i-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>O-CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-(4-CH<sub>3</sub>O-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>), CH<sub>2</sub>-(3,4,5-{CH<sub>3</sub>O}<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>H<sub>2</sub>), C(=O)O-CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, C(=O)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-CN, CH<sub>2</sub>O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, alilo, propargilo,

R es CH<sub>3</sub>, C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, alilo, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, i-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, bencilo, C(=O)-CH<sub>3</sub>, C(=O)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, C(=O)-n-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, C(=O)O-CH<sub>3</sub>, C(=O)-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, C(=O)O-n-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, C(=O)NH-CH<sub>3</sub>, C(=O)NH-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, C(=O)NH-n-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, H, CH<sub>2</sub>-O-CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CH<sub>2</sub>-O-C<sub>2</sub>H<sub>4</sub>-O-CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub> , y

R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno o metilo.

2. Un proceso para la preparación de los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, donde G es hidrógeno, el cual comprende la ciclación del compuesto de fórmula IV



(IV),

donde X, Y, Z, m, n, R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1, y R<sub>14</sub> es alquilo C<sub>1-4</sub>, bajo condiciones básicas.

3. Una composición pesticida que comprende una cantidad eficaz pesticida de por lo menos un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en una cantidad de 0,1 a 99% y al menos un adyuvante sólido o líquido en la cantidad de 1 a 99,9%.

4. Una composición pesticida de acuerdo con la reivindicación 3, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende adyuvantes de la formulación.

5. Una composición pesticida de acuerdo con la reivindicación 3, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida adicional.

6. Una composición pesticida de acuerdo con la reivindicación 3, la cual, además de comprender el compuesto de fórmula I, comprende por lo menos un fungicida, herbicida o regulador del crecimiento vegetal adicional.

7. Un método para combatir y controlar plagas que comprende los siguientes pasos:

(a) formular una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de fórmula I;

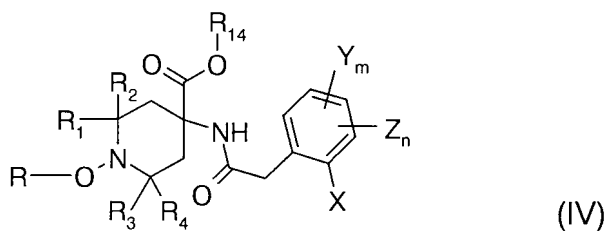
(b) aplicar a la plaga, a un locus de la plaga, o a una planta susceptible al ataque por una plaga dicho compuesto formulado.

8. Un método para combatir y controlar plagas el cual comprende los siguientes pasos:

(a) proporcionar una composición pesticida de acuerdo con la reivindicación 3;

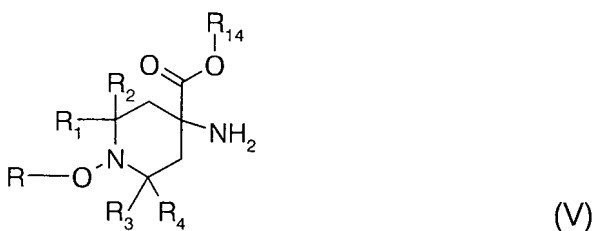
(b) aplicar a una plaga, a un locus de una plaga, o a una planta susceptible al ataque por una plaga dicha composición.

9. Los compuestos de la fórmula IV



donde X, Y, Z, m, n, R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1, y R<sub>14</sub> es alquilo C<sub>1-4</sub>.

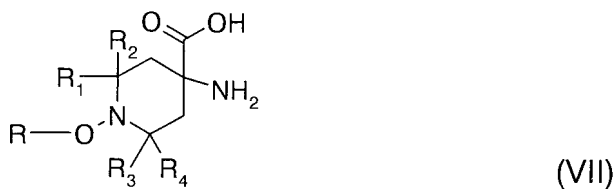
10. Los compuestos de la fórmula V



o sus sales,

donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1, y R<sub>14</sub> es alquilo C<sub>1-4</sub>.

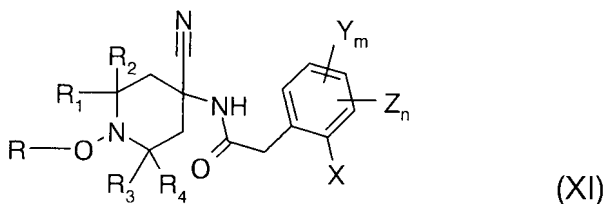
11. Los compuestos de la fórmula VII



o sus sales,

donde R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1 y R es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o bencilo.

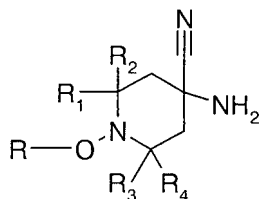
12. Los compuestos de la fórmula XI



13

donde X, Y, Z, m, n, R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1.

**13. Los compuestos de la fórmula VIII**

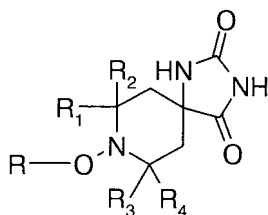


(VIII)

o sus sales,

donde R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1.

**14. Los compuestos de la fórmula IX**



(IX)

donde R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen los significados asignados a los mismos en la reivindicación 1 y R es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o bencilo.