

# CAVELIER

ABOGADOS

EDIFICIO SISKI  
CARRERA 4 No. 72  
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

www.cavelier.com  
cavelier@cavelier.com

Señora Jefe de la  
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES  
Superintendencia de Industria y Comercio  
E. S. D.

330 379  
157 11 347 3611  
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 03-046657-00009-0000  
Fecha: 2008-10-30 16:48:50 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 379 FASENACIONAL II  
Act. 444 RESPUESTA REQUE Folios: 12

Trámite : 011

Evento : 379

Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 03046657  
Asunto : SOLICITUD DE PATENTE PARA:  
: "DELTA 1-PIRROLIDONAS"  
Solicitante : BAYER CROPS SCIENCE AG  
Clase : A01N 043/036, A01N 043/040, A01N 043/054, A01N  
043/058, A01N 043/060, C07D 207/020, C07D 401/010, C07D 403/010  
Fecha de Solicitud : Junio 3 de 2003

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 8337 notificado por fijación en lista del 27 de Junio de 2008.

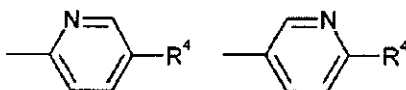
2. Mediante el Oficio No. 8337 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Con memorial radicado el 22 de Septiembre de 2008 solicité plazo de treinta (30) para atender el oficio No. 8337. Atiendo a las observaciones de la siguiente manera:

### 3. Claridad del capítulo reivindicatorio:

3.1 Con relación a las objeciones realizadas al capítulo reivindicatorio y con fundamento en lo establecido en el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta uno nuevo como sustituto del anteriormente presentado compuesto por 4 reivindicaciones, a saber:

3.1.1 En relación con la objeción realizada en cuanto a errores de transcripción en la reivindicación 1, los mismos fueron debidamente corregidos en el nuevo pliego reivindicatorio.

3.1.2 Con respecto a la falta de concisión y unidad de invención del capítulo reivindicatorio, por favor note que en el nuevo capítulo que se presenta se restringe  $R^1$  y  $R^2$  a flúor y Q a un N-heterociclo aromático que contiene un átomo de nitrógeno, es decir a las siguientes dos definiciones de Q:



Los compuestos que contienen esta definición de Q están incluidos en los ejemplos de preparación en las páginas 77 a 79 de la descripción, así como los datos biológicos de las páginas 115 a 126 de la descripción. Por lo tanto, los compuestos que se definen con la nueva restricción de Q se encuentran debidamente soportados por el capítulo descriptivo y además tienen en común el N-heterociclo aromático con un átomo de nitrógeno.

3.1.3 De acuerdo a las anteriores modificaciones se suprimieron las reivindicaciones 2, 4 a 10 y se restringe la reivindicación 11 a las fórmulas (I-g) y (I-h) quedando de esta forma 4 reivindicaciones a proteger.

#### **4. ANÁLISIS DEL REQUERIMIENTO DE NIVEL INVENTIVO:**

Su Despacho enuncia que el documento D1 (DE 19822245) afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones 1 a 12 de la presente invención debido a que con este documento es evidente para una persona medianamente versada en la materia llegar a la invención que se protege en la presente solicitud y que por lo tanto, no tendría nivel inventivo.

##### **4.1 Argumentos en favor de nivel inventivo:**

En primer lugar, queremos poner de presente que el nuevo capítulo reivindicatorio restringe  $R^1$  y  $R^2$  a flúor, de forma contraria D1 tiene un sustituyente metil en la posición de  $R^1$ . Por lo tanto, los compuestos de la presente aplicación son estructuralmente diferentes a los de D1.

232 331

También se puede observar que los compuestos del documento D1 pueden variar de formas diferentes. De este modo, no se esperaría por una persona versada en el tema que los compuestos tal y como se muestran en la presente solicitud al tener un N-heterociclo aromático (definición de Q) pudieran mostrar tan buena y hasta una mayor eficiencia que los que se presentan en el arte previo. Adjunto al presente memorial podrá encontrar datos comparativos que demuestran esta eficiencia superior. Por lo tanto la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

De acuerdo con las razones mencionadas anteriormente se muestra en consecuencia que el nuevo capítulo reivindicatorio es novedoso e inventivo frente al documento D1.

#### 5. Conclusión:

Teniendo en cuenta las modificaciones hechas al capítulo reivindicatorio así como los anteriores argumentos, se puede concluir que la presente invención es novedosa y posee altura inventiva frente a D1.

Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

#### 7. Anexos:

- Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 4 reivindicaciones.
- Copia de los datos comparativos realizados.
- Formulario para modificaciones.
- Recibo por concepto de modificaciones en solicitud pendiente.

Bogota,  
Señora Jefe,

  
**EMILIO FERRERO**

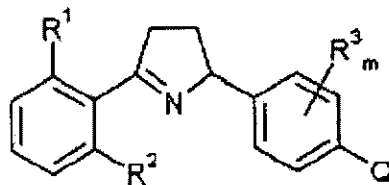
T.P.A. No. 31.929

**FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES**

|                                                  |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                                                                                                                                                            |
|--------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <b>1</b>                                         | <b>SOLICITUD DE:</b><br><input type="checkbox"/> Corrección de Error Material <input checked="" type="checkbox"/> Modificación a una solicitud                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                            |
| <b>2</b><br><b>SOLICITANTE</b>                   | <b>Nombre:</b> BAYER CROPSCIENCE AG<br>Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania.<br><b>Dirección:</b> Alfred Nobel Strasse 50,<br>40789 Monheim,<br>Alemania<br><b>Domicilio:</b> Monheim,<br>Alemania<br><b>Teléfono:</b> 546 09 70 <b>Fax:</b> 249 40 70<br><b>E-mail:</b> <a href="mailto:clientes@camyp.com">clientes@camyp.com</a>     | <b>IDENTIFICACION</b><br>C.C. <input type="checkbox"/> NIT <input type="checkbox"/><br>C.E. <input type="checkbox"/> Otro <input type="checkbox"/><br>Número: _____                        |
| <b>3</b><br><b>REPRESENTANTE<br/>O APODERADO</b> | <b>Nombre:</b> Emilio FERRERO<br><b>Dirección:</b> Carrera 4ª No. 72-35<br><b>Teléfono:</b> 347 36 11 <b>Fax:</b> 217 92 11<br><b>E-mail:</b> <a href="mailto:cavelier@cavelier.com">cavelier@cavelier.com</a>                                                                                                                                                 | <b>IDENTIFICACION</b><br>C.C. <input checked="" type="checkbox"/> NIT <input type="checkbox"/><br>C.E. <input type="checkbox"/> Otro <input type="checkbox"/><br>Número: 438.019 TP 31.929 |
| <b>4</b>                                         | <b>Número de expediente:</b> <u>03.046.657</u>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                            |
| <b>5</b>                                         | <b>Descripción de la corrección o modificación solicitada:</b><br>Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 4 reivindicaciones con el fin de superar las ojecciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que e examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas. |                                                                                                                                                                                            |
| <b>6</b>                                         | <b>Comprobante de pago No.</b> <u>08-82.911</u> <b>Fecha:</b> <u>20 de octubre de 2008</u>                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                                                                                                                                                            |
| <b>7</b>                                         | <b>Anexos</b><br><input checked="" type="checkbox"/> Comprobante de pago de la tasa por \$103.000, por concepto de modificaciones.<br><input type="checkbox"/> Poderes, si fuere el caso<br><input type="checkbox"/> Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.                                |                                                                                                                                                                                            |
| <b>8</b>                                         | <b>NOMBRE:</b> EMILIO FERRERO                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | <b>FIRMA:</b> <br>C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929                                                |

**REIVINDICACIONES**

1.  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (1)



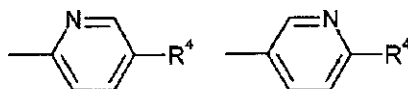
5 En la que,

$R^1$  y  $R^2$  representan flúor,

$R^3$  representa flúor, cloro, metiletil n-propilo, isopropilo, n-butil isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluorometilo, trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio, terc-butiltio, fluorometiltio o trifluoroetiltio,

m representa O o 1,

Q representa un N-heterociclo aromático con un átomo de nitrógeno



15  $R^4$  representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, formilo, representa alquilo  $C_1$ - $C_{16}$ , alquenilo  $C_2$ - $C_{16}$ , alcoxi  $C_1$ - $C_{16}$ , alquenilo  $C_2$ - $C_{16}$ , cada uno de los cuales es opcionalmente mono o polisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano y  $NR^7R^8$ ; representa  $-S(O)_pR^6$ ,  $NR^7R^8$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^6$ ,  $-CONR_9R_{10}$ ,  $-N(R^{11})COR^{12}$ ,

20 o representa ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropil metilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, fenilo, bencilo, feniletilo, tetrazolilo, furilo, furfurilo, benzofurilo, tetrahidrofurilo, tienilo, tenilo, benzotienilo, tiolanilo, pirrolilo, indolilo, pirrolinilo, pirrolidino, pirrolidinilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, tiazolidinilo, piridinilo, pirimidinilo, piridazilo, pirazinilo, piperidinilo, piperidino, morfolinilo, tiomorfolinilo, morfolino, tiomorfolino, triazinilo, triazolilo, quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno de los cuales es opcional mente mono o trisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo,  $-CF_3$ ,  $CHF_2$ ,  $-CCF_2$ ,  $-CF_2CHFCI$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CH_2CHFCF_3$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ , vinilo, alilo, 1-propenilo, butenilo,  $-CF=CHF$ ,  $-CF=CH_2$ ,  $-CF=CCl_2$ ,  $-CH=CF_2$ ,  $-CF_2CF=CF_2$ ,  $-CH=CFH$ ,  $-CH_2CF=CF_2$ ,  $CF=CF_2$ ,  $-CF_2CH=CF_2$ , metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, trifluoroetoxi, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio, terc-butiltio, trifluorometiltio, difluorometiltio, clorodifluoro-metiltio y trifluoroetiltio,

$R^4$  representa adicionalmente  $-\text{CH}=\text{NOH}$ , formilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropilmetoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi o ciclohexilmetoxi, p representa 0, 1 ó 2

$R^6$  representa metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, hexilo,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{CHF}_2$ ,  $-\text{CCl}_3$ ,  $-\text{CCl}_2\text{F}$ , dimetilaminometilo, dimetilaminoetilo, dietilaminometilo, dietilaminoetilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo o bencilo,  $R^6$  representa adicional mente, metoximetilo, trifluorometoximetilo, metiltiometilo o trifluorometiltiometilo.

$R^7$  y  $R^8$  independientemente uno del otro representan hidrógeno,  $-\text{SO}_2\text{R}^6$ ,  $-\text{COR}^6$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^6$ , representa alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_{16}$  o alquenilo  $\text{C}_2\text{-C}_{16}$ , cada uno de los cuales es opcionalmente mono- o polisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, alquilcarbonilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquilcarboniloxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquilamino  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , di(alquil  $\text{C}_1\text{-C}_4$ )amino, alcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , halogenoalcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$  o halogenoalquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ; representan cicloalquilo  $\text{C}_3\text{-C}_8$ , ciclopropilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo, ciclohexiletilo, fenilo, bencilo, feniletilo, tetrazolilo, furilo, furfurilo, benzofurilo, tetrahidrofurilo, tienilo, tenilo, benzotienilo, tiolanilo, pirrolilo, indolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, benzotiazolilo, tiazolidinilo, piridinilo, pirimidinilo, piridazilo, pirazinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, triazinilo, tiazolilo, quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno de los cuales es opcionalmente mono- a trisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , halogenoalquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$ .

$R^7$  y  $R^8$  independientemente uno del otro adicionalmente representan piridinilmetilo, pirimidinilmetilo, piridazilmetilo o pirazinilmetilo, cada uno de los cuales es opcionalmente mono- o trisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , halogenoalquilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , halogenoalcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$  y halogenoalquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$ ,

$R^7$  y  $R^8$  adicionalmente representan alquenileno  $\text{C}_2\text{-C}_8$ , que es opcionalmente mono- o polisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, alcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , halogenoalcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , alquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$  and halogenoalquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$  o representa alquilenilo  $\text{C}_3\text{-C}_8$ , que es opcional mente mono- o polisustituido en la porción alquilenilo por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, ciano, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, halogenoalquilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropiloxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, halogenoalcoxi  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio, terc-butiltio y halogenoalquiltio  $\text{C}_1\text{-C}_4$ , en donde la cadena alquilo puede en cada caso ser interrumpida por  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$  o  $-\text{NR}^{15}-$ ,

$R^7$  y  $R^8$  adicionalmente representan adicionalmente alquileo  $C_3-C_8$  que es mono o disustituido por sustituyentes iguales o diferentes, en donde los sustituyentes se pueden seleccionar del grupo que consiste de etoxicarbonilo, metoxicarbonilo y oxietileneoxi,

$R^7$  y  $R^8$  adicionalmente representan  $-CH_2-CH_2-C(=O)-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-C(=NO-Me)-CH_2CH_2-$ ,  $-CH_2CH_2-C(=NO-Et)-CH_2CH_2$  o  $-CH_2-CH_2-C(=NO-iPr)-CH_2-CH_2-$ ,

$R^9$  y  $R^{10}$  independientemente uno del otro representan hidrógeno,  $-SO_2CF_3$ , metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, pentilo, hexilo,  $CF_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-(CF_2)_3CF_3$ , ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, metoximetilo, metoxietilo, o representa fenilo o bencilo, cada uno de los cuales se sustituye opcional mente por flúor, cloro, bromo, metilo, ti fluorometilo, metoxi o trifluorometoxi,

$R^9$  y  $R^{10}$  adicionalmente representan  $-(CH_2)_4-$ ,  $-(CH_2)_5-$ ,  $-(CH_2)_6-$ ,  $-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_2S-(CH_2)_2-$  o  $-(CH_2)_2-N(R^{15})-(CH_2)_2-$ ,

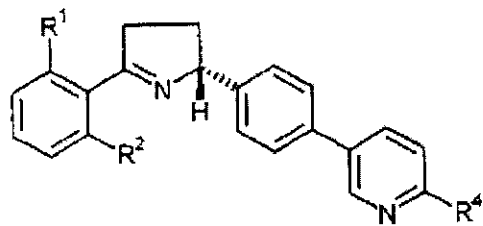
$R^{11}$  y  $R^{12}$  independientemente uno del otro representan metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-hexilo, trifluorometilo, trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, o representa fenilo o bencilo, cada uno de los cuales se sustituye opcionalmente por flúor, cromo, bromo, metilo, trifluorometilo, metoxi o trifluorometoxi,

$R^{11}$  y  $R^{12}$  adicionalmente representan  $-(CH_2)_3-$ ,  $-(CH_2)_4-$ ,  $-(CH_2)_5-$  o  $-(CH_2)_6-$ , cada uno de los cuales se sustituye opcional mente por flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, trifluorometilo, trifluorometoxi o trifluorometiltio,

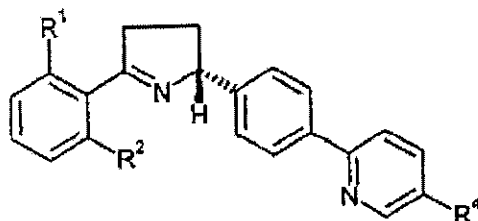
$R^{15}$  representa hidrógeno,  $-SO_2R^6$ , representa  $-COR^6$  o  $-CO_2R^6$ ; representa alquilo  $C_1-C_{16}$ , alquileo  $C_2-C_{16}$ , cada uno de los cuales es opcional mente mono- o polisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano, metilamino, etilamino, di-(alquil  $C_1-C_6$ )amino, alcoxi  $C_1-C_4$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$  y halogenoalquiltio  $C_1-C_4$ ; representa cicloalquilo  $C_3-C_8$ , ciclopropilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropiletilo, ciclopentiletilo, ciclohexiletilo, phenil, bencilo, feniletilo, tetrazolilo, furilo, furfurilo, benzofurilo, tetrahidrofurilo, tienilo, tenilo, benzotienilo, tiolanilo, pirrolilo, indolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, benzoxazolilo, isoxazolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, benzotiazolilo, tiazolidinilo, piridinilo, pirimidinilo, piridazilo, pirazinilo, piperidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, triazinilo, triazolilo, quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno de los cuales es opcional mente mono- a trisustituido por sustituyentes idénticos o diferentes del grupo que consiste de flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, halogenoalquilo  $C_1-C_4$ , metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ , metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio, terc-butiltio y halogenoalquiltio  $C_1-C_4$

2.  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que m representa 0.

3. El compuesto de configuración (R) de la fórmula (I-g) y (I-h)



(I-g)



(I-h)

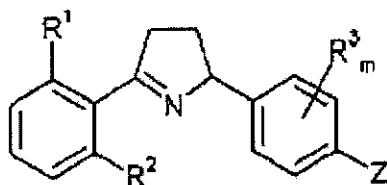
En la que en cada caso

$R^1$  y  $R^2$  representan flúor y

5  $R^4$  tiene los significados dados en la Reivindicación 1

4. Proceso para preparar compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la Reivindicación 1, caracterizado porque

A)  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (II)



(II)

En la que

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y m tienen los significados dados en la Reivindicación 1

y

Z representa cloro, bromo, yodo,  $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  o  $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ , se hace reaccionar en una

15 reacción en tándem con heterociclos de la fórmula (III)

Q-X (III)

En la que

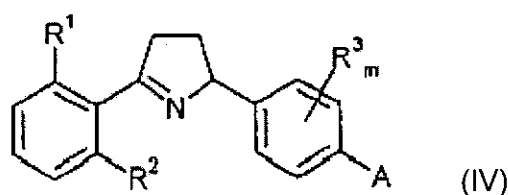
Q tiene el significado dado en la Reivindicación 1 y

X representa cloro, bromo, yodo,  $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$  o  $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ ,

20 En la presencia de un catalizador, en la presencia de un éster de ácido dicarboxílico y, si es apropiado, en la presencia de un ligador ácido y, si es apropiado, en la presencia de un diluyente,

O

B)  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (IV)



En la que

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $m$  tienen los significados dados en la Reivindicación 1

y

- 5 A representa  $-B(OH)_2$ , (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan)-2-ilo, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinan)-2-ilo, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinan)-2-ilo o 1,3,2 benzodioxaborol-2-ilo

Se hace reaccionar con heterociclos de la fórmula (III)

Q-X (III)

En la que

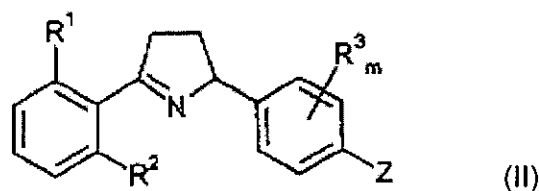
- 10 Q tiene el significado dado en la reivindicación 1 y

X representa cloro, bromo, yodo,  $-OSO_2CF_3$  o  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$ ,

En la presencia de un catalizador, si es apropiado en la presencia de un ligador ácido y, si es apropiado, en la presencia de un diluyente,

o

- 15 C)  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (II)



En la que

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $m$  tienen los significados dados en la Reivindicación 1, y

Z representa cloro, bromo, yodo,  $-OSO_2CF_3$  o  $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$ ,

- 20 Se hacen reaccionar con derivados de ácido borónico de la fórmula (V)

Q-A (V)

En la que

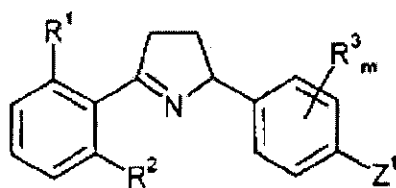
Q tiene los significados dados en la Reivindicación 1, y

- 25 A representa  $-B(OH)_2$ , (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan)-2-ilo, (5,5-dimetil 1,3,2-dioxaborinan)-2-ilo, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinan)-2-ilo o 1,3,2-benzodioxaborol-2-ilo

En la presencia de un catalizador, si es apropiado en la presencia de un ligador ácido y, si es apropiado, en la presencia de un diluyente,

o

- 30 D)  $\Delta^1$ -Pirrolinas de la fórmula (II-a)



(II-a)

En la que

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $m$  tienen los significados dados en la Reivindicación 1,

y

$Z^1$  representa bromo o yodo

Se hacen reaccionar con compuestos organometálicos de la fórmula (VI)

Q-M (VI)

En la que

Q tiene los significados dados en la Reivindicación 1

y

M representa  $ZnCl$ ,  $Sn(Me)_3$  o  $Sn(n-Bu)_3$ ,

En la presencia de un catalizador, si es apropiado en la presencia de un ligador y, si es apropiado en la presencia de un diluyente.

LeA 34776- Test data

*Spodoptera frugiperda* - test (SPODFR)

Solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 2 parts by weight of alkylaryl polyglycoether

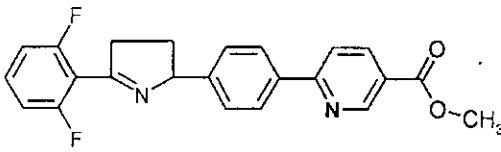
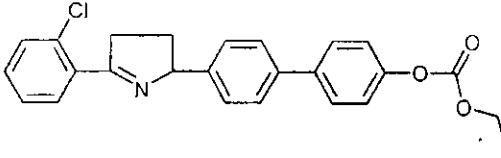
To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Cabbage leaves (*Brassica oleracea*) are treated by being dipped into the preparation of the active compound of the desired concentration and are infested with caterpillars of the fall army worm (*Spodoptera frugiperda*) while the leaves are still moist

After the specified period of time, mortality in % is determined 100 % means that all the caterpillars have been killed; 0 % means that none of the caterpillars have been killed.

In this test for example, the following compounds from the preparation examples showed good activity: see list

Results  
*Spodoptera frugiperda* - Test

| Active compounds                                                                    | Active compound concentration in ppm | Efficacy in % after 7d |
|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------|------------------------|
| according to the invention                                                          |                                      |                        |
|  | 100                                  | 90                     |
| according to D1( DE 19822245)                                                       |                                      |                        |
|  | 100                                  | 50                     |

341 248

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-046657- -00009-0000

Fecha: 2008-10-30 16:48:50 Dep. 2020 NUECREACION  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII  
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 12

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 82,911  
FECHA : OCTUBRE 20 DE 2008

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE       | TIPO PAGO    | BANCO           | CUENTA    | No. PAGO | FECHA PGO  | VR. PAGO      |
|-------------------|--------------|-----------------|-----------|----------|------------|---------------|
| CAVELIER ABOGADOS | CONSIGNACION | BANCO DE BOGOTA | 062754387 | 80663855 | 20/10/2008 | 22,020,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO  | CONCEPTO                       | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------|--------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-03 | CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA |                |
|       |             | 12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES  | 103,000.00     |
|       |             | TOTAL :                        | \$ 103,000.00  |

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

Do 13549-841-0053

342-34

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**  
**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

**Radicación No. 03-46657**

**Clasificación Internacional (IPC): C07D207/20, A01N43/36**

**Concepto Técnico No. 3616**

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐  
Vía Nacional ☐  
Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒  
No. solicitud internacional PCT/EP01/13585  
Fecha de presentación internacional 2001-11-22

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

**1. Documentos estudiados**

Descripción: folios 103 a 228 (como se radicó inicialmente)

Reivindicaciones (4): folios 333 a 338 (como se modificó con oficio de 2008-10-30)

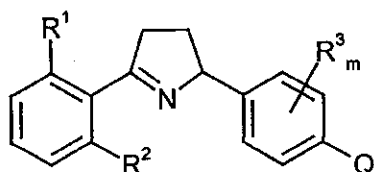
Prioridad: DE 100 60 412.9 de 2000-12-05

Respuesta del solicitante: folios 329 a 331

**2. Objeto de la invención**

Título de la solicitud: Delta-1-pirrolidonas

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:  $\Delta$ 1-pirrolinas de la fórmula (I)



En la que R1, R2, R3, m y Q tienen los significados indicados en el capítulo reivindicatorio, folios 333 a 338.

El anterior producto procedimiento busca suministrar un pesticida ?

Según la Clasificación Internacional de Patentes, la codificación para esta solicitud corresponde a C07D207/20 y A01N43/36

**3. De la solicitud de Patente (según el caso)**

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

A pesar que esta oficina notificó en dos ocasiones al solicitante sobre la falta de definición del objeto de la solicitud y de la falta de claridad del capítulo reivindicatorio y no obstante el solicitante realizó algunas modificaciones en el último capítulo reivindicatorio alegado por el mismo, la solicitud no cumplió con los

en la medida que son infinitas las posibilidades de combinación de los 29 significados de  $R^3$  con la enorme variedad de significados de  $R^4$  el cual, a su vez, puede abarcar miles de sustancias diferentes debido a que tiene sustituciones de sustituciones de sustituciones en los posibles radicales.

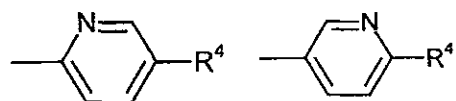
Al solicitante se notificó que la fórmula I y los supuestos compuestos que representa, le dan un carácter totalmente especulativo a la solicitud. Al hacer en el papel las diferentes sustituciones que propone el solicitante, la estructura base pierde en muchos casos la relevancia porque los sustituyentes tienen a su vez otros sustituyentes y éstos otros que, además, pueden formar otros ciclos; todo esto sin mayor sustento real, aparte de la simple mención, en la descripción. En la mayoría de los casos se mencionan sustituciones generales sin definir la posición de los sustituyentes.

En el segundo requerimiento hecho por esta oficina el solicitante fue notificado que si bien se había restringido en algo el alcance de la protección solicitada, el objeto que deseaba proteger se concretó muy poco porque aún se incluían muchísimos compuestos en el capítulo reivindicatorio que ni siquiera se sabía con seguridad si se habían obtenido en realidad porque en la descripción no aparecía ni el punto de fusión ni el log P (pH 2,3), que parecían ser los indicios de haberse sintetizado. Las cuentas de los compuestos reivindicados pasaron de mil y en las tablas no aparecieron más de 220 compuestos. Además, en los ejemplos de activación solo aparecieron algunos compuestos (no más de 10). Luego, no era posible asegurar que los miles de compuestos reivindicados tuvieran una actividad insecticida. Por lo tanto, se consideró que el capítulo reivindicatorio no se sustentó enteramente en la descripción.

Por lo tanto, en cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, a pesar de las respuestas aportadas por el solicitante, subsisten aún los impedimentos para la concesión de la patente porque el capítulo reivindicatorio jamás se ajustó a lo exigido por el artículo 30 de la decisión 486 y por lo tanto se deniega la solicitud de patente. Esto de conformidad con lo establecido en la circular única de la Superintendencia de Industria y Comercio, título X, numeral 1.2.2.3, "en caso de que el solicitante en su respuesta al requerimiento, modifique el capítulo reivindicatorio o la descripción de la invención que pretende proteger, la Superintendencia podrá notificarlo nuevamente y por una vez".

#### 4. Respuestas del solicitante

En la respuesta al último requerimiento de esta oficina el solicitante respondió que "en el nuevo capítulo que se presenta se restringe  $R^1$  y  $R^2$  a flúor y Q a un heterociclo aromático que contiene un átomo de nitrógeno, es decir a las siguientes definiciones de Q:



Los compuestos que contienen esta definición de Q están incluidos en los ejemplos de preparación en la páginas 77 a 79 de la descripción, así como los datos biológicos de las páginas 115 a 126 de la descripción. Por lo tanto, los compuestos que se definen con la nueva restricción de Q se encuentran debidamente soportados por el capítulo descriptivo y además tienen en común el N-heterociclo aromático con un átomo de nitrógeno". Como ya se indicó en el presente concepto, los muy diferentes significados de  $R^4$  pueden hacer que la

344 345

caso; luego, la restricción realizada por el solicitante no define de ninguna manera el objeto de la invención para poder afirmar que se cumplen los requisitos del artículo 30 de la decisión 486. En las páginas de la descripción a que se refiere el solicitante aparecen tan solo unos cuantos compuestos de los muchos que se reivindicaron. Luego, la objeción de falta de entero sustento se mantiene hasta el final.

Por otra parte, el solicitante anexa los resultados de ensayo de un solo único compuesto frente a otro compuesto del estado de la técnica. Después de reivindicar cientos de compuestos no tiene mayor sustento el resultado obtenido para un único compuesto.

#### 5. Conclusión:

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Negar** las reivindicaciones: 1 a 4 (folios: 333 a 338)

Bogotá, D.C., 2008-12-05

|                                     |                                                |
|-------------------------------------|------------------------------------------------|
| <b>CONCEPTO TECNICO</b><br>No. 3616 | <b>EXAMINADOR TECNICO</b><br>Código No. 202043 |
|-------------------------------------|------------------------------------------------|