

Señor
SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO
E. S. D.

537

REF: EXPEDIENTE 04-008-463

TÍTULO SOLICITADO: "ANTRANILAMIDAS ARTROPODICIDAS"

PUBLICACIÓN: Gaceta 555 de 31-08-2005, número de publicación 395, Página 382.

PRIORIDAD: US 60/311.919 (13/08/2001)
US 60/324,128 (21/09/2001)
US 60/369,661 (02/04/2002)

SOLICITANTE: E.I. DUPONT DE NEMOURS AND COMPANY

APODERADO: ÁLVARO CORREA ORDOÑEZ

TRÁMITE: SUSTENTACIÓN DE OPOSICIÓN

JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR, identificado como aparece al pie de mi firma, reconocido apoderado del opositor en el trámite de la referencia, estando dentro de los términos de la prórroga solicitada, ratifico mi petición en el sentido de que se niegue el beneficio patentario a la solicitud contenida en el expediente 04-008-463, por no cumplir con los requisitos de patentabilidad a que se refieren los artículos 14, 16 y 18 de la Decisión 486 de la Comunidad Andina de Naciones, con base en los fundamentos de hecho y de derecho que me permito exponer a continuación.

I. COMPLEMENTO DE INFORMACIÓN

1.1. Los compuestos descritos en las reivindicaciones 1 a 8, al igual que su efecto, carecen de novedad y nivel inventivo.

La solicitud en trámite revela compuestos según la estructura descrita en el capítulo reivindicatorio, incluyendo su N-óxido o una sal agrícolamente adecuada del mismo. De igual manera pretende beneficio patentario sobre un método para controlar plagas y una composición farmacéutica que contiene además otro agente activo insecticida, nematocida o acaricida.

Quiero enfatizar en el hecho de que si bien es cierto que a simple vista los compuestos definidos en la presente solicitud de patente no son en apariencia los mismos descritos en la anterioridad WO 01/70671 A2, titulada "INSECTICIDAL ANTHRANILAMIDES", presentada el 20 de marzo de 2001 y publicada el 27 de septiembre de 2001,- esto es, publicado antes de la fecha de la presentación internacional pero después de la fecha reclamada en la prioridad-, es evidente que unos y otros tienen básicamente la misma estructura o núcleo principal, y que en algunos casos, se diferencian entre sí por los grupos sustituyentes y en otros son exactamente los mismos.

De la misma forma, se observa que tanto los compuestos de la solicitud colombiana en trámite como los revelados en la anterioridad mencionada, se encuentran relacionados en su uso, puesto que unos y otros son empleados en métodos para el control de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados su medio ambiente con una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula (I) y composiciones que los contienen.

Para mayor claridad y para efectos comparativos presentamos a ese Despacho el siguiente cuadro:

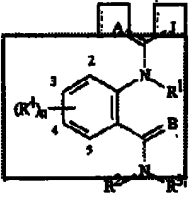
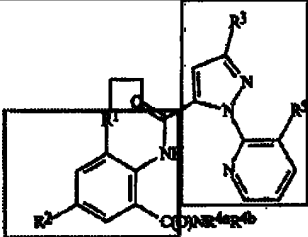
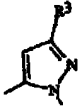
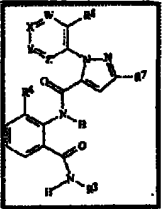
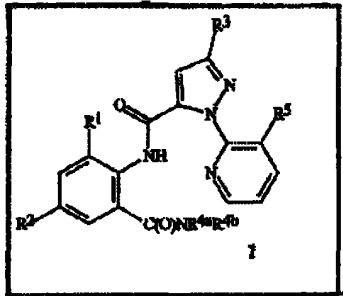
WO 01/70671 A2 publicada el 27/09/2001	CO 04-008-463, EQUIVALENTE A LA WO03/015519 A1 y a su vez de la US 2005/0075372A1
	
A y B: son independientemente O o S. J: es independientemente un grupo fenil o un naftil sustituidos; o J: es independientemente un <u>anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros</u> o un anillo aromático heterobícíclico de 8, 9 o 10 miembros, donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con uno a 4 grupo R7; donde R7 puede ser (ver pág 7 de la WO01/70671=: R7 is independently a phenyl, benzyl, benzoyl, phenoxy or 5- or 6-membered heteroaromatic ring 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system, each ring optionally substituted with one to three substituents independently R1: H o C1-6 alquilo... R2: H o C1-6 alquilo.... R3: H o C1-6 alquilo..... Más específicamente en la página 7 de la solicitud internacional WO 01/70671A2 se describe que: when J is an optionally substituted pyrazole, tetrazole or pyrimidine, then R2 and R3 cannot both be hydrogen.	A y B: son O. J podría estar representado en esta solicitud por un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros como:  el cual es un grupo Pirazol sustituido por un grupo:  R4a: C1-4 alquilo; R4b: H o CH3 R3: alquilo C1-C4, opcionalmente sustituido con Halógeno, CN, OCH3, S(O)pCH3.

Table 2



W	X	Y	Z	R3	R4	R7	R8
CH	CH	CH	N	1-Pr	Me	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Me	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Cl	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Cl	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Br	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Br	CF ₃	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Me	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Me	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Cl	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Cl	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Br	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Br	Cl	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Me	Br	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Me	Br	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Cl	Br	Cl
CH	CH	CH	N	1-Bu	Cl	Br	Cl
CH	CH	CH	N	1-Pr	Br	Br	Cl



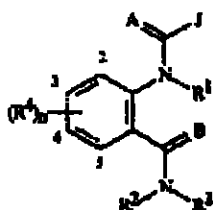
wherein

- R¹ is CH₃, F, Cl or Br;
- R² is F, Cl, Br, I or CF₃;
- R³ is CF₃, Cl, Br or OCH₂CF₃;
- R^{4a} is C₁-C₄ alkyl;
- R^{4b} is H or CH₃; and
- R⁵ is Cl or Br.

7

- La publicación internacional **WO 01/70671 A2**, revela compuestos de fórmula (I) de tipo antralinamida, los cuales son insecticidas y que pueden ser usados en métodos para controlar artrópodos mediante su utilización como ingredientes activos dentro de una composición que tenga una cantidad efectiva de dicho compuesto de fórmula (I). Si suponemos que tales compuestos no son idénticos a los revelados en la presente solicitud, sí son equivalentes en el núcleo principal y en su empleo para combatir insectos.

En relación con lo que aquí denominamos núcleo principal se puede examinar que los compuestos sometidos a comparación poseen un grupo



en donde A y J (ver recuadro verde del cuadro comparativo anterior) están reemplazados por un grupo O-, y un grupo piraz I respectivamente, en donde en este último grupo uno de sus átomos de N está a su vez sustituido por un grupo fenilo o por un anillo heterocíclico, siendo de esta manera, más similares con los de la solicitud en trámite. Por tal razón, llamo la atención al hecho de que la estructura química revelada en la reivindicación 1 y subsidiarias, son el simple resultado de la realización de sustituciones frente a un núcleo básico comprendido en el estado de la técnica, y por ello predecible y obvio para una persona versada en la materia.

De igual manera, se insiste, si en gracia de discusión se estuviera frente a moléculas no reveladas textualmente con anterioridad en la literatura, es claro que en el mejor de los casos se estaría basando su nivel inventivo en la utilización de núcleos básicos conocidos y en la simple inclusión de sustituyentes diversos, que una persona con conocimientos en química y en síntesis, sería capaz de identificar y obtener mediante principios y métodos conocidos en la industria farmacéutica, sin que tal identificación y obtención supongan un aporte técnico sorprendente. En consecuencia, si en gracia de discusión se estuviera frente a una sustancia novedosa, la misma no cumpliría con el indispensable requisito de nivel inventivo, considerando que su obtención es una derivación evidente del arte existente, revelado en esta anterioridad.

Pese a lo anterior, es importante resaltar que los compuestos revelados en la tabla 9 de la WO 01/70671 A2, son a los revelados en la página 2 de la WO 03/01559 A1, equivalente a la solicitud colombiana en trámite 04-008-463, luego de hacer algunas sustituciones adecuadas, por tanto, es de recibo afirmar que la misma no cumple con el requisito de novedad dispuesto en la Decisión 486 de la Comunidad Andina.

1.2. Carece de nivel inventivo la composición farmacéutica revelada en las reivindicaciones 9 a 13, caracterizada porque comprende un compuesto como se define en la reivindicación 1, y un agente biológicamente activo adicional seleccionado de artropodocidas.

En este punto de la solicitud, la novedad y el nivel inventivo están dados por la combinación de dos grupos de principios activos en una formulación farmacéutica, y a su administración como parte de un método de control de plagas. No hace falta ser un experto en la materia para saber que el efecto sinérgico pretendido está dado por el efecto combinado de los principios activos, orientado al logro de un resultado mayor al que produciría la suma del efecto de cada uno de ellos individualmente considerado.

En la industria farmacéutica son muy comunes y conocidas las combinaciones de varios fármacos, y para ello existen múltiples ejemplos que no viene al caso mencionar, debido a su amplia divulgación y uso. La combinación de un compuesto como el descrito en la solicitud colombiana con otro tipo de agente como los mencionados en dicha reivindicación tiene la misma finalidad que en lo expuesto anteriormente, esto es, hacer que el efecto en el control de plagas de insectos, sea mayor que aquel que se obtendría mediante la administración individual de los componentes.

Para el caso en cuestión no sólo son conocidos tales componentes, sino que es absolutamente predecible la posibilidad de su combinación y la obtención del efecto sinérgico pretendido. Es bien sabido que la combinación de moléculas que tienen diferente mecanismo de acción puede ser utilizada para el tratamiento de una misma patología, o de manifestaciones relacionadas (ya sea en humanos,

animales o plantas), pues el efecto deseado se puede conseguir modificando o complementando la acción de cada uno de ellos.

El despacho debería considerar, además del conocimiento individual de los componentes de la combinación farmacéutica pretendida, es decir de los compuestos de fórmula I y de los otros agentes biológicos activos entre los que se menciona Fipronil, la predecibilidad del eventual efecto sinérgico entre ambas sustancias por obra de la identidad de funciones y del uso de ellos como insecticidas, razón por la cual la caracterización que nos ocupa carece de nivel inventivo.

Si tenemos en cuenta sus propiedades y efectos y si se contempla la posibilidad de emplearlos en combinación con los compuestos propuestos en la presente solicitud, es más que obvio pensar que la finalidad tal cual es la de potenciar el efecto mencionado anteriormente, queda demostrada en virtud de que cada compuesto (por separado) es utilizado para el tratamiento de la misma patología.

Por lo expuesto anteriormente reitero la petición de declarar fundada la oposición presentada, de negar en consecuencia el privilegio solicitado, y de ordenar el archivo del expediente respectivo.

II. PRUEBAS

Ruego que se tengan como tales, sin perjuicio de que el Despacho considere oficiosamente, las siguientes:

- Copia de la portada y de las páginas 1,2 y 75 de la publicación WO01/70671 A2.

Señor Superintendente,



JOSÉ LUIS REYES VILLAMIZAR

C.C. 79.152.473 de Usaquén
T.P.A. 44.655 de C.S.J.

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
27 September 2001 (27.09.2001)

PCT

(10) International Publication Number
WO 01/70671 A2

(51) International Patent Classification¹: C07C 235/00

(21) International Application Number: PCT/US01/08338

(22) International Filing Date: 20 March 2001 (20.03.2001)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
60/191,342 22 March 2000 (22.03.2000) US
60/220,232 24 July 2000 (24.07.2000) US
60/254,635 11 December 2000 (11.12.2000) US
60/262,015 17 January 2001 (17.01.2001) US

(71) Applicant (for all designated States except US): E.I. DU
PONT DE NEMOURS AND COMPANY [US/US]; 1007
Market Street, Wilmington, DE 19898 (US).

(72) Inventors; and
(73) Inventors/Applicants (for US only): LAHM, George,
P. [US/US]; 148 Fairhill Drive, Wilmington, DE 19808
(US). MYERS, Brian, J. [US/US]; 102 West Ruddy
Duck Circle, Oxford, PA 19363 (US). SELBY, Thomas,
P. [US/US]; 116 Hunter Court, Wilmington, DE 19808
(US). STEVENSON, Thomas, M. [US/US]; 103 Iroquois
Court, Newark, DE 19702 (US).

(74) Agent: BIRCH, Linda, D.; E.I. Du Pont de Nemours
and Company, Legal/Patent Records Center, 1007 Market
Street, Wilmington, DE 19898 (US).

(81) Designated States (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,
CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GR, GT, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL,
TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

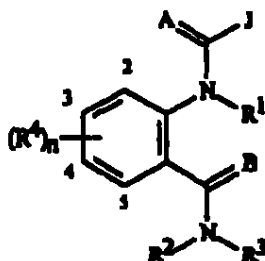
(84) Designated States (regional): ARIPO patent (GH, GM,
KH, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian
patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European
patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, EE, FI, FR, GB, GR, IE,
IT, LI, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF,
CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:
— without international search report and to be republished
upon receipt of that report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 01/70671 A2

(54) Title: INSECTICIDAL ANTHRANILAMIDES



(1)

(57) Abstract: This invention provides compounds of Formula (1), their *N*-ox-
ides and agriculturally suitable salts wherein A, B, J, R¹, R², R³ and R⁴ and n
are as defined in the disclosure. Also disclosed are methods for controlling
arthropods comprising contacting the arthropods or their environment with an
arthropodically effective amount of a compound of Formula (1) and compo-
sitions containing the compounds of Formula (1).

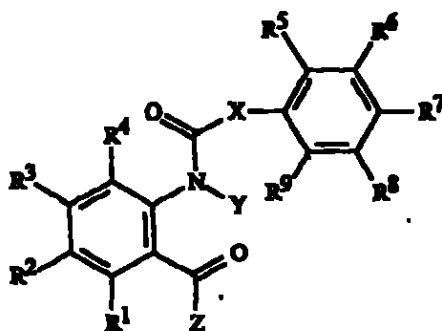
545

TITLE
INSECTICIDAL ANTHRANILAMIDES
BACKGROUND OF THE INVENTION

This invention relates to certain anthranilamides, their *N*-oxides, agriculturally suitable salts and compositions, and methods of their use as arthropodicides in both

The control of arthropod pests is extremely important in achieving high crop efficiency. Arthropod damage to growing and stored agronomic crops can cause significant reduction in productivity and thereby result in increased costs to the consumer. The control of arthropod pests in forestry, greenhouse crops, ornamentals, nursery crops, stored food and fiber products, livestock, household, and public and animal health is also important. Many products are commercially available for these purposes, but the need continues for new compounds that are more effective, less costly, less toxic, environmentally safer or have different modes of action.

NL 9202078 discloses *N*-acyl anthranilic acid derivatives of Formula i as insecticides



1

wherein, *inter alia*,

X is a direct bond;

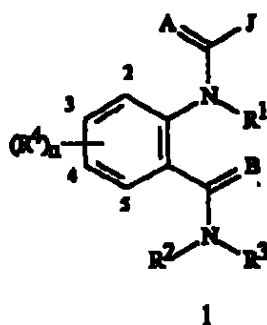
Y is H or C₁-C₆ alkyl;

Z is NH₂, NH(C₁-C₃ alkyl) or N(C₁-C₃ alkyl)₂; and

R¹ through R⁹ are independently H, halogen, C₁-C₆ alkyl, phenyl, hydroxy, C₁-C₆ alkoxy or C₁-C₇ acyloxy.

SUMMARY OF THE INVENTION

This invention pertains to a method for controlling arthropods comprising contacting the arthropods or their environment with an arthropodically effective amount of a compound of Formula 1, its *N*-oxide or agriculturally suitable salts



wherein

A and B are independently O or S;

each J is independently a phenyl or naphthyl group substituted with 1 to 2 R⁵ and optionally substituted with 1 to 3 R⁶;

or each J is independently a 5- or 6-membered heteroaromatic ring or an aromatic 8-, 9- or 10-membered fused heterobicyclic ring system wherein each ring or ring system is optionally substituted with 1 to 4 R⁷;

n is 1 to 4;

R¹ is H; or C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl or C₃-C₆ cycloalkyl each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₆ dialkylamino and C₃-C₆ cycloalkylamino; or

R¹ is C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylaminocarbonyl, C₃-C₆ dialkylaminocarbonyl or C(=A)J;

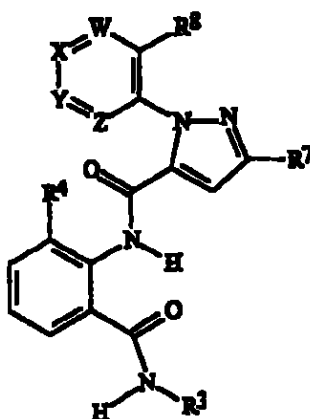
R² is H, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₆ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino, C₂-C₆ alkoxy carbonyl or C₂-C₆ alkylcarbonyl;

R³ is H; G; C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₂-C₆ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, each optionally substituted with one or more substituents selected from the group consisting of halogen, G, CN, NO₂, hydroxy, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₂-C₆ alkoxy carbonyl, C₂-C₆ alkylcarbonyl, C₃-C₆ trialkylsilyl, or a phenyl, phenoxy or 5- or 6-membered heteroaromatic ring, each ring optionally substituted with one to three substituents independently selected from the group consisting of C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₂-C₄ haloalkenyl, C₂-C₄ haloalkynyl, C₃-C₆ halocycloalkyl, halogen, CN, NO₂, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkylamino, C₂-C₆ dialkylamino, C₃-C₆ cycloalkylamino,

547

i-Pr	Cl	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	Br	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	I	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	F	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	H	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	Et	NCH ₂ CF ₃	CH	N	OMe
i-Pr	Me	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	Cl	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	Br	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	I	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	F	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	H	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe
i-Pr	Et	NCF ₂ CHF ₂	N	CH	OMe

Table 9



W	X	Y	Z	R ³	R ⁴	R ⁷	R ⁸
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Bu	Me	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Bu	Cl	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Bu	Br	CF ₃	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	Me
CH	CH	CH	CH	i-Bu	Me	Cl	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	Me
CH	CH	CH	CH	i-Bu	Cl	Cl	Me

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
Álvaro Correa Ordoñez
Apoderado

Oficio N°:
3797

ASUNTO:	Radicación PCT N°	04-8463
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	440
	Folios	017

Con fundamento en lo previsto por el artículo 43 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica que la oposición presentada por el doctor José Luis Reyes Villamizar, en su calidad de apoderado de Tecnoquímicas S.A., reúne los requisitos formales exigidos por la ley al momento de su presentación.

En cumplimiento de lo dispuesto en la citada norma, se le concede el término de sesenta (60) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, para que haga valer sus argumentaciones y presente pruebas.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha, 31 MAR. 2006.

202021