

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Dirección de Nuevas Creaciones

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-052700-00007-0000

Fecha: 2011-09-15 12:17:01 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 523 RESPUESTA Folios: 14

Expediente: 05-052.700

Titular: BAYER CROPSCIENCE S.A.

Asunto: CONTESTACIÓN A REQUERIMIENTO.

LUIS PATIÑO LEYVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en mi calidad de apoderado de **BAYER CROPSCIENCE S.A.**, por medio del presente memorial acudo a la Dirección de Nuevas Creaciones de la Superintendencia de Industria y Comercio con el fin de **DAR RESPUESTA** oportuna al Oficio No. **9756**, de acuerdo como sigue:

CLARIDAD, UNIDAD DE INVENCION, EXCEPCION DE PATENTABILIDAD Y REIVINDICACIONES RELATIVAS A UN USO

Con el fin de superar las objeciones que por claridad, unidad de invención, excepción de patentabilidad y reivindicaciones relativas a un uso planteó su Despacho, presento nuevo pliego reivindicatorio compuesto por diez (10) reivindicaciones, en el cual y siguiendo lo sugerido por el Señor Examinador, se han realizado las siguientes modificaciones. A saber:

- i. La nueva reivindicación independiente 1 se ha modificado para definir los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁷, R¹⁸, W y A según las modalidades de la invención que se encuentran debidamente sustentadas en el capítulo descriptivo. En vista de lo anterior, las definiciones de R⁸, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, p, r y s han sido eliminadas.
- ii. Al significado de "A" presente en las reivindicaciones 1, 6 y 8 ahora reivindica los sustituyentes 1,2- fenileno, 1,3- fenileno, 1,4- fenileno, 2,6 piridil o 2,5- piridil conforme con la página 12 de la descripción originalmente presentada.

- iii. Por su parte, las reivindicaciones dependientes 2 a 10 limitan las definiciones de los sustituyentes característicos de los compuestos de fórmula I, acorde con las modificaciones de la nueva reivindicación independiente 1.
- iv. La nueva reivindicación 9 especifica los grupos salientes, los solventes, las bases y las condiciones de operación.
- v. El nuevo pliego reivindicatorio ha eliminado las reivindicaciones 11 y 12 referentes al uso del compuesto de fórmula I.
- vi. Así mismo, se ha eliminado la reivindicación 13 referente al método para la represión de las plagas en un locus.

En relación con el sustento de la actividad de los compuestos que se desea proteger, respetuosamente pongo de presente que la descripción revela cinco ejemplos biológicos diferentes (métodos A, B, C, D y E, página 69 a 71), en los cuales se evalúa la actividad pesticida de dieciocho compuestos diferentes contra variedad de plagas (1-02, 1-05, 1-16, 1-20, 1-88, 2-22, 3-04, 3-20, 3-35, 4-20, 5-95, 5-113, 7-13, 7-34, 7-40, 7-73, 7-79, 7-85). Estos compuestos presentan patrones de sustitución que son característicos de los compuestos descritos en el nuevo pliego reivindicatorio.

Así pues, el alcance de protección de los compuestos que se reivindican en las modificaciones propuestas está enteramente soportado por los compuestos descritos en los ejemplos sintéticos y biológicos. A saber:

La Tabla 1 describe varios compuestos donde m es 0 y R^5 es el grupo CO_2R^{10} , incluyendo los compuestos 1-02, 1-04, 1-05, 1-16, 1-17, 1-19, 1-20, 1-24, 1-26 y 1-29. Dicha Tabla revela los datos de la caracterización física. Los compuestos específicos 1-02, 1-05, 1-16, 1-20 y 1-88 tienen actividad biológica contra *Diabrotica Undecimpunctata* y *Nephotettix Cinciceps* demostrada en los métodos de actividad biológica B y C.

La Tabla 2 describe los compuestos específicos de fórmula I donde m es 0 y R^5 es $CONR^9R^{10}$, incluyendo los compuestos 2-17, 2-22, 2-64, 2-65, 2-68, 2-74 y

2-77. Dicha tabla revela los datos de la caracterización física. De estos compuestos, el compuesto 2-22 es descrito en el método A como activo contra pulgas de gato.

La Tabla 4 describe compuestos donde m es 1 y R^5 es $CONR^9R^{10}$, incluyendo los compuestos 4-22, 4-23 y 4-62. Dicha tabla revela los datos de la caracterización física. El compuesto 4-20 tiene actividad biológica demostrada en el método A.

La Tabla 5 describe compuestos donde m es 1; A es alquenileno (ver el compuesto 5-26); alquileneno en donde a CH_2 es remplazado por un heteroátomo (ver por ejemplo 5-74); fenilo (por ejemplo, ver compuestos 5-95, 5-101, 5-104 y 5-110); y piridil (ver por ejemplo, compuestos 5-122 y 5-131). De estos compuestos, los compuestos 5-95 y 5-113 tienen actividad biológica contra pulgas de gato demostrada en el método A.

La Tabla 6 describe compuestos donde m es 1; A es alquileneno y R^5 es NR^9R^{17} , incluyendo compuestos 7-13, 7-19, 7-34, 7-40, 7-43, 7-50, 7-73, 7-79, 7-82 y 7-85. Dicha tabla revela los datos de la caracterización física. Los compuestos específicos 7-13, 7-34, 7-40, 7-73, 7-79 y 7-85 han mostrado actividad en los métodos A, D y E.

Finalmente, me permito anotar que las modificaciones realizadas al pliego reivindicatorio no amplían la materia objeto de protección, sino por el contrario limitan la misma, permitiendo una interpretación inequívoca del alcance de protección y su comparación con el estado del arte. En consecuencia, las mismas se encuentran en concordancia con los lineamientos de los artículos 14, 25, 28, 30 y 34 de la D.486.

Así las cosas, las modificaciones al nuevo pliego reivindicatorio dan por superadas las objeciones que por claridad, unidad de invención, excepción de patentabilidad y reivindicaciones relativas a un uso planteó su Despacho, puesto que se están reivindicando compuestos, procesos y composiciones de conformidad con el artículo 14 de la D. 486.

Por consiguiente, atentamente solicito al señor Examinador acepte las modificaciones propuestas y proceda con el respectivo estudio de patentabilidad.

NOVEDAD

El Despacho considera que la invención de mi representada se ve afectada en su novedad por D1, toda vez que el mismo revela compuestos de fórmula Ia, correspondientes a compuestos de arilpirazoles sustituidos, los cuales cubren compuestos contemplados en la solicitud en estudio. Así mismo, el Despacho afirma que D1 cubre los procesos para la obtención de los compuestos de fórmula I según la invención de mi representada.

El Despacho continúa diciendo que D2 enseña compuestos del tipo de los arilpirazoles sustituidos de fórmula I como los de la solicitud en estudio, aplicables como pesticidas de uso agrícola y veterinario. Adicionalmente, este documento divulga el procedimiento de obtención de los compuestos de fórmula I, mediante reacciones de síntesis como las utilizadas en los procedimientos reivindicados.

Establece el artículo 16:

"Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica [...]".

En este sentido, el Manual para el Examen de Solicitudes de Patentes de la Comunidad Andina¹, establece:

"Una invención tal como se reivindica se considera nueva si no forma parte del estado de la técnica....

*Para determinar la novedad de una invención, se debe **comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contengan***

¹ Documento realizado por la Oficinas de Patentes de los Países Miembros de la Comunidad Andina además de la OMPI y el IMPI, IEPI, BID. **"MANUAL PARA EL EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION EN LAS OFICINAS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL DE LOS PAISES DE LA COMUNIDAD ANDINA"**. Quito, Ecuador 2004.

explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención. El examen de patentabilidad se efectúa comparando elemento por elemento de la invención tal como está definida por las reivindicaciones con los del estado de la técnica.”² (Negrita fuera del texto)

Según las limitaciones realizadas al pliego reivindicatorio, respetuosamente hago notar al Despacho que la invención de mi representada goza de novedad a la luz de D1, como veremos a continuación:

1. R^5 solo puede ser CO_2R^{10} cuando m es 0. Este cambio resulta en un grupo CO_2R^{10} directamente unido al grupo carbonilo de $CON(R^7)-$ sustituido en la posición 5 del anillo de pirazol.
2. Adicionalmente, en la reivindicación 1, las definiciones de R^{17} y R^5 se han limitado para eliminar la sustitución por R^{10} y el grupo NR^9R^{17} respectivamente, para el cual ahora se requiere que el átomo de nitrógeno contenga un grupo CO_2 -alquilo(C_1-C_6), $-CH_2CO_2$ -alquilo(C_1-C_6), $CO_2CH_2R^{18}$ o CO -alquilo(C_1-C_6).

En conclusión, los compuestos con el patrón de sustitución α -dicarbonilo y con tales sustituyentes no se encuentran descritos ni son sugeridos en D1.

En relación con D2, los compuestos divulgados en este documento no incluyen (i) un grupo que contenga carbonilo en la definición de R^6 y (ii) un grupo amino o amino sustituido en las definiciones de sus radicales R^4 , R^5 y R^6 . Por tanto, los compuestos comprendidos por las reivindicaciones de la presente solicitud no se encuentran descritos en D2, en cuanto que el grupo CO_2R^{10} solo existe cuando se encuentra directamente unido al grupo carbonilo de $CON(R^7)-$ cuando $m = 0$, como ya se mencionó.

Por la tanto, según los lineamientos del artículo 16 y del Manual Andino la invención de mi representada goza de novedad a la luz de D1y D2.

² Íbidem, Pág. 63 a 65.

NIVEL INVENTIVO

El Despacho considera que los documentos D1 y D2 afectan el nivel inventivo de los compuestos de la solicitud en estudio, porque se trata de compuestos análogos que poseen la misma actividad y los cuales son aplicables como pesticidas tanto de uso agrícola como veterinario, de manera que los compuestos objeto de la solicitud en estudio se pueden derivar del arte previo.

De otra parte, el proceso de obtención no reviste condiciones ni forma de realización específicas, es más resulta tan general que a partir de reacciones convencionales, se pueden obtener un ilimitado número de compuestos.

Establece el artículo 18:

"Art. 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".

A este respecto, el Manual Andino³ en la sección 10.8. referente al nivel inventivo en áreas específicas de la tecnología, establece que en el área de la Química un compuesto o una composición química (preparación farmacéutica) tienen nivel inventivo si se cumple **alguno** de los dos requisitos siguientes :

*"- el compuesto tenga una estructura inesperada (caso poco frecuente);
o*

*- **presenta un efecto inesperado**, (es el caso mas frecuente sobre todo si el compuesto es similar a otros del estado de la técnica. El efecto inesperado puede ser completamente diferente de los descritos para los compuestos similares conocidos, o bien ser igual pero con una mejora en los resultados)" (Negrita fuera del texto).*

Continúa dicho Manual:

³ Manual Andino de Patentes. Pág.82.

"¿Qué es necesario considerar para que un compuesto nuevo tenga nivel inventivo?

Respuesta:

- 1. que el compuesto posea una estructura inesperada; o**
- 2. que el compuesto exhiba un uso o efecto sorprendente**

b. 1 Estructura inesperada

Es un caso poco frecuente. La estructura del nuevo compuesto no hubiera podido ser deducida por el técnico medio en la materia. El examinador no necesita examinar si este compuesto posee o no un uso o efecto sorprendente puesto que la mera estructura ya le confiere nivel inventivo

b.2 Efecto o uso no esperado

b.2.1 *La existencia de un efecto o uso sorprendente es la manera más común de establecer altura inventiva para compuestos nuevos, particularmente cuando tienen estructuras muy próximas a las del estado de la técnica.*

b.2.2 Tipos de efecto sorprendente: (i) completamente diferente de los usos o efectos conocidos de compuestos descritos en el estado de la técnica; y (ii) una mejora sustancial de un efecto de las misma índole que exhiba un compuesto conocido del estado de la técnica más próximo.

b.2.3 *Uso o efecto no descrito previamente: un uso o efecto se considera sorprende cuando para los compuestos descritos en el estado de la técnica no haya sido descrito ningún uso o efecto y éste no pueda ser derivable del conocimiento general."*⁴ **Negrita fuera del texto.**

Por lo tanto, a partir de los lineamientos del artículo 18 y los conceptos expuestos por el Manual Andino procedo a demostrar que la invención de mi representada no se derivaría de manera obvia y evidente de D1 y D2, por cuanto las características técnicas divulgadas en dichos documentos no enseñan ni sugieren la invención reivindicada por mi representada, la cual tiene una estructura y efecto técnico inesperados.

⁴ *Ibíd.* Pág 83

Los compuestos de la presente invención se diferencian de aquellos descritos en D1 y D2 en **los grupos de sustitución en la posición 5 del anillo de pirazol**.

Por su parte, D1 y D2 no muestran ninguna motivación dirigida hacia la modificación para obtener los compuestos reivindicados en la presente solicitud.

En este sentido, respetuosamente pongo de presente que un experto en la materia basado en sus conocimientos puede afirmar que la modificación de un compuesto farmacéutico activo conocido, tiene uno de cuatro resultados en términos de actividad. A saber, (i) el compuesto modificado puede no tener actividad; (ii) el compuesto modificado puede tener un nivel de actividad, reducido pero todavía detectable; (iii) el compuesto modificado puede tener el mismo nivel de actividad; y (iv) el compuesto modificado puede tener un nivel de actividad incrementado.

Por lo tanto, sin un entendimiento muy detallado de la relación estructura-actividad de una clase particular de compuestos, no es posible predecir cuál de los cuatro descritos será el resultado que se observará para cualquier compuesto particular probado.

En el presente caso, se observa que un entendimiento detallado de la relación estructura-actividad de los compuestos reivindicados no pudo haber sido derivado simplemente del estudio de D1 y D2. Por consiguiente, una persona versada en la materia, partiendo de las anterioridades citadas no habría esperado que la diferencia en la sustitución del anillo de pirazol que se atribuye a los compuestos de la presente invención y da lugar a una estructura inesperada, conllevará a compuestos con actividad antiparasitaria.

Por consiguiente, toda vez que no existe sugerencia en D1 o D2 con respecto a las modificaciones de los compuestos aquí reivindicados; se puede concluir, que D1 y D2 (solos o en combinación) no anticipan la materia de la presente invención y por lo tanto no afectan el nivel inventivo de la misma.

ANEXOS

- i. Nuevo pliego reivindicatorio compuestos por diez (10) reivindicaciones.

De acuerdo con todo lo expuesto, solicito en forma muy comedida y respetuosa a la Sr. Jefe de la Dirección de Nuevas Creaciones se sirva tener en cuenta las manifestaciones y documentos aportados junto con el presente memorial y, de conformidad con ello, se sirva continuar con el trámite de la solicitud de patente de la referencia.

Del señor Jefe de la División de Nuevas Creaciones,



LUIS PATIÑO LEYVA

C.C. 2.930.616 de Bogotá

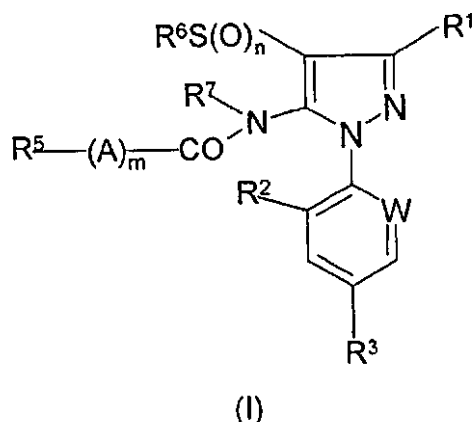
T.P.A. 2698 del C.S. de la J.

Cr 9. # 74 -08 (305)

Bogotá D.C.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la formula (I):



en donde:

R^1 es CN;

R^2 es halógeno;

R^3 es (C₁-C₃)- haloalquilo;

W es C- R^4 ;

R^4 es halógeno;

A es (C₂ – C₆)- alquilenos; o

es (C₃ – C₆) – alquilenos en el cual un carbón en la cadena es remplazado por O, S, SO, o SO₂ con la condición de que el grupo de remplazo no está encadenado al R^5 adyacente o al grupo carbonilo; o

es (C₂ – C₆)- alquilenos; o

es 1,2- fenileno, 1-3- fenileno, 1,4- fenileno, 2,6 piridil o 2,5- piridil;

R^5 es CONR⁹R¹⁰ cuando m es 0 o 1; o R^5 es NR⁹R¹⁷ cuando m es 1; o R^5 es CO₂R¹⁰ cuando m es 0;

R^6 es (C₁-C₃) haloalquilo;

R^7 es H o (C₁-C₆)- alquilo;

R^9 es H, o (C₁-C₆)- alquilo;

R^{10} es R⁹, o -[(C₁-C₆) alquilo] q-R¹¹; o

R^9 y R^{10} o R^9 y R^{17} , cada uno juntos con su respectivo átomo de N adjunto forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros el cual contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo el cual es seleccionado de O, S y N;

R^{11} es fenil;

R^{17} es CO₂(C₁-C₆)- alquilo, -CH₂CO₂(C₁-C₆)- alquilo, CO₂CH₂R¹⁸ o CO(C₁-C₆)- alquilo;

R^{18} es fenil;

n es 0, 1 ó 2;

m y q son cada uno, de manera independiente 0 ó 1;

o una sal pesticida aceptable de la misma.

2. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1, en donde:

R^{10} es R^9 , o $-[(C_1-C_6)\text{-alquilo}]_q-R^{11}$;

R^{17} es $CO_2(C_1-C_6)\text{-alquilo}$, $CO_2CH_2R^{18}$ o $CO(C_1-C_6)\text{-alquilo}$; y los otros valores son como se definieron en la formula (I)

3. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1, en donde:

m es 0;

R^5 es CO_2R^{10} ; y

R^{10} es H o $(C_1-C_6)\text{-alquilo}$.

4. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1, en donde:

m es 1;

A es fenil o piridil; y

R^5 es $CONR^9R^{10}$.

5. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde:

R^3 es CF_3 .

6. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1, en donde:

A es $(C_2-C_6)\text{-alquileo}$; o es $(C_2-C_6)\text{-alquileo}$ en el cual un carbón en la cadena es remplazado por O, S, SO o SO_2 con la condición de que este grupo de remplazo no está encadenado al R^5 adyacente o al grupo carbonilo; o es 1,2-fenileno, 1,3-fenileno, 1,4-fenileno, 2,6-piridil o 2,5-piridil.

7. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 en donde:

R^6 es CF_3 .

8. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en donde

R^3 es CF_3 .

R^4 es Cl;

A es $(C_1-C_6)\text{-alquileo}$; o es $(C_1-C_6)\text{-alquileo}$ en el cual el carbón en la cadena es remplazado por O, S, SO, SO_2 con la condición de que este grupo de remplazo no esté encadenado al R^5 adyacente o al grupo carbonilo; o es 1,2-fenileno, 1,3-fenileno, 1,4-fenileno, 2,6-piridil o 2,5-piridil:

R^6 es CF_3 ;

R^7 es hidrógeno o (C_1-C_2) -alquilo;

R^9 es H o (C_1-C_6) -alquilo;

R^{10} es H, (C_1-C_6) -alquilo; o

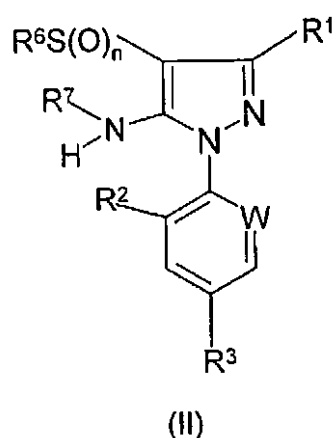
R^9 y R^{10} juntos, con el átomo de N adjunto forman un anillo saturado de cinco o seis miembros el cual opcionalmente contiene un hetero átomo adicional en el anillo el cual es seleccionado de O, S y N.

R^{17} es $CO_2(C_1-C_2)$ -alquilo, $CO_2CH_2R^{18}$ o $CO(C_1-C_2)$ -alquilo; y

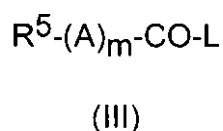
R^{18} es fenil.

9. Un proceso para la preparación de un compuesto de la formula (I) o una sal de la misma como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, cuyo proceso comprende:

a) donde R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A, m y n son como se define en la reivindicación 1, reaccionando un compuesto de formula (II):



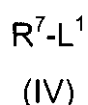
en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^6 , R^7 , W y n son como está definido en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III):



en donde R^5 , A y m son como se define en la reivindicación 1 y L es un grupo saliente seleccionado de halógeno, carboxilato, sulfonato o un heterociclo; y en donde la reacción es

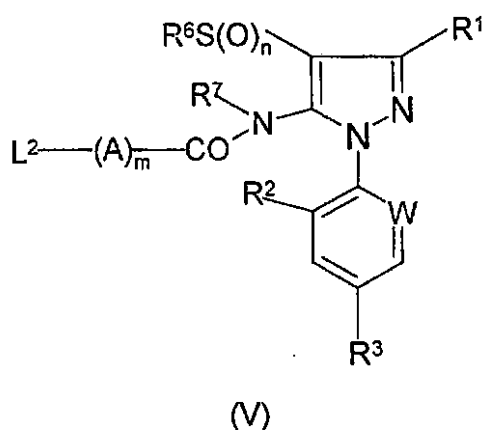
conducida en presencia de un solvente y una base seleccionada de una base de amina terciaria, un metal alcalino hídrido, un metal alcalino hidróxido, un metal alcalino carbonato y un metal alcalino alcoholato a una temperatura de desde 0° a 150° C; o

b) en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , W , A , m y n son como se definieron en la reivindicación 1, y R^7 es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión del hidrógeno, la alquilación o acilación del compuesto correspondiente de la fórmula (I) en la cual R^7 es hidrógeno, con un compuesto de la fórmula IV:

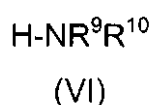


En donde R^7 es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión del hidrógeno y L^1 es un grupo halógeno saliente; en donde la reacción es conducida en la presencia de un solvente y una base a una temperatura de desde 0° a 100° C o;

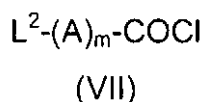
c) donde R^1 , R^2 , R^3 , R^6 , R^7 , W , A y n son como se definieron en la reivindicación 1, R^5 es NR^9R^{10} y m es 1, la sustitución nucleofílica del correspondiente compuesto de fórmula (V):



En donde R^1 , R^2 , R^3 , R^6 , R^7 , A , W y n son como se definieron en la reivindicación 1 m es 1 y L^2 es un halógeno o un grupo sulfonato saliente, con un compuesto de fórmula (VI):



En donde R^9 y R^{10} son como se define en la reivindicación 1, en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y una base a una temperatura de desde 0° a 100° C; en donde el compuesto de la fórmula (V) es preparada por la acilación del compuesto de fórmula (II) con un compuesto de fórmula (VII):



En donde L^2 es un grupo saliente seleccionado de halógeno, carboxilato, sulfonato o un heterociclo y A y m son como están definidas en la reivindicación 1; en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y de una base seleccionada de una base amina terciaria, un metal alcalino hidrido, un metal alcalino hidróxido, un metal alcalino carbonato y un metal alcalino alcoholato a una temperatura de desde 0° a 150° C; o

d) donde $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{W}, \text{A}$ y m son como se definieron en la reivindicación 1, y n es 1 ó 2, oxidando el correspondiente compuesto en cuyo caso n es 0 ó 1; y

e) si se desea, convertir el compuesto resultante de la fórmula (I) en una sal pesticida aceptable de la misma.

10. Una composición pesticida que comprende un compuesto de la fórmula (I) o una sal pesticida aceptable de la misma como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en asociación con un pesticida diluyente aceptable o un portador y/o un agente activo de la superficie.