

CÁSTELLANOS & Co.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-052700- -00005-0000

Fecha: 2010-12-03 14:37:56 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. **05.052.700**

Solicitud del examen de patentabilidad para: **"DERIVADOS PLAGUICIDAS DE 5-(ACILAMINO) PIRAZOLES"**

Solicitante: **BAYER CROPSCIENCE S.A.**

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

LUIS PATIÑO LEYVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pié de mi firma, en atención a su oficio No. **11678** notificado el 10 de septiembre de 2010, atentamente me permito dar repuesta al mismo de la siguiente manera:

Ante las objeciones del examinador:

Claridad

"No se encuentra suficiente sustento técnico con respecto a la actividad de todos los compuestos que se pretende proteger.

La reivindicación 1, tal como se presenta es muy general y no delimita en forma clara y concisa la materia a proteger, en razón a que de acuerdo con la fórmula estructural se tienen múltiples sustituyentes cuyos significados cubren toda clase de posibilidades... De la misma forma R5 y R7 cubren múltiples significados... Por tanto la reivindicación 1 abarca un número ilimitado de compuestos de los cuales no existe suficiente sustento técnico en la descripción."

"La reivindicación 9 relacionada con un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I, presenta de forma general mediante indicación de tipos

de reacción convencionales la obtención de los compuestos, sin especificar por ejemplo cual o cuales son los grupos lábiles, así como tampoco se especifican las condiciones en la forma de llevarla a cabo.

La reivindicación 13 relacionada con un método para la represión de plagas, que comprende la aplicación de una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula I, tal como se reivindica no presenta ninguna característica específica a la forma usual de aplicación...básicamente corresponde al uso de los compuestos de fórmula I. De otra parte cuando se aplica como medicamento veterinario corresponde a un método terapéutico"

El solicitante presenta un nuevo pliego reivindicatorio, en el cual se limitaron las definiciones de los radicales R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , R^9 , W y A , se eliminaron los radicales R^8 , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} y R^{16} , y se definió R^5 según el sustento descriptivo en la reivindicación 1. Los compuestos resultantes presentan patrones de sustitución que se encuentran debidamente soportados en la descripción por la evaluación de 18 compuestos representativos (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) en cinco diferentes ejemplos biológicos (métodos A, B, C, D y E, página 63-65 de WO 2004/049803).

Las siguientes son referencias a la descripción que sustentan la definición de R^5 :

- 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, mostrando los datos de la caracterización física. Compuestos específicos 1-02, 1-05, 1-16, 1-20 y 1-88 tienen actividad biológica demostrada contra *Diabrotica undecimpunctata* y *Nephotettix Cinciceps* en métodos de actividad biológica B y C.
- Tabla 2 describe los compuestos específicos de fórmula (I) donde m es 0; y R^5 es $CONR^9R^{10}$; incluyendo compuestos 2-17, 2-22, 2-64, 2-65, 2-68, 2-74 y 2-77, mostrando los datos de la caracterización física. De estos, el compuesto 2-22 es descrito en el método A como activo contra pulgas de gato.

- Tabla 4 describe compuestos donde m es 1 y R⁵ es CONR⁹R¹⁰; incluyendo compuestos 4-22, 4-23 y 4-62, mostrando los datos de la caracterización física. El compuesto 4-20 tiene actividad biológica demostrada en el método A.
- Tabla 5 describe compuestos donde m es 1; A es alquenileno (ver el compuesto 5-26); alquileno donde a CH₂ 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, los compuestos 5-95 y 5-113 tienen actividad biológica demostrada como activo contra pulgas de gato en el método A
- Tabla 6 describe compuestos donde m es 1; A es alquileno y R⁵ es NR⁹R¹⁷, incluyendo compuestos 7-13, 7-19, 7-34, 7-40, 7-43, 7-50, 7-73, 7-79, 7-82 y 7-85, para los cuales la Tabla 6 incluye los datos de la caracterización física. Los compuestos 7-13, 7-34, 7-40, 7-73, 7-79 y 7-85 han mostrado actividad en los métodos A, D y E.

Adicionalmente, se especificaron los grupos salientes en la reivindicación 9 y las condiciones del procedimiento, de acuerdo con las observaciones del examinador y se eliminó la reivindicación 13. Por favor noten que la expresión "grupo lábil" en la reivindicación 9, en realidad es "grupo saliente", lo cual corresponde a un error de traducción que se corrige en el nuevo pliego reivindicatorio.

Unidad de invención

"La reivindicación 1 cubre un ilimitado número de compuestos, dado que posee varios grupos sustituyentes que a su vez presentan sustituciones con grupos que pueden llegar a ser de un tamaño considerable con respecto a la estructura básica. De otra parte, los compuestos aril-pirazoles con sustitución en la posición 5, son conocidos en el arte previo, de manera que no existe un único concepto común nuevo e inventivo"

Con las limitaciones a las definiciones de los radicales antes mencionados, se supera esta objeción, toda vez que el tamaño de los sustituyentes no supera o iguala a la estructura base común en todos los compuestos reivindicados.

Excepciones a la patentabilidad y reivindicaciones relativas a un uso

"Teniendo en cuenta que los compuestos de fórmula I, son aplicables como medicamentos de uso veterinario, la reivindicación 13 no puede ser patentable, porque corresponde a un método terapéutico.

Las reivindicaciones 11 y 12 se refieren al uso del compuesto o de la composición para la obtención de un medicamento veterinario, y al uso de una composición para la represión de plagas, los cuales no son patentables porque no corresponden a un producto ni a un procedimiento"

Las reivindicaciones 11 a 13 fueron retiradas del capítulo reivindicatorio, en concordancia con la objeción del examinador.

Novedad

"El documento D1 (US5,556,873) revela compuestos de fórmula Ia, correspondientes a compuestos de arilpirazoles sustituidos, los cuales cubren compuestos contemplados en la solicitud en estudio... igualmente cubre los procesos para la obtención de los compuestos de fórmula I como los de la solicitud en estudio.

Una vez limitadas las definiciones de los radicales en las reivindicaciones se supera esta objeción, especialmente el caso de R^5 , el cual solo puede ser CO_2R^{10} (nuevo CO_2R^9) cuando m es 0 en el nuevo pliego reivindicatorio. Este cambio resulta en un grupo CO_2R^{10} (nuevo CO_2R^9) directamente unido al grupo carbonilo de $CON(R^7)$ - sustituido en la posición 5 del anillo de pirazol. Adicionalmente, en la reivindicación 1, se retiraron las definiciones de R^{10} (nuevo R^9) de R^{17} (nuevo R^{11}), y el grupo NR^9R^{17} (nuevo NR^8R^{11}) en la definición de R^5 , 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), $CO_2CH_2R^{18}$ (nuevo $CO_2CH_2R^{12}$) o CO -alquilo(C_1-C_6). De esta forma, los compuestos con el patrón de sustitución α -dicarbonilo y con tales sustituyentes no se encuentran descritos ni son sugeridos por el arte previo D1.

De la misma forma D2 (EP0811615) 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... En este documento se divulga el procedimiento de obtención de los compuestos de fórmula I, mediante reacciones de síntesis como las utilizadas en los procedimientos reivindicados"

En el caso de D2, los compuestos divulgados en este documento no incluyen 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 ya limitadas de la presente solicitud no se encuentran descritos ni sugeridos por D2, en cuanto que el grupo CO_2R^{10} (nuevo CO_2R^9) solo existe cuando se encuentra directamente unido al grupo $CON(R^7)$ - (cuando $m = 0$), como ya se mencionó.

Nivel inventivo

"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.

La reivindicación 13 además de que corresponder a un tratamiento terapéutico, no presenta nivel inventivo, puesto que se trata simplemente de aplicar los compuestos de fórmula I en una cantidad efectiva, lo cual corresponde a la forma usual de aplicar este tipo de compuestos"

Ninguno de los documentos D1 o D2 presenta las enseñanzas que permitan derivar la presente invención, la cual incluye patrones de sustitución y grupos sustancialmente diferentes. Más aún, D1 y D2 no muestran ninguna motivación dirigida hacia la modificación del anillo de pirazol con la sustitución en la posición 5 para obtener los compuestos reivindicados en la presente solicitud.

CASTELLANOS & Co.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Debe tenerse en cuenta que en el campo de los activos biológicos, los cambios estructurales pueden impactar significativamente en la actividad biológica y/o toxicidad que presente un compuesto. Por tanto la diferencia en la sustitución del anillo de pirazol que se atribuye a la presente invención podría conllevar a propiedades farmacológicas, características de la unión a los receptores, actividad farmacocinética o la selectividad por un receptor biológico específicos diferentes a los reportados en el arte previo.

Finalmente, en ausencia de sugerencia o motivación en el arte previo que conlleve a la producción de los compuestos reivindicados y su actividad antiparasitaria, las reivindicaciones de la presente solicitud no pueden ser consideradas derivación obvia de las enseñanzas del arte previo.

En conclusión, solicito a su Despacho continuar con el trámite de la presente solicitud de patente toda vez que las objeciones planteadas han sido claramente superadas. Y en caso que el examinador considere que las objeciones no son superadas por completo, solicito encarecidamente, se conceda la oportunidad de enmendar la solicitud.

Anexos

1. Nuevo capítulo reivindicatorio
2. Formulario de modificaciones
3. Recibo de pago

De la Señora Jefe,



Luis Patiño Leyva
C.C. No. **2.930.616** de Bogotá
T.P.A. No. **2698** del C. Sup. de la Judicatura
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Tel.: 7560770

Bogotá, D.C. **03 DIC. 2010**

Memorial de respuesta a examen de fondo/P20053



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una solicitud

②

Nombre: BAYER CROPSCIENCE S.A.

Dirección: 55, avenue René Cassin
F-69009 Lyon, Francia

Domicilio: Lyon, Francia

Lugar de Constitución: Francia

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: LUIS PATIÑO LEYVA

Dirección: Calle 94A # 7A-09

Teléfono: 756 07 70 Fax: 755 01 58

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 2.930.616 TPA 2698

④

Número de Expediente:

05.052.700

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo capítulo reivindicatorio al cual solicito se realice examen de patentabilidad

⑥

Comprobante de pago No.

10-100,717

Fecha

26 de noviembre de 2010

⑦

Anexos:

☒ Comprobante de pago de la tasa.

☐ Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.

☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

☒ Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE

LUIS PATIÑO LEIVA

FIRMA

CC 2.930.616 de Bogotá - TPA 2698 CSJ

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página - LPL/P20053

03 DIC. 2010

7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 300174099

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-052700- -00005-0000

Fecha: 2010-12-03 14:37:56 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Evt: 379 FASENACIONALII
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 13

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 100,717
FECHA : NOVIEMBRE 26 DE 2010

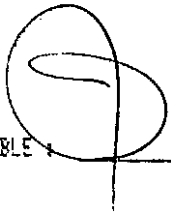
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	4772471	26/11/2010	12,375,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

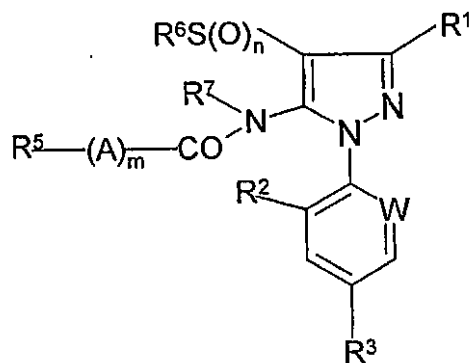
SON: CIENTO DATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

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)-alquileo

o es (C3-C6)-alquileo en el que un carbono en la cadena es reemplazado por O, S, SO, o SO₂ con la condición de que el grupo reemplazante no ha de estar unido al adjacente R^5 o grupo carbonilo; o es

(C2-C6)-alquenileno; o es

fenilo o piridilo, en el que tal fenilo o piridilo está sin sustituir o sustituido por uno o mas radicales seleccionados de un grupo que consiste en halógeno,

(C1-C6)-alquilo, (C1-C6)-haloalquilo, o (C1-C6)-alcoxi

R^5 es CONR⁸R¹⁰ cuando m es 0 o 1; o R^5 es NR⁸R¹¹ cuando m es 1; o R^5 es CO₂R¹⁰ cuando m es 0;

R^6 es (C1-C3)-haloalquilo;

R^7 es H

R^8 es H, o (C1-C6)-alquilo o

R^8 y R^9 o R^8 y R^{11} cada uno conjuntamente con el respectivo átomo de N unido, forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros, que contiene opcionalmente en el anillo un heteroátomo adicional que se selecciona entre O, S y N, el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionado de un grupo

que consiste en (C1-C6)-alquilo y CO₂-(C1-C6)-alquilo;

R^{10} es fenilo no sustituido o sustituido por uno o mas radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C1-C6)-alquilo, (C1-C6)-haloalquilo, y (C1-C6)-alcoxi

R^{11} es R^9 , CO₂(C1-C6)-alquilo, -CH₂CO₂(C1-C6)-alquilo, CO₂CH₂R¹² o CO(C1-C6)-alquilo;

R12 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o mas radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C1-C6)-alquilo, (C1-C6)-haloalquilo y (C1-C6)-alcoxi; n es 0, 1 o 2; m y q son, cada uno independientemente 0 o 1; o una de sus sales aceptables como plaguicidas.

2. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1 donde:

R9 es R8, o $-(C1-C6)\text{-alquilo}]_q\text{-R10}$

R11 es, $CO_2(C1-C6)\text{-alquilo}$, CO_2CH_2R12 o $CO(C1-C6)\text{-alquilo}$; y los otros significados son como se define en la fórmula (I).

3. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1 donde:

m es 0;

R5 es CO_2R9 ; y

R9 es H o (C1-C6)-alquilo.

4. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en la reivindicación 1 donde:

m es 1;

A es fenilo o piridilo; y

R5 es $CONR_8R_9$.

5. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 to 4 donde

R3 es CF_3 .

6. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 to 5 donde A

es (C2-C6)-alquilenos; o es (C2-C6)-alquilenos en el que un carbono en la cadena es reemplazado

por O, S, SO, o SO_2 con la condición de que el grupo reemplazante no ha de estar unido

al adjacente R5 o grupo carbonilo; o es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados de un grupo que consiste en halógeno, (C1-C4)-alquilo, (C1-C4)-haloalquilo, y

(C1-C4)-alcoxi; o es piridilo no sustituido o sustituido por

uno o más radicales seleccionados de un grupo que consiste en halógeno, (C1-C4)-alquilo, (C1-C4)-haloalquilo y (C1-C4)-alcoxi.

7. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde

R6 es CF3.

8. Un compuesto o una de sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 to 7 donde

R3 es CF3;

R4 es Cl;

A es (C1-C6)-alquileo; o es (C1-C6)-alquileo en el que un carbono en la cadena es reemplazado

por O, S, SO, SO2 con la condición de que el grupo reemplazante no ha de estar unido al adjacente R5 o grupo carbonilo; o es fenilo no sustituido o sustituido por uno o

mas radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C1-C2)-alquilo, (C1-C2)haloalquilo,

(C1-C2)-alcoxi; o es piridilo no sustituido o sustituido por

uno o más radicales seleccionado de un grupo que consiste en halógeno, (C1-C2)-alquilo,

(C1-C2)-haloalquilo y (C1-C2)-alcoxi;

R6 es CF3;

R7 es hydrogen o (C1-C2)-alquilo;

R8 es H o (C1-C6)-alquilo;

R9 es H, (C1-C6)-alquilo o

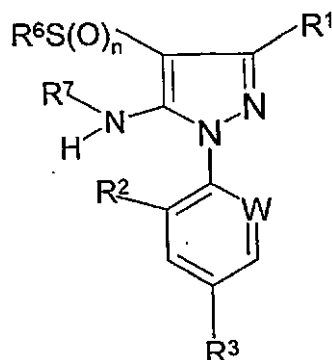
R8 y R9 junto con el átomo de Nitrógeno unido, forman un anillo saturado de 5 a 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que seleccionado de O, S y N

R11 es, CO2(C1-C2)-alquilo, CO2CH2R12 o CO(C1-C2)-alquilo; y

R12 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o mas radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, (C1-C2)-alquilo, (C1-C2)-haloalquilo y (C1-C2)-alcoxi.

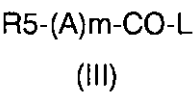
9. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, el cual comprende:

a) donde R1, R2, R3, R5, R6, R7, W, A, m y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II):



(II)

donde R1, R2, R3, R6, R7, W y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (III):



donde R5, A y m son como se definen en la reivindicación 1 y L es un grupo saliente seleccionado de halógeno, carboxilato, sulfonato o a heterociclo; y en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y una base seleccionada de una base de amina terciaria, una hidruro de metálico, un hidróxido metálico, un carbonato metálico, y un alcoholato metálico a una temperatura entre 0 a 150°C; o

b) donde R1, R2, R3, R5, R6, W, A, m y n are como se ha definido en la reivindicación1, y R7 es

son como se definen en la reivindicación 1 con la exclusión del Hidrógeno, la alquilación o acilación del

compuesto de fórmula (I) correspondiente, en el que R7 es Hidrógeno, con a compuesto de la fórmula (IV):

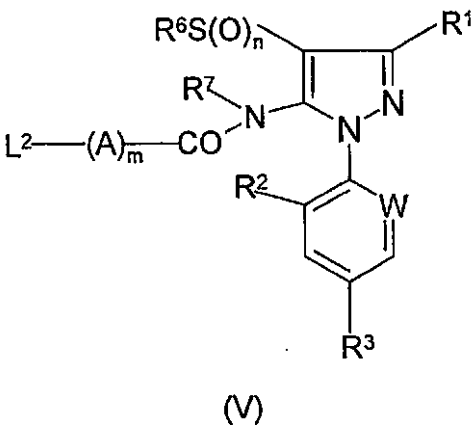


donde R7 es como se ha definido en la reivindicación1 con la exclusión del Hidrógeno y L1 es a leaving

group seleccionado de halógeno, carboxilato, sulfonato o a heterociclo; en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y una base a una temperatura entre 0 y 100°C; o

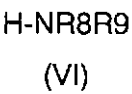
c) donde R1, R2, R3, R6, R7, W, A y n son como se ha definido en la reivindicación1, R5 es NR8R9

y m es 1, la sustitución nucelofílica del correspondiente compuesto de la fórmula (V):



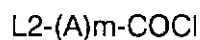
donde R1, R2, R3, R6, R7, A, W y n are como se ha definido en la reivindicación1, m es 1 y L2 es a

es un grupo saliente, con un compuesto de la fórmula (VI):



donde R8 y R9 are como se ha definido en la reivindicación1; en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y una base a una temperatura entre 0 y 100°C;

donde el compuesto de la fórmula (V) es prepara por la acilación de un compuesto de la fórmula (II) con a compuesto de la fórmula (VII):



(VII)

donde L2 es un grupo saliente seleccionado de halógeno, carboxilato, sulfonato o a heterociclo, y A y m son como se ha definido en la reivindicación 1; en donde la reacción es conducida en presencia de un solvente y una base seleccionada de una base de amina terciaria, un hidruro metálico, un hidróxido metálico, un carbonato metálico y un alcoholato metálico; a una temperatura entre 0 y 150°C..

e) donde R1, R2, R3, R5, R6, R7, W, A y m are como se ha definido en la reivindicación1, y n es 1

o 2, oxidar el correspondiente compuesto en el que n es 0 o 1; y

f) Si se desea, convertir un resultante compuesto de la fórmula (I) una de sus sales aceptables como plaguicida.

10. una composición plaguicida un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales aceptables como plaguicida como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en asociación con a diluyente o vehículo y/o un agente tensioactivo aceptable como plaguicida.