

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

258
258

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-059203-00009-0000

Fecha: 2009-10-20 14:06:20 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 14

Señora

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E.

S.

D.

Re.: Expediente No. 05.059.203

Solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, para:
AVERMECTINA B1 Y DERIVADOS DE MONOSACARIDOS DE AVERMECTINA B1
QUE TIENEN UN SUSTITUYENTE ALCOXIMETILO EN LA POSICION 4' O 4'
Solicitante: Merial Limited

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio No. 08493 notificado por fijación en lista el 24 de julio de 2009 correspondiente al examen de fondo, estando dentro del término legal en los siguientes términos:

Claridad de las reivindicaciones

Argumenta su Despacho que "las reivindicaciones no son concisas por cuanto existen múltiples posibilidades de sustitución a nivel del compuesto de fórmula (I) para los radicales R^2-R^3 (...) para las reivindicaciones 1-4 se encuentran términos como arilo, heterocíclico, ariloxi, ariltio ya que no es específica el número de carbonos que los conforman, no se define su tamaño, etc (...), en la reivindicación 1 en las excepciones se habla de $n=2$ pero según la definición de n en el folio 175 $n=2$ no está dentro del alcance de los compuestos de fórmula (I) (...)".

259

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Con el fin de dar por superada la objeción por claridad del capítulo reivindicatorio me permito presentar a su Despacho las siguientes aclaraciones:

En primer lugar, nuestro apoderado desea corregir la condición en la reivindicación 1 de la siguiente manera:

"...con la condición de que el compuesto no sea un derivado de Avermectina B1a o B1b

cuando n es 0, R_3 es H, y R_2 es $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$ o $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O-fenilo}$;

cuando n es 1, R_3 es H y R_2 es $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O-fenilo}$; o

cuando n es 0, y R_2 y R_3 juntos son $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ no sustituido."

La anterior corrección en la condición es necesaria para atender errores tipográficos originales obvios. En efecto, la invención se relaciona con compuestos donde n es 0 ó 1, y la condición original se refería a compuestos donde n era 1 ó 2. Dado que la condición se refería a n que era 2, es obvio para una persona versada en la materia que existe un error en dicha condición. Este error ocurrió porque los valores de n proporcionados (incorrectamente) en la condición original se refirieron al número total de grupos sacáridos presentes en los compuestos de la fórmula (I) reivindicados (1 ó 2) y no al número de grupos sacáridos adicionados (0 ó 1), ya que la fórmula (I) tiene un grupo sacárido en la fórmula (I), por eso cuando $n = 0$ se designa al monosacárido y cuando $n = 1$ se designa al disacárido. Adicionalmente, la parte de la condición que se refiere al derivado de Avermectina B2a o B2b se ha eliminado ya que la invención no se relaciona con dichos derivados. Ahora bien, los siguientes compuestos eran referidos en la condición original:

- a) derivados de Avermectina B1a o B1b cuando $n = 1$, $R_3 = \text{H}$, y $R_2 =$
 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$ o $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O-fenilo}$;

260
~~260~~

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

- b) derivados de Avermectina B1a o B1b cuando $n = 2$, $R_3 = H$, y $R_2 = -CH_2-CH_2-O-fenilo$;
- c) derivados de Avermectina B1a o B1b cuando $n = 1$, R_2 y R_3 juntos son $-CH_2-CH_2-CH_2-$;
- d) derivados de Avermectina B2a o B2b cuando $n = 1$, $R_3 = H$, y $R_2 = -CH_2-CH_2-OCH_3$.

Ya que n sólo puede ser 0 ó 1, se puede ver que si n fuera 1 en (b) existiría una superposición entre R_2 y R_3 en (a) y (b). Por lo tanto, una persona versada en la materia consideraría que el valor de n debe ser diferente en (a) y (b), menor que 2, y seguramente en el mismo orden, 0 y 1.

En este orden de ideas, nuestro apoderado considera que es aparente para un persona versada en la materia que los valores de n referidos como "1" y "2" en la condición original deberían ser realmente "0" y "1" respectivamente.

En cuanto a los sustituyentes del compuesto de fórmula (I), los mismos han sido restringidos, específicamente en las reivindicaciones 1 y 5. Sobre este punto, pongo de presente a su Despacho que los grupos arilo y heterociclilo son bien conocidos para una persona versada en la materia y además los mismos se encuentran debidamente ejemplificados en la descripción. Sin embargo, para dar mayor claridad al capítulo reivindicatorio, el grupo arilo se ha definido como fenilo, naftilo, antraceno y periloeno. En el caso del grupo heterociclilo, el mismo se ha definido como piridilo, pirimidilo, tienilo, furilo, etc. Dichas limitaciones se encuentran debidamente sustentadas en la descripción.

Por otra parte, pongo de presente a su Despacho que los compuestos de Avermectina B2 descritos en la página 4 de la solicitud PCT se citan sólo como información de antecedentes.

Excepciones de Patentabilidad

Con el fin de superar la objeción en cuestión, la reivindicación 7 ha sido eliminada del capítulo reivindicatorio.

261
~~261~~

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

Nivel inventivo

Con relación a los documentos US 5.169.839 (D1) y US 4,310,519 (D2), su Despacho afirma que los compuestos de US 5.169.839 (D1) hacen a los compuestos reivindicados no inventivos. Específicamente, su Despacho afirma que la única diferencia entre los compuestos de D1 y los compuestos de la presente invención es que los radicales R⁴ y R⁵ en D1 no son simultáneamente metilo, y que esta diferencia no proporcionaría una ventaja inesperada sobre los compuestos de la referencia D1. El solicitante respetuosamente no está de acuerdo por las razones que expongo a continuación:

En primer lugar, los compuestos reivindicados describen un grupo metilo en ambas posiciones referidas como R⁴ y R⁵ en D1. Las reivindicaciones en la presente solicitud son inventivas sobre las enseñanzas de D1, ya que específicamente se aleja en sus enseñanzas de los compuestos acá reivindicados basado en la divulgación de D1 que explícitamente excluye compuestos donde R⁴ y R⁵ son simultáneamente metilo (ver col. 2, líneas 37-44 de D1). Además, los compuestos acá reivindicados exhiben actividad sobre *S. littoralis*, *H. virescens* y *P. xylostella*, ninguno de los cuales son descritos en la referencia D1.

En este orden de ideas, la referencia D1 no hace obvios a los compuestos de la presente invención ya que se aleja en su enseñanza de los compuestos donde R⁴ y R⁵ son simultáneamente metilo, ni describe la actividad contra varias de las especies que son susceptibles a los compuestos acá reivindicados. Contrario a la afirmación del Sr. Examinador, una persona versada en la materia estaría guiado a alejarse de los compuestos que simultáneamente contienen grupos metilo en las posiciones correspondientes a las variables R⁴ y R⁵.

262
~~262~~

CASTELLANOS & CO.
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Por otra parte, su Despacho afirma que D1 en combinación con US 4,310,519 (D2) hace a la presente invención no inventiva, ya que la referencia D2 se relaciona con compuestos donde R^4 y R^5 son simultáneamente metilo. El solicitante nuevamente no está de acuerdo por las siguientes razones:

La referencia D2 se relaciona con derivados de ivermectina que son estructuralmente distintos de los presentes compuestos, ya que los compuestos de D2 no tienen otras sustituciones en la posición 4" que no sea -OH. En contraposición, los compuestos acá reivindicados requieren sustitución adicional en esta posición, que no imita estructuralmente al grupo -OH de los compuestos de D2. Estas diferencias estructurales imparten propiedades estéricas, electrónicas, farmacocinéticas y metabólicas, como también selectividad a receptores biológicos.

Estos efectos como resultado de los cambios estructurales no pueden ser predichos u obvios. Además, a causa de las diferencias significativas entre los compuestos de D1 y D2 y la enseñanza explícita en D1 contra los compuestos que contienen simultáneamente grupos metilo en las posiciones de R^4 y R^5 , una persona versada en la materia no estaría motivada a modificar las enseñanzas de D1 para arribar a los compuestos recitados en las reivindicaciones basados en D2.

Adicionalmente, la referencia D2 también falla en recitar la actividad contra *S. Littoralis*, *H. Virescens* y *P. Xylostella*, que se ha demostrado son susceptibles a los compuestos de la presente invención.

En este orden de ideas, solicito al señor examinador conceder el privilegio de patente a la presente invención toda vez que las objeciones de claridad y nivel inventivo han sido debidamente superadas.

263 263

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

De la Señora Jefe,

Margarita Castellanos Abondano
Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. **39.779.654** de Usaquén
T.P.A. No. **70819** del C. Sup. de la Judicatura
Calle 94 A No. 7 A - 09
Teléfonos: 7 56 07 70
Bogotá, D.C.,

264261



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

SOLICITANTE

Nombre: MERAL LIMITED
Dirección: 3239 Satellite Blvd
Duluth
Georgia 30096-4640
Estados Unidos de América
Domicilio: Georgia 30096-4640
Estados Unidos de América
Lugar de Constitución: Estados Unidos de América

Teléfono: Fax:
E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.
Dirección: Calle 94 A No. 7 A-09
Teléfono: 756 0770 Fax: 755 0158
E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Número 39'779.654 Cual TPA 70.819

4

Número de Expediente:

05.059.203

5

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio para llevar a cabo el examen de patentabilidad.

6

Comprobante de pago No.

09-66,171

Fecha

4 de septiembre de 2009

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 MARGARITA CASTELLANOS A.

FIRMA

Margarita Castellanos A.

CC 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 CSJ

265-253

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 66,171
FECHA : SEPTIEMBRE 4 DE 2009

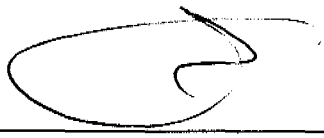
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	92622784	04/09/2009	10,415,000.00

***** 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	111,000.00
		TOTAL :	\$ 111,000.00

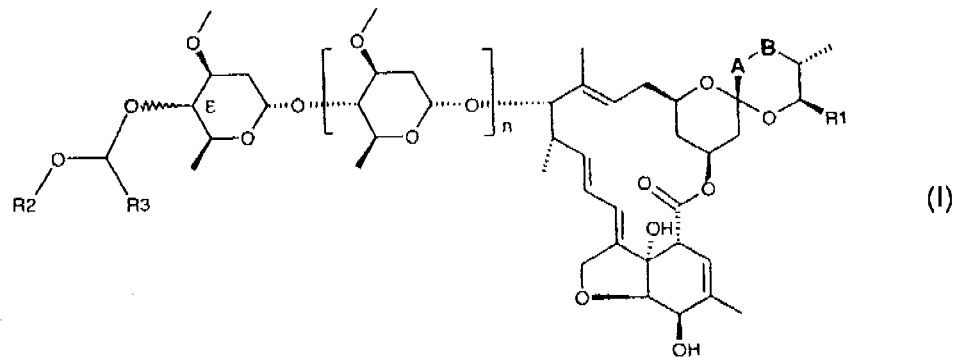
SÓN: CIENTO ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula



donde

n es 0 o 1;

A-B es $-\text{CH}=\text{CH}-$ o $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

R_1 es alquilo C_1-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_8 o alqueno C_2-C_{12} ;

R_2 es alquilo C_1-C_{12} , alqueno C_2-C_{12} , alquino C_2-C_{12} ; o alquilo C_1-C_{12} , alqueno C_2-C_{12} o alquino C_2-C_{12} , los cuales son sustituidos con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, $-\text{N}_3$, $-\text{NO}_2$; cicloalquilo C_3-C_8 que es opcionalmente sustituido con uno a tres grupos alquilo C_1-C_6 ; cicloalqueno C_3-C_8 que está opcionalmente sustituido con uno a tres grupos alquilo C_1-C_6 ; norbornilenilo-, halocicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , cicloalquiltio C_3-C_8 , haloalquiltio C_1-C_{12} , alquilsulfinilo C_1-C_{12} , cicloalquilsulfinilo C_3-C_8 , haloalquilsulfinilo C_1-C_{12} , halocicloalquilsulfinilo C_3-C_8 , alquilsulfonilo C_1-C_{12} , cicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , haloalquilsulfonilo C_1-C_{12} , halocicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , $-\text{NR}_4\text{R}_6$, $-\text{X}-\text{C}(=\text{Y})-\text{R}_4$, $-\text{X}-\text{C}(=\text{Y})-\text{Z}-\text{R}_4$, $-\text{P}(=\text{O})(\text{OalquilC}_1-\text{C}_6)_2$, arilo, heterociclilo, ariloxi, ariltio y heterociciloxi; donde los grupos arilo, heterociclilo, ariloxi, ariltio y heterociciloxi son opcionalmente - dependiendo de las posibilidades de sustitución en el anillo - sustituidos con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, Halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_{12} ,

267

Cicloalquilo C_3-C_8 , Haloalquilo C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_{12} , Haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , haloalquiltio C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , Si(alquil- C_1-C_{12})₃, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, arilo, ariloxi, heterociclilo y heterocicililoxi; o

R_2 es arilo, heterociclilo, cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 ; o arilo, heterociclilo, Cicloalquilo C_3-C_8 o Cicloalquenilo C_3-C_8 , los cuales son opcionalmente - dependiendo de las posibilidades de sustitución en el anillo - sustituidos con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_{12} , Cicloalquilo C_3-C_8 , haloalquilo C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_{12} , haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , haloalquiltio C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , dimetilaminoalcoxi C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , metilendioxi, arilo, ariloxi, heterociclilo y heterocicililoxi;

R_3 es H, alquilo C_1-C_{12} o alquilo C_1-C_{12} el cual está sustituido con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, $-N_3$, $-NO_2$; Cicloalquilo C_3-C_8 que está opcionalmente sustituido con uno a tres grupos alquilo C_1-C_6 ; norbornilenil-; Cicloalquenilo C_3-C_8 que está opcionalmente sustituido con uno a tres grupos metilo; halocicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , cicloalquiltio C_3-C_8 , haloalquiltio C_1-C_{12} , alquilsulfinilo C_1-C_{12} , cicloalquilsulfinilo C_3-C_8 , haloalquilsulfinilo C_1-C_{12} , halocicloalquilsulfinilo C_3-C_8 , alquilsulfonilo C_1-C_{12} , cicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , haloalquilsulfonilo C_1-C_{12} , halocicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , $-NR_4R_6$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, $-P(=O)(OalquilC_1-C_6)_2$, arilo, heterociclilo, ariloxi, ariltio y heterocicililoxi; donde los grupos arilo, heterociclilo, ariloxi, ariltio y heterocicililoxi son opcionalmente - dependiendo de las posibilidades de sustitución en el anillo - sustituidos con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, Halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_{12} , Cicloalquilo C_3-C_8 , Haloalquilo C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_{12} , Haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , haloalquiltio C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo

C_2-C_8 , $Si(alquil-C_1-C_{12})_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, arilo, ariloxi, heterociclilo y heterociclioxi; o

R_2 y R_3 juntos son un puente alquileo de tres a siete miembros o un puente alquenileno de cuatro a siete miembros, donde uno o dos grupos CH_2 pueden independientemente entre sí ser reemplazados por un grupo $-C(=O)-$, $-C(=S)-$, O, S, $-NR_5$, $-OC(=O)-O$, $-OC(=O)S-$, $-OC(=O)N(R_5)-$, $-C(=O)O-$, $-C(=O)S$, $-C(=O)N(R_5)-$, $-N(R_5)C(=O)S-$, $-N(R_5)C(=O)N(R_5)-$, y donde el puente alquileo o alquenileno puede estar independientemente entre sí sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en alquilo C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 y halogenalquilo- C_1-C_4 ;

X es O, NR_5 o un enlace;

Y es O ó S;

Z es O, S o NR_5

R_4 es H, alquilo C_1-C_{12} el cual está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, alcoxi C_1-C_6 y CN; alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , arilo, heterociclilo, aril-alquilo C_1-C_{12} , heterocicil-alquilo- C_1-C_{12} ; o arilo, heterociclilo, aril-alquilo- C_1-C_{12} o heterocicil-alquilo C_1-C_{12} , los cuales son - dependiendo de las posibilidades de sustitución - sustituidos opcionalmente en el anillo con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y haloalcoxi C_1-C_6 ;

R_5 es H, alquilo C_1-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , bencilo o $-C(=O)-alquilo C_1-C_{12}$;

R_6 es H, alquilo C_1-C_{12} el cual es opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C_1-C_6 , CN, alquenilo C_2-C_8 , haloalquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , Haloalquenilo C_1-C_{12} , $-X-C(=Y)-R_9$, $-X-C(=Y)-Z-R_9$, $-SO_2-R_9$, arilo, heterociclilo, arilalquilo C_1-C_{12} , heterocicil-alquilo C_1-C_{12} ; o arilo, heterociclilo, aril-alquilo C_1-C_{12} o heterocicil-alquilo C_1-C_{12} , los cuales son dependiendo de las posibilidades de sustitución - sustituidos opcionalmente en el anillo con uno a cinco sustituyentes

seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o

R₄ y R₆ juntos son un puente alquileo de tres a cinco miembros, donde uno de los grupos metileno puede estar reemplazado con O, S o SO₂; y

R₉ es H, alquilo C₁-C₁₂ el cual está opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆ y CN; alqueno C₂-C₈, alquino C₂-C₈, arilo, heterociclilo, aril-alquilo C₁-C₁₂, heterociclil-alquilo C₁-C₁₂; o arilo, heterociclilo, aril-alquilo C₁-C₁₂ o heterociclil-alquilo C₁-C₁₂, los cuales son - dependiendo de las posibilidades de sustitución - sustituidos opcionalmente en el anillo con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

y, donde fuese aplicable, a isómeros E/Z, mezclas de isómeros E/Z y/o tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal;

con la condición de que el compuesto no sea un derivado de Avermectina B1a o B1b

cuando n es 0, R₃ es H, y R₂ es -CH₂-CH₂-OCH₃ o -CH₂-CH₂-O-fenilo,

cuando n es 1, R₃ es H y R₂ es -CH₂-CH₂-O-fenilo, o

cuando n es 0, y R₂ y R₃ juntos son -CH₂-CH₂-CH₂- no sustituido;

donde arilo es seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, antraceno y perilo;

donde heterociclilo es seleccionado del grupo que consiste en piridilo, pirimidilo, s-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, tienilo, furilo, tetrahydrofuranilo, piranilo, tetrahidropiranilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzofuranilo, benzimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, coumarinilo e indazolilo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 de la fórmula (I) en la forma libre.

3. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 de la fórmula (I), donde R_3 es metilo.

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 de la fórmula (I), donde R_3 es alquilo C_3-C_8 .

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2 de la fórmula (I), donde R_3 es alquilo C_1-C_8 el cual está sustituido con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, $-N_3$, $-NO_2$, cicloalquilo C_3-C_8 que está opcionalmente sustituido con uno a tres grupos alquilo C_1-C_6 , norbornilenil-, cicloalquenilo C_3-C_8 que está opcionalmente sustituido con uno a tres grupos metilo; halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalcoxi C_3-C_8 , haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , arilo, heterociclilo, ariltio o heterocicililoxi; donde los grupos arilo, heterociclilo, ariltio y heterocicililoxi son opcionalmente - dependiendo de las posibilidades de sustitución en el anillo - sustituidos con uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en OH, Halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_8 , haloalquilo C_1-C_{12} , alcoxi C_1-C_{12} , haloalcoxi C_1-C_{12} , alquiltio C_1-C_{12} , haloalquiltio C_1-C_{12} , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo- C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_8 , alquinilo C_2-C_8 , $Si(alquil-C_1-C_{12})_3$, $-X-C(=Y)-R_4$, $-X-C(=Y)-Z-R_4$, arilo, ariloxi, heterociclilo y heterocicililoxi;

donde arilo es seleccionado del grupo que consiste en fenilo, naftilo, antracenilo y periloenilo;

donde heterociclilo es seleccionado del grupo que consiste en piridilo, pirimidilo, s-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, tienilo, furilo, tetrahidrofurano, piranilo, tetrahidropiranilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, benzotienilo, quinolinilo, quinoxalinilo, benzo-furanilo, benzimidazolilo, benzopirrolilo, benzotiazolilo, indolilo, coumarinilo y indazolilo.

2-4-1
241

6. Un pesticida que contiene al menos un compuesto de la fórmula (I) de la reivindicación 1 como compuesto activo y al menos un auxiliar.

272

272

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

202075
Bogotá, D.C.,

Abogado
MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO.

ASUNTO	Radicación	05059203
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	006

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐
		Cap. II	☒

No. Sol. Internacional	PCT/EP2003/014613
Fecha de Presentación Internal.	19-12-2003.

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

Documentos estudiados

<u>Descripción:</u>	Folios: 91 a 174	(como se radicó inicialmente)
<u>Reivindicaciones:</u>	Folios: 175 a 179	(como se radicó inicialmente)
	Folios: 266 a 271	Modificado.

Documentos requeridos por Art 46 : Folios 236 a 257

Respuesta del solicitante: Folios: 258 a 263

Prioridad: Folio 1 (20-12-2002, GB 0229804.0).

Se acepta para estudio el capítulo reivindicatorio de los folios 266 a 271.

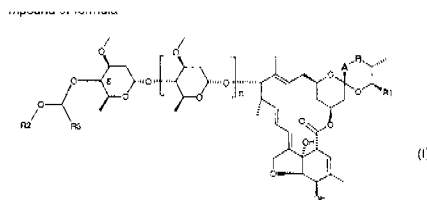
Objeto de la invención

Título de la solicitud: Avermectina B1 y derivados de monosacáridos de avermectina B1 que tienen un sustituyente alcoximetilo en la posición 4 "o 4'

Expediente 2005 059203

273
~~273~~

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en:
Compuestos derivados de Avermectina B1



Reivindicación 1-5: Un compuesto de fórmula I.
Reivindicación 6: Un pesticida que lo contiene

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad proporcionar compuestos que tienen propiedades pesticidas especialmente en el control de insectos y miembros del orden de la acarina.

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona los compuestos derivados de avermectina de fórmula I.

El objeto de la invención definido anteriormente se clasificó de acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (IPC): C07H17/08, A61K31/70 , A61P33/00

De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

La no son concisas por las siguientes razones:

- Aún existen múltiples posibilidades de sustitución a nivel del compuesto de fórmula I para los radicales R2-R3 especificados de acuerdo con los parámetros de sustitución señalados.

Se le sugiere al solicitante para tales restricciones tener en cuenta los ejemplos y las tablas de los folios 129 a 155.

Por lo tanto se definen muchísimas posibilidades de compuestos lo cual hace que no se pueda determinar que todos los que se obtienen finalmente , presenten la actividad reclamada.

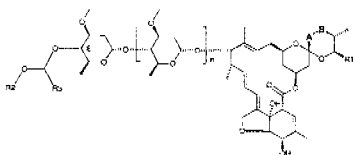
Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de presentación de la primera solicitud de patente de la cual se reivindica prioridad es 20-12-2002, se consultaron las bases de datos y los archivos con que cuenta la entidad con fecha de publicación anterior y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de Publicación
D3	SHOP, W.L. ET.AL INTERNATIONAL JOURNAL FOR PARASITOLOGY,26 (11) , PAGES 1227-1235, XP002280645	Efficacy in sheep and pharmacokinetics in cattle that led to the selection of Eprinomectic as a topical endectocide for cattle	1996
D4	JONES, TODD K. ET AL JOURNAL OF AGRICULTURAL AND FOOD CHEMISTRY Pages 1786-90 , XP002280646	Synthesis and Biological Activity of 4a,4"-Disubstituted Avermectins	1994

Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

Novedad (artículo 16 D486)

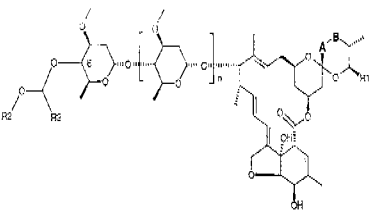
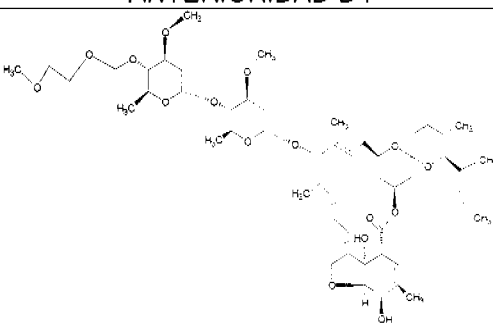


La reivindicación 1 dice “Un compuesto de fórmula I.

Respecto al estado de la técnica .

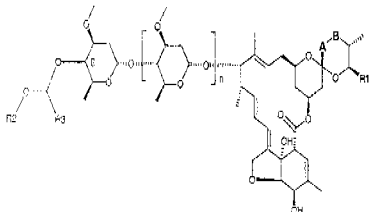
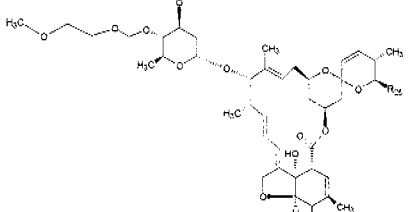
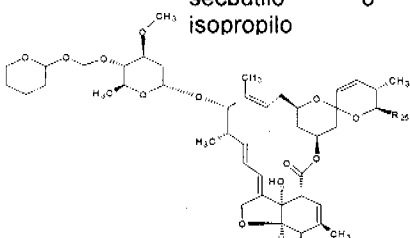
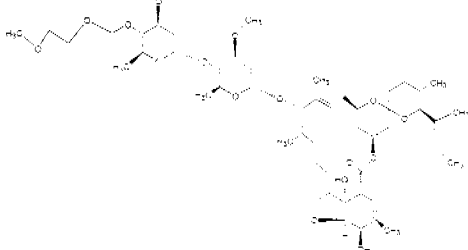
- Al comparar elemento por elemento el objeto de la presente solicitud con el estado de la técnica, esta oficina encuentra:

D4 (Folios 253 a 257) que divulga compuestos derivados de avermectina caracterizados por tener actividad como agentes antiparasitarios.

SOLICITUD		ANTERIORIDAD D4
 Corresponde al compuesto divulgado en la tabla 1 (compuesto 1.8). folio 143	R2 es -CH2-CH2-OCH3.	 Compuesto 1i
	R3 es hidrógeno.	
	n es 1	
	R1 es alquilo C1-12 (secbutilo) .	
	A-B es -CH=CH- o -CH2-CH2-	

Que D4 (folio 255, compuesto 1, donde X es OMEM (2-metoxietoximetil, ver folio 254, compuesto 1i) , ya divulga un compuesto específico reclamado bajo la fórmula I de la solicitud, tal como se expone en el cuadro comparativo. En consecuencia, los compuestos reclamados y ya divulgados, así como el pesticida que los contiene no son nuevos.

Nivel inventivo (artículo 18 D486)

SOLICITUD	D3	D4
	 compuesto 32 Donde R ₂₅ es o isopropilo  Compuesto 36	 Compuesto 1i

Para la reivindicación 1 en donde se reclama : Un compuesto de fórmula I . Cuando n es = 0 (derivados de avermectina B1 monosacáridos).

El documento del estado de la técnica más cercano es D3 (Folios 244 a 252) que divulga compuestos derivados de avermectina caracterizados por tener actividad como agentes antiparasitarios en ganado.

Para la reivindicación 1 en donde se reclama : Un compuesto de fórmula I . Cuando n es = 1 (derivados de avermectina B1 disacáridos).

El documento del estado de la técnica más cercano es D4 (Folios 253 a 257) que divulga compuestos derivados de avermectina caracterizados por tener actividad como agentes antiparasitarios.

La solicitud se diferencia de D3 y D4 en los sustituyentes a nivel del grupo alcoximetilo en la posición 4' (derivados monosacáridos) o 4'' (derivados disacáridos) de la avermectina B1.

Esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado o una ventaja a los compuestos reclamados en esta solicitud ya que no parecen presentar un mayor actividad antiparasitaria en comparación con los compuestos del estado de la técnica más cercano.

A pesar de que los compuestos reseñados en D3 (avermectina B1 monosacáridos) no se encuentran dentro del alcance de D1 por las restricciones realizadas en el folio (269 reivindicación 1) , al revisar dentro de la descripción de la actual solicitud de invención encontramos que los compuestos 32 y 36 de D3 corresponden a los mismos compuestos divulgados en la descripción en la tabla 3 (compuestos 3.8 y 3.45 respectivamente) y el compuesto 1i de D4 es el mismo divulgado en la tabla 1 (compuesto 1.8). Por lo tanto no se puede reconocer un nivel inventivo a la actual solicitud ya que los compuestos divulgados específicamente en cada uno de los documentos reseñados y que se encuentran claramente divulgados en la actual solicitud , según la descripción poseen la misma actividad antiparasitaria específica contra la *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera littoralis littoralis* sistémica , *Heliothis virescens*, *Plutella xylostella* , *Diabrotica balteada*, *Tetranychus urticae* con respecto a los demás compuestos reclamados.

El Problema Técnico Objetivo de esta solicitud es la necesidad de compuestos derivados de avermectina B1 caracterizados por ser agentes antiparasitarios contra la *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera littoralis littoralis* sistémica , *Heliothis virescens*, *Plutella xylostella* , *Diabrotica balteada*, *Tetranychus urticae*, alternativos a los ya conocidos en el estado del arte.

El Experto en la Materia, enfrentado al Problema Técnico Objetivo y conociendo el Estado de la Técnica (D3 y D4) hubiera sugerido sin mucho esfuerzo realizar diferentes tipos de sustitución a nivel del grupo alcoximetilo que sustituye a la avermectina B1 (monosacárido o disacárido) para obtener más compuestos con la misma actividad .

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en las reivindicaciones 1-5 es obvia y no tiene Nivel Inventivo.

El pesticida de la reivindicación 6 no tiene nivel inventivo porque el compuesto que lo caracteriza no es inventivo.

Respuesta a los argumentos del solicitante:

1. En cuanto a la claridad de la solicitud, el solicitante argumenta que la claridad de la solicitud se ve superada por el nuevo capítulo reivindicatorio presentado en cuanto a :

- Las condiciones o restricciones dadas en la reivindicación 1 .

Se aceptan los argumentos presentados por el solicitante en cuanto a los errores tipográficos presentados en el capítulo reivindicatorio inicial en cuanto a la inclusión de compuestos donde se define a n como 2 y a los derivados de avermectina B2a y B2b. Sin embargo al eliminar la condición inicial de cuando "n es 1, R3 es H y R2 es $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, el compuesto divulgado en el documento D4 (1i) queda incluido del presente análisis de patentabilidad , afectando la novedad de la solicitud.

- En cuanto a los sustituyentes del compuesto de fórmula I, los mismos han sido restringidos, específicamente en las reivindicaciones 1 y 5. Los grupos arilo y heterocíclico han sido definidos de acuerdo a la descripción.

Se aceptan los argumentos en cuanto a la aclaración de los términos arilo y heterocíclico los cuales como afirma el solicitante están divulgados de acuerdo a la descripción. Sin embargo en este punto se le sugiere al solicitante en lo posible restringir los compuestos actualmente reclamados en los radicales R2-R3 de acuerdo a las tablas y los ejemplos dados en la descripción. Esta gran variedad de sustituyentes definen muchísimas posibilidades de compuestos lo cual hace que no se pueda determinar que todos los que se obtienen finalmente , presenten la actividad reclamada.

2. En cuanto a los argumentos expuestos por el solicitante para el análisis del nivel inventivo de la solicitud, son aceptados por este Despacho ya que los documentos reseñados en el primer examen de fondo no divulgan la actividad antiparasitaria específica reclamada en la actual solicitud. Sin embargo en el presente análisis de patentabilidad de los folios (275 a 276) , realizada con los documentos solicitados por Art 46 denominados D3 y D4 , se observa que estos afectan el nivel inventivo de la solicitud.

Conclusión:

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D3	SHOP, W.L. ET.AL INTERNATIONAL JOURNAL FOR PARASITOLOGY,26 (11) , PAGES 1227-1235, XP002280645	1-6	Nivel inventivo.
D4	JONES, TODD K. ET AL JOURNAL OF AGRICULTURAL AND FOOD CHEMISTRY Pages 1786-90 , XP002280646	1-6	Nivel inventivo.

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días

contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

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 CÉSPEDES DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (C).

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 24-2010

CONCEPTO TÉCNICO No. 2411	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202075
-------------------------------------	--

EXAMEN TÉCNICO DE FONDO			
Nº Radicación	05059203	Fecha de presentación	17-06-2005
Nº Solicitud Internacional	PCT/EP2003/014613	Fecha Solicitud Internacional	19-12-2003
Nº Prioridad	GB 0229804.0	Fecha de Prioridad	20-12-2002
Palabras clave			
AVERMECTIN COMPOUNDS AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES	ANTIPARASITIC ACTIVITY	COMPOUNDS C-076	AVERMECTIN B1
CLASIFICACIONES INTERNACIONALES DE BÚSQUEDA			
C07H17/08, A61K31/70, A61P33/00			
DOCUMENTOS CORRESPONDIENTES EN OTROS PAÍSES			
Ver hoja anexa			
Patente Original			
BASES DE DATOS CONSULTADAS			
EPOLINE	COLOMBIANA	scirus	CHEMSPIDER
ESPACENET	SINGAPUR	FREEPATENTS	PATENT FAMILY
uspto	depatinet	SURECHEM	
INFORMES DE EXÁMENES EN OTRAS OFICINAS			
Oficina	Fecha	Relev. afectadas	
EUROPEA	21-02-2005	1-7	
USPTO	01-07-2008	1-7	
ANTERIORIDADES ENCONTRADAS			
Documento	Relev. afectadas	Relevancia	
US5189839	1-6	Nivel Inventivo.	
US4310619	1-6	Nivel Inventivo.	
LITERATURA NO PATENTES			
Documento	Relev. afectadas	Relevancia	
Observaciones			
Fecha del examen			

- 1 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: AU2003302284 (A1) — 2004-07-14
- 2 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: BR0317601 (A) — 2005-11-29
- 3 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: CA2507774 (A1) — 2004-07-08
- 4 Avermectin b1 and avermectin b1 monosaccharide derivatives having an alkoxyethyl substituent in the 4"- or 4'-position in my patents list
Publication info: CN1738828 (A) — 2006-02-22
- 5 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: EP1581546 (A1) — 2005-10-05
- 6 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: JP2006515849 (T) — 2006-06-08
- 7 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: KR20050088133 (A) — 2005-09-01
- 8 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: MA27546 (A1) — 2005-12-01
- 9 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4aCO- OR 4aCOE-POSITION in my patents list
Publication info: MXPA05006036 (A) — 2005-08-18
- 10 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: PL377497 (A1) — 2006-02-06
- 11 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTINE B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES WITH ALKOXYMETHYL SUBSTITUTE IN THE POSITION 4"- OR 4'- in my patents list
Publication info: RU2330857 (C2) — 2008-08-10
- 12 AVERMECTIN DERIVATIVES, PESTICIDE COMPOSITION AND METHOD OF PEST CONTROL in my patents list
Publication info: UA81281 (C2) — 2007-12-25
- 13 Avermectin b1 and avermectin b1 monosaccharide derivatives having an alkoxyethyl substituent in the 4"-or 4'-position in my patents list
Publication info: US2006148729 (A1) — 2006-07-06
- 14 AVERMECTIN B1 AND AVERMECTIN B1 MONOSACCHARIDE DERIVATIVES HAVING AN ALKOXYMETHYL SUBSTITUENT IN THE 4"- OR 4'-POSITION in my patents list
Publication info: WO2004056844 (A1) — 2004-07-08
- 15 Avermectin B1 and Avermectin B1 monosaccharide derivatives having an alkoxyethyl substituent in the 4"- or 4'-position in my patents list
Publication info: ZA200504353 (A) — 2006-03-29

278