



No. 06-129099- -00015-0000

Fecha: 2012-08-22 14:58:01 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 23 RESPUESTA Folios: 11

Señor Director

**División de Nuevas Creaciones**

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

E. S. D.

Ref.: Expediente No. 06 129099

Solicitud de patente PCT entrada en Fase Nacional, para: "**DERIVADOS DE PIPERIDINA Y SUS USOS COMO INSECTICIDAS, ACARICIDAS, MOLUSQUICIDAS O NEMATICIDAS**"

Solicitante: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

## **RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO**

Yo, **Margarita Castellanos Abondano**, identificada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio **No.5530** notificado por fijación en lista del 11 de abril de 2012, estando dentro del término de la prórroga solicitada el 29 de junio de 2012, en los siguientes términos:

### **De la solicitud de patente**

Su Despacho concluye que el pliego reivindicatorio de la presente solicitud de patente no cumple con las disposiciones del artículo 30 de la Decisión 486. El Examinador señala que se debe representar el benceno con la figura convencionalmente empleada en el estado de la técnica y adicionalmente pone de presente lo siguiente:

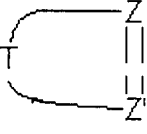
- "La reivindicación 5 no es clara porque al tratarse de una composición esta debería definirse en términos de sus componentes y proporciones, sólo se

está indicando un componente y no se está mencionando en que proporciones debe ir. Se sugiere incluir los componentes y proporciones en las que debe ir”.

Con el fin de atender las observaciones formuladas a este respecto, y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 5 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado.

En este nuevo capítulo reivindicatorio, se ha revisado la redacción de la reivindicación 5 con el fin de hacer claridad sobre la materia que se solicita proteger y el alcance de la misma.

Específicamente, en la nueva reivindicación 5 se caracteriza la composición objeto de la invención por sus componentes y su relación en la composición, de conformidad con las enseñanzas de la descripción (ver página 117, líneas 18-26 de la solicitud internacional).

Asimismo, la figura  ha sido reemplazada por  de conformidad con las sugerencias del Señor Examinador. Por lo tanto, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

Así entonces, teniendo en cuenta las modificaciones efectuadas al capítulo reivindicatorio, consideramos que las objeciones que por claridad hizo su Despacho quedan superadas ya que el nuevo capítulo reivindicatorio se encuentra redactado en los términos sugeridos por su Despacho y el mismo es ahora claro y conciso.

#### Nivel inventivo

Su Despacho concluye que el documento EP0494717 (D1) afecta el nivel inventivo de la presente solicitud de patente. En cuanto a las objeciones del examinador deseamos poner de presente lo siguiente:

De acuerdo con el artículo 18 de la Decisión 486:

***“Artículo 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”.***

Así entonces, es claro que en la evaluación de nivel inventivo de la presente invención, el documento citado D1 **debería** revelar sugerencias y enseñanzas claras para el técnico en la materia que lo lleven a obtenerla. Para este fin, el Señor Examinador debe examinar si, de conformidad con dicho documento (el estado de la técnica más cercano), una persona versada en la materia habría o no propuesto las características técnicas que distinguen la invención reivindicada y que permiten alcanzar los resultados obtenidos por dicha invención.

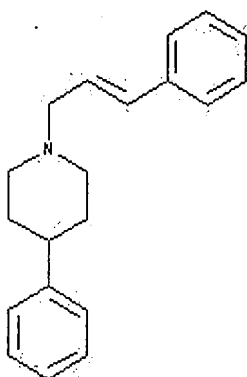
De conformidad con el anterior artículo, se exponen a continuación las razones por las cuales la presente invención posee nivel inventivo frente a las enseñanzas del documento D1:

El problema técnico planteado en la presente solicitud es la necesidad de proporcionar derivados de piperidina para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos. Este problema es precisamente el que soluciona la presente invención, toda vez que proporciona derivados de piperidina que presentan los efectos deseados.

De acuerdo con el Señor Examinador, en el documento D1 se menciona que los compuestos tienen una actividad contra seres vivos y hongos y por lo tanto, una persona versada en la materia se vería motivada a emplear las enseñanzas de dicho documento para llegar al objeto de la reivindicación 1 realizando ensayos de la actividad de compuestos derivados de piperidina en contra de otros seres vivos, tales como insectos, acaricidas, molusquicidas o nematocidas. Respetuosamente deseamos poner de presente que no compartimos la opinión del Señor Examinador, toda vez que los hongos e insectos son biológicamente muy diferentes entre sí y en consecuencia, una persona versada en la materia sin

experimentación alguna no esperaría que un compuesto fungicidamente activo sea también activo como insecticida.

Con el fin de demostrar lo anterior, se comparó un compuesto descrito en D1 estructuralmente similar con un compuesto de fórmula (I), como el cubierto por la reivindicación 1 de la presente solicitud. El compuesto de D1 es proporcionado a continuación:



4-fenil-1-(3-fenil-2-propen-1-il)-piperidina

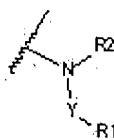
El compuesto anterior (de D1) fue tomado y evaluado en el mismo procedimiento de ensayo que se reporta en la presente solicitud de patente. Los resultados obtenidos se presentan anexos al presente memorial.

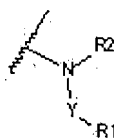
El compuesto de D1 proporcionó **0% control a 200ppm** cuando se evaluó de acuerdo con los procedimientos descritos mientras que el compuesto de fórmula (I') proporcionó **más de 80% control a 200ppm** (ver páginas 150-151 de la solicitud internacional).



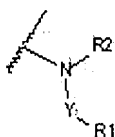
De modo que, es claro que el grupo  presente sobre el anillo fenilo en la posición "orto" (en relación con la piperidina) permite obtener un efecto significativamente mejorado y es muy importante para la actividad insecticida.

Así entonces, es claro que los compuestos acá reivindicados presentan una actividad insecticida mejorada frente a compuestos similares ya conocidos en el estado de la técnica (i.e. D1) y por lo tanto, no es posible derivar los mismos de manera obvia u evidente a partir de las enseñanzas de D1. En particular, el documento D1 no



enseña ni sugiere incluir el grupo  presente sobre el anillo fenilo en la posición “orto” (in relación con la piperidina), tal como en los compuestos reivindicados y mucho menos permite prever con absoluta certeza el efecto mejorado sobre la actividad insecticida al realizar dicha modificación. De tal manera que, no se entiende cómo una persona versada en el arte podría verse motivada a obtener los compuestos acá reivindicados y el efecto técnico obtenido con los mismos a partir de las enseñanzas generales del documento D1.

En efecto, debido a que en el documento D1 no existe ninguna enseñanza o sugerencia que motive a una persona versada en la materia a incluir el grupo



de acuerdo con lo recitado en la reivindicación 1 de la presente invención con el fin de presentar un efecto mejorado en la actividad insecticida de derivados de piperidina, tal como lo hace la presente solicitud, la materia divulgada en la presente solicitud se debe tener como inventiva frente a dicho documento, ya que tal y como lo señala el Manual Andino de Patentes un compuesto tiene nivel inventivo cuando:

***“- presenta un efecto inesperado, (es el caso más 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 similarmente conocidos, o bien ser igual pero con una mejora en los resultados)”<sup>1</sup>.***

<sup>1</sup> 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. Página 82.

Adicionalmente, deseamos poner de presente que los compuestos de fórmula (IIa) y (IIb) también son inventivos toda vez que los mismos son compuestos intermediarios de los compuestos insecticidas inventivos de fórmula I'.

### **Conclusión.**

Así entonces, teniendo en cuenta que las enseñanzas de la anterioridad D1 citada por su Despacho no llevan a un técnico versado en la materia a obtener los compuestos acá reivindicados toda vez que no enseña ni sugiere como un todo las características técnicas esenciales de los mismos, es claro que a partir de dicho documento no era posible para un técnico medio obtener de manera obvia y/o evidente la presente invención. Lo anterior, si se tiene en cuenta que para el estudio de nivel inventivo el Examinador no puede adoptar la posición de un inventor y que además no puede partir de la solución dada sino simplemente de lo que expresamente revelen el o los documentos más cercanos del estado del arte, que en el presente caso es D1.

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 30 y 18 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se proceda con la concesión de la presente solicitud.

### **Anexos**

Nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 5 reivindicaciones.

Datos experimentales.

Señor Director,

  
Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. 39.779.654 de Usaquén

T.P.A. No. 70.819 de C.S.J.

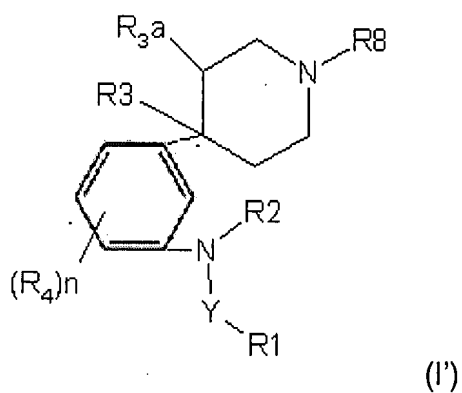
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.

Tel.: 7560770

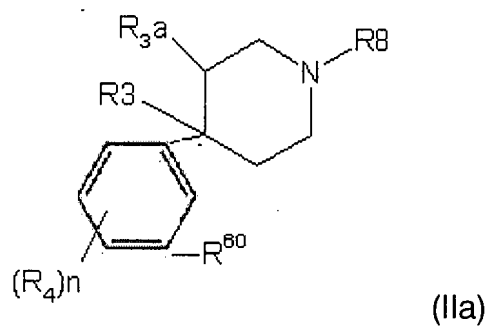
Bogotá D.C. **22 AGO. 2012**

## REIVINDICACIONES

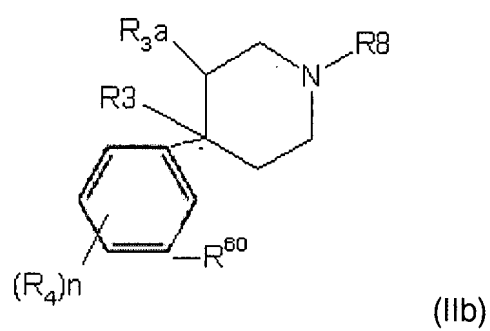
1. Un compuesto de Fórmula I'



o un compuesto de Fórmula IIa



o un compuesto de Fórmula (IIb)



donde Y es C=O;

R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, o piridilo (opcionalmente sustituido con halo);

R<sup>2</sup> es hidrógeno;

R<sup>3</sup> es hidrógeno;

$R^{3a}$  es H o  $R^3$  y  $R^{3a}$  juntos forman un enlace;

cada  $R^4$  es independientemente halógeno, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , haloalcoxi  $C_{1-6}$ , o alcoxicarbonilo  $C_{1-6}$ ; n es 0, 1 o 2;

y en los compuestos de fórmula (I') o (IIa)  $R^8$  es  $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$  donde z es 1,  $R^{51}$  y  $R^{52}$  son cada uno independientemente H o alquilo  $C_{1-2}$ ,  $R^{53}$  y  $R^{54}$  son cada uno independientemente hidrogeno o halógeno, y  $R^{55}$  es fenilo opcionalmente sustituido por un halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , o haloalcoxi  $C_{1-4}$ ;

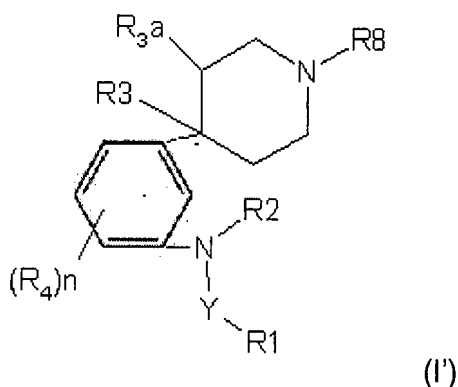
y en los compuestos de fórmula (IIb)  $R^8$  es metilo, bencilo o  $COO$ alquilo  $C_{1-6}$  con la condición que el compuesto no es tert-butil 4-(2-aminofenil)piperidina-1-carboxilato o 2,4-diamino-5-(1-bencil-4-piperidinil)-pirimidina,  
y  $R^{60}$  es  $NH_2$ ,  $NO_2$  o halógeno;  
o sales o N-óxidos de los mismos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde  $R^1$  es piridilo halo-sustituido.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2 donde  $R^4$  es independientemente flúor, cloro, bromo, alquilo  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ ; n es 1 o 2.

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde  $R^{51}$ ,  $R^{52}$ ,  $R^{53}$  y  $R^{54}$  son hidrógeno.

5. Una composición insecticida y acaricida que comprende 0.0001 a 95% en peso de un compuesto de fórmula I'



donde Y es C=O;

R<sup>1</sup> es alquiloC<sub>1-6</sub>, haloalquiloC<sub>1-6</sub>, o piridilo (opcionalmente sustituido por halógeno);

R<sup>2</sup> es hidrógeno;

R<sup>3</sup> es hidrógeno;

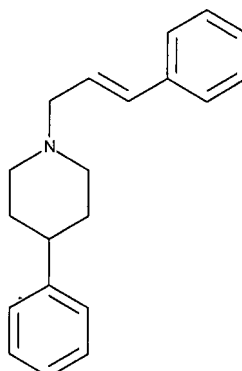
R<sup>3a</sup> es H o R<sup>3</sup> y R<sup>3a</sup> juntos Forman un enlace;

cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, alquiloC<sub>1-8</sub>, haloalquiloC<sub>1-8</sub>, haloalcoxiC<sub>1-6</sub>, o alcóxicarboniloC<sub>1-6</sub>; n es 0, 1, o 2;

R<sup>8</sup> es -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> donde z es 1, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H o C<sub>1-2</sub> alquil, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente hidrógeno o halógeno, y R<sup>55</sup> es fenilo opcionalmente sustituido por halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, o haloalcoxi C<sub>1-4</sub>; o sales o N-óxidos del mismo, un diluyente o portador inerte adecuado y, opcionalmente, un agente activo de superficie.

### **Datos Experimentales.**

El siguiente compuesto [4-fenil-1-(3-fenil-2-propen-1-il)-piperidina], que está descrito en D1 (EP0494717), fue ensayado contra tres insectos usando los ensayos biológicos reportados en la solicitud internacional WO06003494.



4-fenil-1-(3-fenil-2-propen-1-il)-piperidina

### **Procedimiento de ensayo biológico:**

#### **Ensayo 1**

*Spodoptera littoralis* (rosquilla negra egipcia)

Se colocaron discos de hoja de algodón sobre agar en una placa para microtítulo de 24 pocillos y se rociaron con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, los discos foliares se infestaron con 5 larvas L<sub>1</sub>. Tres días después del tratamiento (DAT) se analizó la mortalidad, el efecto repelente, el comportamiento alimentario y la regulación del crecimiento en las muestras.

#### **Ensayo 2**

*Heliothis virescens* (gusano cogollero):

Se colocaron huevos (de 0 a 24 h de vida) en placas para microtítulo de 24 pocillos con dieta artificial y se trataron con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 200 ppm con pipeta. Después de un periodo de incubación de 4 días, se analizó la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento de las muestras.

**Ensayo 3**

*Plutella xylostella* (polilla de crucíferas):

Se trató una placa para microtítulo de 24 pocillos (MTP) con dieta artificial con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 18,2 ppm con pipeta. Después de secarse, las MTP se infestaron con larvas (L2) (10-15 por pocillo). Después de un periodo de incubación de 5 días, se evaluó la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento y antialimentación en las muestras.

**Resultados:**

|                                | Procedimiento de ensayo |                 |                 |
|--------------------------------|-------------------------|-----------------|-----------------|
|                                | <u>Ensayo 1</u>         | <u>Ensayo 2</u> | <u>Ensayo 3</u> |
| Porcentaje de Control a 200ppm | 0                       | 0               | 0               |