



European Patent Office
80298 MUNICH
GERMANY
Tel: +49 89 2399 0
Fax: +49 89 2399 4465



Dehns
St. Brides House
10 Salisbury Square
London EC4Y 8JD
ROYAUME-UNI

Formalities Officer
Name: Benitez Sierra, O
Tel: +49 89 2399 - 5715
or call
+31 (0)70 340 45 00

Application No. 14 815 174.9 - 1116	Ref. 61.129054	Date 08.02.2019
Applicant FMC Corporation		

Communication under Rule 71(3) EPC

1. Intention to grant

You are informed that the examining division intends to grant a European patent on the basis of the above application, with the text and drawings and the related bibliographic data as indicated below.

A copy of the relevant documents is enclosed.

1.1 In the text for the Contracting States:

AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT
RO RS SE SI SK SM TR

Description, Pages

2, 3, 6-14, 16, 18, 20, as published
21, 25-38, 40-45,
48-94, 96-98,
101-103, 106, 107,
110-112, 115-117,
119-121, 124-126,
129, 130, 133-135,
138-140, 142-147,
151-162, 164-168

1a, 4, 5, 15, 17, 46, filed in electronic form on
47

20-01-2017

19, 141 filed in electronic form on

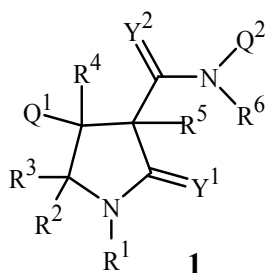
15-03-2018

22-24, 39, 95, 99, filed in electronic form on
100, 104, 105, 108,
109, 113, 114, 118,
122, 123, 127, 128,
131, 132, 136, 137,

05-11-2018

MARZO DE 2019

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula **1**,



en donde:

Q¹ es un anillo de fenilo o un sistema de anillo de naftalenilo; cada anillo o sistema de anillo está sustituido o no sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷; o un anillo heterocíclico de 5 a 6-miembros o un sistema de anillo bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema de anillo contiene miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, cada anillo o sistema de anillo está sustituido o no sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros del anillo de átomos de carbono y seleccionados de R⁹ en miembros del anillo de átomos de nitrógeno;

Q² es un anillo de fenilo sustituido o no sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰; o un anillo -heterocíclico completamente insaturado de 5 a 6 miembros o un sistema de anillo bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros; cada anillo o sistema de anillo contiene miembros del anillo seleccionados de átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, cada anillo o sistema de anillo está sustituido o no sustituido con hasta 5 sustituyentes

seleccionados independientemente de R¹⁰ en miembros del anillo de átomos de carbono y seleccionados de R¹¹ en miembros del anillo de átomos de nitrógeno;

Y¹ es O o NR¹²;

Y² es O o S;

R¹ es H, hidroxilo, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, cicloalquilalquilo de C₄-C₈, o alquilcarbonilo de C₂-C₈;

R² y R³ son, independientemente, cada uno, H o alquilo de C₁-C₄; R⁴ y R⁵ son, independientemente, cada uno, H o halógeno;

R⁶ es H, hidroxilo, alquilo de C₁-C₆ o alcoxi de C₁-C₆; cada R⁷ y R¹⁰ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo de C₁-C₈, haloalquilo de C₁-C₈, alcoxi de C₁-C₈, haloalcoxi de C₁-C₈, alquiltio de C₁-C₈, haloalquiltio de C₁-C₈, o alquilsulfonilo de C₁-C₈, o G²;

cada R⁹ y R¹¹ es independientemente alquilo de C₁-C₃;

cada R¹² es independientemente H;

cada G² es independientemente fenilo, cada uno sustituido o no sustituido en miembros del anillo con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁴; y

cada R¹⁴ es independientemente haloalquilo de C₁-C₆;

siempre que

- (a) cuando Q¹ comprende un anillo de 3-furanilo o 3-piridinilo unido directamente al resto de la Fórmula **1**, entonces ese anillo se sustituye con uno a 4 sustituyentes seleccionado de R⁷;
- (b) cuando Q¹ es un anillo de fenilo no sustituido y Q² comprende un anillo de fenilo unido directamente al resto de la Fórmula **1**, entonces ese anillo Q² se sustituye con R¹⁰ distinto al fenoxi sustituido o no sustituido o F en una posición 2-, ciano o -CF₃ en la posición 4 y R⁵ es H o halógeno;
- (c) cuando Q¹ es fenilo no sustituido y Q² comprende un anillo de piridinilo unido directamente al

- resto de la Fórmula **1**, entonces ese anillo de piridinilo se sustituye con uno a 4 sustituyentes seleccionado de R^{10} ;
- (d) cuando Q^1 es un anillo de fenilo sustituido con 4-fenilo o 4-fenoxi, ese anillo Q^1 se sustituye, además, con un sustituyente R^7 ;
- (e) cuando Q^1 comprende un anillo de fenilo unido directamente al resto de la Fórmula **1** y ese anillo se sustituye con R^7 en ambas posiciones orto (en relación con la unión al resto de la Fórmula **1**), entonces, ese anillo se sustituye, además, independientemente, con R^7 en una a tres posiciones adicionales;
- (f) cuando Q^1 es 1-naftalenilo no sustituido, entonces Q^2 es distinto a 2,3-di-fluorofenilo o 2-CF₃-fenilo;
- (g) Q^2 es distinto al 1H-pirazol-5-ilo sustituido o no sustituido; y
- (h) cuando Q^2 comprende un anillo de 1H-pirazol-3-ilo unido directamente al resto de la Fórmula **1**, ese anillo se sustituye en la posición 1 con R^{11} .

2. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, en donde:

cada R^7 y R^{10} es, independientemente, halógeno, ciano, nitro, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, alquiltio de C₁-C₄, haloalquiltio de C₁-C₄, alquilsulfonilo de C₁-C₄, o -SF₅; y
 cada R^9 y R^{11} es, independientemente alquilo de C₁-C₂.

3. El compuesto de conformidad con la reivindicación 2, en donde:

Y^1 y Y^2 son, cada uno, O;
 R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 son, cada uno, H; y
 R^1 es H o alquilo de C₁-C₆.

4. El compuesto de conformidad con la reivindicación 3,
en donde:

Q^1 es un anillo de fenilo sustituido con 1 a 3
sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ;
 Q^2 es un anillo de fenilo sustituido con 1 a 3
sustituyentes seleccionados independientemente de
 R^{10} y

R^1 es H o alquilo de C_1-C_6 .

5. El compuesto de conformidad con la reivindicación 4,
en donde:

cada R^7 es, independientemente, halógeno, ciano,
alquilo de C_1-C_2 , haloalquilo de C_1-C_3 o
alquilsulfonilo de C_1-C_3 ;

cada R^{10} es, independientemente, halógeno, ciano,
nitro, alquilo de C_1-C_2 , haloalquilo de C_1-C_3 o
alquilsulfonilo de C_1-C_3 ; y

R^1 es H, Me o Et.

6. El compuesto de conformidad con la reivindicación 5,
en donde:

Q^1 es un anillo de fenilo sustituido con 1
sustituyente seleccionado de R^7 en la posición para
o sustituido con 2 sustituyentes seleccionados
independientemente de R^7 , en donde un sustituyente
está en la posición para y el otro sustituyente está
en una posición meta;

Q^2 es un anillo de fenilo sustituido con 1
sustituyente seleccionado de R^{10} en una posición
orto o sustituido con 2 sustituyentes seleccionados
independientemente de R^{10} , en donde un sustituyente
está en una posición orto y el otro sustituyente
está en la posición meta adyacente; y

R^1 es H, Me o Et.

7. El compuesto de conformidad con la reivindicación 6,
en donde:

cada R^7 es, independientemente, F o CF_3 ;

cada R^{10} es F; y

R^1 es H o CH_3 .

8. El compuesto de conformidad con la reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste en:

N-(2,3-difluorofenil)-4-(3,4-difluorofenil)-2-oxo-3-pirrolidincarboxamida;

N-(2-fluorofenil)-2-oxo-4-[4-(trifluorometil)fenil]-3-pirrolidincarboxamida;

N-(2,3-difluorofenil)-2-oxo-4-[4-(trifluorometil)fenil]-3-pirrolidincarboxamida;

4-(3,4-difluorofenil)-*N*-(2-fluorofenil)-2-oxo-3-pirrolidincarboxamida; y

(3*R*,4*S*)-*N*-(2-fluorofenil)-2-oxo-4-[3-(trifluorometil)fenil]-3-pirrolidincarboxamida.

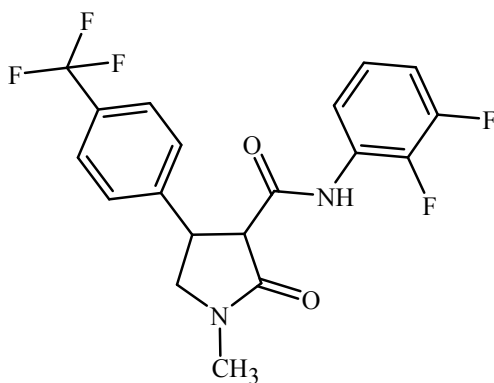
9. Una composición herbicida que comprende un compuesto de conformidad con la reivindicación 1 y de uno a 10 componentes seleccionados del grupo que consiste en surfactantes seleccionados de etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y el óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos, en donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno;

ésteres de ácido graso de sorbitol polietoxilados; poliglicósidos de alquilo; lignina y derivados de lignina, tal como lignosulfonatos; diluyentes sólidos seleccionados de arcillas tales como bentonita, montmorilonita, y atapulguita, sílice, y sulfato de sodio; y diluyentes líquidos seleccionados de agua, polipropilenglicol, hidrocarburos aromáticos, ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente, de C₆-C₂₂), y ácidos grasos alquilados (p. ej., metilados).

10. La composición herbicida de conformidad con la reivindicación 9, que comprende un ingrediente activo adicional seleccionado del grupo que consiste de atrazina, bensulfuron-metilo, clorimuron-etilo, fentrazamida, mefenacet, mesotriona, metolaclor, S-metolaclor, pirimisulfano, saflufenacilo, tefuriltriona, triafamona.

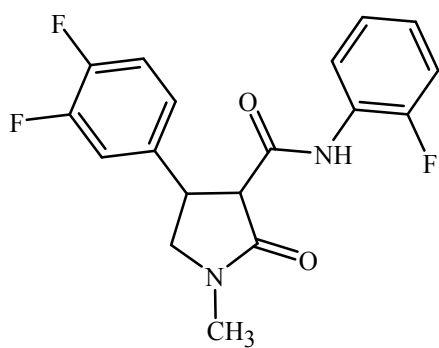
11. Una mezcla herbicida que comprende (a) un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, y (b) un ingrediente activo adicional seleccionado del grupo que consiste en (b2) inhibidores de acetohidroxiácido sintasa (AHAS), (b9) inhibidores de elongasa de ácido graso de cadena muy larga (VLCFA), (b12) inhibidores de 4-hidroxifenil-piruvato dioxigenasa (HPPD), sales de los compuestos de (b2), sales de los compuestos de (b9) y sales de los compuestos de (b12).

12. Un compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es

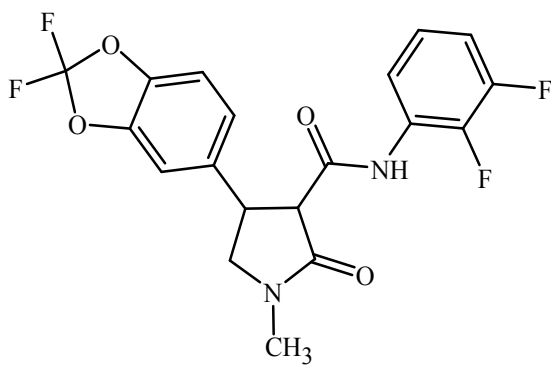


13. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 12 que está en la configuración *trans*.

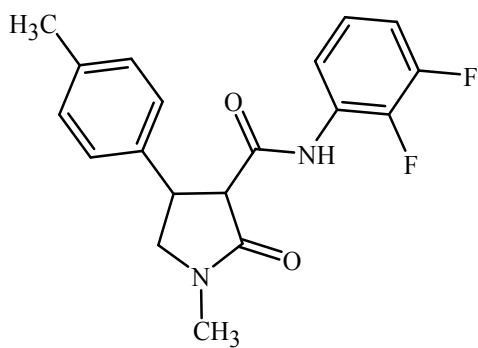
14. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es



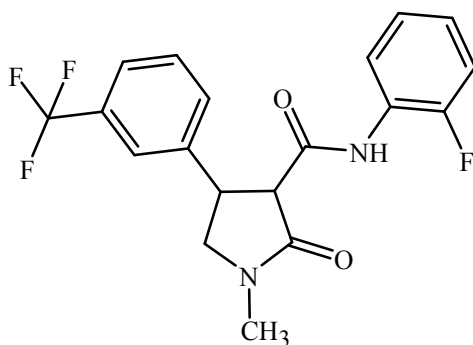
15. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es



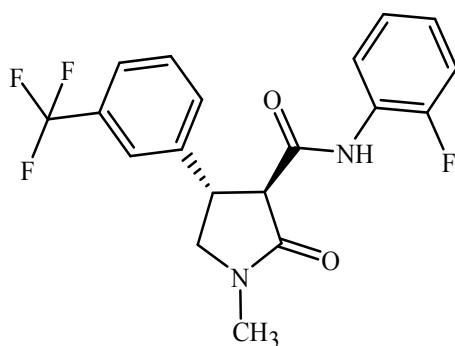
16. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es



17. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es



18. El compuesto herbicida de conformidad con la reivindicación 1 que es (3S,4S)-N-(2-fluorofenil)-1-metil-2-oxo-4-[3-(trifluorometil)fenil]-3-pirrolidinecarboxamida:



19. El compuesto de la reivindicación 1, en donde

Q¹ es un anillo de fenilo o un sistema de anillo de naftalenilo, cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷; o un tienilo, furanilo, piridinilo, o un anillo de pirazolilo, o un sistema de anillo benzofuranilo, benzodioxolilo o benzotiofenilo, cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo de átomo de carbono y seleccionados de R⁹ en miembros de anillo de átomo de nitrógeno; y

Q² es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰; o un anillo piridinilo, pirazolilo u oxazolilo, o sistema de anillo benzodioxolilo, cada anillo o sistema de anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰ en miembros del anillo del átomo de carbono y seleccionados de R¹¹ en miembros del anillo del átomo de nitrógeno.



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT: 800.176.089-2

COMPROBANTE DE RECAUDO SISTEMA SIPI

Radicado: 16147134
Recibo: 19-15256
Fecha: 01/03/2019

JUAN PABLO CONCHA DELGADO
CC: 80.416.654
Pago PSE No: 264162
CUS: 419515648

Patente PCT
PIRROLIDINONAS HERBICIDAS

Detalle del pago

Id.	Rentístico	Concepto y Servicio	Cant.	Val. Unit.	Subtotal
1	50005-01-01	Solicitud examen de patentabilidad Patente de Invención (DESCUENTO INTERNET)	1	\$ 1,097,600	\$ 1,097,600
2	50005-01-02	Pago unitario reivindicacion adicional patente de invencion (A partir de de undí½cima reivindicacion) (DESCUENTO INTERNET)	1	\$ 40,500	\$ 40,500
TOTAL					\$ 1,138,100

Doctora María José Lamus Becerra

Directora de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Referencia: Expediente Núm. **16147134**

Solicitud de Patente de Invención titulada: “*Pirrolidinonas Herbicidas*”

Solicitante: FMC Corporation

Asunto: **RESPUESTA OFICIO NO. 12641. EXAMEN DE FONDO**

JUAN PABLO CONCHA DELGADO, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término de prórroga solicitado el 16 de enero de 2019:

1. Modificaciones al Capítulo Reivindicatorio:

De conformidad con el artículo 34 de la Decisión 486 y con el fin de atender a las objeciones presentadas por este Despacho en su oficio N° 12641, el solicitante ha decidido presentar un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 19 reivindicaciones en donde se limita y se precisa mejor la invención.

2. Respuesta a las observaciones del Examinador

1.1 Claridad de la las reivindicaciones

1.1.1 Reivindicación 1

Su Despacho afirma que la reivindicación 1 del nuevo capítulo reivindicatorio no es concisa y no se encuentra enteramente sustentada en la descripción, puesto que las realizaciones preferidas de la invención se alejan bastante de la generalidad reclamada (Tablas A-D). En este sentido, aún subsiste la objeción referida a que las múltiples posibilidades de sustitución reclamadas son generalizaciones que se hacen de manera especulativa y que carecen de sustento. El solicitante debe restringir la solicitud a una razonable generalización que se encuentre enteramente sustentada en el capítulo descriptivo.

Asimismo, la Examinadora afirma que si bien se ha limitado el alcance de la materia reclamada, la misma continúa cubriendo una amplia variedad de posibles patrones de sustitución diferentes que no se encuentran enteramente sustentados en la descripción y para los cuales no hay ninguna evidencia que muestre algún efecto técnico. Se llama la atención del solicitante frente a que los ejemplos presentados no solo no demuestran que los compuestos de la presente solicitud sean superiores a sus muy cercanos conocidos en D1, sino además que, para muchos de ellos no se encontró ninguna actividad relacionada. Tal afirmación queda en evidencia con los resultados presentados para algunos compuestos tales como: 15, 29, 32, 36, 37, 38, 42, 47, 22, 24, 96, 84, 85, 86, 88, 91, 94, 97, 102, 116, 117, 111, 112, 113, 175, 182, 183, 186, 188, 191, 192, 252-255, 265, 266, 216, 297, 276, 298, 300, 301, 329 y 334, entre otros, los cuales mostraron actividad =0, actividad no determinada =(-) o una actividad muy baja, por lo cual no se puede afirmar que tengan algún efecto asociado o que representan un salto cualitativo en la técnica.

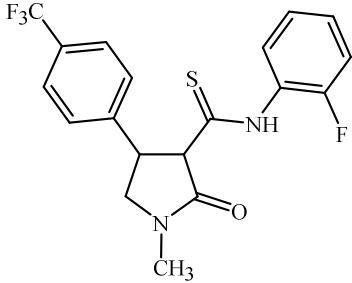
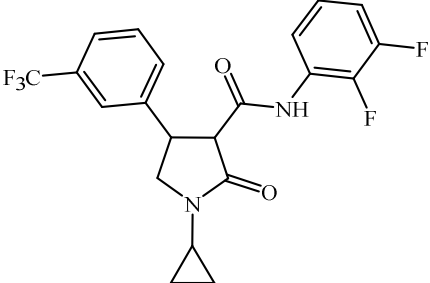
Frente a las objeciones de la Examinadora, el solicitante desea mencionar, que tal como se podrá observar en el nuevo capítulo reivindicatorio, ha decidido limitar de manera significativa las definiciones de los grupos funcionales de los compuestos de fórmula I, para definir de manera concisa la invención de acuerdo con los ejemplos preparados.

En relación con el sustento de los compuestos reclamados en dicho nuevo capítulo reivindicatorio y los ejemplos, mi representada afirma que los mismos se encuentran plenamente sustentados por la Descripción. Además, el solicitante desea llamar de nuevo la atención de este Despacho hacia los compuestos A, B, C, D y E de Formula 1, los cuales fueron presentados en la fase internacional, a la Oficina Europea de Patentes sustentando el

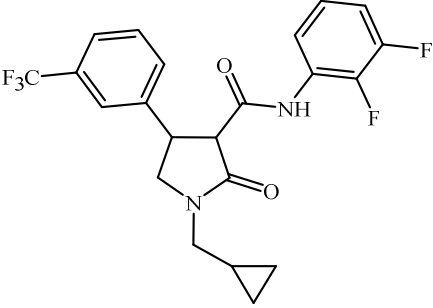
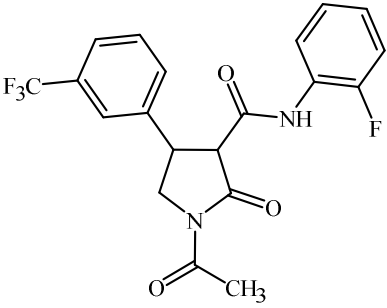
alcance de las reivindicaciones. Además, la estructura de estos compuestos fue corregida ya que por un error no se incluyó la definición correcta para Y¹ en las figuras inicialmente presentadas.

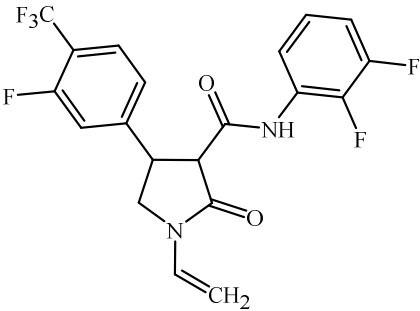
Los compuestos A, B, C, D y E fueron ensayados como se describe en la descripción tal como fue presentada en la Tabla A página 464 con los valores listados. Se observa que los valores para el zorro gigante (*Setaria faberii*) se reportaron a 500 y 125 g/ha.

Los compuestos A, B, C, D y E son de Fórmula 1 con R¹ siendo ciclopropil,

			
Ensayo	Tasa (ppm)	Compuesto A	Compuesto B
Después	500	80	80
	125	80	80
Antes	500	90	90
	125	90	90

ciclopropilmetil, acetil, y alilo respectivamente. Adicionalmente, los compuestos A, B, C, D y E incluyen el resto carbonilo correspondiente a Y¹=O.

			
Ensayo	Valores (ppm)	Compuesto C	Compuesto D
Posterior	500	80	90

	125	40	90
Antes	500	90	90
	125	90	90
			
Ensayo	Valores (ppm)	Compuesto E	
Después	500	60	
	125	40	
Antes	500	90	
	125	90	

Adicionalmente, el solicitante desea hacer notar que algunos compuestos los cuales para el Examinador tienen poca o ninguna actividad no pueden eliminarse así sin más del alcance de las reivindicaciones debido a que sus análogos de proximidad cercanos sí muestran actividad demostrada. En consecuencia, un experto versado en la materia sabría que dichos compuestos conllevan la misma actividad esperada, por lo cual corresponden a una "generalización razonable" de la invención, tal como este despacho la prevé en su significado. El solicitante considera que es indebida e injusto eliminar estos análogos y que se le pretenda limitar a lo estrictamente ensayado en la descripción, no sólo por las razones expuestas anteriormente, si no por la gran limitación hecha a las definiciones de los grupos funcionales de los compuestos reclamados en el nuevo capítulo reivindicatorio.

Además, el solicitante hace notar al examinador que como intención de avanzar en el proceso, como ya se mencionó se limitó lo más que se pudo el alcance de las reivindicaciones y se añadió una nueva reivindicación 19 dependiente de la reivindicación 1, la cual corresponde a una realización ejemplar de la invención en donde se recitan expresamente los anillos Q¹ y Q² y los sistemas de anillos listados en los ejemplos de la descripción. Esto considerando que no debería limitarse a dichos ejemplos como se mencionó con anterioridad.

Por todo lo anterior, mi representada quisiera solicitar a la Señora Examinadora y a este Despacho se tengan en cuenta todos los argumentos presentados a lo largo de este proceso y en el presente memorial, las medidas tomadas con el fin de regirse a las normas de la Oficina de Patentes Colombiana en relación a las limitaciones realizadas a las reivindicaciones y la posición de un experto en la materia frente a la presente invención y analice que el nuevo capítulo reivindicatorio es completamente conciso y sí esta sustentado en la Descripción, teniendo en cuenta que los compuestos reclamados fueron completamente ensayados y probados.

1.1.2 Reivindicación 11

Su Despacho menciona que las composiciones de la reivindicación 11 también corresponden a una generalización sin sustento en la descripción, ninguno de los ejemplos presentados para combinaciones incluye un tercer componente. Además, se aclara que la actividad biológica o el modo de acción de un compuesto no lo define de forma inequívoca, por lo tanto, dicha reivindicación tampoco cumple con el requisito de claridad. Se le recomienda al solicitante que limite el alcance de su invención.

Frente a las afirmaciones de la Examinadora el solicitante desea aclarar que nunca fue su intención reclamar un tercer componente en la mezcla herbicida. Es así como, el solicitante ha decidido modificar la redacción de la reivindicación para que sean entendibles los verdaderos componentes de dicha mezcla. Por lo tanto, el Examinador podrá observar que la nueva reivindicación 11 reclama una mezcla herbicida que comprende (a) un compuesto de conformidad con la reivindicación 1, y (b) un ingrediente activo adicional, este último siendo seleccionado de un grupo en particular.

1.2 Nivel inventivo

La Examinadora afirma que los documentos **D1** (US2006019831 "1-phenylpyrrolidine-2-one-3-carboxamides" y el documento **D2** (DE1262277) afectan el nivel inventivo de las reivindicaciones 1 a 7 y 11 y en forma resumida se argumenta lo siguiente:

"El documento D1 se considera el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga 1-fenilpirrolidin-2-ona-3-carboxamidas de fórmula

(I) con actividad herbicida que son cercanos a los reclamados en la presente solicitud.

La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y el compuesto divulgado en el documento D1 consiste en los significados del sustituyente Q1 y R1 (...)el efecto técnico que logra dicha diferencia no puede ser determinado porque no existe alguna evidencia que indique que al incluir una sustitución de un anillo de fenilo o un sistema de anillo de naftalenilo en la posición de Q1 y además al modificar las sustituciones de R1 se obtenga alguna ventaja en cuanto a la actividad herbicida de los derivados de esta solicitud.

Sin embargo, incluir un radical tipo arilo en la posición de Q1 en un anillo de pirrolidin-2-ona ya se había dado a conocer en el documento D2, al igual que incluir una sustitución de por ejemplo un átomo de hidrógeno en la posición R1. Dicho documento divulga compuestos agrícolamente activos como pesticidas o biocidas pirrolidin-2-ona de formula (I) que incluyen una sustitución de un grupo arilo que tienen hasta 8 átomos de carbono sobre la posición 4 (radical R3) del anillo de pirrolidin-2-ona y una sustitución, por ejemplo, de H, en la posición R1 (columna 3, línea 64 y reivindicaciones).

En consecuencia, la persona del oficio normalmente versada en la materia incluiría una sustitución de un radical arilo que tienen hasta 8 átomos de carbono en la posición 4 del anillo de pirrolidin-2-ona y modificaría la sustitución sobre el radical R1 tal como o divulga el documento D2, en el derivado 1-fenilpirrolidin-2-ona-3-carboxamida del documento D1, para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia".

Adicionalmente la Examinadora afirma que:

"(...) frente al argumento en cuanto a que "La variable Q1 requiere varios anillos que poseen el volumen estérico sustancial. Tal requerimiento para el volumen estérico no se enseña ni se sugiere por el documento D1." Esta Despacho aclara que, si bien el documento D1 no presenta dicha posición sustituida, el documento D2 en cambio, sí enseña una sustitución "voluminosa" como la llama el solicitante, en dicha posición del anillo de pirrolidin-2-ona, el cual a su vez puede estar sustituido en sus otras posiciones con sustituyentes voluminosos, de modo tal que el documento D2 sugiere o deja claro que sí se pueden unir sustituyentes voluminosos sobre el anillo de pirrolidin-2-ona. De este modo un

técnico medio en la materia tiene motivación suficiente para incluir un sustituyente voluminoso en el anillo de pirrolidin-2-ona de los derivados divulgados en D1, con la plena expectativa de éxito de lograr unirlos y esperar además actividad herbicida para los mismos.

Finalmente, frente a las tasas de aplicación, este Despacho aclara que en el documento D1 se divulgan tasas de aplicación muy bajas que oscilan entre 0.001-3 Kg/ha, de preferencia 0.01-1 Kg/ha (ver reivindicaciones 15 y 16)".

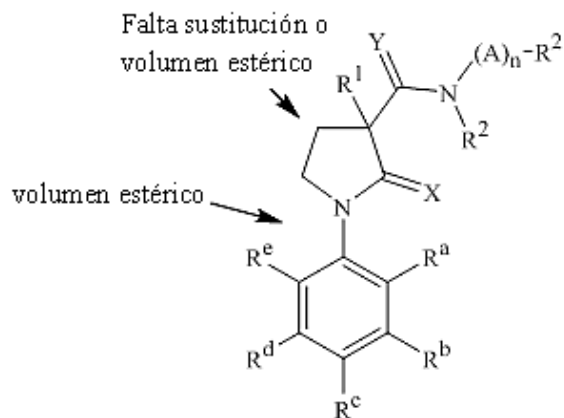
1.3 Argumentos en favor del nivel inventivo

El nivel inventivo de una solicitud se encuentra definido en el Artículo 18 de la Decisión 486 y se establece cuando “*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*”. (subrayado fuera del texto)

Contrario a lo que plantea el Examinador, los documentos del arte previo citados no afectan el nivel inventivo de la presente solicitud por las siguientes razones:

Con relación al documento D1

Mi representada afirma que la invención del solicitante requiere que la pirrolidincarboxamida central esté sustituida con una variable Q¹ en la posición 4. La variable Q¹ requiere varios anillos que poseen un volumen estérico sustancial. **D1** no enseña ni sugiere este requisito para el volumen estérico.



Por comparación, la inclusión del Q¹ de la solicitante es considerado un elemento estructural crítico que es requerido para la actividad biológica y por lo tanto, para el funcionamiento de la invención del solicitante.

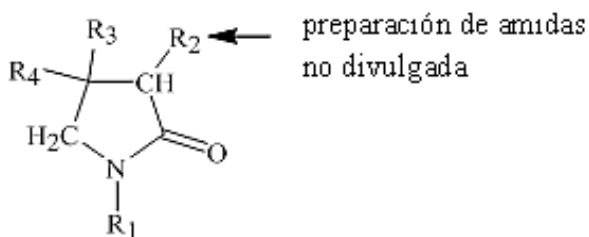
El solicitante menciona que nota el requisito en **D1** de un grupo aromático en el nitrógeno del anillo pirrolidinona, que proporciona volumen estérico en esa posición. pero sin embargo, en contraste, los sustituyentes de nitrógeno del anillo de los solicitantes (es decir, R¹ tal como se modificó el nuevo capítulo reivindicatorio) son relativamente pequeños.

El Examinador sugiere que **D1** enseña tasas de aplicación muy bajas que van desde 0.001 a 3 Kg/ha, preferiblemente de 0.01 a 1 Kg/ha. Sin embargo, hacemos notar que ni el extremo inferior del amplio rango ni el rango preferido completo son compatibles con los ejemplos de trabajo reales en **D1**. Mientras que **D1** describe que los compuestos de fórmula (**I**) se pueden usar como herbicidas (párrafo [0001] del documento de EE.UU.), la tasa de aplicación requerida para observar dicha actividad herbicida se describe a una tasa de 2 y 3 kg/ha (página 46, párrafos [0186]-[0198]). En contraste, los compuestos de la presente invención muestran una actividad herbicida a velocidades mucho más bajas (es decir, 0.50, 0.25, 0.125, 0.064, 0.032 y 0.016 kg/ha) que los descritos en **D1**. Un experto en la técnica, liderado por la actividad herbicida demostrada en D1, no tendría una expectativa razonable de éxito en la búsqueda de compuestos que tengan actividad herbicida a tasas de aplicación tan bajas.

Además, solo 4 compuestos en **D1** (Ejemplos 3, 18, 19 y 26) han demostrado poseer actividad herbicida, y cada uno de estos Ejemplos tiene un R^2 que es alquilo inferior (metilo y etilo) o cicloalquilo (ciclopropilo). Ninguno de los ejemplos en **D1** que tienen grupos R^2 más voluminosos tiene actividad herbicida. Cuando esta variable se compara con el Q^2 del solicitante (que requiere un anillo de fenilo, un anillo de naftalenilo, un sistema de anillo heteroaromático de 5 a 6 miembros o un sistema de anillo heteroaromático de 8 a 10 miembros), la extensión de la actividad herbicida es aún más sorprendente e inesperada. Por lo tanto, se afirma que las reivindicaciones 1 y 2, tal como se representan en el nuevo capítulo reivindicatorio, son inventivas sobre la divulgación de **D1**.

Con relación al documento **D2**

La referencia **D2** enseña la preparación de pirrolidonas de fórmula general **I**



Fórmula **I** de **D2**

a partir de una amida de α,β -ácido carboxílico insaturado de fórmula general **II** y un metiluro de dimetil-oxosulfonio de fórmula **III**.

El método de **D2** enseña cómo preparar un compuesto de fórmula general **I** en donde R_2 es "hidrógeno o restos de alquilo, cicloalquilo, aralquilo o arilo", pero no enseña ni sugiere preparar un compuesto en el que R_2 sea una amida. Se observa que el compuesto de Fórmula **I** del solicitante requiere una amida (es decir, $-N(R_6)Q^2$) en la posición correspondiente en la pirrolidinona.

Además, no hay ninguna sugerencia en la descripción de **D2** relacionada con el uso del método para elaborar un compuesto de fórmula general **1** con propiedades herbicidas. La única descripción en **D2** relacionada con la actividad biológica es la descripción de que los

compuestos descritos pueden ser intermedios para la preparación de “Pharmazeutika, Schädlingsbekämpfungsmitteln und Farbstoffen” [Traducción al español: productos farmacéuticos, pesticidas y colorantes]. Una definición secundaria de “Schädlingsbekämpfungsmitteln” en inglés es "insecticida". Un experto en la técnica no tendría una expectativa razonable de éxito en encontrar actividad herbicida basada en las enseñanzas de **D2** usando los compuestos de **D2** como intermedios dada la falta completa de instrucción de **D2** con respecto a la actividad herbicida en general y cómo alguno de los compuestos **D2** se puede modificar de cualquier manera para producir cualquiera de los usos descritos específicamente en **D2**.

Análisis incorrecto del requisito de nivel inventivo

El solicitante respetuosamente quiere hacer notar a este Despacho que la Señora Examinadora está efectuando un análisis incorrecto del nivel inventivo de la solicitud. Esto debido a que insiste en que era obvio incluir un radical tipo arilo en la posición de Q1 en un anillo de pirrolidin-2-ona, debido a que ya se había dado a conocer en el documento D2, al igual que incluir una sustitución de por ejemplo un átomo de hidrógeno en la posición R1.

Sin embargo, en esencia, la Examinadora ha reconstruido formulas estructurales por comparación utilizando el compuesto reclamado, es decir, reconstruye piezas de la estructura reivindicada en virtud de lo que se conoce en materia de patentes como “*hindsight*”.

En otras palabras el análisis Hindsight es una compresión retrospectiva de un evento, que en materia de patentes no es un análisis correcto. Consiste básicamente en comprender de manera retrospectiva la invención, y comprender la naturaleza de la misma y la manera de llegar a ella después de que se ha tenido conocimiento de la misma.

Es así como el concomimiento previo por parte del examinador, de la invención, hace que al hacer el análisis de la misma, no se ponga en el lugar del inventor, es decir antes de que la invención existiera sino, que conociéndola y entendiéndola, se le hace mucho mas probable y creíble que la forma de llegar a dicha invención puede ser obvia para cualquier persona versada en la materia.

En el presente caso, es claro que la Examinadora, efectúa un análisis de nivel inventivo equivocado e inadecuado, puesto que realizó un análisis *ex-post facto* (llamado *hindsight*, en inglés), al basar su análisis en la invención final, que como es obvio no la conocía el inventor cuando inició la investigación, y devolverse en el análisis de la invención y seleccionar y formar estructuras para llegar a compuestos que él considera como los más cercanos, lo convierten en un análisis errado.

Para sustentar esto, hacemos notar que el documento **D1**, presentado después que **D2**, no considera que **D2** sea instructivo para encontrar actividad herbicida al preparar compuestos con "restos alquilo, cicloalquilo, aralquilo o arilo" en posiciones comparables a los sustituyentes R_3 y R_4 de **D2**, según lo sugiere el Examinador. Esto es notable, ya que tanto **D1** como **D2** son del mismo solicitante: BASF. Por lo tanto, respetuosamente se sugiere sugerir que la Señora Examinadora está utilizando la divulgación de la presente solicitud en retrospectiva inadecuada para idear una objeción de nivel inventivo que no está respaldada por las enseñanzas en los documentos **D1** y **D2**, ya sea solos o en combinación.

Por lo tanto, teniendo en cuenta todo lo anterior, se afirma que incluso la combinación de las enseñanzas de **D1** y **D2**, como lo sugiere la Examinadora, presentan dos diferencias inconfundibles en comparación con la presente invención. Específicamente a saber, los grandes grupos Q^1 y los grupos relativamente pequeños R^1 de la presente invención no se enseñan en la combinación de **D1** y **D2**.

En consecuencia, la presente invención no solamente es novedosa como ya lo ha reconocido su Despacho sino que también cumple con el requisito de nivel inventivo con respecto a **D1** y **D2**.

3. Solicitudes concedidas en otros países para esta misma invención.

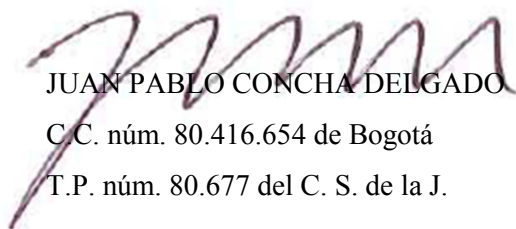
A manera informativa, pongo en conocimiento del Examinador que la Oficina de patentes Europea, envió una comunicación de intención de otorgamiento para la solicitud de patente europea 14815 174.9-1116 equivalente a la presente solicitud colombiana.

Aún cuando entiendo que estas decisiones de ninguna manera obligan al Despacho para decidir de igual forma, considero que por tratarse de una pregunta fáctica la determinación de la existencia de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial, las decisiones de otras oficinas de patentes constituyen un antecedente persuasivo en la materia.

En este orden de ideas, tenemos que la invención propuesta por el solicitante cumple con los requisitos de patentabilidad y de esta manera es susceptible de ostentar el título de patente de invención.

En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas en el presente documento y en consecuencia, se otorgue el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

Atentamente,



JUAN PABLO CONCHA DELGADO
C.C. núm. 80.416.654 de Bogotá
T.P. núm. 80.677 del C. S. de la J.

Anexos:

- Capítulo reivindicatorio modificado conformado por 19 reivindicaciones
- Pago de examen de patentabilidad.
- Pago por reivindicaciones adicionales.
- Copia de la notificación de intención de otorgamiento para la solicitud EP 14 815 174.9-1116 de la oficina de patentes europea