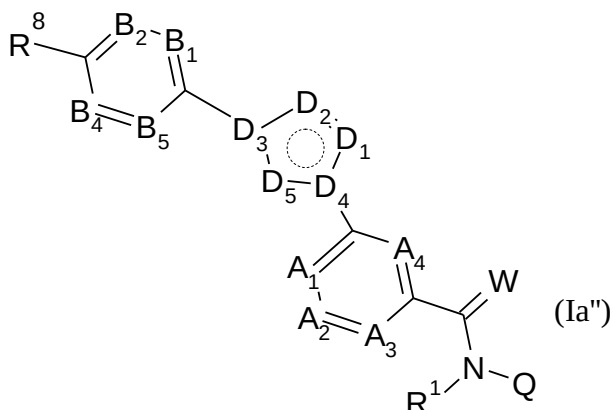


CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Compuestos de la fórmula (Ia'')



donde

D₁ es C-R¹¹, D₂ es C-R¹¹, D₃ es C, D₄ es N y D₅ es N; o
 D₁ es C-R¹¹, D₂ es N, D₃ es N, D₄ es C y D₅ es C-R¹¹; o
 D₁ es N, D₂ es C-R¹¹, D₃ es C, D₄ es N y D₅ es C-R¹¹; o
 D₁ es O, D₂ es N, D₃ es C, D₄ es C y D₅ es C-R¹¹; o
 D₁ es N, D₂ es O, D₃ es C, D₄ es C y D₅ es C-R¹¹; o
 D₁ es C-R¹¹, D₂ es C-R¹¹, D₃ es N, D₄ es C y D₅ es C-R¹¹;

○ es un sistema aromático; y

R¹ es H;

A₁ es C-H,

A₂ es C-H o N,

A₃ es CR⁴,

A₄ es C-H,

B₁ es CR⁶ o N,

B₂ es C-H,

B₃ es CR⁸,

B₄ es C-H, y

B₅ es CR¹⁰ o N,

en donde solamente uno de B₁ y B₅ es N,

R^4 es H, F, Cl, Br, I, ciano, nitro, metilo, etilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

R^6 y R^{10} son cada uno, de modo independiente, H, halógeno (en especial cloro, bromo, flúor), ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, 1-metiletoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

R^8 es alcoxi C_1-C_4 sustituido con flúor o alquilo C_1-C_4 sustituido con flúor;

R^{11} es independientemente H;

W es O;

Q es alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, 1-(ciano)ciclopropilo, 1-(alquil C_1-C_3 perfluorado)ciclopropilo, 1-(alquil C_1-C_4)ciclopropilo, 1-(tiocarbamoil)ciclopropilo, alquilo C_1-C_3 sustituido con halógeno, tietan-3-ilo, N-metilpirazol-3-ilo o 2-oxo-2(2,2,2-trifluoroetilamino)etilo;

así como sus sales, N-óxidos y formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (Ia").

2. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia") son compuestos de la fórmula (I-T3)



en donde

$R^1, A_1, A_2, A_3, A_4, R^{11}, B_1, B_2, B_4, B_5, R^8, Q$ y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

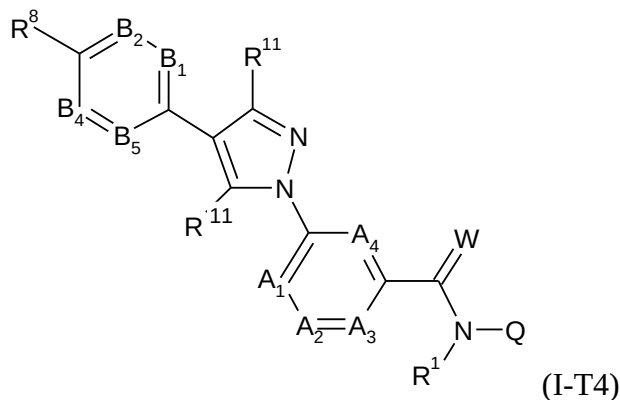
3. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T2)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

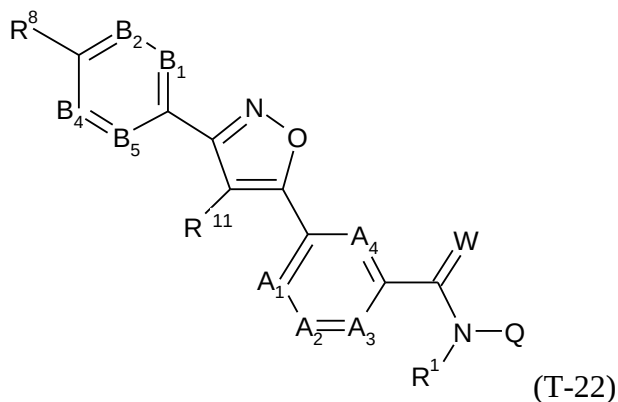
4. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T4)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

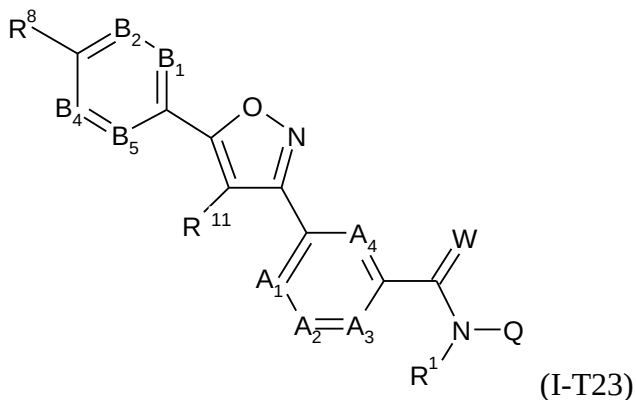
5. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T22)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

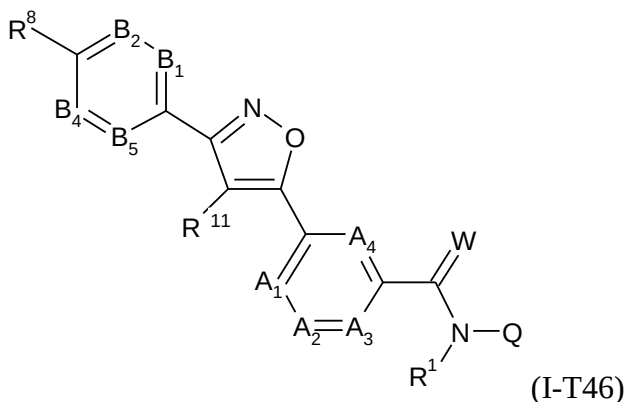
6. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T23)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

7. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T46)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

8. Agente insecticida, caracterizado por un contenido de un compuesto de la fórmula (Ia'') de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7 y un extensor y/o una sustancia tensoactiva.

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re.: Expediente No. 16-117.791

**Solicitud de Patente de Invención titulada: “PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y
PIRROLIL-BENZAMIDAS SUSTITUIDAS Y PIRAZOLIL-,
ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-PIRIDIN-3-CARBOXAMIDAS
SUSTITUIDAS PARA COMBATIR ARTRÓPODOS”.**

Solicitante: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT.

Nuestra Ref.: P2016/000054

RESPUESTA AL OFICIO No. 13030, NOTIFICADO EL 5 DE SEPTIEMBRE DE
2017
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado el 5 de septiembre de 2016.

Así entonces, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto contiene los siguientes cambios:

- en la nueva Reivindicación 1 se adiciona la expresión “*en donde solamente uno de B1 y B5 es N*”;
- se elimina la expresión “al menos” de la Reivindicación 8.

Valga anotar que la modificación efectuada al Capítulo Reivindicatorio cumple a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que ésta de ninguna manera implica una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud original.

2. a- La Examinadora señala que el título no corresponde con el objeto de la solicitud porque no divulga la materia reclamada. La Examinadora sugiere incluir en el título el grupo farmacofórico principal.

b- i) Siguiendo las amables sugerencias de la Examinadora, y con el ánimo de facilitar el trámite de la invención, el título se modifica de la siguiente manera:

“PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-BENZAMIDAS SUSTITUIDAS Y PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-PIRIDIN-3-CARBOXAMIDAS SUSTITUIDAS PARA COMBATIR ARTRÓPODOS”

3 a- La Examinadora señala que la materia reclamada en la presente invención se superpone a la materia reclamada en CO 16117846. Adicionalmente, la Reivindicación 8 carece de concisión puesto que utiliza la expresión “al menos” que es ambigua y no limita el alcance de la invención.

b- i) En primer lugar respecto a las objeciones señaladas por la Examinadora, respetuosamente me permito llamar la atención sobre las modificaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto como se menciona en el primer punto del presente memorial, en donde en la nueva Reivindicación 1 se especifica que solamente uno de B₁ y B₅ es N. Adicionalmente, en la nueva Reivindicación 8 se elimina la expresión “*al menos*”.

ii) Ahora bien, en cuanto a la superposición de la materia, cabe destacar que la presente invención difiere de la materia reclamada en CO 16117846 en la definición del sustituyente R₁. Específicamente, el sustituyente R₁ significa H (hidrógeno) en el caso de la presente invención, y significa alquilo (C₁-C₆) (o metilo) en el caso de CO 16117846. Por consiguiente, no existe superposición entre ambas solicitudes de patente. Adicionalmente, la limitación introducida en la nueva Reivindicación 1 permite resaltar aún más tales diferencias. Asimismo, esta limitación de la nueva Reivindicación 1 se encuentra adecuadamente soportada por los compuestos que han sido sintetizados y ensayados en los ejemplos del Capítulo Descriptivo, además de los ejemplos adicionales que se adjuntan al presente memorial (Anexo

1). Por consiguiente, la nueva Reivindicación 1 ha sido limitada aún más a los ejemplos reclamados en el presente Capítulo Reivindicatorio. Por todo lo anterior, considero superadas las objeciones al respecto.

Así, con base en las modificaciones realizadas, consideramos superadas las objeciones referentes a la falta de claridad y de suficiencia. Cabe resaltar que las enmiendas introducidas en el nuevo Capítulo Reivindicatorio no exceden lo divulgado originalmente y, por tanto, cumplen con lo establecido por la Decisión 486.

4. a- La Examinadora señala que la presente invención carece de novedad a la luz de las patentes US20100144672 (D1) y WO2011/009484 (D2) y el artículo “3,5-Diarylazoles as novel and selective inhibitors of protein kinase D”¹.

La Reivindicación 1 se ha divulgado previamente en D1 a D3. Si bien D2 indica que estos agentes son inhibidores de enzima quinasa, la determinación de un segundo uso para materia previamente divulgada en el arte previo. En consecuencia, la Reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en D1 a D3 de manera independiente.

Las Reivindicaciones dependientes 2 a 8 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la Reivindicación 1, por lo cual se considera que no son novedades.

b- i) Al respecto, cabe destacar que el documento D1 describe compuestos cuyo radical X puede representar fenilo o 2-piridilo que en cada caso puede estar sustituido con un grupo carboxamida o dialquilcarboxamida. Sin embargo, el grupo monoalquilcarboxamida (que es el sustituyente de los compuestos de la presente invención) no figura entre la lista de posibles sustituyentes de dicho radical X = fenilo o 2-piridilo definido en D1.

Asimismo, los radicales R¹ y R² en D1 no son hidrógeno, mientras que R11 = H, lo que genera otra diferencia con la presente invención.

Al margen de las diferencias explicadas, cabe resaltar que en el nuevo Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto al presente memorial, en la nueva Reivindicación 1 se ha introducido una limitación adicional, a saber que “solamente uno de B1 y B5 es N”. Como bien se explicó más arriba, esta limitación introducida en la nueva Reivindicación 1 permite resaltar aún más las

¹ <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0960894X11000278>

diferencias entre los compuestos definidos en D1 (en donde ambos radicales B_1 y B_5 son siempre N) y los compuestos de la presente invención.

En cuanto a los documentos D2 y D3, cabe resaltar que ninguno de estos documentos divulga compuestos en los cuales el radical R_8 tenga el significado de alquilo **fluorado** o alcoxi **fluorado**. D2 solamente divulga que R^{1f} puede ser alquilo, pero no haloalquilo. Por otro lado, D3 solamente divulga halógenos o sustituyentes que tienen un grupo amino en dicha posición.

Por consiguiente, las reivindicaciones de la presente invención, tal como se acompañan junto con el presente escrito, cumplen con el requisito de novedad indicado en el Art. 16 de la Decisión 486. Al respecto, cabe destacar que la Autoridad Examinadora de la Oficina Europea de Patentes ha reconocido la novedad y la actividad inventiva de las reivindicaciones de la correspondiente solicitud europea No. 14793179.4, las cuales tienen un alcance similar al de las presentes reivindicaciones, frente a las enseñanzas de los documentos D2 y D3 (el documento D1 no fue citado en Europa como documento relevante).

ii) Si bien la Examinadora no ha presentado comentarios ni observaciones puntuales respecto al nivel inventivo de la presente invención, hemos observado que en las conclusiones de su informe menciona que el documento D1 afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones actualmente vigentes.

El solicitante respetuosamente difiere del punto de vista de la Examinadora. Como bien se mencionó más arriba, existen varias diferencias estructurales entre los compuestos definidos en D1 y los compuestos de la presente invención. A fin de demostrar el efecto ventajosos de los compuestos de la presente invención adjuntamos los datos comparativos adicionales que detallamos a continuación (Anexo 1). Al respecto, cabe resaltar que los compuestos comparativos que se incluyen en estos ejemplos adicionales no son completamente iguales a los divulgados en D1 (en realidad, los compuestos comparativos empleados en los ejemplos que se detallan a continuación son aún más cercanos a los compuestos de la presente invención que los compuestos divulgados en D1), pues difieren de los compuestos de D1 en que el anillo fenilo está sustituido con un sustituyente de monoalquilcarboxamida. Sin embargo, estos compuestos comparativos permiten demostrar el efecto de las otras dos características diferenciadoras de D1, a saber, que en D1 R^{11} no es H y que ambos radicales B_1 y B_5 son siempre N. Los datos demuestran un efecto insecticida mejorado de los compuestos de la presente invención frente a los compuestos similares a los de D1. Por consiguiente, estos datos demuestran que los

compuestos de la presente invención exhiben una actividad inesperadamente superior y, por ende, son inventivos frente a D1.

En atención a las modificaciones realizadas, a los argumentos mencionados en el presente memorial y a los datos adicionales aportados, el solicitante confía en haber superado todas las objeciones elevadas por la Examinadora en el informe relativo al examen de fondo.

5. Finalmente, si el Despacho lo considera necesario, solicito amablemente proceda a realizar un segundo examen de fondo, para lo cual adjunto el comprobante de pago de la tasa de examen correspondiente. De otra forma, considero que la presente solicitud cumple con los requisitos de patentabilidad establecidos por la Decisión 486 y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexos:

- Capítulo Reivindicatorio Modificado;
- Anexo1. Datos Adicionales.
- Comprobante de pago correspondiente a la tasa de examen.

ANEXO 1

Datos comparativos adicionales

Myzus persicae – ensayo de rociado (MYZUPE)

Solvente: 78 partes en peso de acetona y 1.5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para producir una formulación de ingrediente activo apropiada se mezcla 1 parte en peso de ingrediente activo con la cantidad indicada de solventes y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba se diluye la preparación con agua que contiene emulsionante.

Se rocían los discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todas las etapas del áfido verde del durazno (*Myzus persicae*) con una formulación de ingrediente activo de la concentración deseada.

Después de transcurrido el período de tiempo especificado se determina la mortalidad en %. 100% significa que todos los áfidos murieron; 0% significa que ninguno de los áfidos murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un nivel superior de actividad en comparación con el arte previo: véanse los compuestos listados.

Phaedon cochleariae – ensayo de rociado (PHAECO)

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona y 1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para preparar una formulación de ingrediente activo apropiada se mezcla 1 parte en peso de ingrediente activo con la cantidad indicada de solventes y se completa con agua que contiene

una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Otras concentraciones de ensayo se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

Los discos de col china (*Brassica pekinensis*) son rociados con una formulación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después de secar, son poblados con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de transcurrido el período de tiempo especificado se determina la mortalidad en %. 100% significa que todas las larvas de escarabajo murieron; 0% significa que ninguna larva de escarabajo murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un nivel superior de actividad en comparación con el arte previo: véanse los compuestos listados.

Spodoptera frugiperda – ensayo de rociado (SPODFR)

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona y 1,5 partes en peso de dimetilformamida

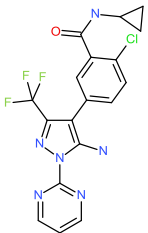
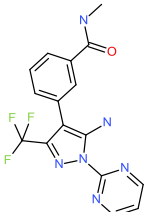
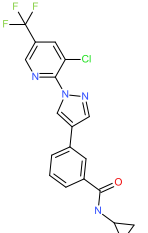
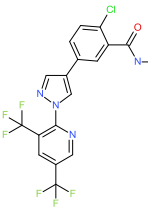
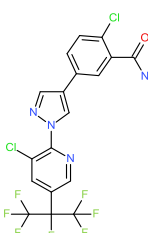
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para preparar una formulación de ingrediente activo apropiada se mezcla 1 parte en peso de ingrediente activo con la cantidad indicada de solventes y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Otras concentraciones de ensayo se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

Los discos de hojas de maíz (*Zea mays*) son rociados con una formulación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después de secar, son poblados con oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*).

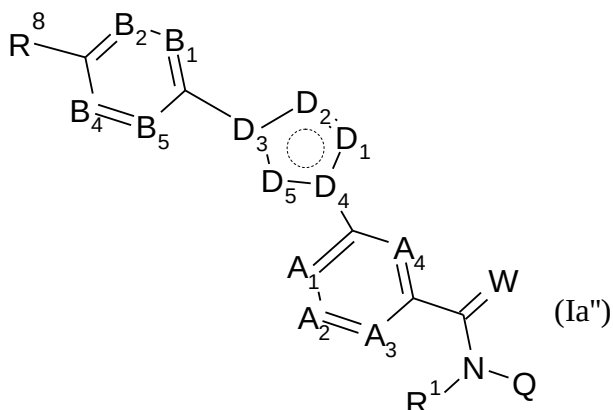
Después de transcurrido el período de tiempo especificado se determina la mortalidad en %. 100% significa que todas las orugas murieron; 0% significa que ninguna oruga murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un nivel superior de actividad en comparación con el arte previo: véanse los compuestos listados.

Sustancia	Estructura	Objeto	Concentración	% Eficacia	dat
Similar a US2010/0144672		MYZUPE	500 g ai/ha	0	6 dat
		PHAECO	100 g ai/ha	0	7 dat
		SPODFR	100 g ai/ha	0	7 dat
Similar a US2010/0144672		MYZUPE	500 g ai/ha	0	6 dat
		PHAECO	100 g ai/ha	0	7 dat
		SPODFR	100 g ai/ha	0	7 dat
Ejemplo.-No.I-T3-122 Conforme a la presente invención		MYZUPE	500 g ai/ha	100	6 dat
Ejemplo.-No.I-T3-149 Conforme a la presente invención		PHAECO	100 g ai/ha	100	7 dat
Ejemplo.-No.I-T3-152 Conforme a la presente invención		PHAECO SPODFR	100 g ai/ha 100 g ai/ha	100 100	7 dat 7 dat

CAPÍTULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Primer Examen de Fondo)

1. Compuestos de la fórmula (Ia'')



donde

D_1 es $C-R^{11}$, D_2 es $C-R^{11}$, D_3 es C, D_4 es N y D_5 es N; o
 D_1 es $C-R^{11}$, D_2 es N, D_3 es N, D_4 es C y D_5 es $C-R^{11}$; o
 D_1 es N, D_2 es $C-R^{11}$, D_3 es C, D_4 es N y D_5 es $C-R^{11}$; o
 D_1 es O, D_2 es N, D_3 es C, D_4 es C y D_5 es $C-R^{11}$; o
 D_1 es N, D_2 es O, D_3 es C, D_4 es C y D_5 es $C-R^{11}$; o
 D_1 es $C-R^{11}$, D_2 es $C-R^{11}$, D_3 es N, D_4 es C y D_5 es $C-R^{11}$;

○ es un sistema aromático; y

R^1 es H;

A_1 es C-H,

A_2 es C-H o N,

A_3 es CR^4 ,

A_4 es C-H,

B_1 es CR^6 o N,

B_2 es C-H,

B_3 es CR^8 ,

B_4 es C-H, y

B_5 es CR^{10} o N,

en donde solamente uno de B_1 y B_5 es N,

R^4 es H, F, Cl, Br, I, ciano, nitro, metilo, etilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)etilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

R^6 y R^{10} son cada uno, de modo independiente, H, halógeno (en especial cloro, bromo, flúor), ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, 1-metiletoxi, difluorometoxi, clorodifluorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

R^8 es alcoxi C_1-C_4 sustituido con flúor o alquilo C_1-C_4 sustituido con flúor;

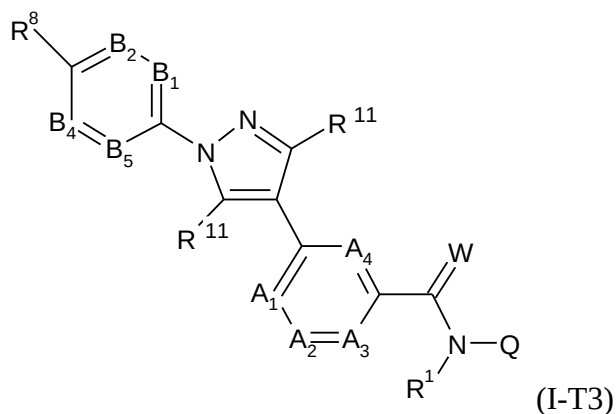
R^{11} es independientemente H;

W es O;

Q es alquilo C_1-C_3 , ciclopropilo, 1-(ciano)ciclopropilo, 1-(alquil C_1-C_3 perfluorado)ciclopropilo, 1-(alquil C_1-C_4)ciclopropilo, 1-(tiocarbamoil)ciclopropilo, alquilo C_1-C_3 sustituido con halógeno, tietan-3-ilo, N-metilpirazol-3-ilo o 2-oxo-2(2,2,2-trifluoroetilamino)etilo;

así como sus sales, N-óxidos y formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (Ia").

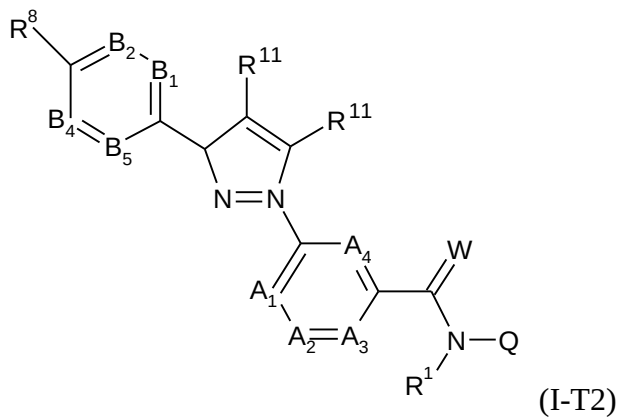
2. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia") son compuestos de la fórmula (I-T3)



en donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

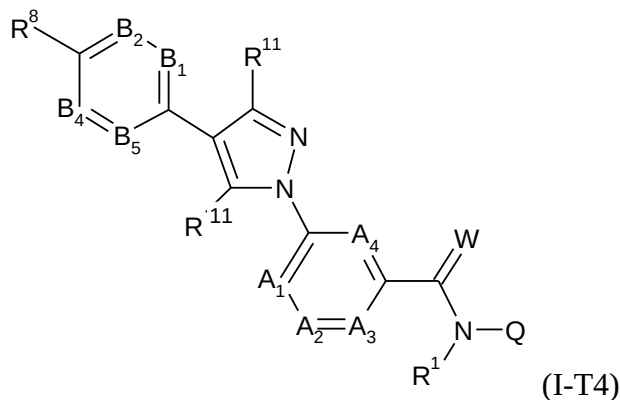
3. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T2)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

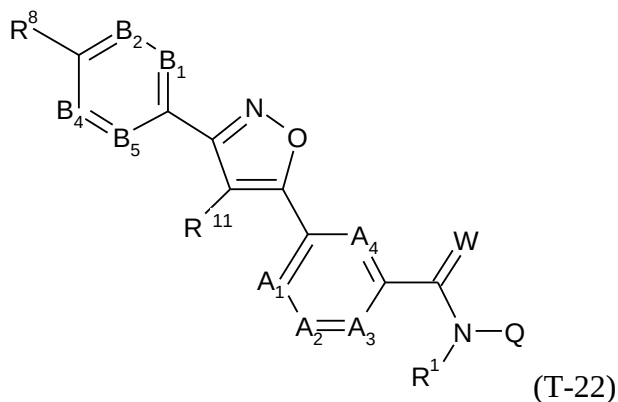
4. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T4)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

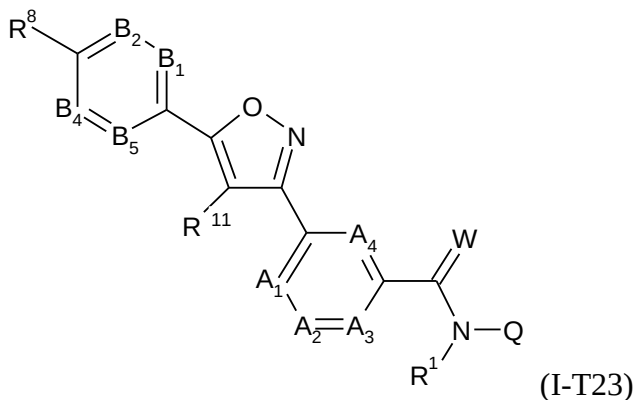
5. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T22)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

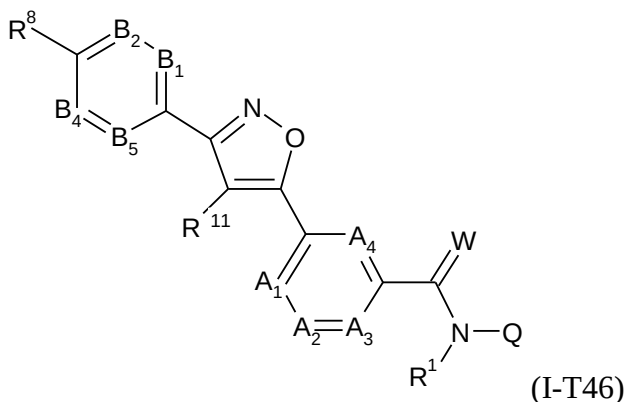
6. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T23)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

7. Compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1, en donde los compuestos de la fórmula (Ia'') son compuestos de la fórmula (I-T46)



donde

R^1 , A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , R^{11} , B_1 , B_2 , B_4 , B_5 , R^8 , Q y W son cada uno como se define en la Reivindicación 1.

8. Agente insecticida, caracterizado por un contenido de un compuesto de la fórmula (Ia'') de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 7 y un extensor y/o una sustancia tensoactiva.

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

Re.: Expediente No. 16-117.791

**Solicitud de Patente de Invención titulada: “PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y
PIRROLIL-BENZAMIDAS SUSTITUIDAS Y PIRAZOLIL-,
ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-PIRIDIN-3-CARBOXAMIDAS
SUSTITUIDAS PARA COMBATIR ARTRÓPODOS”.**

Solicitante: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT.

Nuestra Ref.: P2016/000054

RESPUESTA AL OFICIO No. 13030, NOTIFICADO EL 5 DE SEPTIEMBRE DE
2017
(PRIMER EXAMEN DE FONDO)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad solicitante, me permito manifestar lo siguiente ante el auto emanado por ese Despacho, dentro del plazo de prórroga previsto en el artículo 45 de la Decisión 486, en los siguientes términos:

1. En primer lugar, con el ánimo de brindar mayor claridad a la materia reivindicada, me permito presentar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado el 5 de septiembre de 2016.

Así entonces, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto contiene los siguientes cambios:

- en la nueva Reivindicación 1 se adiciona la expresión “*en donde solamente uno de B1 y B5 es N*”;
- se elimina la expresión “al menos” de la Reivindicación 8.

Valga anotar que la modificación efectuada al Capítulo Reivindicatorio cumple a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que ésta de ninguna manera implica una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud original.

2. a- La Examinadora señala que el título no corresponde con el objeto de la solicitud porque no divulga la materia reclamada. La Examinadora sugiere incluir en el título el grupo farmacofórico principal.

b- i) Siguiendo las amables sugerencias de la Examinadora, y con el ánimo de facilitar el trámite de la invención, el título se modifica de la siguiente manera:

“PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-BENZAMIDAS SUSTITUIDAS Y PIRAZOLIL-, ISOXAZOLIL- Y PIRROLIL-PIRIDIN-3-CARBOXAMIDAS SUSTITUIDAS PARA COMBATIR ARTRÓPODOS”

3 a- La Examinadora señala que la materia reclamada en la presente invención se superpone a la materia reclamada en CO 16117846. Adicionalmente, la Reivindicación 8 carece de concisión puesto que utiliza la expresión “al menos” que es ambigua y no limita el alcance de la invención.

b- i) En primer lugar respecto a las objeciones señaladas por la Examinadora, respetuosamente me permito llamar la atención sobre las modificaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto como se menciona en el primer punto del presente memorial, en donde en la nueva Reivindicación 1 se especifica que solamente uno de B₁ y B₅ es N. Adicionalmente, en la nueva Reivindicación 8 se elimina la expresión “*al menos*”.

ii) Ahora bien, en cuanto a la superposición de la materia, cabe destacar que la presente invención difiere de la materia reclamada en CO 16117846 en la definición del sustituyente R₁. Específicamente, el sustituyente R₁ significa H (hidrógeno) en el caso de la presente invención, y significa alquilo (C₁-C₆) (o metilo) en el caso de CO 16117846. Por consiguiente, no existe superposición entre ambas solicitudes de patente. Adicionalmente, la limitación introducida en la nueva Reivindicación 1 permite resaltar aún más tales diferencias. Asimismo, esta limitación de la nueva Reivindicación 1 se encuentra adecuadamente soportada por los compuestos que han sido sintetizados y ensayados en los ejemplos del Capítulo Descriptivo, además de los ejemplos adicionales que se adjuntan al presente memorial (Anexo

1). Por consiguiente, la nueva Reivindicación 1 ha sido limitada aún más a los ejemplos reclamados en el presente Capítulo Reivindicatorio. Por todo lo anterior, considero superadas las objeciones al respecto.

Así, con base en las modificaciones realizadas, consideramos superadas las objeciones referentes a la falta de claridad y de suficiencia. Cabe resaltar que las enmiendas introducidas en el nuevo Capítulo Reivindicatorio no exceden lo divulgado originalmente y, por tanto, cumplen con lo establecido por la Decisión 486.

4. a- La Examinadora señala que la presente invención carece de novedad a la luz de las patentes US20100144672 (D1) y WO2011/009484 (D2) y el artículo “3,5-Diarylazoles as novel and selective inhibitors of protein kinase D”¹.

La Reivindicación 1 se ha divulgado previamente en D1 a D3. Si bien D2 indica que estos agentes son inhibidores de enzima quinasa, la determinación de un segundo uso para materia previamente divulgada en el arte previo. En consecuencia, la Reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en D1 a D3 de manera independiente.

Las Reivindicaciones dependientes 2 a 8 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la Reivindicación 1, por lo cual se considera que no son novedades.

b- i) Al respecto, cabe destacar que el documento D1 describe compuestos cuyo radical X puede representar fenilo o 2-piridilo que en cada caso puede estar sustituido con un grupo carboxamida o dialquilcarboxamida. Sin embargo, el grupo monoalquilcarboxamida (que es el sustituyente de los compuestos de la presente invención) no figura entre la lista de posibles sustituyentes de dicho radical X = fenilo o 2-piridilo definido en D1.

Asimismo, los radicales R¹ y R² en D1 no son hidrógeno, mientras que R11 = H, lo que genera otra diferencia con la presente invención.

Al margen de las diferencias explicadas, cabe resaltar que en el nuevo Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto al presente memorial, en la nueva Reivindicación 1 se ha introducido una limitación adicional, a saber que “solamente uno de B1 y B5 es N”. Como bien se explicó más arriba, esta limitación introducida en la nueva Reivindicación 1 permite resaltar aún más las

¹ <http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0960894X11000278>

diferencias entre los compuestos definidos en D1 (en donde ambos radicales B_1 y B_5 son siempre N) y los compuestos de la presente invención.

En cuanto a los documentos D2 y D3, cabe resaltar que ninguno de estos documentos divulga compuestos en los cuales el radical R_8 tenga el significado de alquilo **fluorado** o alcoxi **fluorado**. D2 solamente divulga que R^{1f} puede ser alquilo, pero no haloalquilo. Por otro lado, D3 solamente divulga halógenos o sustituyentes que tienen un grupo amino en dicha posición.

Por consiguiente, las reivindicaciones de la presente invención, tal como se acompañan junto con el presente escrito, cumplen con el requisito de novedad indicado en el Art. 16 de la Decisión 486. Al respecto, cabe destacar que la Autoridad Examinadora de la Oficina Europea de Patentes ha reconocido la novedad y la actividad inventiva de las reivindicaciones de la correspondiente solicitud europea No. 14793179.4, las cuales tienen un alcance similar al de las presentes reivindicaciones, frente a las enseñanzas de los documentos D2 y D3 (el documento D1 no fue citado en Europa como documento relevante).

ii) Si bien la Examinadora no ha presentado comentarios ni observaciones puntuales respecto al nivel inventivo de la presente invención, hemos observado que en las conclusiones de su informe menciona que el documento D1 afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones actualmente vigentes.

El solicitante respetuosamente difiere del punto de vista de la Examinadora. Como bien se mencionó más arriba, existen varias diferencias estructurales entre los compuestos definidos en D1 y los compuestos de la presente invención. A fin de demostrar el efecto ventajosos de los compuestos de la presente invención adjuntamos los datos comparativos adicionales que detallamos a continuación (Anexo 1). Al respecto, cabe resaltar que los compuestos comparativos que se incluyen en estos ejemplos adicionales no son completamente iguales a los divulgados en D1 (en realidad, los compuestos comparativos empleados en los ejemplos que se detallan a continuación son aún más cercanos a los compuestos de la presente invención que los compuestos divulgados en D1), pues difieren de los compuestos de D1 en que el anillo fenilo está sustituido con un sustituyente de monoalquilcarboxamida. Sin embargo, estos compuestos comparativos permiten demostrar el efecto de las otras dos características diferenciadoras de D1, a saber, que en D1 R^{11} no es H y que ambos radicales B_1 y B_5 son siempre N. Los datos demuestran un efecto insecticida mejorado de los compuestos de la presente invención frente a los compuestos similares a los de D1. Por consiguiente, estos datos demuestran que los

compuestos de la presente invención exhiben una actividad inesperadamente superior y, por ende, son inventivos frente a D1.

En atención a las modificaciones realizadas, a los argumentos mencionados en el presente memorial y a los datos adicionales aportados, el solicitante confía en haber superado todas las objeciones elevadas por la Examinadora en el informe relativo al examen de fondo.

5. Finalmente, si el Despacho lo considera necesario, solicito amablemente proceda a realizar un segundo examen de fondo, para lo cual adjunto el comprobante de pago de la tasa de examen correspondiente. De otra forma, considero que la presente solicitud cumple con los requisitos de patentabilidad establecidos por la Decisión 486 y por consiguiente solicito respetuosamente que el Despacho proceda con la concesión de la patente.

Atentamente,



CARLOS R. OLARTE

C.C. No. 79.782.747 de Bogotá

T.P. 74.295

Anexos:

- Capítulo Reivindicatorio Modificado;
- Anexo1. Datos Adicionales.
- Comprobante de pago correspondiente a la tasa de examen.