

Señora Directora

NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

Referencia: Expediente NC2018/0010715

Asunto: Solicitud de patente para: COMPUESTOS BICÍCLICOS TIPO TRIAZOL E
IMIDAZOL PIRIDONA CON ACTIVIDAD PLAGUICIDA

Solicitante: BASF SE

Fecha de solicitud: 04 de octubre de 2018

RESPUESTA A SEGUNDO EXAMEN DE PATENTABILIDAD

Yo, JOSE ANDRES RINCON USCATEGUI identificado como aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, doy respuesta al Oficio **18736**, notificado el 1 de diciembre de 2021.

I. MODIFICACIONES AL CAPÍTULO REIVINDICATORIO

Tomando en consideración las objeciones presentadas en el mencionado Oficio, apporto junto con este memorial un Capítulo Reivindicatorio Modificado conformado por **7** reivindicaciones en las que se han incluido las siguientes modificaciones:

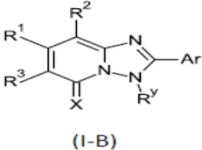
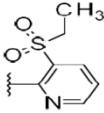
- las Reivindicaciones 1 a 7 se limitan a los compuestos de la Fórmula I-A;
- se modifican los sustituyentes de la Reivindicación 1 de la siguiente manera:
 - se limitan los sustituyentes R^x , R^1 , Ar, R^{Ar} , R^b y R^c ;
 - se adiciona el radical C_2 - C_3 -alquenilo en la definición del sustituyente R^x , lo cual encuentra soporte en la página 23 del Capítulo Descriptivo;
 - se eliminan los sustituyentes R^y y R^3 ;
 - en la definición del radical R^1 se especifica que cada uno de los radicales mencionados está parcial o totalmente halogenado;
 - en la definición del sustituyente Ar se especifica que el heteroarilo comprende un heteroátomo seleccionado de N y S como miembro del anillo;
 - en la definición del sustituyente R^{Ar} se adicionan los radicales CN, C_1 - C_3 -alcoxi, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo y NR^bR^c lo cual encuentra soporte en la página 3 del Capítulo Descriptivo;

- se limita el radical C₃-C₆-cicloalquilo a ciclopropilo en la definición de los sustituyentes R^{Ar}, R^b y R^c;
- en la Reivindicación 3 se reemplaza la referencia a la Fórmula (I) por la Fórmula (I-A).

Me permito resaltar que estas modificaciones se ajustan completamente a lo establecido por el Artículo 34 de la Decisión 486 de 2000, ya que no constituyen una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.

II. EN CUANTO A LA FALTA DE CLARIDAD Y SUSTENTO

II.1. El Examinador considera que el Capítulo Reivindicatorio no cumple con adecuado soporte en el Capítulo Descriptivo, en tanto reclama un amplio número de posibilidades en las definiciones de los sustituyentes de las fórmulas reclamadas. Adicionalmente, el Examinador indica que la Fórmula (I-B) es una extrapolación sin sustento, en tanto el Capítulo Descriptivo soporta únicamente los siguientes sustituyentes:

Ejemplo	Ar	R ¹	R ²	R ^x	R ⁴
C-4, Fórmula (I-B)  (I-B)		CF ₃	H	CH ₃	H

Al respecto me permito llamar la atención del Examinador sobre el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, en donde en atención a sus amables sugerencias se ha modificado la Reivindicación 1, para limitar el alcance reclamado a los compuestos de Formula (IA), así como las definiciones de sus sustituyentes.

Particularmente, los sustituyentes han sido limitados de acuerdo con aquellas definiciones que encuentran soporte particular en alguno de los compuestos ejemplificados sobre los cuales se demostró actividad plaguicida de amplio espectro. A continuación, me permito presentar una tabla que recopila el soporte para cada uno de los sustituyentes de la Fórmula (IA):

Sustituyentes de la Fórmula (IA)	Compuesto(s) de sustento con datos biológicos presentados
X es O	C-1, C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-51, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-70, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-94, C-95, C-96, C-

	97, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103
R ^x se selecciona de C ₁ -C ₃ -alquilo no sustituido o sustituido con halógeno	C-1, C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-65, C-68, C-74, C-88, C-90, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103 (CH ₃), C-44 (etilo), C-60 (isopropilo), C-63, C-71 (CH ₂ CF ₃), C-84 (CH ₂ CH ₂ F)
C ₂ -C ₃ -alquenilo	C-78 (2-propenilo)
C ₂ -C ₃ -alquinilo	C-62 (propin-2-ilo)
C ₃ -C ₆ -cicloalquilo	C-51, C-70, C-72, C-73, C-76, C-77, C-79, C-80, C-81, C-82, C-89, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97 (ciclopropilo), C-66 (ciclobutilo)
C ₁ -C ₂ -alcoxi-C ₁ -C ₂ -alquilo	C-64 (etoximetilo)
C ₃ -C ₆ -cicloalquil-C ₁ -C ₂ -alquilo	C-59, C-75 (ciclopropil-metilo), C-61, C-86 (ciclohexil-metilo)
o bencilo	C-58
R ¹ es C ₁ -C ₃ -alcoxi	C-100 (OCH ₂ CF ₃)
C ₁ -C ₃ -sulfenilo	C-101 (SCF ₃)
C ₁ -C ₃ -sulfinilo	C-102 (S(O)CF ₃)
o C ₁ -C ₂ -alquilo, en donde cada uno de los radicales arriba mencionados está parcial o totalmente halogenado	C-1, C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-51, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-70, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97, C-98, C-99, C-103 (CF ₃), C-96 (C ₂ F ₅)
R ² , y R ⁴ son H	C-1, C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-51, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-70, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-86, C-88, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102
Ar es fenilo	C-1, C-51, C-65, C-97, C-98, C-103
o heteroarilo de 5 o 6 miembros que comprenden un heteroátomo seleccionado de N y S	C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-66, C-68, C-70, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103 (piridilo); C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57 (tiofenilo)
que están sustituidos con R ^{Ar} , que son idénticos o diferentes, en donde R ^{Ar} es Halógeno	C-1, C-51 (cloruro), C-70, C-86, C-99 (bromuro)
CN	C-79
C ₁ -C ₃ -alquilo, C ₁ -C ₃ -alcoxi no sustituido o sustituido con halógeno	C-65 (CH ₃), C-77 (CHF ₂), C-88 (CH ₃ CH ₂ O), C-92 (CF ₃ CH ₂ O), C-94 (OCH ₂ C ₂ F ₅), C-98 (CH ₃ O)
C ₂ -C ₆ -alquenilo	C-82 (CHCH ₂)
C ₂ -C ₆ -alquinilo	C-81 (CCC(CH ₃) ₃)
C ₂ -C ₆ -alquilenio-CN	C-73, C-74, C-75, C-76, C-97
C ₃ -C ₆ -cicloalquilo no sustituido o sustituido con halógeno	C-44, C-52, C-66, C-71, C-72 (ciclopropilo), C-93 (2-difluorociclopropilo)
C(O)-R ^d – R ^d es H	C-68

C(O)-OR ^a	C-50
C(O)-NR ^b R ^c	C-53, C-54, C-55, C-56, C-57
NR ^b R ^c	C-80, C-95
S(=O) _m R ^e	C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, R-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103
fenilo no sustituido o sustituido con 1 o 2 radicales R ^f ;	C-39 (2 radicales R ^f), C-40, C-42, C-43, C-47, C-48, C-49, C-89, C-90, C-91 (1 sustituyente R ^f), C-41, C-45 (no sustituido)
cada R ^a se selecciona de C ₁ -C ₃ -alquilo	C-50 (CH ₃)
cada R ^b y R ^c se selecciona de H	C-54, C-56, C-80, C-95
C ₁ -C ₃ -alquilo	C-53, C-54, C-95 (CH ₃),
C ₁ -C ₃ -haloalquilo	C-56 (CF ₃ CH ₂)
C ₃ -C ₆ -cicloalquilo	C-57 (ciclopropilo)
y bencilo	C-55
cada R ^d es H	C-68
cada R ^e es C ₁ -C ₃ -alquilo	C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, C-62 C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103 (etilo)
cada R ^f es halógeno, C ₁ -C ₃ alquilo no sustituido o sustituido con halógeno, C ₁ -C ₃ alcoxi, o CN	C-39, C-49 (halógeno), C-40 (CF ₃), C-42, C-47, C-48, C-90 (metoxi), C-91 (CHF ₂ O), C-43 (CN), C-89 (CF ₃ O)
el índice m es 2	C-2, C-39, C-40, C-41, C-42, C-43, C-44, C-45, C-47, C-48, C-49, C-50, C-52, C-53, C-54, C-55, C-56, C-57, C-58, C-59, C-60, C-61, R-62, C-63, C-64, C-65, C-66, C-68, C-71, C-72, C-73, C-74, C-75, C-76, C-77, C-78, C-79, C-80, C-81, C-82, C-84, C-86, C-88, C-89, C-90, C-91, C-92, C-93, C-95, C-96, C-97, C-98, C-99, C-100, C-101, C-102, C-103
y los N-óxidos, estereoisómeros, tautómeros y las sales de aquel aceptables en la agricultura o veterinaria	C-103

Resulta relevante indicar que algunos de los compuestos que se presentan como sustento del nuevo alcance reclamado se aportan como datos experimentales adicionales de respaldo en el Anexo I adjunto al presente memorial.

Así las cosas, la Reivindicación 1 reclama compuestos de la Fórmula (I-A), en donde cada uno de los sustituyentes que definen dicha fórmula encuentra soporte en el Capítulo Descriptivo y además se encuentran plenamente identificados por el tipo y número de átomos que los

conforman, tal como lo sugirió el Examinador en su examen. De esta manera, la materia reclamada fue drásticamente limitada a una generalización bastante razonable y muy restrictiva respecto de la materia reclamada originalmente, de tal forma que para cualquier persona medianamente versada en la materia resultan claros, restringidos y comprensibles los límites de la materia reclamada en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto.

En adición a lo anterior, dada la relación de dependencia con la Reivindicación 1, las Reivindicaciones 2 a 7 también objetadas, incluyen de igual modo las respectivas limitaciones para los sustituyentes que abarca el compuesto de Fórmula (I-A) aquí reclamada, por lo que considero completamente superadas las objeciones de sustento que eleva el Examinador en su Oficio No. 18736.

II.2. En relación con la falta de claridad de la Reivindicación 3 por hacer referencia a la Fórmula (I), la cual no se encuentra definida en el Capítulo Reivindicatorio y tomando en consideración la anotación del Examinador, se ha reemplazado dicha expresión para hacer referirse a la Fórmula (I-A), teniéndose así como superada la objeción.

Por todo lo anterior, considero que el concepto inventivo que aquí se reclama se encuentra divulgado y sustentado de manera clara y suficiente en la descripción para que la persona normalmente versada en la materia pueda ejecutarla o reproducirla, de tal forma que los límites y el alcance de la materia reclamada en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto resultan claros y comprensibles en el marco de los lineamientos del Artículo 30 de la Decisión 486.

II. ARTE PREVIO

El Examinador considera los siguientes documentos como relevantes en la evaluación de patentabilidad de la presente invención:

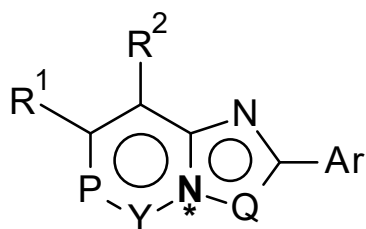
No.	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO2016023954	Pesticidally Active Heterocyclic Derivatives with Sulphur Containing Substituents	18 de febrero de 2016
D2	WO2015038503	Heterocycle-Substituted Bicyclic Azole Pesticides	19 de marzo de 2015

III. EN CUANTO A LA FALTA DE NIVEL INVENTIVO

El Examinador considera que la Reivindicación 1 carece de nivel inventivo a la luz de D1, dado que los compuestos reclamados podrían supuestamente derivarse de manera obvia a partir de las enseñanzas allí divulgadas, reconociendo como única diferencia entre la invención definida en la Reivindicación 1 y los compuestos de D1 la inclusión de un átomo de nitrógeno en el sistema de anillo bicíclico. El Examinador falla en encontrar un efecto técnico asociado a la diferencia que resalta y argumenta que D2 sugiere la inclusión de un átomo de nitrógeno en el sistema de anillo bicíclico.

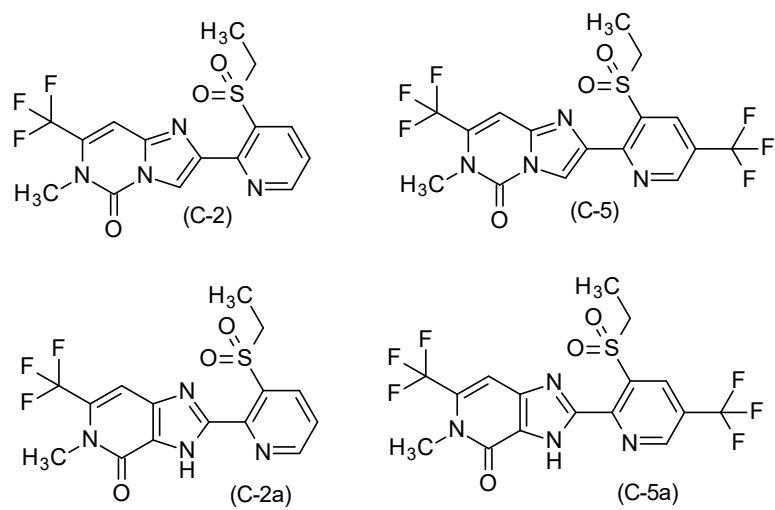
Al respecto me permito señalar que concuerdo con la consideración del Examinador, al señalar a D1 como el arte previo más cercano a la presente solicitud. En efecto, D1 se refiere a compuestos insecticidas bicíclicos (ver pag.1, par.1). Al igual que los compuestos inventivos de la presente solicitud, el anillo de 5 miembros dentro de la estructura bicíclica de D1 está conectado a una porción arilo, y el anillo de seis miembros puede igualmente contener un grupo carbonilo como un miembro del anillo (G1 de la Fórmula I).

Los compuestos inventivos de la Fórmula (I) se diferencian de los de D1 en la presencia de un átomo de nitrógeno adicional, que está presente en la posición con letras en negrita al lado del asterisco en la siguiente Fórmula (I):



En cuanto al efecto técnico de esta característica distintiva, me permito presentar los siguientes datos experimentales comparativos:

Los compuestos C-2 y C-5 de acuerdo con la presente invención (Tabla 1, pág. 89, del Capítulo Descriptivo), se compararon con los compuestos C-2a y C-5a:



Los compuestos C-2 y C-2a se probaron para determinar la actividad frente a la cigarra verde del arroz (*Nephotettix virescens*; “NEPHIM”), al saltamonte marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*; “NILALU”), al gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*; “PRODER”) y al gusano del tabaco (*Heliothis virescens*; “HELIVI”). La mortalidad de las plagas a una determinada concentración de los compuestos se resume en la Tabla X:

Compuesto	Concentración [ppm]	Mortalidad [%] de NEPHIM	Mortalidad [%] de NILALU	Mortalidad [%] de PRODER	Mortalidad [%] de HELIVI
C-2	10	90	100	75	100
C-2a*	10	0	0	12,5	50

Tabla X: actividad de los compuestos C-2 y C-2a* frente a *N. visrescens*, *N. lugens*, *S. eridania* y *H. virescens*. * de acuerdo con D2.

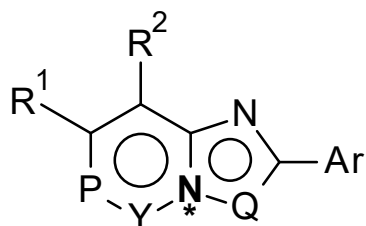
Los compuestos C-5 y C-5a se probaron para determinar la actividad frente al picudo del algodón (*Anthonomus grandis*; “ANTHGR”), al barrenador del arroz (*Chilo suppressalis*; “CHILSU”) y a la mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*; “BEMIAR”). La mortalidad de las plagas a una determinada concentración de los compuestos se resume en la Tabla Y:

Compuesto	Concentración [ppm]	Mortalidad [%] de CHILSU	Mortalidad [%] de ANTHGR	Mortalidad [%] de BEMIAR
C-5	100	50	100	100
C-5a*	100	25	50	82,5

Tabla Y: actividad de los compuestos C-5 y C-5a* frente a *C. suppressalis*, *A. grandis* y *B. argentifolii*. * de acuerdo con D1.

Los resultados muestran que la presencia de un átomo de N, que es mutuo para ambos anillos en el sistema bicíclico, tiene un impacto pronunciado sobre la eficacia insecticida de los compuestos.

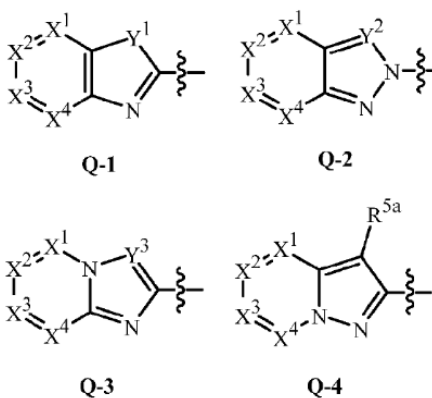
El objetivo de la presente invención consiste en proporcionar compuestos con un efecto insecticida mejorado en comparación con el arte previo. Este objetivo se logró al proporcionar compuestos de la Fórmula (I)



que contienen un átomo de N en la posición puente del sistema bicíclico.

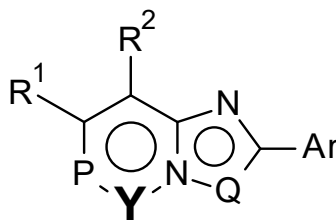
No hay ningún indicio en D1 para agregar un átomo de nitrógeno en la posición * de ramificación de la estructura bicíclica. A su vez, la persona medianamente versada en la materia no podría llegar a los compuestos de la Fórmula (I) sin ninguna orientación adicional.

Por otra parte, el documento D2 también se refiere a compuestos insecticidas (pág.1, par. 1,) que tienen una estructura bicíclica (Q-1, Q-2, Q-3 o Q-4) que está conectada mediante el anillo de 5 miembros a una porción arilo como en la presente solicitud.



Solo Q-3 (pág.2) contiene un patrón de nitrógeno en el sistema de anillos de acuerdo con los compuestos reivindicados de la Fórmula (I). Sin embargo, la persona medianamente versada en la materia no obtiene ninguna información sobre cuál de las estructuras pueden resultar beneficiosas en combinación con el patrón de sustitución de D1.

Además, D2 enseña compuestos que no tienen ningún grupo carbonilo o sulfonilo en cualquiera de las posiciones de la estructura bicíclica. Por otro lado, los compuestos reivindicados en la presente solicitud tienen una porción Y, que es C=O:



Incluso si la persona medianamente versada en la materia eligiera la estructura Q-3 correcta entre las cuatro alternativas de D2, habría quitado también la porción Y de la estructura. Lo haría porque ni D1 ni D2 brindan ninguna orientación respecto de la importancia de la porción Y. A partir de la estructura Q-3 en D2, la persona medianamente versada en la materia solo aprende que no debería estar presente ninguna porción Y si la estructura contiene un átomo de N que funciona como puente para ambos anillos de la estructura bicíclica. Por otro lado, no hay razón alguna para que dicha persona elija ciertas partes de las enseñanzas de D2, y no tome en cuenta otras, en particular sin ninguna orientación en cuanto al impacto sobre la eficacia insecticida de la presencia de un átomo de N en la posición puente del sistema bicíclico.

Por lo tanto, se requería de actividad inventiva para combinar las posiciones de los átomos de N en el sistema bicíclico con la porción carbonilo Y, y de esta manera llegar al objeto reivindicado.

En conclusión, la invención no habría podido ser dilucidada ni mucho menos prevista a partir de la información aportada por los documentos citados. La persona normalmente versada en la materia no habría encontrado sugerencia o motivación alguna que la condujera directamente a desarrollar los compuestos aquí reclamados con sus características estructurales reivindicadas, esperando obtener los efectos biológicos particulares e inesperados derivados de tales diferencias estructurales y evidenciados a lo largo del Capítulo Descriptivo, por lo tanto, la presente invención reviste de nivel inventivo.

IV. PETICIÓN

1. Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por la Dirección de Nuevas Creaciones, solicito proceder al otorgamiento de la solicitud de patente.
2. Subsidiariamente, en caso de que su Despacho considere que la modificación introducida al Capítulo Reivindicatorio amerita una nueva revisión, solicito realizar un examen de patentabilidad adicional de conformidad con lo dispuesto en el Artículo 10 de la Resolución 59669 de 25 de septiembre de 2020, para lo cual realizo el pago de tasa correspondiente.

V. ANEXOS

1. Capítulo Reivindicatorio modificado conformado por **7** reivindicaciones;
2. Pago en línea por concepto de modificaciones voluntarias;
3. Pago línea por examen de patentabilidad adicional;
4. Anexo I: Datos experimentales de respaldo adicionales.

Señora Directora,

ANDRÉS RINCÓN USCÁTEGUI

C.C. 79.780.910 de Bogotá

T.P. 114.908

COLO-16452-0841-0200-4
ANR\ANR\ID-308941\WPC16452
No. M-2022-308941\ANR