

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re.: Expediente No. NC2020/0016021

**Solicitud de Patente de Invención titulada: “DERIVADOS
HETEROCÍCLICOS COMO PLAGUICIDAS”**

Solicitante: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Nuestra Ref.: P2020/000233

**RESPUESTA AL OFICIO No. 20177, NOTIFICADO EL 12 DE DICIEMBRE DE
2022**

(SEGUNDO 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 legal 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 presente solicitud, me permito adjuntar un **Capítulo Reivindicatorio Modificado**, que reemplaza en su totalidad al Capítulo Reivindicatorio presentado en respuesta al primer examen de fondo el 23 de noviembre de 2022. Así entonces, en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto se realizan los siguientes cambios:

- la Reivindicación 1 se modifica de forma que se limita la definición de los sustituyentes R¹, R², R³, V, R⁴, R⁵ y R⁶;
- se agrega la nueva Reivindicación 3 la cual corresponde a una modalidad más limitada de la Reivindicación 1;
- las nuevas Reivindicaciones 2 y 4 a 8 corresponden a las antiguas Reivindicaciones 2 a 7, en las cuales además se limita la definición de los sustituyentes;

- se modifican las numeraciones y dependencias a lo largo del Capítulo Reivindicatorio.

Valga anotar que las modificaciones efectuadas al Capítulo Reivindicatorio cumplen a cabalidad con lo estipulado en el Artículo 34 de la Decisión 486, ya que éstas de ninguna manera implican una ampliación de la protección correspondiente a la divulgación contenida en la solicitud original. Por el contrario, estas corresponden a una limitación drástica de la materia reclamada originalmente.

2. a- El Despacho eleva las siguientes objeciones relacionadas con la claridad del Capítulo Reivindicatorio:

- las frases *“arilo mono o polisustituido opcionalmente con sustituyentes iguales o diferentes o es un anillo saturado, parcialmente saturado o heteroaromático opcionalmente mono o polisustituido con sustituyentes iguales o diferentes, en el cual por lo menos un átomo de C está reemplazado por un heteroátomo, en donde en cada caso opcionalmente puede haber por lo menos un grupo carbonilo y/o en donde en cada caso los sustituyentes...”* y *“un arilo mono o disustituido opcionalmente con sustituyentes iguales o diferentes o es un anillo saturado, parcialmente saturado o heteroaromático opcionalmente mono o disustituido con sustituyentes iguales o diferentes, en el cual por lo menos un átomo de C está reemplazado por un heteroátomo del grupo de N, O o S, en donde en cada caso opcionalmente puede haber por lo menos un grupo carbonilo y/o en donde en cada caso los sustituyentes...”* son ambiguas e imprecisas y no permiten definir claramente la materia reclamada;
- las Reivindicaciones 1 a 5 no están soportadas en el Capítulo Descriptivo porque reclaman materia de forma extremadamente general y la información técnica presentada en el Capítulo Descriptivo no es suficiente para sustentar dicha extrapolación;
- la Reivindicación 7 no está soportada en el Capítulo Descriptivo porque este no contiene información técnica que muestre el desarrollo de una combinación que incluya en compuesto de Fórmula (I) y otro ingrediente activo.

b- i) En respuesta a este punto, me permito llamar la atención del Despacho a las modificaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio aquí adjunto, en donde, la Reivindicación 1 se limitó de forma que define compuestos de Fórmula (I) en

donde las definiciones de los sustituyentes R¹ a R⁶, V y X corresponden a definiciones mucho más limitadas que las reclamadas originalmente. En particular, los sustituyentes R³ y V se limitaron de forma que encuentran completamente definidos por los residuos que pueden representar, además de sus posibles sustituyentes. Por lo que me permito señalar que el alcance de la materia reclamada ha sido limitado drásticamente, de manera que esta corresponde a una generalización razonable de lo descrito en el Capítulo Descriptivo y se encuentra completamente soportada por este.

Asimismo, me permito señalar que las frases objetadas por el Despacho fueron eliminadas del Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, por lo cual considero completamente superada la objeción relacionada.

ii) Ahora bien, en cuanto a la objeción relacionada con el sustento de la Reivindicación 8 (antigua Reivindicación 7), me permito respetuosamente diferir de la opinión del Despacho, pues dicha reivindicación está dirigida a una combinación, por lo que dicha reivindicación proporciona protección para modalidades particulares de la presente invención abarcadas en el concepto inventivo desarrollado por los inventores, que en el presente caso incluye composiciones y combinaciones que comprenden los compuestos de la invención, lo que las hace novedosas e inventivas como se explicará más adelante. Así, en el presente caso la formulación agroquímica de la Reivindicación 8 resulta completamente clara para la persona medianamente versada en la materia en tanto su característica esencial es que comprende los compuestos reclamados en la presente solicitud, es decir, la definición específica de otros ingredientes, incluso de otros ingredientes activos y de sus cantidades limitaría injustamente la materia reclamada en tanto lo que hace inventiva a la composición es el agente activo que comprende. Adicionalmente, en caso de la sección Formulaciones y Mezclas de las páginas 53 a 61 del Capítulo Descriptivo mencionan la forma en que dichas composiciones pueden ser realizadas.

Sin perjuicio de lo anterior, me permito señalar que un inventor tiene derecho a reclamar protección para la totalidad de un concepto inventivo desarrollado, sin importar la amplitud de éste. Así, una reivindicación puede ser tan amplia como se requiera para así poder enmarcar la totalidad del concepto inventivo desarrollado, y no solamente las modalidades preferidas o específicamente ejemplificadas en la solicitud. Adicionalmente, vale la pena mencionar que la función de los ejemplos en el Capítulo Descriptivo **es estrictamente ilustrativa** y de ninguna manera puede considerarse como el único alcance reivindicable posible. De hecho, reclamar estrictamente aquello ejemplificado en el

Capítulo Descriptivo limitaría injustamente el alcance de la protección a la cual el inventor tiene derecho, y facilitaría que un tercero modifique alguno de estos elementos específicos ilustrados en los ejemplos, evitando de este modo cometer una infracción y aprovechando indebidamente el desarrollo realizado por el Solicitante, lo que desdibujaría completamente el sistema de protección de propiedad intelectual vía patente.

iii) Así las cosas, en vista de las modificaciones realizadas y los argumentos presentados anteriormente, considero que el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto cumple con los requisitos de claridad, concisión y soporte establecidos en el Artículo 30 de la Decisión 486, permitiéndole a la persona medianamente versada en la materia no sólo comprender inequívocamente el alcance y los límites de la materia reclamada, sino también reproducirla a partir de la información divulgada en el Capítulo Descriptivo y sus conocimientos del campo técnico, sin tener que recurrir a experimentación adicional exhaustiva.

3. El Despacho afirma que la presente invención carece de nivel inventivo a la luz de WO2017/055185 (D1) y JP2018024658 (D3).

Particularmente, el Despacho señala que D1 es el arte previo más cercano a la Reivindicación 1 porque describe derivados heterociclos fusionados de Fórmula (I) y su actividad como insecticidas.

El Despacho considera que la diferencia entre el compuesto de Fórmula (I) y el compuesto de D1 consiste en un anillo de imidazol central. Sin embargo, no reconoce que esta diferencia proporcione un efecto técnico diferente al que ya proporcionaba D1, porque ya se había previsto la actividad insecticida para derivados heterocíclicos fusionados equivalentes.

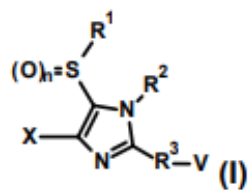
Por lo tanto, el Despacho considera que el problema técnico que pretende resolver la presente invención se puede formular así: “*¿Cómo modificar el compuesto conocido en D1 para obtener un derivado heterocíclico fusionado insecticida alternativo?*”

Sin embargo, el incluir un anillo de imidazol central en un derivado heterociclo fusionado con actividad insecticida ya está divulgado en D3 que se refiere a derivados de fórmula (1) útiles como insecticidas, en donde se considera de manera particular un anillo imidazolpiridin central. El Despacho aclara que pese a que D3 presenta un anillo imidazolpiridin esta estructura se considera sugerencia suficiente para plantearse de manera

evidente un anillo imidazol e igualmente esperar actividad insecticida. Aún más cuando es reconocido para la persona medianamente versada en la materia la equivalente estructural, de síntesis y de actividad entre los anillos de imizadol e imidazolpiridin. Así, incluir uno u otro estaría al alcance de la persona versada en la materia de manera obvia.

Las Reivindicaciones dependientes 2 a 7 no mencionan alguna característica que, junto con las características de la reivindicación independiente, aporte nivel inventivo al producto de la Reivindicación 1, por lo cual se considera que carece de nivel inventivo.

b- i) En respuesta a este punto, me permito señalar nuevamente las modificaciones realizadas en el Capítulo Reivindicatorio Modificado adjunto, en donde la Reivindicación 1 se modificó de forma que ahora reclama compuestos, caracterizados porque son de la Fórmula (I)

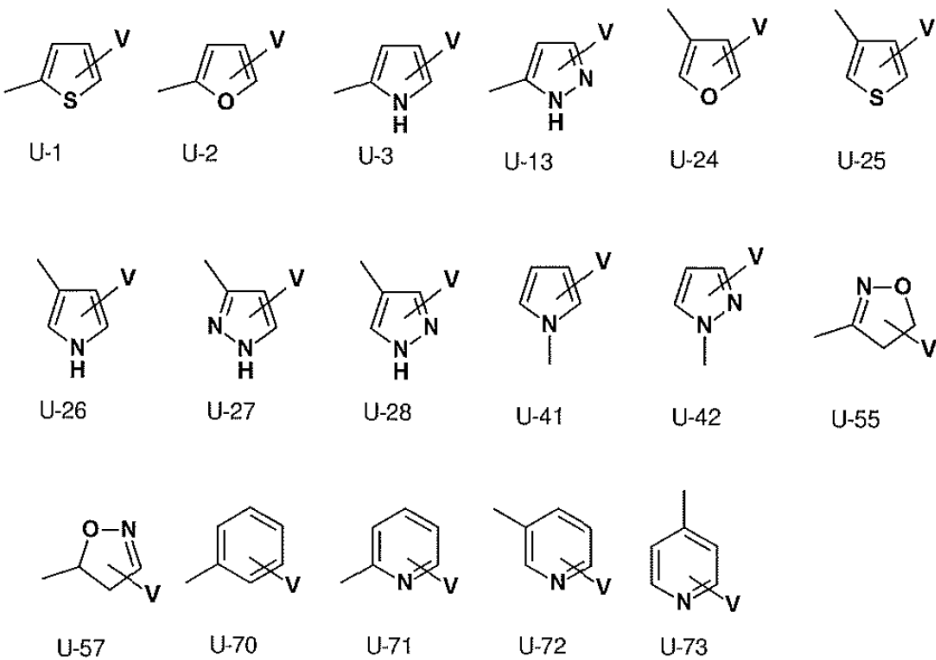


en donde

R¹ es (C₁-C₆)alquilo,

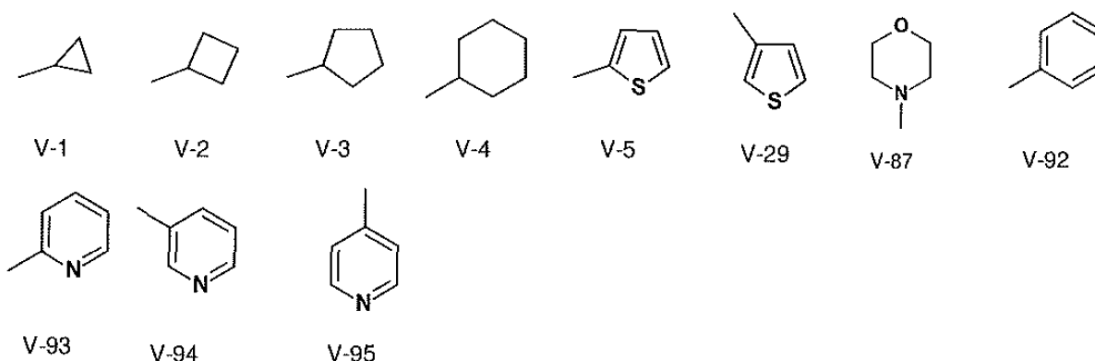
R² es (C₁-C₆)alquilo,

R³-V representan un anillo de 5 ó 6 miembros opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes que son iguales o diferentes de la serie U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72 y U-73, en donde los sustituyentes son en cada caso: ciano o halógeno,

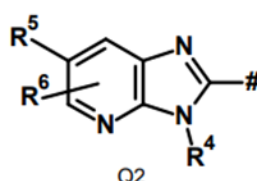


en donde

V representa un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes que son iguales o diferentes de la serie V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94 y V-95, en donde los sustituyentes son en cada caso: ciano o halógeno,



X representa un sistema de anillos bicíclico heteroaromático fusionado de 9 miembros que es Q2,

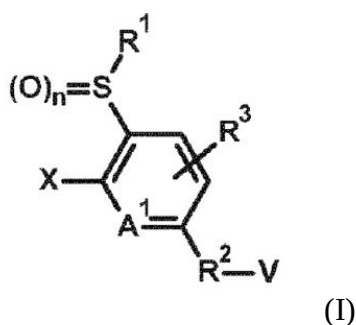


R⁴ representa (C₁-C₆)alquilo,

R⁵, R⁶ representan de manera independiente entre sí, hidrógeno o (C₁-C₆)haloalquilo,

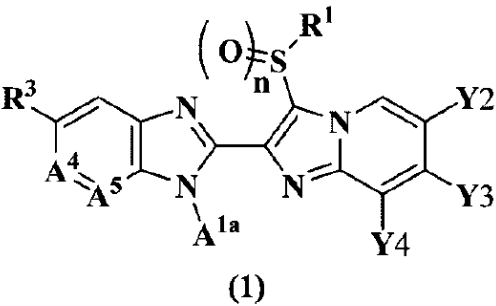
n representa 2.

ii) Ahora bien, con respecto al arte previo citado por el Despacho, me permito señalar que D1 divulga derivados heterocíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo-arilo como agentes de control de plagas, de Fórmula (I):



donde X tiene 20 definiciones posibles. Como bien señala el Despacho, el anillo central de D1 siempre corresponde a un **anillo heterocíclico de 6 miembros**, en el que A¹ representa nitrógeno, =N⁺(O⁻)- o =C(R⁴)-, mientras que en la presente solicitud el **anillo central es un imidazol N sustituido**.

Por su lado, D3 hace referencia a un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula (1), o una sal del mismo, o un N-óxido del mismo.



en donde A4 y A5 pueden ser independientemente N o CH.

Ahora bien, difiero de la opinión del Despacho respecto a que solo existe una única diferencia entre la presente invención y D3, y me permito señalar a continuación algunas de las diferencias con el compuesto de fórmula (1), citado por el Despacho:

- como bien señala el Despacho, la principal diferencia entre los compuestos de la presente solicitud y D3 es que en el primero se trata de un anillo de imidazol y en D3 es un imidazopiridin (señalados en rojo a continuación);
- dado que el sustituyente R3 de la presente solicitud no puede formar en ningún caso un anillo bicíclico con el anillo de imidazol, no hay un sustituyente equivalente a Y2 en los compuestos de la presente solicitud, contrario al análisis del Despacho, en la cual se encuentra R3-V que corresponde a un anillo de 5 ó 6 miembros opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes que son iguales o diferentes de la serie U-1, U-2, U-3, U-13, U-24, U-25, U-26, U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-71, U-72 y U-73, en donde los sustituyentes son en cada caso: ciano o halógeno:

Table with 2 columns: Presente invención, D3. It compares chemical structures and substituents between the present invention and D3.

U-27, U-28, U-41, U-42, U-55, U-57, U-70, U-72 y U-73, en donde los sustituyentes son en cada caso: ciano o halógeno; V representa un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes que son iguales o diferentes de la serie V-1, V-2, V-3, V-4, V-5, V-29, V-87, V-92, V-93, V-94 y V-95, en donde los sustituyentes son en cada caso: ciano o halógeno.	G1-1 G1-2 G2-1 G2-2
---	---

Por lo tanto, me permito afirmar que los compuestos reclamados no se encuentran enseñados, ni sugeridos en D1 y D3, de tal manera que dichos documentos no habrían podido guiar a la persona medianamente versada en la materia en un modo obvio a desarrollar los compuestos de Fórmula (I), pues no contienen enseñanza o sugerencia alguna que guiaría a dicha persona a realizar las modificaciones estructurales señaladas anteriormente para obtener los compuestos aquí reclamados, con una esperanza mínima de que dichas modificaciones no alteren la actividad biológica de los compuestos.

iii) Ahora bien, en cuanto a la afirmación de que “*es reconocido para la persona medianamente versada en la materia la equivalencia estructural, de síntesis y de actividad entre los anillos de imizadol e imidazolpiridin*” realizada por el Despacho, me permito respetuosamente diferir, por al menos los motivos que expongo a continuación:

En primer lugar, el Despacho cita el documento “*Direct preparation of thiazoles, imidazoles, imidazopyridines and thiazolidines from alkenes*”¹, el cual está dirigido a la síntesis de una gama de heterociclos como tiazoles, imidazoles, imidazopiridinas, tiazolidinas y dimetoxiindoles, directamente a partir de alquenos a través de un protocolo de cetoidinación/ciclación de dos pasos. No resulta claro por qué el Despacho cita un artículo dirigido al método de síntesis de diferentes heterociclos, pues como sabría la persona versada en la materia, el método de obtención no está directamente relacionado con la actividad de los compuestos obtenidos. Si bien los imidazoles e imidazopiridinas se pueden obtener por métodos similares, no es correcto afirmar que la persona versada en la materia encontraría una motivación o sugerencia para obtener un imidazol con actividad insecticida por su similitud con las imidazopiridinas basado en un método de síntesis.

¹ Donohoe, T. J., Kabeshov, M. A., Rathi, A. H., & Smith, I. E. D. (2012). Direct preparation of thiazoles, imidazoles, imidazopyridines and thiazolidines from alkenes. *Org. Biomol. Chem.*, 10(5), 1093–1101. doi:10.1039/c1ob06587d

En segundo lugar, el Despacho cita el documento “*Imidazole-pyridine bioisosterism: comparison of the inotropic activities of pyridine- and imidazole-substituted 6-phenyldihydropyridazinone cardiotonics*”², el cual está dirigido a probar la hipótesis del bioisosterismo entre el imidazol y la piridina, en donde se encontró que un sitio aceptor de enlaces de hidrógeno adecuadamente orientado contribuye al alto grado de potencia inotrópica observado con compuestos cardiotónicos. Considerando lo anterior, sería erróneo afirmar que resulta obvio para la persona versada en la materia que la actividad de los anillos imidazol e imidazopiridin es equivalente, pues estos anillos ni siquiera se comparan en el artículo citado por el Despacho, el cual además está dirigido a compuestos cardiotónicos. Por lo tanto, no resulta claro porque la persona versada en la materia encontraría motivación de intercambiar el anillo de imidazopiridin por un anillo de imidazol si este no se encuentra sugerido en el estado del arte.

iv) Así las cosas, y a la luz de las evidentes diferencias encontradas entre la materia reclamada en la solicitud frente al arte previo, vale la pena señalar que de acuerdo con el Manual Andino de Patentes (en adelante MAP), para que pueda negarse la existencia de nivel inventivo, es necesario, no solamente que la combinación de las enseñanzas pueda hacerse, sino también que exista una sugerencia o razón tal, que lleve al técnico con conocimientos medios a combinar las enseñanzas de los documentos³. Además, el MAP también establece que las invenciones en el campo de la química tienen nivel inventivo cuando los compuestos tienen una **estructura inesperada** (no derivable por la persona medianamente versada en la materia) o cuando presentan un **efecto técnico inesperado o mejorado impredecible del arte previo**⁴. De manera similar, la Guía para Examen de Solicitudes de Patente de Invención y Modelo de Utilidad (en adelante Guía de la SIC) establece que, para que una invención no resulte inventiva “*el conjunto de enseñanzas del estado de la técnica lo llevarían (a la persona medianamente versada en la materia) de forma inmediata a la solución propuesta por la solicitud. **Si se requiere de pasos adicionales o de corroboración o de superar obstáculos revelados por las propias enseñanzas entonces el estado de la técnica no revela la solución al problema***”⁵ (subrayado y énfasis fuera del texto). Lo cual no sucede en el presente caso, toda vez que los compuestos que se reclaman en la presente solicitud no pudieron haber sido predichos con éxito a partir del arte previo identificado por el Despacho.

² Robertson, D. W., Krushinski, J. H., Pollock, G. D., & Hayes, J. S. (1988). Imidazole-pyridine bioisosterism: comparison of the inotropic activities of pyridine- and imidazole-substituted 6-phenyldihydropyridazinone cardiotonics. *Journal of Medicinal Chemistry*, 31(2), 461–465. doi:10.1021/jm00397a033

³ Comunidad Andina de Naciones, *op. cit.*, Sección 10.2.1 - Ejemplo 1.

⁴ Ibídem, Sección 10.8.1.

⁵ Superintendencia de Industria y Comercio, *op. cit.*, sección 2.13.2.

v) En este punto, resulta relevante notar que en el momento de la realización del Examen de fondo, el Despacho no parece haberse regido por lo estipulado en la Guía de la SIC en cuanto la evaluación de nivel inventivo, ya que ésta debe basarse únicamente en si existen **sugerencias explícitas y suficientes** en el arte previo que indicarían de manera clara cómo desarrollar de manera obvia los compuestos aquí reclamados, que, como se demostró anteriormente, no existen. En consecuencia, no es aceptable a quien examina o a quién concede o deniega una patente desvirtuar el nivel inventivo de la misma por simplemente desglosar sus elementos separadamente y luego buscar referencias en el estado del arte que los incluyan, como si de armar un rompecabezas con piezas aisladas, o una colcha de retazos, se tratara.

En este caso particular, y contrario al análisis del Despacho, como es evidente del análisis del arte previo realizado anteriormente, la única forma en que una persona medianamente versada en la materia podría llegar a los compuestos de la presente invención siguiendo los argumentos del Despacho, sería al realizar un análisis en retrospectiva una vez conoce la invención aquí reclamada.

Sin embargo, el estudio de solicitudes de patente que conduzca a ese tipo de conclusiones anticipadas corresponde abiertamente a un análisis conocido en el ámbito de patentes como “**análisis hindsight**” o en retrospectiva. Para entender el análisis equivocado que realiza el Despacho, podemos citar nuevamente el MAP, que indica claramente que “...*la búsqueda de anterioridades se efectúa a posteriori, tomando como punto de partida la misma invención, ... (La SIC) debe realizar el esfuerzo intelectual de colocarse en la situación que ha tenido que afrontar el técnico con conocimientos medios en la materia en un momento en que la invención no era conocida, es decir antes de la invención*”⁶ (mi subrayado). Por ende, no es apropiado anticiparse a los resultados presentados por la invención, ya que así, siempre resultará “obvio” todo objeto de una solicitud de patente, pues inevitablemente esta parecerá derivada de la teoría en que se basa su desarrollo, sin dar mayor importancia al trabajo, intelecto y creatividad involucrados en la invención para llegar a la solución del problema planteado en la solicitud.

Aceptar el estándar de nivel inventivo del Despacho, donde supuestamente el desarrollo de los compuestos aquí reclamados, así como sus resultados mejorados, son obvios, equivaldría a desdibujar el objetivo principal del sistema de patentes, que es precisamente fomentar la investigación y desarrollo de mejoras incrementales. **Nada se inventa de la nada.** Necesariamente, la tecnología avanza en pasos discretos constituida por mejoras

⁶ Comunidad Andina de Naciones, *op. cit.*, Sección 10.2.1.

concretas a lo que se conoce. El sistema de patentes recompensa al inventor que proporciona una solución que no resultaría previsible a partir del estado de la técnica. Lo anterior además quiere decir que el resultado inventivo no podría ser desarrollado sin algún grado de experimentación o que presente resultados inesperados.

En este sentido, resulta evidente que el Despacho rechaza el nivel inventivo de la presente invención mediante la búsqueda sesgada de las características esenciales aquí reclamadas en D1 y D3, sin considerar adecuadamente si el arte previo, considerado como un todo, comprende enseñanzas claras y evidentes que guíen inequívocamente a la persona medianamente versada en la materia a obtener la presente invención de manera obvia.

De hecho, el análisis en retrospectiva se hace precisamente evidente al considerar que ninguno de los documentos citados por el Despacho enseña explícitamente la diferencia estructural reconocida durante el análisis de nivel inventivo, es decir el anillo imidazol. Adicionalmente, el Despacho falla en demostrar por qué una persona medianamente versada en la materia que partiera de las enseñanzas del arte previo citado habría reemplazado los anillos de D1 o D3 específicamente por el anillo imidazol en la estructura divulgada. Por el contrario, una persona medianamente versada en la materia, en el mejor de los casos, y a partir de las enseñanzas de D1 y D2 estaría motivada a reemplazar el anillo de 6 miembros de los compuestos divulgados en D1 con un anillo imidazopiridin como enseña D3.

vi) A la luz de lo anterior, considero que la presente invención es inventiva a la luz del arte previo citado, pues siguiendo las enseñanzas de D1 y D3, la persona medianamente versada en la materia no obtendría la materia reclamada, ni podría esperar que ésta presentase los resultados que en efecto reviste.

4. Adicionalmente y sólo a título ilustrativo no vinculante, deseo destacar que, para el concepto inventivo comprendido en la presente solicitud, ha sido otorgado hasta el momento el privilegio de patente en China y ha recibido intención de concesión en Chile y Europa.

Si bien es cierto que las concesiones de patentes en oficinas de otros países no son vinculantes en el sentido que obliguen a la SIC a tomar una decisión en el mismo sentido, considero que dichas concesiones sugieren el cumplimiento de los requisitos de patentabilidad de la materia reivindicada, ya que los criterios de evaluación aplicados para

concluir la aceptación de dichas patentes resultan equivalentes a los que la SIC debe emplear.

5. Finalmente, 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;
- Recibo de pago por modificaciones del Capítulo Reivindicatorio.