

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 --
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

465 486 486
486
Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 9650

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-023860- -00006-0000

Fecha: 2007-05-29 16:36:38 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios: 3

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 03.023.860
Asunto : REGISTRO - PATENTE PCT DELTA1-PIRROLINAS
COMO PESTICIDAS, PROCESO PARA SU
OBTENCION Y PREPARACIONES PESTICIDAS QUE
LAS CONTIENEN.
Solicitante : BAYER CROPS SCIENCE AG
Publicada en : La Gaceta No. 570 Del 30 de noviembre de 2006
Fecha de Solicitud : 20 de marzo de 2003

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado en el asunto de la referencia, atentamente, solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia presentada de acuerdo con el Capítulo II del PCT y según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo por valor de \$ 202.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 36155 de 28 de diciembre de 2006.

2. Ruego atentamente a la Señora Jefe se sirva ordenar que se anexe este recibo para que se efectúe dicho examen y se continúe con el trámite de la solicitud.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 13549 841 002 0
FBH\ASG\ID-102095\WPC13549
No. M-2007-102095\FBH

466487
464

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 000170087-2

RECIBO OFICIAL DE CADA : 07 - 40,532
FECHA : MAYO 22 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-023860- -00006-0000

Fecha: 2007-05-29 18:36:38 Dep. 2020 NUECLACIONI
Tra 11 PATENTEIYII Lve: 379 FASENACIONALII
Act 538 PETICION Folios: 3

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55000355	22/05/2007	11,941,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	
	83 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN SI	40,000.00
	TOTAL :	40,000.00

SON: SESENTA Y CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CADA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

WOLLO 08443 841 0054
13549 841 0020

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800178098-2

RECIBO OFICIAL DE CASH : 87 - 40,533
FECHA : MAYO 20 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-023860-00006-0000

Fecha: 2007-05-29 16:36:38 Dep. 2020 NUEBOACIONE
Tit. 11 PATENTEYH Lvg: 379 FASENACIONALI
Act. 538 PELICION Folios: 3

***** CONSIGNACION *****

REPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	NO. PAGO	FECHA PGO	VAL. PAGO
CANILLER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-5	88000055	22/05/2007	44,533.000.00

***** C O N S I G N A C I O N *****

CANT. RECIBIDO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
----------------	----------	----------------

1 90005-01-01 SOLICITUDES 88 INVOGACION DE UNA PRIORIDAD EN SI 68,000.00
TOTAL : 68,000.00

SWA: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CASH RELACIONADO AL EXPEDIENTE NO.

COLO 06448 81480 13544 841002.0
0.700 148 841002.0

467488

468/489
468

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176009-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 40,834
FECHA : MAYO 22 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-023860- -00006-0000

Fecha: 2007-05-29 16:36:38 Dep: 2020 NUECREACION:
Tra. 11: PATENTE/II Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 538 PETICION Folios: 3

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55800750	22/05/2007	44,941,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	83 INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EX SI	60,000.00
	TOTAL :	60,000.00

CON: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

PAGOS DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

60648 844 005 71
13549 841 002 -0

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 03-023860-00008-0000

Fecha: 2008-03-03 17:08:52 Dep. 2020 NUECREACIONES
Act. 11 PATENTILYB Evt. 379 PASNACIONALI
Act. 444 RESPUESTA RQUE Folios: 13

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011 Evento : 379 Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 03023860
Asunto : PATENTE PCT A1-PIRROLINAS COMO
PESTICIDAS
Solicitante : BAYER CROPS SCIENCE AG
Clase : A01N 043/036, C07D 207/022, C07D 401/014, C07D
405/014, C07D 409/014

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 15907 notificado por fijación en lista del 7 de diciembre de 2007.

2. Mediante el Oficio No. 15907 se puso en conocimiento del solicitante el informe del examen de fondo que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

3. Claridad de las reivindicaciones:

En forma resumida su Despacho afirma lo siguiente:

"En general todo el capítulo reivindicatorio es muy amplio y no define la materia de la invención de forma específica. No queda claro cuales son los compuestos de la fórmula 1 debido a la gran cantidad de posibles sustituyentes y no se define la materia ni el alcance de la invención".

470
~~465~~
~~468~~
~~465~~

"Además durante todo el capítulo reivindicatorio se presentan expresiones que no definen el objeto de la invención".

"En consecuencia, el compuesto de la formula I no se encuentra definido, además la estructura de esa fórmula es suficientemente pequeña para que los posibles sustituyentes puedan formar una estructura más grande que ella, de tal forma que la formula I deja de ser representativa".

"No existe un sustento suficiente en la descripción para la gran cantidad de posibles compuestos reivindicados en la cláusula 1. Las reivindicaciones 2 a 5 presentan problemas similares de claridad y amplitud".

"De otro lado, no se sabe si el compuesto de la formula I-a presentado en la reivindicación 6 se deriva de una de las múltiples sustituciones o corresponde a un compuesto adicional".

"La reivindicación 7 no define el objeto ni el alcance del proceso por la gran cantidad de posibilidades de sustitución en la formula I. Además A-1 y A-2 presentan la misma materia pues, de acuerdo con el criterio del Examinador, estas estructuras son iguales. Por otra parte el literal D no aporta ninguna característica al procedimiento de obtención de compuesto de fórmula I".

471 486
484 486

"Las reivindicaciones 8, 10 y 11 son presentadas de forma amplia y ambigua y por lo tanto, no cumplen con el requisito de claridad".

4. Unidad de Invención

En forma resumida su Despacho afirma lo siguiente:

"Dado que los compuestos presentados son estructuralmente diferentes no se puede distinguir una estructura específica que relacione un concepto común inventivo y la estructura propuesta pierde importancia al considerar el tamaño y variedad de sus posibles sustituyentes".

5. Reivindicaciones Relativas a un uso

En forma resumida su Despacho afirma lo siguiente:

"La reivindicación 12 hace referencia al empleo de los compuestos de la formula I para la fabricación de agentes pesticidas. Lo cual no es patentable pues no corresponde a una invención de producto o de procedimiento".

6. Modificación a una solicitud en trámite:

Con el objeto de atender las anteriores observaciones y de conformidad con lo establecido en el artículo 34 de la Decisión 486, que permite al solicitante en cualquier momento del trámite efectuar modificaciones, sin ampliar el objeto de la invención inicialmente

472/67
472/67
472/67

solicitada, me permito presentar un nuevo capítulo reivindicatorio, que comprende 2 reivindicaciones.

El alcance del producto reivindicado en el nuevo capítulo reivindicatorio se limitó a la materia presentada en la reivindicación 5 original, de tal forma que se definió específicamente la estructura del objeto de la invención y se redujo considerablemente el numero de sustituyentes y las posibles estructuras.

Al eliminar las reivindicaciones 1-4 del capítulo original se superan las objeciones de claridad que estaban principalmente dirigidas a la reivindicación 1 inicial mediante la eliminación de funciones químicas no específicas y la supresión de expresiones poco claras y ambiguas.

De esta forma, la estructura de la formula I queda apropiadamente definida y es representativa del alcance de la invención. En este sentido vale la pena señalar que todos los posibles sustituyentes que Q representa están debidamente caracterizados por las funciones químicas y el tamaño de sus cadenas.

Por otra parte, se redactó una nueva reivindicación de proceso independiente número 2 basada en la reivindicación original numero 7, donde las definiciones de los sustituyentes se han restringido de acuerdo con la reivindicación nueva numero 1 y por lo tanto queda determinado el objeto y el alcance de la invención. Por otra parte

el término ambiguo "diluyente" fue eliminado y la traducción del termino "acid binder" fue corregida a "ligante de ácido" en lugar de "acceptor de ácido".

En cuanto a la afirmación por parte del Examinador respecto a la presentación de la misma materia en A-1 y A-2, respetuosamente pongo de presente a su Despacho que no se trata de la misma materia ya que las estructuras de los iminocloruros de formula II-a y II-b, son diferentes toda vez que las posiciones de los radicales Ar^1 y Ar^2 , están intercambiadas en las estructuras II-a y II-b. Por otra parte, el literal D de la reivindicación 7 original, fue eliminado de la reivindicación correspondiente numero 2, en el nuevo capitulo reivindicatorio.

La materia presentada en las reivindicaciones 6 y 8-12 del capitulo original, fue eliminada del nuevo capitulo reivindicatorio.

7. Argumentos a favor de la unidad de invención

Tras haber limitado el numero de sustituyentes de la formula I de acuerdo con la reivindicación original 1, la naturaleza química de los compuestos reclamados es única, sus propiedades son similares y por lo tanto los posibles compuestos resultantes de las sustituciones son estructural y funcionalmente semejantes. Estas características se constituyen como un concepto común inventivo para los compuestos reivindicados. Este concepto común inventivo es sustentado por los ejemplos biológicos de aplicación donde el efecto pesticida asociado a la estructura de los $\Delta 1$ -pirrolinas 4-sustituidas, es demostrado.

489
442
469
474

8. Conclusión:

Teniendo en cuenta los argumentos arriba citados así como el nuevo capítulo reivindicatorio que se presenta con este escrito, se concluye que la presente invención además de cumplir con los requisitos de claridad y sustento, también cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo con el artículo 25 de la Decisión 486.

Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

9. Anexos:

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 2 reivindicaciones.
- Formulario para modificaciones.
- Recibo por concepto de modificaciones en solicitud pendiente.

Señora Jefe,


EMILIO FERRERO
T.P.A. No.31.929

COLO-13549-841-002-0
AMG\MGT\ID-120426\WPC13549
No. M-2008-120426\AMG

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

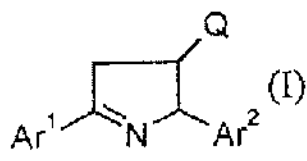
FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1		SOLICITUD DE:	
☐ Corrección de Error Material		☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania.		IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
	Dirección: Alfred-Nobel-Str. 50, D-40789 Monheim, Alemania Domicilio: Monheim, Alemania Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@cavelier.com		
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: Emilio FERRERO Dirección: Carrera 4ª No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 217 92 11 E-mail: cavelier@cavelier.com		IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: <u>438.019 TP 31.929</u>
4	Número de expediente: <u>03.023.860</u>		
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 2 reivindicaciones, para subsanar las observaciones del examen de fondo.		
6	Comprobante de pago No. <u>08-16,477</u> Fecha: <u>25 de febrero de 2008</u>		
7	Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa por valor de \$103.000.00 ☐ Poderes, si fuere el caso ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas.		
8	NOMBRE: EMILIO FERRERO	FIRMA: 	C.C. 438.019 de Usaquén T.P.A. 31.929

471
476
477

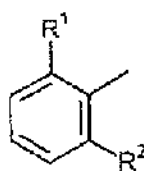
Reivindicaciones

1 Δ^1 -Pirrolinas de fórmula (I)

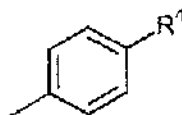


en las cuales

Ar¹ representa el radical



Ar² representa el radical



R¹ representa flúor o cloro,

R² representa hidrógeno, cloro o flúor,

R⁴ representa B-Z-D,

B representa p-fenileno,

Z representa oxígeno o azufre,

D representa -CE-

472
475
477

Q representa $-\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2$ -n-propil, $-\text{CO}_2$ -isopropil,

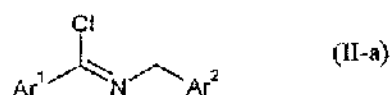
$-\text{CO}_2$ -n-butil, $-\text{CO}_2$ -isobutil, $-\text{CO}_2$ -sec-butil, $-\text{CO}_2$ -tert-butil, $-\text{CO}_2$ -n-pentil, $-\text{CO}_2$ -neopentil, $-\text{CO}_2$ -sec-isoamil, $-\text{CO}_2$ -pentan-3-il, $-\text{CO}_2$ -ciclopentil, $-\text{CO}_2$ -n-hexil, $-\text{CO}_2$ -ciclohexil, $-\text{CONHMe}$, $-\text{CONHEt}$, $-\text{CONH(n-propil)}$, $-\text{CONH(isopropil)}$, $-\text{CONH(n-butil)}$, $-\text{CONH(tert-butil)}$, $-\text{CONH(n-pentil)}$, $-\text{CONH(n-hexil)}$, $-\text{CONH-(ciclohexil)}$, $-\text{CONMe}_2$, $-\text{CONEt}_2$, $-\text{CON(n-propil)}_2$, $-\text{CON(isopropil)}_2$, $-\text{CON(n-butil)}_2$, $-\text{CON(n-pentil)}_2$, $-\text{CON(Me)Et}$, $-\text{CON(Me)n-propil}$, $-\text{CON(Me)n-butil}$, $-\text{CON(Me)n-pentil}$, $-\text{CN}$,
pirrolidinocarbonil o piperidinocarbonil,

Q adicionalmente representa CO_2H , $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CN}$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CN}$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NO}_2$, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$, 2-metoxicarbonil-propiloxicarbonil, 3-(2-oxo-1-pirrolidinil)propiloxicarbonil, N-4-fluorofenil-N-isopropil-amino-2-oxoetiloxicarbonil, $-\text{CO}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}=\text{CH}_2$, $\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$, $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}-\text{Ph}$, 2-clorobenziloxicarbonil, 3-clorobenziloxicarbonil, 4-clorobenziloxicarbonil, 1-feniletiloxicarbonil, 3-fenilpropiloxicarbonil, 2-fenoxi-etiloxicarbonil, 4-metilciclohexiloxicarbonil, ciclohexilmetiloxicarbonil, 1-ciclohexiletiloxicarbonil, 3-furfuriloxicarbonil, 2-tieniloxicarbonil, 3-tieniloxicarbonil, 2-piridinilmetiloxicarbonil, 3-piridinilmetiloxicarbonil, 6-cloro-3-piridinilmetiloxicarbonil, 1-

478 473
475 472

tetrahidronaftiloxicarbonil, 1-indaniloxicarbonil, -
 CON(H)CH₂CF₃, metoxietilaminocarbonil, 4-
 trifluorometoxifenil-aminocarbonil, benzil-
 aminocarbonil, 2-clorobenzil-aminocarbonil, 3-
 clorobenzil-aminocarbonil, 4-clorobenzil-aminocarbonil,
 3-metilbenzil-aminocarbonil, 4-metilbenzil-
 aminocarbonil, 2,4-diclorobenzil-aminocarbonil, 2-
 metoxibenzil-aminocarbonil, 2,3-dimetoxibenzil-
 aminocarbonil, 3,5-dimetilbenzil-aminocarbonil, 2,4-
 difluorobenzil-aminocarbonil, 4-
 trifluorometilciclohexil-aminocarbonil, ciclohexilmetil-
 aminocarbonil, 2-tienil-aminocarbonil, 2-
 tetrahidrofurilmetil-aminocarbonil, 2-tiazolil-
 aminocarbonil, 5-metoxycarbonil-2-tiazolil-aminocarbonil
 o representa morfolinocarbonil.

2 Proceso para la preparación de compuestos de fórmula (I)
 de acuerdo con la reivindicación 1 caracterizados porque
 A-1) iminocloruros de fórmula (II-a)



reaccionan con compuestos dipolarófilos de fórmula (III)

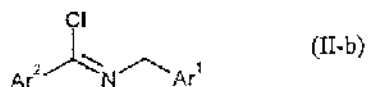


428
429
429

en los cuales

Ar^1 , Ar^2 y Q es cada uno tal como se define en la reivindicación 1 en presencia de un ligante de ácido, o

A-2) iminocloruros de fórmula (II-b)



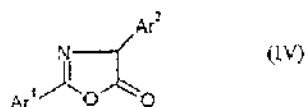
reaccionan con compuestos dipolarófilos de fórmula (III)



en los cuales

Ar^1 , Ar^2 y Q es cada uno tal como se define en la reivindicación 1 en presencia de una ligante de ácido, o

B) Las oxazolinonas de fórmula (IV)



reaccionan con compuestos dipolarófilos de fórmula (III)

No. 03-023869

No. 03-023860- -00008-0000

Tel. 011-525860-40008-0000
 Fax: 011-525860-40008-0000
 Tel. 011-525860-40008-0000
 Fax: 011-525860-40008-0000

NIT : 800174039-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 16,477
FECHA : FEBRERO 25 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vir. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	2808482	25/02/2008	40.274.000,00

***** C O N C E P T O *****

CONCEPTO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
----------	----------	----------------

1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12	MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	103,000.00
				TOTAL :	\$ 103,000.00

SON: CIENTO TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

Colo 13549-841-002-0



US006274613B1

447
480477
482(12) **United States Patent**
Plant et al.(10) **Patent No.:** **US 6,274,613 B1**(45) **Date of Patent:** ***Aug. 14, 2001**(54) **CYCLIC IMINES AS PESTICIDES**(75) **Inventors:** **Andrew Plant, Leverkusen; Gerd Kleefeld, Neuss-Uedesheim; Thorsten Pötter, Köln; Christoph Erdelen, Leichlingen; Norbert Mencke, Leverkusen; Andreas Turberg, Haan; Ulrike Wachendorf-Neumann, Neuwied, all of (DE)**(73) **Assignee:** **Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen (DE)**(*) **Notice:** This patent issued on a continued prosecution application filed under 37 CFR 1.53(d), and is subject to the twenty year patent term provisions of 35 U.S.C. 154(a)(2).

Subject to any disclaimer, the term of this patent is extended or adjusted under 35 U.S.C. 154(b) by 0 days.

(21) **Appl. No.:** **09/297,964**(22) **PCT Filed:** **Nov. 7, 1997**(86) **PCT No.:** **PCT/EP97/06186**§ 371 Date: **May 11, 1999**§ 102(e) Date: **May 11, 1999**(87) **PCT Pub. No.:** **WO98/22438****PCT Pub. Date: May 28, 1998**(30) **Foreign Application Priority Data**

Nov. 20, 1996 (DE) 196 48 011

(51) **Int. Cl.⁷** **A01N 43/36; C07D 207/18; C07D 405/10; C07D 409/10**(52) **U.S. Cl.** **514/408; 514/422; 514/429; 514/443; 514/444; 514/452; 514/456; 548/110; 548/565; 548/517; 548/577; 549/49; 549/59; 549/356; 549/362; 549/365; 549/377; 549/434; 549/440**(58) **Field of Search** **514/408, 422, 514/429, 443, 444, 452, 456; 548/565, 517, 577, 110; 549/49, 59, 362**(56) **References Cited****FOREIGN PATENT DOCUMENTS**

94/29268 12/1994 (WO).

OTHER PUBLICATIONSKoller et al., "ein neues darstellungsverfahren für 2-Aryl-Δ¹-pyrrolin und 2-Δ¹-piperidine," *Chemische Berichte*, Bd. 96, Nr. 4, pp. 93-113, 1963.*
Organic Preparations and Procedures International, vol. 25, No. 2, (month unavailable) 1993.
Wei et al., A Practical Procedure for the Synthesis of 5-Substituted γ-lactams, pp. 255-258.

J. Org. Chem., 56 (month unavailable) 1991 pp. 1822-1827, Savoia et al., Organometallic Reactions of ω-Heterosubstituted N-Acyl Lactams. A New Route to γ-Keto Aldehydes from 5-Ethoxy-2-pyrrolidinone.

Synthesis, Apr. 1980, pp. 315-317, Eine einfache Herstellung von ω-Alkoxy-lactamen durch anodische Alkoxylierung, Michael Mitzlaff et al.

Recueil des Travaux Chim. Des Pays-Bas 81, (month unavailable) 1962, pp. 786-791, G.B.R. DeGraaff et al., A Novel Synthesis of the Diastereomeric 5-Phenylprolines.

Chem. Ber. 120, (month unavailable) 1987, pp. 285-290, Mormann et al., Synthese und Stabilisierung von Isocyanatketenen.

J. Am. Chem. Soc., 77, Dec. 5, 1955 pp. 6269-6280, Kornblum et al., The Mechanism of the Reaction of Silver Nitrite with Alkyl Halides. The Contrasting Reactions of Silver and Alkali Metal Salts with Alkyl Halides. The Alkylation of Ambident Anions^{1,2}.J. Am. Chem. Soc. 86, Jul. 5, 1964, pp. 2681-2686, Kornblum et al., The Synthesis and Characterization of Nitronic Esters^{1,2}.

Tetrahedron Letters, vol. 22, No. 39, pp. 3815-3818, Nahm et al., N-Methoxy-N-Methylamides As Effective Acylating Agents, (month unavailable) 1981.

Helv. Chim. Acta, vol. 68, (month unavailable) 1985, pp. 162-172, Seebach et al., Über den Stierischen Verlauf der Umsetzung von Enaminen aus offenkettigen Aldehyden und Ketonen mit Nitroolefinen zu 2,3-disubstituierten 4-Nitroketonen¹.

Tetrahedron, vol. 45, No. 7, pp. 2099-2108 (month unavailable) 1989, Felluga et al., Highly Diastereoselective Synthesis of Cyclic Nitronic Esters from 1-(4-Morpholinyl)-1-Phenylpropene with Nitroolefins.

Organic Syntheses, vol. 58, (month unavailable) 1987, p. 56, Cyclopentenones from α, α'-Dibromoketones and Enamines: 2,5-Dimethyl-3-Phenyl-2-Cyclopenten-1-one.

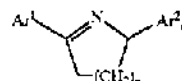
Synthetic Communications, 17(2), pp. 211-217 (month unavailable) 1987, Dryanska et al., Phase-Transfer Catalyzed Additions. V¹. Addition of N-Diphenylmethylenebenzylamine to β-Unsaturated Ketones.

(List continued on next page.)

Primary Examiner—Jaue C. Oswecki

(74) **Attorney, Agent, or Firm—Joseph C. Gil**(57) **ABSTRACT**

The invention relates to novel cyclic imines of the formula (I)



(I)

in which

Ar¹ and Ar² each represent substituted phenyl and n represents 1,

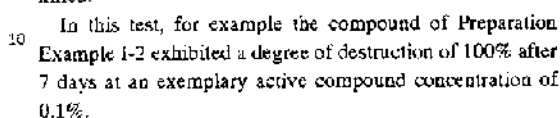
to a process for their preparation and to their use as pesticides.

9 Claims, No Drawings

60

desired concentration and are infested with caterpillars of the owl moth (*Spodoptera frugiperda*) while the leaves are still moist.

After the desired period time, the destruction in % is determined. 100% means that all the caterpillars have been killed; 0% means that none of the caterpillars have been killed.



Example C

Nephrotettix test

solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and the stated amount of emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Rice seedlings (*Oryza sativa*) are treated by being dipped into the preparation of the active compound of the desired concentration and are infested with larvae of the green rice leaf hopper (*Nephotettix cincticeps*) while the seedlings are still moist.

After the desired period of time, the destruction in % is determined. 100% means that all the leaf hoppers have been killed; 0% means that none of the leaf hoppers have been killed.

In this test, for example the compound of Preparation 40 Example 1-1 exhibited a degree of destruction of 100% after 6 days at an exemplary active compound concentration of 0.1%.

Example D

Myzus Test

Solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide

⁵⁰ Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

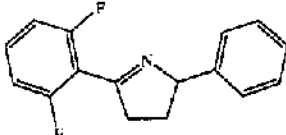
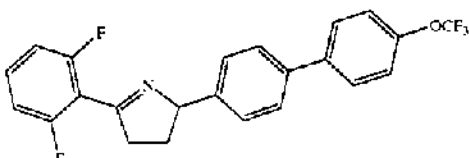
To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and the stated amount of emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Cabbage leaves (*Brassica oleracea*) which are severely infested with the (green peach aphid (*Myzus persicae*) are treated by being dipped into the preparation of the active compound of the desired concentration.

After the desired period of time, the destruction % is determined. 100% means that all the aphids have been killed; 0% means that none of the aphids have been killed.

In this test, for example the following compounds exhibited good activity:

TABLE D

Active compound	Active compound concentration in %	Degree of destruction after 6 days
	0.1	90
Example I-1	0.1	100
	0.1	100
Example I-2		

Example E

Tetranychus test (OP resistant/dip treatment)

Solvent: 3 parts by weight of dimethylformamide

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To prepare a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and the stated amount of emulsifier, and the concentrate is diluted with emulsifier-containing water to the desired concentration.

Beans (*Phaseolus vulgaris*) which are strongly infested by all stages of the common spider mite (*Tetranychus urticae*) are dipped into an active compound preparation of the desired concentration.

After the desired time, the activity in % is determined. 100% means that all spider mites have been killed; 0% means that none of the spider mites have been killed.

In this test, for example the compound of Preparation Example I-2 exhibited a degree of destruction of 100% after 7 days at an exemplary active compound concentration of 0.001%.

Example F

Blow fly larvae test/development-inhibitory action

Test animals: All larval stages of *Lucilia cuprina* (OP resistant) [Pupae and adults (without contact with the active compound)]

Solvent: 35 parts by weight of ethylene glycol monomethyl ether

35 parts by weight of nonylphenol polyglycol ether

To prepare a suitable formulation, 3 parts by weight of active compound are mixed with 7 parts by weight of the abovementioned solvent-emulsifier mixture, and the resulting emulsion concentrate is diluted with water to the concentration desired in each case.

For each concentration, 30 to 50 larvae are transferred to horse meat (1 cm³) located in glass tubes, and 500 μ l of the test dilution are pipetted onto the meat. The glass tubes are placed into plastic beakers whose bottom is covered with sea sand and kept in a controlled-environment cabinet (26° C. $\pm$ 1.5° C., 70% relative humidity $\pm$ 10%). The activity is

checked after 24 hours and 48 hours (larvicidal action). After the larvae have left (about 72 h), the glass tubes are removed and perforated plastic lids are placed on the beakers. After 1½ times the development period (hatching of the control flies), the hatched flies and the pupae/puparia are counted.

The criterion for the action is death in the treated larvae after 48 h (larvicidal effect), or inhibition of adults hatching from the pupae or inhibition of pupation. The criterion for the in-vitro action of a substance is the inhibition of fly development or a standstill of development prior to the adult stage. 100% larvicidal activity means that all the larvae have died after 48 hours. 100% development-inhibitory activity means that no adult flies have hatched.

In this test, for example the compound of Preparation Example I-1 exhibited an activity of 100% at an exemplary active compound concentration of 1000 ppm.

Example G

Ecdysis test on polyphagous tick nymphs

Test animals: *Amblyomma variegatum*, ticks which have sucked themselves full

Solvent: 35 parts by weight of ethylene glycol monomethyl ether

35 parts by weight of nonylphenol polyglycol ether

To prepare a suitable formulation, 3 parts by weight of active compound are mixed with 7 parts of the abovementioned solvent-emulsifier mixture, and the resulting emulsion concentrate is diluted with water to the concentration desired in each case.

10 Nymphs which have sucked themselves full are immersed for 1 minute into the preparation of active compound to be tested. The animals are transferred to Petri dishes (Ø9.5 cm) equipped with filter paper discs and covered. After the nymphs have remained in a controlled-environment cabinet for 4 weeks, the ecdysis rate is determined.

100% means that all the animals have undergone normal ecdysis; 0% means that none of the animals have undergone normal ecdysis.

In this test, for example the compounds of Preparation Examples I-1 and I-2 showed an activity of in each case 100% at an exemplary active compound concentration of 1000 ppm.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	03023860
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	4664
	Folios	7

Patente de Invención	☒	Patente de Modelo de Utilidad	☐
Vía Nacional	☐		
Vía PCT (fase nacional)	☒	Cap. I	☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional: WO 02/24646

Fecha de Presentación Internacional: 10 de Septiembre de 2001

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

- 1.1. Capítulo descriptivo: folios 21 al 41 tal y como fueron presentados.
- 1.2. Capítulo reivindicatorio: folios 42 al 44 tal y como fueron presentados.
- 1.3. Prioridad: folio 1 DE100471161 22/Septiembre/2000.
- 1.4. Respuesta del solicitante: Folios 464 a 469.
- 1.5. Nuevo capítulo reivindicatorio: Folios 471 a 475.

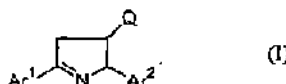
2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Δ^1 -Pirrolinas como pesticidas. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere nuevas Δ^1 -Pirrolinas de la fórmula (I), a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como agentes pesticidas.

Reivindicación 1

Δ^1 -Pirrolinas de la fórmula (I)



Reivindicación 2

Proceso para la preparación de compuestos de la fórmula (I)

El problema técnico planteado en la solicitud menciona que el nivel de actividad y/o la duración de la actividad de los agentes pesticidas conocidos, no son completamente satisfactorios en todos los campos de aplicación. Existe entonces la necesidad de nuevos compuestos que presenten algunas ventajas sobre los ya descritos. Para solucionar este problema técnico la solicitud plantea nuevas Δ^1 -Pirrolinas de la fórmula (I).

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC C07D 207/22, A01N 35/08, A01N 43/34, A01N 43/36.

3. Modificaciones no aceptadas (artículo 34 D.486 y art. 22 Tratado PCT)

Las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio correspondientes a los significados de Q, los cuales indican que "Q adicionalmente representa..." no se aceptan debido a que amplían el objeto inicial de la solicitud y no se encuentran sustentados en la descripción. Por ejemplo el radical " $-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CN}$ " no fue incluido entre los significados de Q inicialmente planteados, puesto que Q podía representar $-\text{CO}_2\text{R}^9$, pero R^9 no incluye un radical del tipo $-\text{CH}_2\text{CN}$.

4. Determinación del Estado de la Técnica

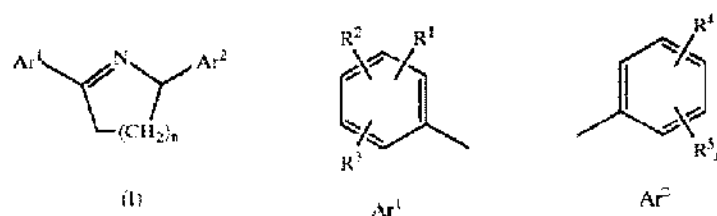
Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 22 de Septiembre de 2000, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

N°	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	US6274613	Cyclic imines as pesticides	2001-08-14

5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

El documento D1 presenta nuevas iminas cíclicas, procedimientos para su obtención y su aplicación como agentes pesticidas. Específicamente presenta iminas cíclicas de la fórmula (I), en donde Ar^1 y Ar^2 significan respectivamente:



Para así obtener estructuras como por ejemplo la siguiente:

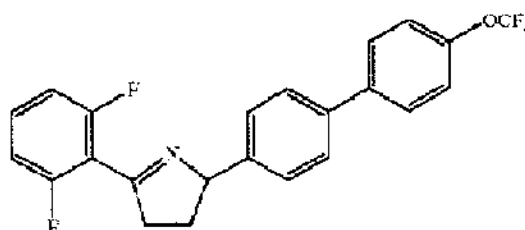
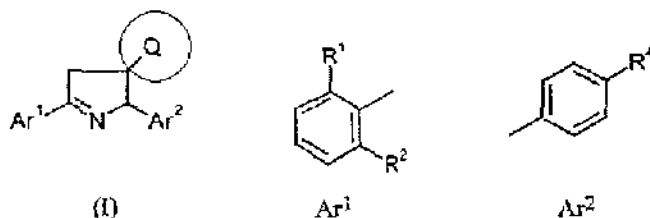


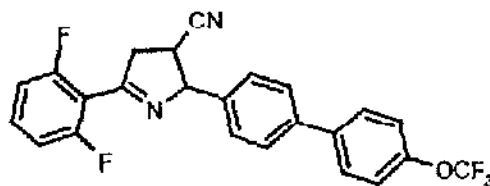
Figura a.

482
482
482

La presente solicitud de patente presenta Δ^1 -pirrolinas de la fórmula (I) en las cuales Ar^1 y Ar^2 significan respectivamente:



Para así obtener estructuras como lo siguiente, entre otras posibilidades:



Al observar las estructuras divulgadas por D1 y compararlas con las estructuras de la presente solicitud; se observa que la única diferencia radica en la presencia del radical Q de la solicitud en estudio. Sin embargo esta diferencia no parece conceder un efecto técnico inesperado en comparación con el arte previo; debido a que D1 ya había divulgado un núcleo principal como el que ilustra la figura a, y ya había descrito su actividad pesticida. Además los compuestos divulgados por D1 mostraron (según los ejemplos divulgados allí) un grado de destrucción del 100% en una concentración de 1000ppm, al ser ensayados en los mismos blancos de acción que presenta la solicitud en estudio.

De este modo el problema técnico planteado en esta solicitud: "la necesidad de nuevos compuestos que presenten ventajas en términos del nivel de actividad y/o la duración de la actividad de los agentes pesticidas conocidos" ya había sido solucionado previamente utilizando iminas cíclicas como las divulgadas por D1.

Adicionalmente estas nuevas sustituciones sobre un núcleo principal conocido resultan ser prácticas comunes para un técnico medio en la materia que junto con el estado de la técnica (D1); hubiera sugerido sin mucho esfuerzo de su parte modificar las estructuras divulgadas en D1 y esperar un actividad pesticida que ya había sido divulgada.

En consecuencia las Δ^1 -pirrolinas de la fórmula (I) de la solicitud en estudio surgen tan solo como alternativas obvias para una persona medianamente versada en la materia y carecen de nivel inventivo.

Es importante anotar que según los ejemplos de la presente solicitud, los significados preferidos de Q solo varían entre $-CN$ y $-CO_2CH_3$. Radicales que pueden ser encontrados en otra parte de la misma estructura, son pequeños en comparación con el núcleo principal y no aportan un salto cualitativo en la técnica que haga a estos derivados inventivos.

Del mismo modo el procedimiento de la reivindicación 2 carece de nivel inventivo debido a que las reacciones de adición de dobles enlaces son ampliamente conocidas para una persona medianamente versada en la materia y además la descripción no argumenta un salto cualitativo en la técnica que demuestre una mejora sobre el proceso conocido.