

CASTELLANOS & Co.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-076616- -00011-0000

Fecha: 2011-03-07 13:55:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 523 RESPUESTA Folios: 24

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. 05.076.616

Solicitud de Patente de Invención para: **AMINO 1,3,5-TRIAZINAS SUSTITUÍDAS EN N CON RADICALES BICICLICOS QUIRALES, PROCEDIMIENTO PARA SU PREPARACIÓN, COMPOSICIONES DE LAS MISMAS Y US USO COMO HERBICIDAS Y REGULADORES DEL CRECIMIENTO DE LAS PLANTAS**

Solicitante: **BAYER CROPS SCIENCE AG**

RESPUESTA A EXAMEN DE FONDO

LUIS PATIÑO LEYVA, mayor de edad, identificado y domiciliado como aparece al pie de mi firma, en atención a su oficio **No. 14105** notificado el 29 de octubre de 2010, estando dentro del término de prórroga, atentamente me permito dar repuesta al mismo de la siguiente manera:

Ante la objeción del examinador:

Reivindicaciones

"Es necesario especificar las sales agrícolamente aceptables que el solicitante pretende proteger en la invención las cuales se derivan de los compuestos de fórmula 1...

En la reivindicación 5 se presenta una composición herbicida o reguladora del crecimiento de plantas; para esta composición no se están indicando las características técnicas que la puedan diferenciar de composiciones similares que se encuentren en el estado del arte.

El método presentado en la reivindicación 6 no presenta las características técnicas que lo puedan diferenciar de una aplicación de agroquímicos en una práctica agrícola convencional"

En cuanto a la expresión "sal agrícolamente aceptable de los compuestos de fórmula (I)", el solicitante señala que dicha definición se encuentra incluida de manera específica dentro de la descripción (página 4, línea 26 a página 5, línea 4).

"Los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales mediante adición de un ácido inorgánico u orgánico adecuado, tal como, por ejemplo, HCl, HBr, H₂SO₄ o HNO₃, o un ácido carboxílico mono- o bifuncional o ácido sulfónico, a un grupo básico tal como, por ejemplo, amino o alquilamino.

Algunos compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales mediante adición de una base inorgánica u orgánica adecuada. Tales compuestos (I) tienen un grupo funcional que contiene "un átomo de hidrógeno de carácter ácido", tal como el grupo carboxilo o el grupo sulfonilo, que puede ser un sustituyente en la definición del grupo acilo. Ejemplos de estas sales son sales metálicas, particularmente sales de metales alcalinos, o sales de metales alcalino-térreos, preferiblemente sales de sodio o de potasio, o sales de amonio sin sustituir o sustituido, tales como sales de amonio o sales de aminas orgánicas, o sales de amonio cuaternario"

Por otro lado, en la descripción es claro que la formación de sales no cambia los compuestos sustancialmente. Por tanto, la objeción del examinador no puede considerarse justificada, dado que la expresión "sal agrícolamente aceptable" define de manera general la posibilidad aceptada por cualquier persona versada en la materia técnica, de que compuestos tales como aquellos de fórmula (I) de la presente invención, con grupos amino dentro de la molécula, puedan formar fácilmente sales gracias a la adición de ácidos.

Estas sales a las que se refiere el solicitante se encuentran en equilibrio químico con el amino compuesto libre en medio acuoso, de este modo las sales de los compuestos de fórmula (I) aplicados sobre plantas formarán fácilmente el amino compuesto básico libre. Así, la aplicación de cualquiera de las sales con un ácido resultará en un efecto igual o similar al de la aplicación del amino compuesto libre.

Si el compuesto de fórmula (I) contiene además un grupo carboxilo o hidroxilo (grupos con hidrógenos de carácter ácido) la formación de la sal con bases es posible en principio. Lo mismo que se describe para las sales generadas por adición de ácido, se cumplirá para las sales con hidrógenos ácidos en presencia de bases cuando son aplicadas a plantas.

Con los argumentos anteriores, la expresión "sal agrícolamente aceptable" debe ser considerada clara por una persona versada en la materia técnica.

En cuanto a la reivindicación 5, el solicitante considera que la composición que se reclama contiene las características técnicas suficientes, por cuanto se menciona la posible concentración del compuesto activo de fórmula (I), y la presencia de auxiliares de formulación, los cuales se encuentran debidamente sustentados y definidos en la descripción (ejemplos de formulación, página 124 de la presente solicitud). Aún así, el solicitante presenta un nuevo pliego reivindicatorio en que la reivindicación 5 contiene mayores especificaciones. Hay que resaltar que una persona versada en la materia técnica tendría en la solicitud la información necesaria para reproducir la presenta invención.

En cuanto a la reivindicación 6, ésta ha sido retirada del nuevo pliego reivindicatorio, de acuerdo con la observación del examinador.

Nivel inventivo

"Al comparar los compuestos que se obtienen a partir de la fórmula 1 de la solicitud y los compuestos de fórmula 1 de la anterioridad D1 es posible establecer que la única diferencia se encuentra en el radical sustituyente del anillo de la triazina. Por lo tanto, los compuestos de la solicitud es posible derivarlos de la anterioridad D1.

En la anterioridad D2 se están presentando derivados de triazina de la fórmula general (I), o sales que se pueden derivar de esta misma estructura, estos compuestos son utilizados como herbicidas...

...es posible establecer que las diferencias entre los compuestos radican en los sustituyentes del grupo fenilo y un radical sustituyente del anillo de triazina. De

esta manera es posible establece que a partir de los compuestos de la fórmula 1 de la anterioridad D2 se derivan los compuestos de la solicitud.

De acuerdo con lo establecido en las observaciones anteriores, es posible derivar los compuestos de la solicitud a partir de las anterioridades D1 y D2"

Ante las objeciones del examinador en cuanto al nivel inventivo de la presente solicitud, el solicitante señala que la presente invención reclama compuestos ópticamente activos en una forma resuelta mejorada como herbicidas. Estos compuestos son 2,4-diamino-1,3,5-triazinas N-sustituídas particularmente activas ópticamente, gracias a la estructura específica de los grupos bicíclicos, donde el anillo unido al amino es un grupo alifático, mientras que el anillo condensado con el primer anillo es un benceno.

En el arte previo señalado por el examinador no se divulga ninguno de los estereoisómeros específicos reivindicados en la presente solicitud, solamente se presentan compuestos genéricos de fórmulas generales o ejemplos sin la indicación de un centro quiral.

Por otro lado, los compuestos reclamados en la presente solicitud presentan un grado particular de resolución óptica, lo cual corresponde a una ventaja en cuanto a la selección regioquímica de las características estructurales. A favor de esta afirmación, el solicitante señala que los inventores han encontrado que, sorprendentemente, la estructura estereoquímica de los compuestos tiene un impacto decisivo sobre la acción herbicida de los mismos, como es el caso del centro quiral en el anillo bicíclico que se encuentra al lado del grupo amino (posición 1 en la fórmula (I)). Adicionalmente, se ha encontrado que la orientación estereoquímica de otros grupos, en caso de formarse otros centros quirales en posiciones específicas, afecta las propiedades herbicidas, como es el caso de las posiciones 2 y 1* de la fórmula (I).

Los compuestos ópticamente activos de la presente solicitud se diferencian de los compuestos racémicos en su pureza, es decir, en la relación de los estereoisómeros. Es por esto que los compuestos ópticamente activos pueden estimarse como estereoisómeros puros, o mezclas novedosas donde un estereoisómero se encuentra en exceso sobre los demás (esta relación mayoritaria se indica en las últimas 3 líneas de la reivindicación 1)

Adicionalmente, se ha encontrado que los compuestos de la presente solicitud, presentan propiedades importantes y ventajosas al ser utilizados en su forma resuelta o parcialmente resuelta, las cuales no se evidencian cuando se usan los compuestos de fórmula (I) junto con sus estereoisómeros y enantiómeros en mezcla racémica. El solicitante anexa (Anexo 2) los resultados de los ensayos que respaldan estas afirmaciones, en donde se comparan los compuestos de fórmula (I) definidos en la reivindicación 1, con compuestos racémicos con las estructuras más cercanas, es decir mezclas racémicas de las mismas estructuras regioquímicas.

Dado que las mezclas racémicas de los isómeros de regioestructuras idénticas también contienen el estereoisómero de mayor actividad, se espera que al menos alguno de los isómeros ópticamente activos en forma resuelta tenga efecto herbicida. Aun así, los resultados del reporte adjunto muestran indudablemente un efecto sorprendente e inesperado de la presente invención, puesto que para una cantidad específica del isómero herbicida ópticamente activo en forma resuelta, no se esperaría obtener un efecto mejor al que se obtiene con el doble de cantidad de la mezcla racémica que contiene la misma cantidad de isómero activo utilizado en su forma resuelta.

Sorprendentemente, el uso del isómero (R) con el centro quiral en la posición 1 de la fórmula (I) tiene un efecto herbicida mucho mejor en su forma resuelta, comparado con el efecto del doble de cantidad de la mezcla racémica.

Finalmente, los conocimientos generales de una persona versada en la materia técnica, y las enseñanzas del arte previo no presentan sugerencia alguna de que la resolución del centro quiral 1, o de cualquiera de los otros centros quirales posibles en la molécula específica, pueda generar el incremento registrado en el efecto herbicida. Por tanto, debe reconocerse el nivel inventivo de la presente solicitud.

En conclusión, solicito a su Despacho continuar con el trámite de la presente solicitud, toda vez que las objeciones planteadas por su Despacho han sido claramente superadas

De considerar que los argumentos y las reivindicaciones que presento con este memorial aún mantienen defectos en cuanto a claridad y el nivel inventivo, el solicitante manifiesta su intención de limitar el pliego reivindicatorio para superar las objeciones del examinador.

CASTELLANOS & Co.
A B O G A D O S
Calle 94 A No. 7 A - 09
Bogotá, D.C., COLOMBIA

Por tanto, comedidamente solicito que se emita un oficio de fondo adicional de conformidad con el Título X numeral 1.2.2.3 sobre la notificación de no patentabilidad.

Anexos

1. Nuevo capítulo reivindicatorio
2. Datos de ensayos comparativos del efecto herbicida
3. Formulario de modificaciones
4. Recibo de pago

Del Señor Jefe,



Luis Patiño Leyva

C.C. No. ~~2.930.616~~ de Bogotá

T.P.A. No. **2698** del C. Sup. de la Judicatura

Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.

Tel.: 7560770 - fax 7550158

Bogotá, D.C. **U7 MAR. 2011**

Memorial de respuesta a examen de fondo/P20144



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:

☐ Corrección de Error Material

☒ Modificación a una solicitud

②

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG

Dirección: Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim
Alemania

Domicilio: 40789 Monheim
Alemania

Lugar de Constitución: Alemania

Teléfono: Fax:
E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número _____

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: LUIS PATIÑO LEYVA

Dirección: Calle 94A No. 7A - 09

Teléfono: 756 0770 Fax: 7550158

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐

C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____

Número 2.930.616 TPA 2698

④

Número de Expediente:

05.076.616

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo capítulo reivindicatorio para llevar a cabo el examen de patentabilidad

⑥

Comprobante de pago No.

11-0020451

Fecha

4 de marzo de 2011

⑦

Anexos:

☒ Comprobante de pago de la tasa.

☐ Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.

☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas

☒ Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE

LUIS PATIÑO LEYVA

FIRMA

Cd 2.930.616 de Bogotá - TPA 2698 CSJ

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página - LPL/20144

07 mar 2011

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0020451

Bogotá D.C., Marzo 04 de 2011 - 11:04:27

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO

NI 800.174.641

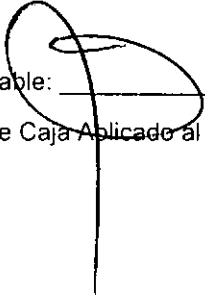
*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	387634623	03/03/2011	2.881.960.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES	EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA	118.000.00	118.000.00
				\$118.000.00

SON: **CIENTO DIECIOCHO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

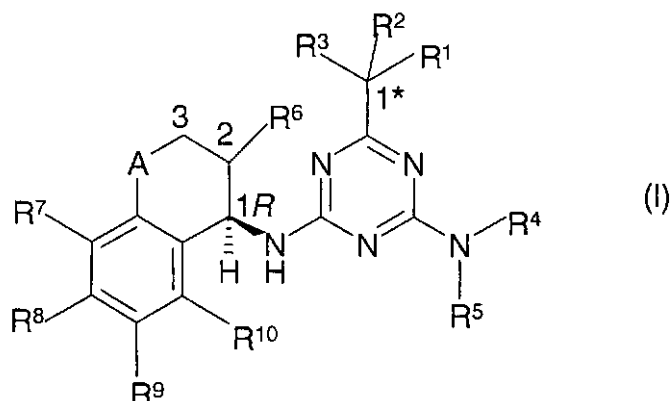
Responsable: 
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 05-076616- -00011-0000
Fecha: 2011-03-07 13:55:13 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 24

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto ópticamente activo de la fórmula (I),



en la que:

R^1 es H, halógeno, alquilo(C_1-C_6), haloalquilo(C_1-C_6), [alcoxi(C_1-C_4)]alquilo(C_1-C_6), cicloalquilo(C_3-C_6) que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consta de halógeno, alquilo(C_1-C_4) y haloalquilo(C_1-C_4), o es alquenilo(C_2-C_6), alquinilo(C_2-C_6), haloalquenilo(C_2-C_6), cicloalquenilo(C_4-C_6), halocicloalquenilo(C_4-C_6), alcoxi(C_1-C_6) o haloalcoxi(C_1-C_6);

R^2 es H, halógeno, alquilo(C_1-C_6) o alcoxi(C_1-C_4); o

R^1 y R^2 pueden formar, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo cicloalquílico(C_3-C_6) o cicloalquenílico(C_4-C_6);

R^3 es H, alquilo(C_1-C_6), alcoxi(C_1-C_4) o halógeno;

R^4 y R^5 son cada uno independientemente H, alquilo(C_1-C_4), haloalquilo(C_1-C_4), alquenilo(C_3-C_4), haloalquenilo(C_3-C_4), alquinilo(C_3-C_4), haloalquinilo(C_3-C_4) o un radical acilo;

R^6 es H, alquilo(C_1-C_6) o alcoxi(C_1-C_6);

R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno independientemente H, alquilo(C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_3), halógeno, alcoxi(C_1-C_3), haloalcoxi(C_1-C_3) o CN;

A es CH_2 , O o un enlace directo;

y la configuración estereoquímica en la posición marcada 1 es (*R*) que tiene una pureza estereoquímica de 60 a 100 % de (*R*),

o una sal agrícolamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1, en el que:

R^1 es H, halógeno, alquilo(C_1-C_4), tal como metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo, o es haloalquilo(C_1-C_4), [alcoxi(C_1-C_4)]alquilo(C_1-C_4), cicloalquilo(C_3-C_6) que está sin sustituir o

sustituido con uno o dos grupos alquilo(C₁-C₄), o es halocicloalquilo(C₃-C₄), alquenilo(C₂-C₄), haloalquenilo(C₂-C₄), alquinilo(C₂-C₄), alcoxi(C₁-C₄) o haloalcoxi (C₁-C₄);

R² es H o alquilo(C₁-C₄); o

R¹ y R², junto con el átomo de carbono adyacente, forman un anillo cicloalquílico (C₃-C₆);

R³ es H, alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₂) o halógeno;

R⁴ es H, alquilo(C₁-C₄), haloalquilo(C₁-C₄), alquenilo(C₃-C₄), alquinilo(C₃-C₄) o un radical acilo que tiene 1 a 12 átomos de carbono;

R⁵ es H, alquilo(C₁-C₄) o haloalquilo(C₁-C₄);

R⁶ es H, alquilo(C₁-C₃) o alcoxi(C₁-C₃);

R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son cada uno independientemente H, alquilo(C₁-C₃), halógeno o alcoxi(C₁-C₃);

y

A es CH₂, O o un enlace directo.

3. Un compuesto o una sal del mismo como se reivindica en la reivindicación 1 ó 2, en el que:

R¹ es H o alquilo(C₁-C₃);

R² es H o alquilo(C₁-C₃); o

R¹ y R² junto con el átomo de carbono adyacente, forman un anillo cicloalquílico (C₃-C₄);

R³ es H, alquilo(C₁-C₂), metoxi, Cl o F;

R⁴ es H, alquilo(C₁-C₃), haloalquilo(C₁-C₃), alilo, propargilo, CHO, -COalquilo(C₁-C₃) o -COhaloalquilo(C₁-C₃);

R⁵ es H o alquilo(C₁-C₂);

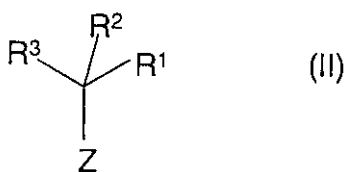
R⁶ es H, alquilo(C₁-C₃) o alcoxi(C₁-C₃);

R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son cada uno independientemente H, metilo, F y Cl; y

A es CH₂, O o un enlace directo.

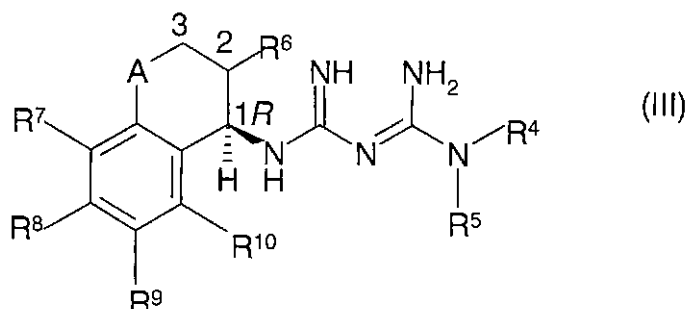
4. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) o una sal del mismo como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, cuyo procedimiento comprende:

a) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II):



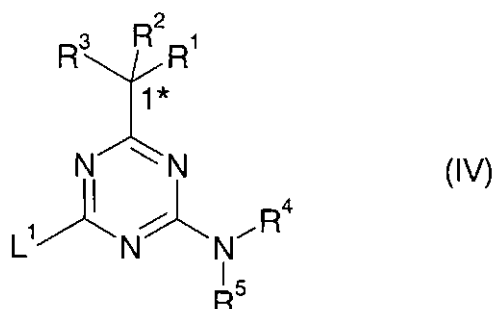
en la que R¹, R² y R³ son como se definen en la fórmula (I), y Z es un grupo funcional

seleccionado del grupo que consta de éster carboxílico, orto-éster carboxílico, cloruro de ácido carboxílico, carboxamida, ciano, anhídrido carboxílico o triclorometilo, con un compuesto biguanidínico de la fórmula (III) o una sal por adición de ácido del mismo:

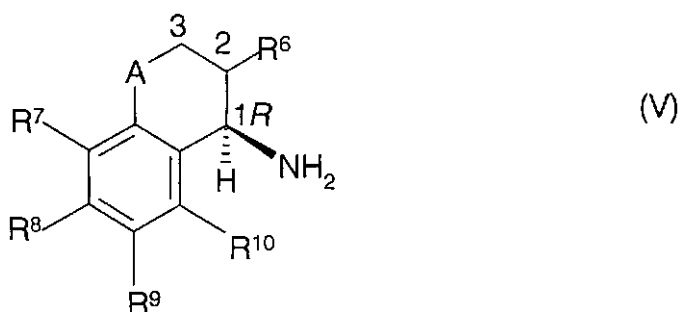


en la que R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y A y la configuración en la posición marcada 1 son como se definen en la fórmula (I);

b) hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (IV):



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 y la configuración en la posición marcada 1* son como se definen en la fórmula (I), y L^1 es un grupo lábil, con una amina de la fórmula (V) o una sal por adición de ácido de la misma:



en la que R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y A y la configuración en la posición marcada 1 son como se definen en la fórmula (I);

c) cuando uno de R^4 o R^5 en la fórmula (I) es alquilo(C_1 - C_4), haloalquilo(C_1 - C_4), alqueno(C_3 - C_4), haloalqueno(C_3 - C_4), alquino(C_3 - C_4) o haloalquino(C_3 - C_4), hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (I) correspondiente, en la que dicho R^4 o R^5 es respectivamente H, y los otros radicales y las configuraciones son como se definen en la fórmula (I), con un agente alquilante de la fórmula (VI) o (VII), respectivamente:



(VI)



(VII)

en las que L^2 es un grupo lábil;

d) cuando uno de R^4 o R^5 es un radical acilo, hacer reaccionar el compuesto de la fórmula (I) correspondiente en la que dicho R^4 o R^5 es respectivamente H, y los otros radicales y las configuraciones son como se definen en la fórmula (I), con un agente acilante de la fórmula (VIII) o (IX), respectivamente:



(VIII)



(IX)

en las que R^4 y R^5 son cada uno un radical acilo como se define en la fórmula (I) y L^3 es un grupo lábil; o

e) resolver un compuesto de la fórmula (I) usando, en los procesos anteriormente descritos, uno o más compuestos intermedios (II), (III), (IV) o (V), cuyas configuraciones difieren de la configuración como se define en el compuesto de la fórmula (I) a preparar, y resolver la mezcla obtenida de acuerdo con métodos conocidos de resolución.

5. Una composición herbicida o reguladora del crecimiento de las plantas, que comprende uno o más compuestos de la fórmula (I) o sus sales como se reivindica en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en una proporción de 0.1 a 99 % en peso, opcionalmente en presencia de otro agente de protección de cultivo, y el porcentaje restante en peso de auxiliares de formulación.

6. Un compuesto de la fórmula (V), o sales del mismo, como se define en la reivindicación 4, en que

R^4 y R^5 son hidrógeno, y R^6 es H, alquilo(C_1-C_6) o alcoxi(C_1-C_6);

R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno independientemente H, alquilo(C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_3), halógeno, alcoxi(C_1-C_3), haloalcoxi(C_1-C_3) o CN;

A es CH_2 , O o un enlace directo; y en las que la configuración estereoquímica en la posición marcada 1 es como se define en la fórmula (I),

con la excepción de compuestos de la fórmula (V), o sales de los mismos, en los que:

(i) A es un enlace directo, R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son cada uno hidrógeno, y R^{10} es hidrógeno, metoxi, n-propoxi o ciano; o

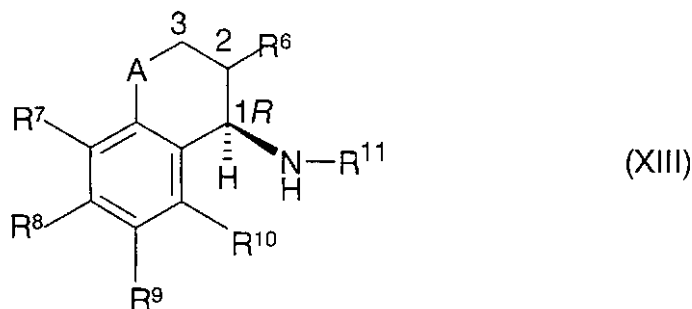
(ii) A es CH_2 , y R^6 , R^7 , R^8 y R^{10} son cada uno hidrógeno, y R^9 es hidrógeno, metilo, metoxi, isopropoxi o t-butilo; o

A es CH_2 , y R^6 , R^7 y R^9 son cada uno hidrógeno, y R^8 es metilo y R^{10} es metilo; o

(iii) A es un átomo de oxígeno, y R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno H.

7. Un compuesto de la fórmula (III) o una sal del mismo, como se define en la reivindicación 4.

8. Un compuesto de la fórmula (XIII) o una sal del mismo,



en la que:

R^6 es H, alquilo(C_1-C_6) o alcoxi(C_1-C_6); y R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno independientemente H, alquilo(C_1-C_4), haloalquilo(C_1-C_3), halógeno, alcoxi(C_1-C_3), haloalcoxi(C_1-C_3) o CN;

R^{11} es alcanoílo(C_1-C_6) que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que consta de halógeno, alcoxi(C_1-C_4) y alquiltio(C_1-C_4);

A es CH_2 , O o un enlace directo; y la configuración estereoquímica en la posición marcada 1 es (R) que tiene una pureza estereoquímica de 60 a 100 % de (R),

con la excepción de compuestos de la fórmula (XIII), o sales de los mismos, en que:

- (i) A es un enlace directo, R^6 , R^7 , R^8 y R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, y R^{11} es formilo, acetilo, trifluoroacetilo o bromoacetilo, o
A es un enlace directo, R^6 es metilo; R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, y R^{11} es acetilo, o
A es un enlace directo, R^6 , R^7 , R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, R^8 es fluoro, y R^{11} es acetilo, o
- (ii) A es CH_2 , y R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, y R^{11} es acetilo, trifluoroacetilo o cloroacetilo; o
A es CH_2 , y R^6 , R^7 y R^9 son cada uno hidrógeno, y R^8 es metilo y R^{10} es metilo; y R^{11} es acetilo, o
A es CH_2 , y R^6 , R^7 , R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, y R^8 es metoxi, y R^{11} es acetilo, o
A es CH_2 , y R^6 es metilo, R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada un hidrógeno, y R^{11} es acetilo, o
- (iii) A es un átomo de oxígeno, y R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son cada uno H, y R^{11} es acetilo.

Colombian Pat. Appln. No. 05076616 - P20144 / 57366 - BCS 03-1002 CO PCT - 21 Jan. 2011
Test Report

Sheet 1

Test Report

Compounds A1 to A19 according to D1 = WO 97/31904 (= US 6,069,114) and D2 = EP 0864567 (= WO 97/19936) and structurally closest compounds E1 to E19 according to Patent Application in Colombia No. 0507616 as defined in Table 1 below were tested in pre-emergence application or post-emergence application against important weed species. The tests were performed in accordance with Biological Examples 1 and 2 set forth in the description of the Patent Application in Colombia No. 0507616 and evaluated by visual scoring in comparison with untreated control plants (0% control means no herbicidal effect = as untreated control; 100% = all weed plants died). The results are summarized in Tables 2 to 25 below.

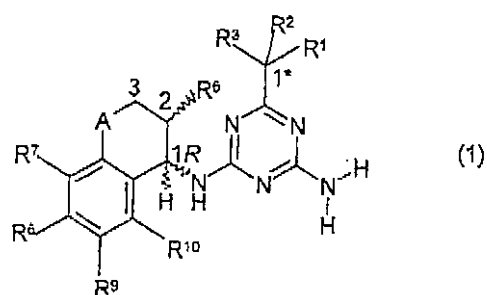
Abbreviations in Tables 1 to 25

a.i.	=	active ingredient
Cpd.	=	Compound
Cpd. No.	=	the compound having the compound no. as defined in Table 1
R, S	=	Stereochemical configuration according to Cahn Ingold and Prelog
ABUTH	=	Abutilon theophrasti
ALOMY	=	Alopecurus myosuroides
AMARE	=	Amaranthus retroflexus
CHEAL	=	Chenopodium album
DIGSA	=	Digitaria sativa
ECHCG	=	Echinochloa crus-galli
GALAP	=	Galium aparine
LOLMU	=	Lolium multiflorum
MATIN	=	Matricaria inodora
PHBPU	=	Pharbitis purpurea
POAAN	=	Poa annua
POLCO	=	Polygonum convulvus
SETVI	=	Setaria viridis
SORHA	=	Sorghum halepense
STEME	=	Stellaria media
VERPE	=	Veronica persica
XANST	=	Xanthium strumarium

Colombian Pat. Appln. No. 05076616 - P20144 / 57356 - BCS 03-1002 CO PCT - 21 Jan, 2011

Sheet 2

Table 1: Test compounds of formula (1):



Cpd. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷ to R ¹⁰	A	Stereostructure at positions 1, 2 and 1*
A1	H	H	H	H	H	direct bond	racemic
E1	H	H	H	H	H	direct bond	1R; positions 2 and 1* are achiral
A2	H	H	H	C ₂ H ₅	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	racemic
E2	H	H	H	C ₂ H ₅	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A3	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	racemic
E3	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A4	CH ₃	H	H	CH ₃	H	direct bond	racemic
E4	CH ₃	H	H	CH ₃	H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A5	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅	H	direct bond	racemic
E5	CH ₃	H	H	C ₂ H ₅	H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A6	F	CH ₃	CH ₃	H	H	direct bond	racemic
E6	F	CH ₃	CH ₃	H	H	direct bond	1R; positions 2 and 1* are achiral

Colombian Pat. Appln. No. 05076616 - P20144 / 57366 - BCS 03-1002 CO PCT - 21 Jan. 2011
Test Report

Sheet 3

Cpd. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷ to R ¹⁰	A	Stereostructure at positions 1, 2 and 1*
A7	CH ₃	H	H	H	H	direct bond	racemic
E7	CH ₃	H	H	H	H	direct bond	1R; positions 2 and 1* are achiral
A8	CH ₃	CH ₃	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	racemic
E8	CH ₃	CH ₃	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	1R; positions 2 and 1* are achiral
A9	C ₂ H ₅	H	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	racemic
E9	C ₂ H ₅	H	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	1R; positions 2 and 1* are achiral
A10	F	CH ₃	CH ₃	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	racemic
E10	F	CH ₃	CH ₃	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	1R; positions 2 and 1* are achiral
A11	F	CH ₃	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	racemic
E11	F	CH ₃	H	H	R ⁷ = R ⁹ = CH ₃ R ⁸ = R ¹⁰ = H	CH ₂	1R, 1*R; position 2 is achiral
A12	CH ₃	CH ₃	H	H	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	racemic
E12	CH ₃	CH ₃	H	H	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	1R; positions 2 and 1* are achiral
A13	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	direct bond	racemic
E13	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A14	F	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	direct bond	racemic
E14	F	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral

Colombian Pat. Appln. No. 05076616 - P20144 / 57366 - BCS 03-1002 CO PCT - 21 Jan. 2011
Test Report

Sheet 4

Cpd. No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷ to R ¹⁰	A	Stereostructure at positions 1, 2 and 1*
A15	F	CH ₃	H	H	H	CH ₂	racemic
E15	F	CH ₃	H	H	H	CH ₂	1R, 1*R; position 2 is achiral
A16	F	H	H	H	H	direct bond	racemic
E16	F	H	H	H	H	direct bond	1R, positions 2 and 1* is achiral
A17	H	H	H	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	racemic
E17	H	H	H	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A18	CH ₃	H	H	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	racemic
E18	CH ₃	H	H	CH ₃	R ⁹ = CH ₃ , R ⁷ = R ⁸ = R ¹⁰ = H	direct bond	1R, 2S, position 1* is achiral
A19	H	H	H	C ₂ H ₅	H	direct bond	racemic
E19	H	H	H	C ₂ H ₅	H	direct bond	1R, 2S; position 1* is achiral

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 5

Table 2: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	E C H C G	P O A A N	S E T V I	C H E A L	G A L A P	P H B P U	P O L C O
A1	320	90	50	80	90	90	90	90	70
E1	80	100	100	100	100	100	100	100	100

Table 3: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	L O L M U	S E T V I	G A L A P	M A T I N		Dose [g a.i./ha]	E C H C G	G A L A P
A2	20	20	90	80	70	0		320	80	90
E2	5	80	100	90	100	90		20	100	100

Table 4: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	L O L M U	S E T V I	S O H A L	C H E A L
A3	80	90	90	30	40	50
E3	20	100	100	100	70	100

Table 5: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	L O L M U		Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	S O H A L	P H B P U	P O L C O
A4	20	80	90		320	90	80	30	90
E4	80	100	100		80	100	100	80	100

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 6

Table 6: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	D I G S A	E C H C G	L O L M U	S O H A L	C H E A L	G A L A P	S T E M E
A5	80	50	20	40	30	80	90	50
E5	20	100	70	50	60	100	100	100

Table 7: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	D I G S A	E C H C G	L O L M U	S E T V I	S O H A L	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	P O L C O	S T E M E	V E R P E
A6	80	50	70	50	40	30	50	10	80	80	40	50	40	90
E6	20	100	90	80	100	100	80	90	100	100	100	70	60	100

Table 8: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	E C H C G	L O L M U	A M A R E	G A L A P	M A T I N	S T E M E	V E R P E
A7	80	70	40	90	100	80	80	90	100
E7	20	80	80	90	100	90	80	90	100

Table 9: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	D I G S A	E C H C G	L O L M U	S O H A L	A M A R E	C H E A L	M A T I N	S T E M E
A8	320	0	20	20	30	0	0	0	10	20
E8	80	60	100	60	100	80	100	100	90	100

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 7

Table 10: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	D I G S A	E C H C G	A M A R E	C H E A L	S T E M E	V E R P E
A9	320	40	50	50	90	30	100
E9	80	100	70	70	100	100	100

Table 11: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	L O L M U	S O H A L	A M A R E	M A T I N	G A L A P	S T E M E	V E R P E
A10	80	100	40	100	90	40	90	100
E10	20	100	70	100	100	50	100	100

Table 12: Herbicidal effect (in percent) in pre-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	E C H C G	L O L M U	M A T I N	A M A R E	S T E M E	V E R P E
A11	20	0	50	0	70	100	80	100
E11	5	90	80	70	90	100	90	100

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 8

Table 13: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	L O L M U	C H E A L	M A T I N	S T E M E	V E R P E
A1	1280	40	70	50	50	70
E1	320	80	100	70	90	90

Table 14: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	E C H C G	L O L M U	S E T V I	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	P O L C O	S T E M E	V E R P E
A2	320	60	60	0	70	90	90	70	90	70	90	90
E2	80	90	70	70	80	100	90	90	90	90	90	90

Table 15: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	E C H C G	L O L M U	S E T V I	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	S T E M E	V E R P E
A3	320	90	20	0	90	90	90	70	60	70	90
E3	80	90	90	90	80	100	90	90	80	100	90

Table 16: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A B U T H	A M A R E	C H E A L	P H B P U	V E R P E
A4	320	0	20	20	20	90
E4	80	80	60	90	70	90

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 9

Table 17: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	E C H C G	L O L M U	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	P H B P U	P O L C O	S T E M E	V E R P E
A7	1280	0	40	0	50	30	30	60	80	0	0	80
E7	320	90	90	90	90	90	90	90	100	70	60	90

Table 18: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	L O L M U	S E T V I	A B U T H	C H E A L	G A L A P	M A T I N	P H B P U	V E R P E
A12	320	40	20	70	60	30	80	70	80
E12	80	60	60	90	90	80	90	90	90

Table 19: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	D I G S A	E C H C G	L O L M U	A B U T H	A M A R E	G A L A P
A13	320	40	90	0	90	80	80
E13	80	70	100	70	90	90	90

Table 20: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	E C H C G	A B U T H	A M A R E	C H E A L	M A T I N	P H B P U	P O L C O	S T E M E	V E R P E	X A N S T
A14	320	40	80	70	80	70	80	40	40	90	70
E14	80	90	90	90	100	90	100	60	90	90	100

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 10

Table 21: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	D I G S A	E C H C G	L O L M U	S E T V I	S O R H A	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	V E R P E
A15	320	20	80	50	30	0	70	80	50	70	60	90
E15	80	90	100	100	80	100	90	90	90	90	100	100

Table 22: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A L O M Y	E C H C G	L O L M U	S O R H A	C H E A L	P H B P U	V E R P E
A16	1280	80	70	80	60	50	70	80
E16	320	90	90	100	100	90	100	90

Table 23: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	E C H C G	L O L M U	S E T V I	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	P O L C O	S T E M E	V E R P E	X A N S T
A17	320	40	80	90	60	90	90	60	70	60	90	90	80
E17	80	80	100	90	100	100	100	100	90	90	100	90	90

Table 24: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	E C H C G	L O L M U	S E T V I	S O R H A	A B U T H	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	S T E M E
A18	320	30	60	60	60	70	90	60	80	80	90
E18	80	80	100	90	80	90	90	100	90	80	90

Patent Application in Ecuador - TRAMITE SP-05-5934-PCT - Our Ref.: BCS 03-1002 EC PCT
Test Report

Sheet 11

Table 25: Herbicidal effect (in percent) in post-emergence application

Cpd. No.	Dose [g a.i./ha]	A M A R E	C H E A L	G A L A P	M A T I N	P H B P U	P O L C O	S T E M E	V E R P E
A19	320	80	50	40	40	30	60	60	80
E19	80	80	80	50	60	90	70	80	90