

187 137

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
(57-1) 700 4814
Fax in U.S.A.: (1-305) 381 8660

Señora Directora
DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-006393-00003-0000

Fecha: 2010-04-26 16:47:58 Des: 2006DIR NUI VASOR
Pa: 11 PA: 1 NUI VASOR Lve: 378 PAS: NACIONAL
Act: 154 RESPON: 514-000000 Folios: 22

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 444

Referencia : Expediente No. 06006393
Asunto : Solicitud de patente para: "Pirimidinas
2-sustituidas"
Solicitante : BASF AKTIENGESSELLSCHAFT
Fecha de solicitud: Enero 24 de 2006.

1. Yo, Luz Clemencia de PAÉZ, mayor de edad, domiciliada en Bogotá, D.C., identificada con la Cédula de ciudadanía N° 35.456.344 de Usaquén, obrando como apoderada del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al Oficio No. 866 notificado por fijación en lista del 29 de Enero de 2010.

2. Mediante el Oficio No. 866 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 siguiente manera:

3. De la solicitud de patente:

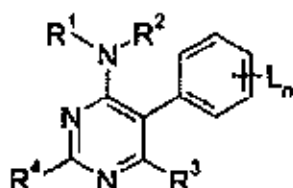
Su Despacho enuncia:

- "En general el capítulo reivindicatorio es demasiado amplio. La gran cantidad de sustituyentes y la ambigüedad para definirlos conllevan a un gran número de posibles estructuras para el compuesto de fórmula I".
- "El capítulo reivindicatorio no solo es demasiado amplio sino que no se encuentra enteramente sustentado en la descripción. El solicitante debe definir específicamente la materia objeto

108
198

Reivindicaciones.

1. Pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula



en la que el índice y los sustituyentes tienen los significados siguientes:

n es un número entero de 1 a 5;

L es halógeno, ciano, cianato (OCN), alquilo C₁-C₈, alquenoilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, -alcoxi C₁-C₈, alquenoiloxi C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenoilo C₄-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalquenoiloxi C₄-C₆, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A,

M es 0, 1 ó 2;

A, A', A'' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenoilo C₂-C₆, alquiriilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenoilo C₃-C₆, fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente halogenados o sustituidos por nitrógeno, cianato, ciano o alcoxi C₁-C₄; o pudiendo A y A' formar juntos con los átomos a los que están ligados un heterociclo saturado, parcialmente insaturado o aromático de cinco o seis miembros, que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo O, N o S,

pudiendo los grupos alifáticos de las demás definiciones de L estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^u:

R^u significa ciano, alcoxi C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₆, alquenoiloxi C₂-C₈, alquiniloxi C₂-C₈, cicloalquenoilo C₄-C₆, cicloalquiloxi C₃-C₆, cicloalquenoiloxi C₄-C₆, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A;

R¹, R² significan, independientemente, alquilo C₁-C₆, alquenoilo C₂-C₆, pudiendo los grupos alifáticos de las definiciones de los radicales R¹ y R² a su parte estar parcial o completamente halogenados o llevar uno a cuatro grupos R^v:

R^v ciano, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆, hidroxilo, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquiniolo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₄-C₆, alquiltio C₁-C₆, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A, N(A')-C(=O)-N(A')A, S(=O)_m-A, S(=O)_m-O-A o S(=O)_m-N(A')A o fenilo, pudiendo la parte de fenilo llevar uno a tres radicales seleccionados del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquiniolo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, ciano, nitro, -C(=O)-A, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A;

R² puede significar, adicionalmente, hidrógeno;

Rⁱ y R^j pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que están ligados un anillo saturado o no saturado de cinco o seis miembros, que puede estar interrumpido por un grupo éter (-O-), carbonilo -C(=O)-, tio -S-, sulfoxilo -S(=O)- o sulferilo -SO₂- o un grupo amino -N(R^k) adicional, donde R^k es hidrógeno o alquilo C₁-C₆, y/o contener uno o varios sustituyentes del grupo: halógeno, alquilo C₁-C₆, halógenoalquilo C₁-C₆ y oxi- alquilenoxi C₁-C₃;

R₃ es halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄;

R¹ corresponde a una de las fórmulas



donde

X significa un enlace directo, -O ó -NR^c;

R^a es hidrógeno, alquilo C₁-C₆;

R^b es hidrógeno, alquilo C₁-C₆;

R^c es hidrógeno, alquilo C₁-C₆;

2. Pirimidinas 2-sustituídas de la fórmula I según la reivindicación 1, donde el índice y los sustituyentes tienen los significados siguientes:

n es un número entero de n 1 a 3, encontrándose por lo menos un sustituyente L en la posición orto en el anillo fenilo;

L significa halógeno, ciano, metilo, metoxi, -C(=O)-O-A, -C(=O)-N(A')A, C(A') (=N-OA), N(A')A, N(A')-C(=O)-A,

A, A' significan, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquiniolo C₂-C₆, fenilo, pudiendo los radicales orgánicos estar parcial o completamente halogenados o estar sustituidos por alcoxi C₁-C₄; o pudiendo A y A' representar junto con los átomos a los que están ligados un heterociclo saturado de

202
202

9. Producto pesticida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

10. Producto pesticida, que contiene un soporte sólido o líquido y un compuesto de la fórmula V según una de las reivindicaciones 7 ó 8.

11. Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infección por los hongos, con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula I según la reivindicación 1.

12. Procedimiento para combatir hongos nocivos fitopatógenos, caracterizado porque se tratan los hongos o los materiales, plantas, el suelo o las semillas a proteger frente a la infección por los hongos, con una cantidad activa de un compuesto de la fórmula V según una de las reivindicaciones 7 o 8.

MGM\MGM\ID-169858\WPCL0361

203
703

Pruebas Biológicas- micro titulación.

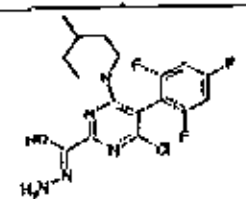
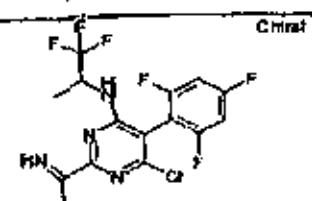
Los compuestos activos se formularon separadamente como una solución stock con una concentración de 10000ppm en DMSO.

Ejemplo 1- Actividad contra el patógeno del añublo del arroz *Pyricularia oryzae* en el ensayo de microtitulación.

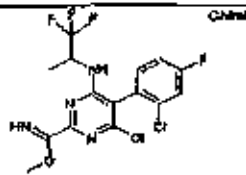
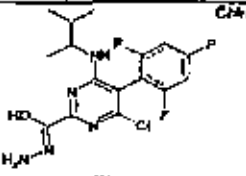
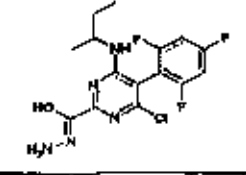
La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuosa de nutrientes de malta para los hongos. Una suspensión de esporas de *Pyricularia oryzae* acuosa se adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

Ejemplo 2- Actividad contra el patógeno de Mancha foliar *Septoria tritici* en el ensayo de microtitulación.

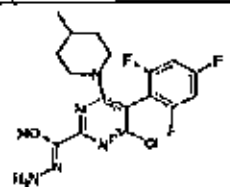
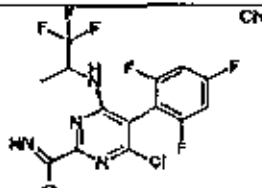
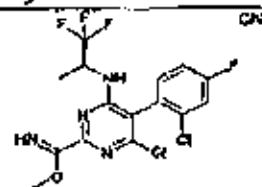
La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuosa de nutrientes de malta para los hongos. Una suspensión de esporas de *Septoria tritici* acuosa se adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

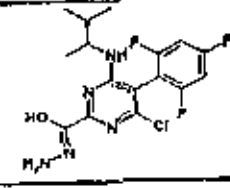
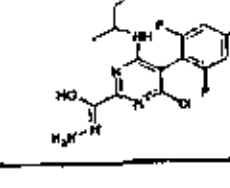
structure	Growth in % at 125ppm <i>Pyricularia oryzae</i>	Growth in % at 125ppm <i>Septoria tritici</i>
	0	0
	6	3

204
204

structure	Growth in % at 125ppm <i>Pyricularia oryzae</i>	Growth in % at 125ppm <i>Septoria tritici</i>
	0	0
	3	4
	1	3

Datos físico-químicos de los compuestos:

structure	melting point [°C]
	122-125
	101-103
	82-85

structure	melting point [°C]
	115-118
	164-166

Pruebas Biológicas- micro titulación.

Los compuestos activos se formularon separadamente como una solución stock con una concentración de 10000ppm en DMSO.

Ejemplo 1: Actividad contra el patógeno de tizón tardío Phytophthora infestans en el ensayo de microtitulación.

La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuosa de jugo de guisante para los hongos. Una suspensión de esporas de *P. infestans* adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

Ejemplo 2: Actividad contra el patógeno de moho gris Botrytis cinerea en el ensayo de microtitulación.

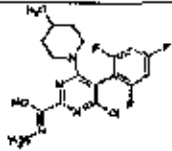
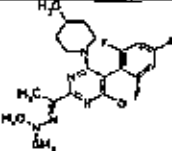
La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuosa de nutrientes de malta para los hongos. Una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* acuosa se adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

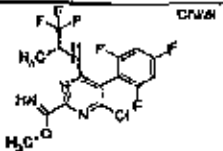
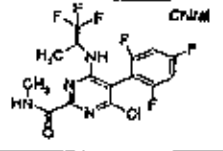
Ejemplo 3: Actividad contra el añublo de arroz causado por Pyricularia oryzae en el ensayo de microtitulación.

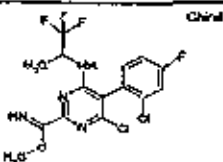
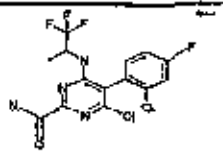
La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuoso de nutrientes de malta para los hongos. Una suspensión de esporas de *Pyricularia oryzae* acuosa se adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

Ejemplo 4: Actividad contra el patógeno de tizón foliar Septoria tritici en el ensayo de microtitulación.

La solución stock se inoculó en placas de microtitulación (MTP) y se diluyó la concentración del principio activo utilizando una base acuoso de nutrientes de malta para los hongos. Una suspensión de esporas de *Septoria tritici* acuosa se adicionó seguidamente. Las placas se colocaron en una cámara de vapor de agua saturada a una temperatura de 18 °C. Usando un fotómetro de absorción, los PPM se midieron a 405 nm en el día 7 después de la inoculación. Los parámetros medidos fueron comparados con el crecimiento del compuesto activo libre-variante de control de frecuencia(100%) y el hongo; y el compuesto activo libre (valor en blanco) para determinar el crecimiento relativo en % de los patógenos en los compuestos activos individuales.

Document	structure	Growth of <i>P. infestans</i> in % at 8 ppm	Growth of <i>Pyricularia oryzae</i> in % at 8 ppm
according to the invention		38	6
D1		95	84

Document	structure	Growth of <i>B. cinerea</i> in % at 0.125 ppm	Growth of <i>Pyricularia oryzae</i> in % at 0.125 ppm
according to the invention		47	0
D1		83	68

Document	structure	Growth of <i>P. oryzae</i> in % at 2 ppm	Growth of <i>Septoria tritici</i> in % at 2 ppm
according to the invention		0	0
D1		58	83

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 27,479
FECHA : ABRIL 12 DE 2010

SUP. INTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-006393-00003-0000

Fecha: 2010-04-26 16:37:58 Dep: 2020 DIR NCL VASCH
Lib: 1 PATENTILYI Lva: 378 VASL NACIONAL
Act: 444 RESPLA STAR C.O.L. - dia: 22

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	175534542	12/04/2010	49,791,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		*** REINTEGRACION UNITARIA ADICIONAL	25,000.00
		TOTAL :	5 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

0060: 00361 - 8A1 - 071-4

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 27,480
FECHA : ABRIL 12 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-006393-00003-0000

Folio 2010-04 2010 3758 Dep. 2010 Direccion ASOR
Ha. 11 PATENTE Y Ha. 375 FASE NACIONAL
Art. 444 RESOLUCION 1001-2010

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	VR. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	175534542	12/04/2010	49,791,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. REVISITADO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	*** REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL	26,000.00
	TOTAL :	26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE NO. _____

0010 : 00361-841-074-4

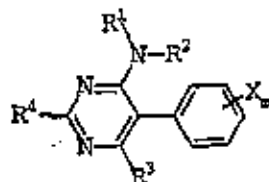
210

Beschreibung

5-Phenylpyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung

Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Phenylpyrimidine der Formel I

10



I

15 in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

R^1, R^2 unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Halogenocycloalkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Halogenalkenyl, C_2-C_6 -Alkinyl oder C_2-C_6 -Halogenalkinyl,

R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S(=O)-) oder Sulfonyl-(-SO₂-) Gruppe unterbrochen sein und/oder durch eine bis vier Gruppen R^a und/oder R^b substituiert sein kann;

R^a, R^b unabhängig voneinander Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkinyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkoxy,

C_3-C_{10} -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise oder vollständig substituiert sein können durch folgende Gruppen R^* :

R^* unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Alkylcarbonyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_6 -Alkylsulfoxyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, C_1-C_6 -Alkyloxycarbonyl, C_1-C_6 -Alkylthio, C_1-C_6 -Alkylamino, Di- C_1-C_6 -Alkylamino, C_1-C_6 -Alkylaminocarbonyl, Di- C_1-C_6 -Alkylaminocarbonyl, C_1-C_6 -Alkyl-

aminothiocarbonyl, Di-C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, C(=NOR^a)-OR^b oder OC(R^a)₂-C(R^b)=NOR^b,

wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste R^x:

R^x Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfoxyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₁-C₆-Alkylaminocarbonyl, Di-C₁-C₆-alkylaminocarbonyl, C₁-C₆-Alkylaminothiocarbonyl, Di-C₁-C₆-alkylaminothiocarbonyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy oder C(=NOR^a)-OR^b;

R^a, R^b Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R^a und R^b können auch gemeinsam über eine Alkylen- oder Alkenylenkette mit dem überbrückenden Atom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden;

R³ Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy oder C₃-C₆-Alkenyloxy;

R⁴ Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkylthio, C₃-C₆-Alkenylthio, C₃-C₆-Alkinylthio, C₁-C₆-Halogenalkylthio, -ON=CR^aR^b, -CR^c=NOR^a, -NR^cN=CR^aR^b, -NR^aR^b, -NR^cNR^aR^b, -NOR^a, -NR^cC(=NR^{c'})NR^aR^b, -NR^cC(=O)NR^aR^b, -NR^aC(=O)R^c, -NR^aC(=NOR^c)R^{c'}, -OC(=O)R^c, -C(=NOR^c)NR^aR^b, -CR^c(=NNR^aR^b), -C(=O)NR^aR^b oder -C(=O)R^c;

R^c eine der bei R^a und R^b genannten monovalenten Gruppen;

5 X Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Halogenalkyl;
und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser
10 Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur
Bekämpfung von Schadpilzen.

Pyridylpyrimidin-Derivate mit fungizider Wirkung sind bekannt aus
EP-A 407 899 DE-A 42 27 811 und WO-A 92/10490. Tetrahydropyrimi-
15 din-Derivate mit fungizider Wirkung sind aus GB-A 2 277 090 be-
kannt.

Die in den vorstehend genannten Schriften beschriebenen Verbin-
dungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.

20 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend.
Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter
Wirksamkeit zu finden.

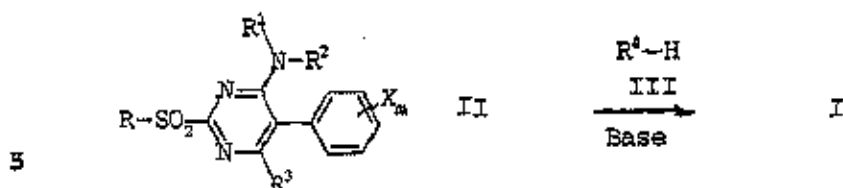
25 Demgemäß wurden die eingangs definierten Phenylpyrimidinderivate
I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie
sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen und ihre
Verwendung in diesem Sinne gefunden.

30 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten
Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten wer-
den.

35 Vorteilhaft geht man zur Herstellung der Verbindungen der Formel
I, in der R^d für Cyano oder eine über ein Heteroatom gebundene
Gruppe steht, von Sulfonen der Formel II aus. In Formel II haben
die Substituenten X_m und R¹ bis R³ die Bedeutung wie in Formel I
40 und R steht für C₁-C₄-Alkyl, bevorzugt für Methyl.

Die Sulfone der Formel II werden mit Verbindungen der Formel III
unter basischen Bedingungen umgesetzt. Aus praktischen Gründen
kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder
45 Ammoniumsalz der Verbindung III eingesetzt werden.



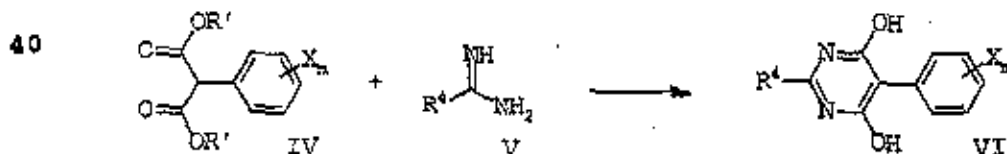
Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base (vgl. DE-A 39 01 094; 10 Chimia, Bd. 50, S. 525-530 (1996); Khim. Geterotsikl. Soedin, Bd. 12, S. 1696-1697 (1998)).

Geeignete Lösungsmittel sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, 15 1,2-Dimethoxyethan, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt werden Ethanol, Dichlormethan, Acetonitril und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium- 25 hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

30 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

35 Verbindungen der Formel I, in der R⁴ für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus Phenylmalonestern der Formel IV durch Umsetzung mit Amidinen der Formel V erhalten.



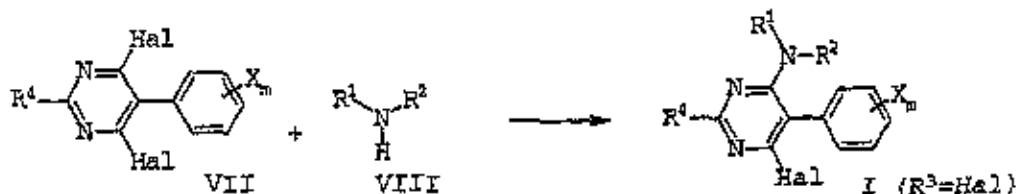
Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. 45 (1943) S. 388 und J. Org. Chem. (1952) Bd. 17, S. 1320 bekannten Bedingungen.

Phenylmalonester der Formel IV sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

Hydroxypyrimidine der Formel VI werden in Halogenverbindungen VII überführt [vgl. J. Chem. Soc. (1943) S. 383; Helv. Chim. Acta 5 (1981) Bd. 64, S. 113-152]. Als Halogenierungsmittel kommen dabei insbesondere POCl₃ und POBr₃ in Betracht.

Aus Halogenpyrimidinen VII werden durch Umsetzung mit Aminen VIII Verbindungen der Formel I erhalten.

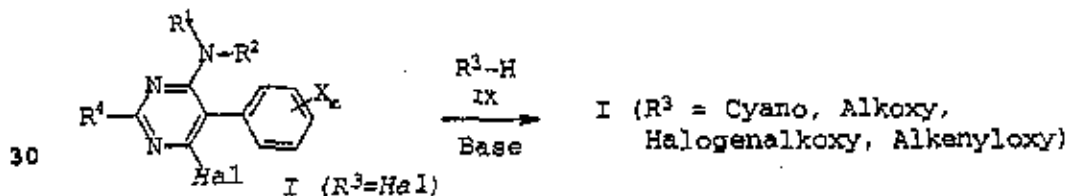
10



15

Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. (1943) S. 383 und Chem. Eur. J. (1999) Bd. 5 (12), S. 3450-3458 bekannten Bedingungen.

20 Phenylpyrimidine der Formel I, in der R³ für Cyano oder über Sauerstoff gebundene Gruppen steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit Verbindungen IX unter basischen Bedingungen erhalten. Aus praktischen Gründen kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalka-
25 limetall- oder Ammoniumsalz der Verbindung IX eingesetzt werden.



30

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel ggf. in Gegenwart einer Base [vgl. Recl.

35 Trav. Chim. Pays-Bas (1942) Bd. 61, S. 291; J. Heterocycl. Chem. (1993) Bd. 30 (4), S. 993-995].

Geeignete Lösungsmittel sind Ether, Sulfoxide, Amide, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, N,N-Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon, N,N-Dimethylacetamid, Diethylether, Tetrahydrofuran,
40 1,2-Dimethoxyethan. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

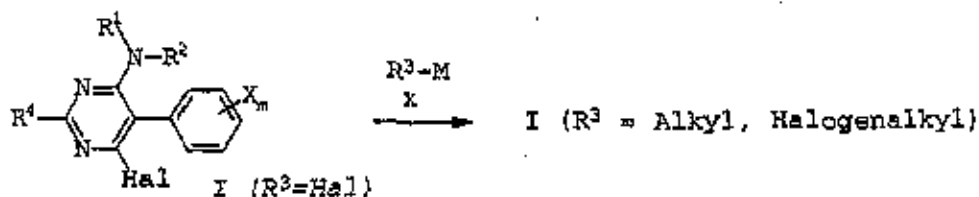
Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali-
45 metall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium-

hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht.

- 5 Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

Phenylpyrimidine der Formel I, in der R^3 für C_1 - C_6 -Alkyl oder, C_1 - C_6 -Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit metallorganischen Verbindungen der Formel X, in der M für eine Gruppe Mg-Hal, Zn- R^3 oder $B(OR)_2$ steht, wobei Hal ein Halogenatom und R Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl bedeutet und R^3 für C_1 - C_6 -Alkyl steht, erhalten.

15



20

- Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -25°C bis 250°C , vorzugsweise 0°C bis 150°C , in einem inerten organischen Lösungsmittel, ggf. in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators [vgl. Chem. and Pharm. Bull. (1980) Bd. 28, Nr. 2, S. 571-577; Tetrahedron Lett. (1996) Bd. 37 (8), S. 1309; Tetrahedron Lett. (1994) Bd. 35 (19), S. 3155; Synlett (1999) Bd. 7, S. 1145].

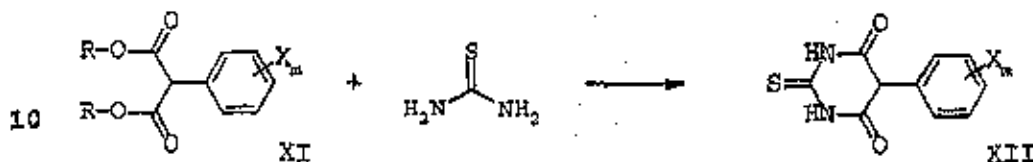
- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe, Ether, besonders bevorzugt Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, Benzol, Toluol und Xylol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Als Übergangsmetall-Katalysatoren sind Eisen-, Kobalt-, Nickel-, Rhodium-, Platin- oder Palladium-Verbindungen, besonders Nickel(0)-, Nickel(II)-, Palladium(0)- und Palladium(II)-Verbindungen geeignet. Dabei können Salze wie Palladiumchlorid oder Palladiumacetat oder auch Pd-Komplexe verwendet werden. Voraussetzung ist nur, daß die Liganden am Palladium unter den Reaktionsbedingungen vom Substrat verdrängt werden können.

- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, X in bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf I einzusetzen.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe der Formel II können nach literaturbekannten Methoden beispielsweise auf folgender Syntheseroute erhalten werden:

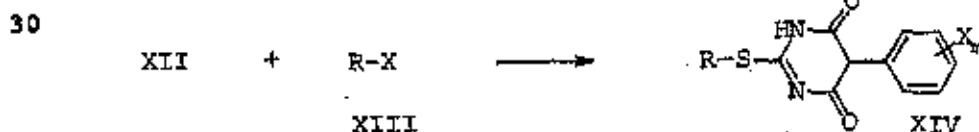
- 5 Ausgehend von Phenylmalonsäurealkylestern der Formel XI und Thioharnstoff werden Verbindungen der Formel XII erhalten,



- wobei in Formel XI R für C₁-C₆-Alkyl steht. Die Reaktion erfolgt üblicherweise in einem protischen Lösungsmittel wie z.B. Alkoholen, insbesondere Ethanol, gegebenenfalls in Gegenwart einer
- 15 Base, wie Na₂CO₃ und NaHCO₃. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 70-220°C [vgl. Collect. Czech. Chem. Commun., Bd. 48, S. 137-143 (1983); Heteroat. Chem., Bd. 10, S. 17-23 (1999); Czech. Chem. Commun., Bd. 58, S. 2215-2221 (1993)].

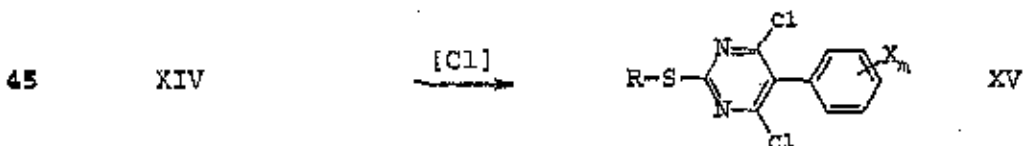
- 20 Die benötigten Phenylmalonsäureester XI sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

- Verbindungen XII werden durch Alkylierungsmittel XIII zu Thiobarbitursäurederivaten umgesetzt. In Formel XIII bedeutet R C₁-C₆-Alkyl und X eine nucleophil abspaltbare Abgangsgruppe. Formel XIII
- 25 steht allgemein für übliche Alkylierungsmittel, wie Methylchlorid und Methylbromid, Dimethylsulfat oder Methansulfonsäuremethylester.



- Die Reaktion kann in Wasser oder auch einem dipolar aprotischen
- 35 Lösungsmittel wie z.B. N,N-Dimethylformamid durchgeführt werden [vgl. US 5,250,689], sie erfolgt vorteilhaft in Gegenwart einer Base, wie beispielsweise KOH, NaOH, NaHCO₃ und Na₂CO₃ oder Pyridin. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 10-60°C.

- 40 Verbindungen XIV werden in Dichlorpyrimidine der Formel XV überführt [vgl. EP-A 745 593; WO-A 99/32458; J.Org. Chem. Bd. 58, S. 3785-3786 (1993)].



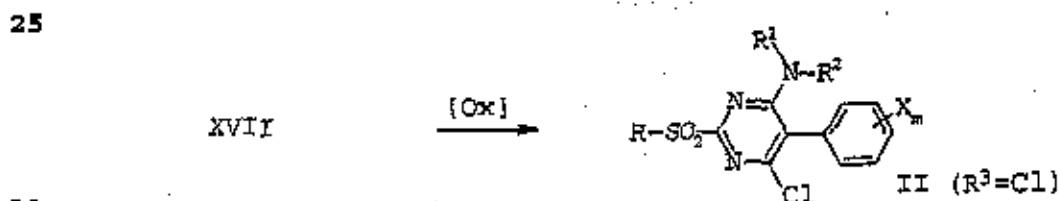
Als Chlorierungsmittel [Cl] eignen sich beispielsweise POCl_3 , PCl_3/Cl_2 oder PCl_5 . Die Reaktion kann in überschüssigem Chlorierungsmittel (POCl_3) oder einem inerten Lösungsmittel durchgeführt werden. Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise zwischen 10 und 180°C.

Durch Aminierung mit XVI werden die Dichlorverbindungen der Formel XV in die Verbindungen der Formel XVII überführt.



- 15 Diese Umsetzung erfolgt vorzugsweise bei 20 bis 120°C [vgl. J. Chem. Res. S (7), S. 286-287 (1995); Liebigs Ann. Chem., S. 1703-1705 (1995)] in einem inerten Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Hilfsbase, wie NaHCO_3 , Na_2CO_3 oder tert. Amine.
- 20 Die Amine der Formel XVI sind käuflich oder literaturbekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

Die Thioverbindungen XVII werden zu den Sulfonen der Formel II oxidiert.

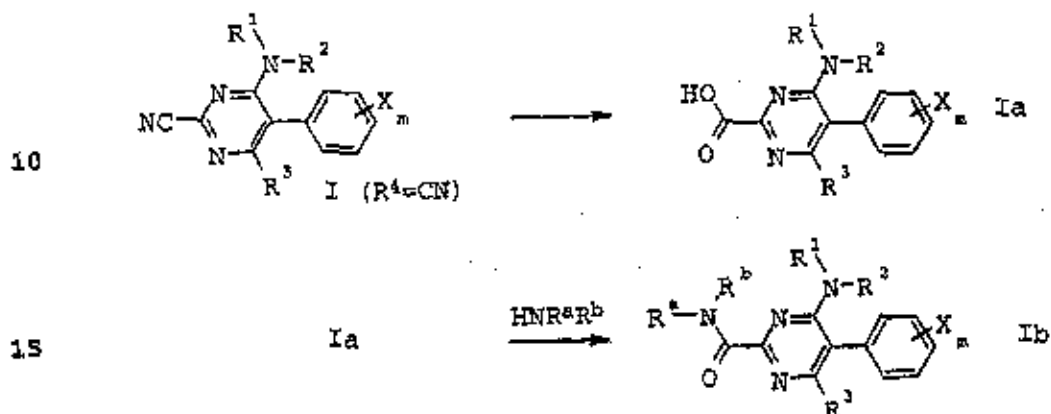


- 30 Die Reaktion wird vorzugsweise bei 10 bis 50°C in Gegenwart protischer oder aprotischer Lösungsmittel durchgeführt [vgl.: B. Kor. Chem. Soc., Bd. 16, S. 489-492 (1995); Z. Chem., Bd. 17, S. 63 (1977)]. Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise Wasserstoffperoxid oder 3-Chlorperbenzoesäure.
- 35

Die Einführung von von Chlor verschiedenen Gruppen R^3 in die Sulfone II kann analog der Verbindungen der Formel I erfolgen.

- 40 Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$, $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$, $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$, $-\text{C}(=\text{NNR}^a\text{R}^b)\text{R}^c$ oder $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^c$ steht, werden vorteilhaft aus Verbindungen der Formel I, in der R^4 Cyano bedeutet, erhalten.
- 45 Verbindungen der Formel I, in der R^4 für $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ oder $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$ steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen ($R^4=\text{Cyano}$) durch Versäuerung zu den Carbonsäuren der Formel Ia

unter sauren oder basischen Bedingungen und Amidierung mit Aminen HNR^aR^b . Die Verseifung erfolgt üblicherweise in inerten polaren Lösungsmitteln, wie Wasser oder Alkoholen, bevorzugt mit anorganischen Basen, wie Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, insbesondere NaOH.

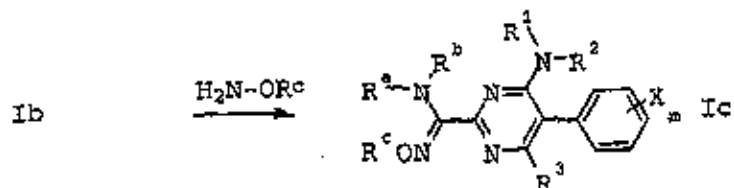


Diese Umsetzungen erfolgen vorteilhaft unter den aus Chem. and Pharm. Bull. 1962, Bd.30, N12, S.4314 bekannten Bedingungen.

20

Aus Amidinen der Formel Ib werden durch Oximierung mit substituierten Hydroxyaminen $\text{H}_2\text{N-OR}^c$ unter basischen Bedingungen die Verbindungen der Formel I, in der R⁴ für $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$ steht, erhalten [vgl. US 4,876,252]. Die substituierten Hydroxyamine können als freie Base oder bevorzugt in Form Ihrer Säureadditionssalze eingesetzt werden. Aus praktischen Gründen kommen dabei insbesondere die Halogenide, wie die Chloride oder die Sulfate in Frage.

30



Alternativ können die Amidoxime der Formel Ic, in der R^a und R^b für Wasserstoff stehen, auch aus den entsprechenden Nitrilen (R⁴=Cyano) durch Umsetzung mit Hydroxylamin und anschließender Alkylierung erhalten werden. Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus DE-A 198 37 794 bekannten Bedingungen.

40

Verbindungen der Formel I, in der R⁴ für $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$ steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen (R⁴=Cyano) durch Umsetzung mit Grignard-Verbindungen $\text{R}^c\text{-Mg-Hal}$, wobei Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor oder Brom steht, zugänglich.

45

219
219

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	06006393
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	908184
	Folios	14

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

No. Sol. Internacional: PCT/EP2004/007877
Fecha de Presentación Internacional: 2004-07-15

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:

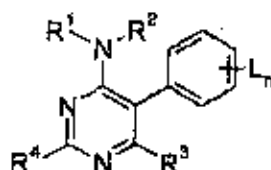
1. Documentos estudiados

Capítulo descriptivo: Folios 66 a 160 tal y como fueron presentados.
Capítulo reivindicatorio: Folios 161 a 171 tal y como fueron presentados.
Prioridad: Folio 2 DE 10333857,8 2003-07-24
DE 10357714,9 2003-12-09.
Respuesta del solicitante: Folios 187 a 194 y 203 a 206.
Nuevo capítulo reivindicatorio: Folios 198 a 202

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Pirimidinas 2-sustituidas. Folio 2.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a pirimidinas 2-sustituidas de la fórmula (I).



El problema técnico planteado en la presente solicitud indica que las pirimidinas 2-sustituidas conocidas en el arte previo presentan un efecto insatisfactorio en muchos casos. Por lo tanto existe la necesidad de compuestos con eficiencia

mejorada. Para solucionar este problema técnico la solicitud plantea pirimidinas 2-sustituidas de fórmula (I) para combatir hongos nocivos.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC C07D 239/42.

De la solicitud de Patente

2.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El nuevo capítulo reivindicatorio, continúa siendo amplio y no cumple con el requisito de concisión. Al revisar los ejemplos de la descripción y la misma respuesta es claro que los significados de los radicales L, R¹, R² y R³ son cercanamente constantes y tiene significados muy puntuales. Se le recomienda al solicitante que presente una razonable generalización de los compuestos ensayados.

En consecuencia el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486 o art.22 Tratado PCT.

3. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

Se reitera que el procedimiento de la reivindicaciones 11 y 12 no divulga un procedimiento propiamente dicho. **Es evidente que la llamada etapa de "se tratan" se refiere a la forma de utilizar el compuesto de interés.** En otras palabras el procedimiento reivindicado se refiere al uso de las pirimidinas de fórmula (I) para combatir hongos nocivos fitopatógenicos. Lo cual no es patentable a partir del artículo 21 de la Decisión 486.

Se le aclara al solicitante que un procedimiento cuya única etapa es una aplicación corresponde tan solo a una aplicación, y una aplicación es un uso.

4. Determinación del Estado de la Técnica

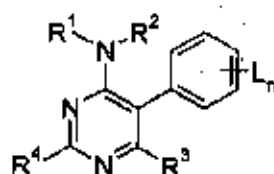
Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 2003-07-24, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	WO03/043993	5-phenylpyrimidines agents comprising the same, method for production and use thereof	2003-05-30

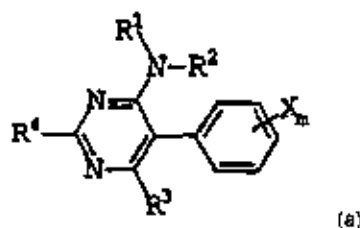
5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Novedad (artículo 16 D 486)

La solicitud de patente en estudio presenta pirimidinas de la fórmula (I)



El documento D1 divulga compuestos de pirimidinas de fórmula (a)



Se reitera nuevamente que al comparar las estructuras de los compuestos reclamados en esta solicitud, con las estructuras de los derivados de D1 se observa que son iguales.

Nótese que los significados de cada uno de los radicales R¹, R², R³, R⁴ y L son equivalentes a los significados de R¹, R², R³, R⁴ y X de D1, respectivamente. De modo tal y de acuerdo a lo establecido en el artículo 16 de la Decisión 486 la materia reclamada se encuentra comprendida y por lo tanto divulgada en la anterioridad citada. De modo tal que la reivindicación 1 carece de novedad a partir de D1, al igual que sus reivindicaciones dependientes, pues no presentan ninguna otra característica que las pudiera hacer nuevas.

Igualmente carece de novedad el intermediario de las reivindicaciones 6 y 7 y el producto pesticida de las reivindicaciones 9 y 10.

5.2. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

Se reitera que el derivado de fórmula (I) de esta solicitud no es nuevo a partir de D1 y evidentemente tampoco tiene nivel inventivo. Sin embargo nuevamente vale la pena subrayar que la anterioridad D1 ya había divulgado la actividad fungicida de dichos derivados.

Asimismo el intermediario de la reivindicación 8, carece de nivel inventivo una vez que D1 ya había divulgado diversas rutas de síntesis de dichos derivados y al mismo tiempo intermediarios entre los cuales se incluyen estructuras tipo imina, tal como el derivado (Ic) de D1, las cuales claramente sugieren el mismo tipo de estructura imina reclamada en la reivindicación 8 de esta solicitud.

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

Se le aclara al solicitante que siguiendo lo indicado en el artículo 16 de la Decisión 486 los compuestos de interés no se consideran nuevas, en vista de que ya estaban comprendidos en el estado del arte, entendiendo este como la divulgación del documento D1.

Se tuvieron en cuenta los demás argumentos del solicitante.

7. Conclusión

Los requisitos de patentabilidad de la presente solicitud se encuentran afectados así:

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	W003/043993	1-7 y 9-10 8	Novedad Nivel Inventivo

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL

Directora de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 25 JUN 2009

CONCEPTO TÉCNICO No. 2133	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202085
---------------------------	--

108
1083

de invención y esta debe estar enteramente sustentada en el capítulo descriptivo".

- "Las reivindicaciones 6 y 7 presentan procedimientos de síntesis que no se encuentran definidos. Las etapas son enunciadas de forma muy general y solo corresponden a reacciones comunes en química".
- "La formula (I) no resulta representativa de la materia de la invención y no se distingue como única estructura que relacione un mismo concepto común inventivo".

4. Modificación de la solicitud en trámite.

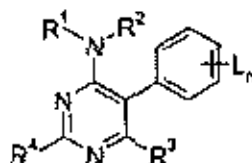
Con el fin de atender las anteriores observaciones, y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, donde se establece que la modificación de una solicitud es posible en cualquier momento del trámite mientras no implique una ampliación de la solicitud inicial, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio como sustituto del anteriormente presentado. En este nuevo capítulo reivindicatorio, se ha revisado la redacción del mismo con el fin de hacer claridad sobre la materia que se solicita proteger y sobre el alcance de la misma. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto quedan superadas respectivamente con las modificaciones realizadas de la siguiente manera:

- La reivindicación 1 ha sido redactada nuevamente, limitando significativamente las definiciones de los sustituyentes R1, R2, R3 y R4 de los compuestos de formula (I) con base en las definiciones que se encuentran debidamente sustentadas en el capítulo descriptivo (Ver tabla 1A).
- Asimismo, las reivindicaciones 6 y 7 han sido eliminadas. De tal manera que el nuevo pliego reivindicatorio esta constituido por 12 reivindicaciones y la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.
- Con respecto a que el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de unidad de invención por cuanto no se observa un único concepto inventivo, deseamos poner de presente lo siguiente:

A este respecto, mi representada respetuosamente desea señalar que no comparte la opinión del Señor Examinador. Lo anterior, debido a que los compuestos divulgados en las reivindicación 1 contienen una fracción significativa en común correspondiente al grupo pirimidina sustituido en la

189
189

posición 2 por R⁴ y en la posición 5 por un grupo fenilo, tal como se muestra a continuación:



Adicionalmente, todos los compuestos están relacionados con compuestos pirimidina 2-sustituídos empleados para combatir hongos nocivos que presentan una eficiencia mejorada en comparación con compuestos similares conocidos en el estado del arte.

De tal manera que es claro que la presente invención guarda unidad de invención ya que los compuestos reivindicados comparten un concepto inventivo en común (compuestos para combatir hongos nocivos) y los mismos se encuentran relacionados entre sí (fracción en común).

Así entonces, es claro que con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio y con las anteriores aclaraciones se deben tener por superadas las objeciones que por claridad y por unidad de invención hizo su Despacho, de acuerdo con las disposiciones de los artículos 25 y 30 de la Decisión 486. Sin embargo, en el evento que el Despacho considere que una modificación adicional en el capítulo reivindicatorio sea necesaria, respetuosamente le solicito hacer uso de la facultad que le otorga el artículo 45 inciso 2. de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina a efecto de requerir nuevamente de nuestra parte cualquier complementación o aclaración.

5. Evaluación de los requisitos de patentabilidad:

Su Despacho concluye que la novedad de la reivindicación 1 y sus dependientes de la presente solicitud de patente se ve afectada por el documento WO03043993 (D1).

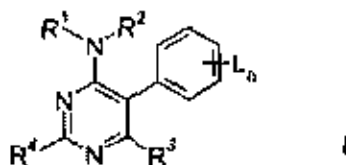
Con respecto a que el documento D1 afecta la novedad de la presente solicitud, mi representada desea señalar lo siguiente:

5.1 Novedad.

El Examinador afirma que el documento D1 anticipa los compuestos reivindicados en la presente solicitud de patente. El examinador sustenta su punto de vista indicando que la reivindicación 1 de dicho documento abarca los compuestos que se divulgan explícitamente en la presente solicitud de patente. Es decir, que

la fórmula de los compuestos revelados en la anterioridad D1 y las definiciones de sus radicales comprenden compuestos mencionados en la reivindicación 1 de la presente solicitud.

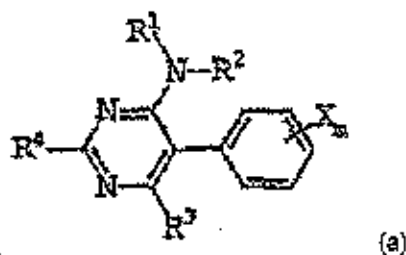
Ahora bien, la presente solicitud de patente se refiere a pirimidinas 2 sustituidas de fórmula 1 :



En donde el sustituyente en la posición 2 es el radical R4 el cual se define como:



Asimismo, D1 se refiere a 5-fenil pirimidinas de fórmula (a):



y a su uso como fungicidas. Sin embargo, mientras que en la presente invención, en la posición 2 se encuentra un grupo carboxamida o iminoeter, en D1 el radical R4 puede tener un gran número de posibles definiciones. Adicionalmente, ninguno de los compuestos explícitamente divulgados en D1 presenta un sustituyente en la posición 2 similar a los revelados en la presente solicitud.

Teniendo en cuenta lo anterior, mi representada desea poner de presente que no puede estar de acuerdo con la metodología adelantada para determinar la novedad de la presente invención. Lo anterior, porque únicamente compuestos específicamente nombrados (con todas las variables identificadas en el mismo documento de la anterioridad y no simples revelaciones genéricas de estos

compuestos) pueden afectar la novedad de compuestos reivindicados en una solicitud presentada posteriormente.

En efecto, la materia acá reivindicada se debe tener como novedosa porque indicaciones o formulas generales contenidas en un documento anterior no destruyen la novedad de compuestos específicos debidamente sustentados por datos experimentales reales (si la obtención de dicho compuesto no se ha especificado) contenidos en una solicitud de patente posterior, tal y como lo señala el Manual Andino de Patentes:

"Para determinar la novedad de la invención, se debe comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contenga explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención"¹; y

"La descripción de un ejemplo específico destruye la novedad de una reivindicación genérica que incluya esa descripción, pero una descripción genérica no destruye normalmente la novedad de un ejemplo específico que caiga dentro de dicha descripción"².

De otro lado, se reitera a su Despacho que para obtener el compuesto acá reivindicado, a partir de D1, sería necesario seleccionar sustituyentes de más de dos (2) listas de compuestos diferentes (R1, R2, R3, R4, Xm), lo cual, también de acuerdo con el Manual Andino de Patentes, le otorga novedad a la presente invención:

"Sin embargo, si hay que hacer una selección en dos listas o más de sustituyentes para llegar al objeto de la reivindicación, entonces se considera que hay novedad"³.

En efecto, la forma como se hizo en el presente caso el examen de novedad de una solicitud de patente se encuentra proscrita de acuerdo con la doctrina y la práctica internacional pues llevaría al absurdo que la simple constatación de la previa mención de los elementos constitutivos de la invención en el arte previo, destruya la novedad, cuando la misma puede estar dada por la especial combinación de dichos elementos.

Así entonces, si es claro que se tienen que hacer diferentes selecciones para llegar a los compuestos de formula I de la presente solicitud, tal y como lo reconoce su Despacho, no se

¹IEPI, S.D. "MANUAL PARA EL EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION EN LAS OFICINAS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL DE LOS PAISES DE LA COMUNIDAD ANDINA". Quito, Ecuador 2004. Página 65.

² Ibidem, Página 67.

³ Ibidem, Página 71.

entiende por qué este documento afectaría la novedad de la presente invención.

5.2 Invenciones de selección/Nivel inventivo.

Adicionalmente, mi representada desea poner de presente que el problema técnico de la presente solicitud es la necesidad de compuestos pirimidina 2 sustituidos con eficiencia mejorada para combatir hongos nocivos, debido a que las pirimidinas 2 sustituidas conocidas en el estado del arte presentan un efecto insatisfactorio en muchos casos.

A pesar que estos compuestos son descritos de manera general en el antecedente, lo importante es si un inventor practicó y confirmó realmente el efecto de una invención de manera suficiente para reconocerla como su invención. Esto tiene mucha influencia para decidir el alcance de protección de una invención o el estado de la técnica relevante para determinar la patentabilidad de invenciones posteriores. Si un inventor anterior realmente conduce un experimento sobre su invención y la describe como un ejemplo, su invención pertenecería al alcance del derecho del inventor sea esta buena o mala, y posteriores inventores no podrían tener ningún derecho sobre esta. Sin embargo, si un inventor anterior describió su especificación muy ampliamente solamente refiriéndose a especificaciones de patentes anteriores sin experimentos o confirmación real sobre los efectos, el alcance del derecho del inventor anterior debe estar restringido, y también se le debe otorgar una compensación a un investigador posterior que invente nuevos productos o procedimientos frente a la invención anterior para contribuir con el desarrollo de la tecnología.

Sin tal consideración, si todos los derechos se deben dar al inventor anterior solo porque él describió muy ampliamente esta especificación se desalentaría a posteriores inventores y también los fundamentos del sistema de patentes colapsarían porque esto propiciaría que los inventores describieran sus especificaciones con una exageración absurda.

Por lo tanto, la mayoría de los países en el mundo reconocen la invención de selección. Si la especificación de una invención anterior describe de manera muy amplia la invención anterior sin ejemplos de trabajo específicos, y una invención posterior experimenta con la invención anterior, y confirma un hecho notorio inesperado de esta, la invención posterior puede conseguir el reconocimiento de novedad y nivel inventivo como una invención de selección a pesar de cualquier descripción hecha en la invención anterior.

Ahora bien, tal como se encuentra demostrado en la descripción de la presente invención con los datos allí revelados, las pirimidinas 2-sustituidas acá reivindicadas presentan una actividad fungicida mejorada en comparación con pirimidinas ya conocidas en el estado del arte (i.e. D1). En particular, el ejemplo 1 muestra que el ataque fungicida por el Oomiceto patógeno de las plantas *PHYTOPHTHORA INFESTANS*, el agente causante de la enfermedad devastadora del tizón tardío de gran importancia económica, puede ser controlado del todo por el compuesto I-5 de la presente invención mientras que el compuesto V1 de D1 no presenta actividad fungicida alguna (0% vs 80% de ataque).

Asimismo, en el ejemplo 2 se muestra que el compuesto I-5 proporciona actividad de larga duración contra otra planta patógena Ascomiceto conocida como *ALTERMARIA SOLANI*, la cual causa daños severos en plantas de tomate y papa. El compuesto I-5 reduce el ataque fungicida en un 30% incluso después de ser aplicado 7 días antes de la inoculación, con una densidad alta de esporas fungicidas mientras que la actividad del compuesto V1 de D1 es claramente inferior (67% de ataque).

Así entonces, debido a que el subgrupo de compuestos acá reivindicado no se encuentra explícitamente divulgado en D1, y adicionalmente el mismo presenta un efecto superior para combatir hongos, la presente invención de selección debe considerarse inventiva frente a D1, ya que tal y como lo señala el Manual Andino de Patentes una invención de selección tiene nivel inventivo cuando:

"...todos los compuestos en el subgrupo presentan un efecto o propiedad técnica no descrita en el arte anterior y que además es inesperada"¹.

Adicionalmente, mi representada presenta anexo al presente memorial, pruebas comparativas adicionales que demuestran al igual que los ejemplos 1 y 2 de la presente solicitud, que los compuestos acá reivindicados SI presentan una actividad fungicida mayor en comparación a los compuestos revelados en D1.

5.3 Solicitud internacional.

Hemos notado que la objeción formulada por el Señor Examinador en el presente caso reproduce la objeción formulada a este mismo respecto a la solicitud internacional en el Informe de búsqueda Internacional.

¹ IEPI, BID. "MANUAL PARA EL EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCIÓN EN LAS OFICINAS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL DE LOS PAÍSES DE LA COMUNIDAD ANDINA". Quito, Ecuador 2004. Página 82.

1971
174

Por lo tanto, llamamos la atención del Señor Examinador sobre el hecho de que la misma fue superada igualmente en el trámite internacional mediante los mismos argumentos acá presentados, tal y como se puede observar en el Informe de Patentabilidad Preliminar.

Por último, aunque compartimos la opinión de su Despacho, en cuanto a que la concesión de una solicitud de patente en otros países, equivalente a la solicitud Colombiana, no obliga a su Despacho a otorgar el privilegio de patente para la misma invención, sí constituye un antecedente favorable para el estudio de patentabilidad que respetuosamente solicitamos tener en cuenta. Por lo tanto informamos a su Despacho que la presente invención fue otorgada por la Oficina de Patentes Europea con número de patente: EP1651618 B1.

6. Teniendo en cuenta lo anterior y toda vez 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.

7. Anexos

- Copia autenticada del memorial de sustitución de poder del Doctor Emilio FERRERO a la Doctora Luz Clemencia de PAÉZ.
- Formulario para modificaciones.
- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 12 reivindicaciones.
- Recibo por \$52.000 por concepto de 2 reivindicaciones adicionales a la décima reivindicación.
- Ensayos comparativos.

Señora Directora,

Luz Clemencia de Paéz
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. N° 35.456.344
T.P.A. No. 23.555

✓ COLO-00361-841-074-4
MGM\MGM\TD-169882\WPCL0361
No. M-2010-169882\MGM

FORMULARIO UNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

1	SOLICITUD DE: ☐ Corrección de Error Material ☒ Modificación a una solicitud	
2 SOLICITANTE	Nombre: BASF AKTIENGESSELLSCHAFT Sociedad constituida y existente bajo las leyes de Alemania. Dirección: 67056 Ludwigshafen, Alemania Domicilio: Ludwigshafen, Alemania Teléfono: 546 09 70 Fax: 249 40 70 E-mail: clientes@caveller.com	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Número: _____
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@caveller.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>35.456.344</u> T. P. <u>23.555</u>
4	Número de expediente: <u>06.006.393</u>	
5	Descripción de la corrección o modificación solicitada: Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 12 reivindicaciones con el fin de superar las objeciones hechas por Su Despacho a la presente solicitud de patente y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas.	
6	Comprobante de pago No. <u>10-27.479</u> Fecha: <u>12 de abril de 2010</u> Comprobante de pago No. <u>10-27.480</u> Fecha: <u>12 de abril de 2010</u>	
7	Anexos ☐ Comprobante de pago de la tasa por \$114.000, por concepto de modificaciones. ☒ Comprobante de pago por 2 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$52.000.00. ☐ Poderes, si fuere el caso ☒ Copia auténtica de la Sustitución del poder otorgada por el Doctor Emilio Ferrero a mi favor para lo cual solicito me sea reconocida personería para continuar con el trámite de la presente solicitud.	

CAVELIER

ABOGADOS

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

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

169
197
TELÉFONO: (57) (1) 347-3612
TELEFAX: (57) (1) 212-9211 (57) (1) 310-4995

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Poderdante : BASF AKTIENGESELLSCHAFT

Poder conferido el : 17/03/1989

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.

Señora Jefe,

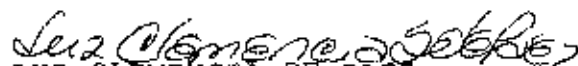


EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

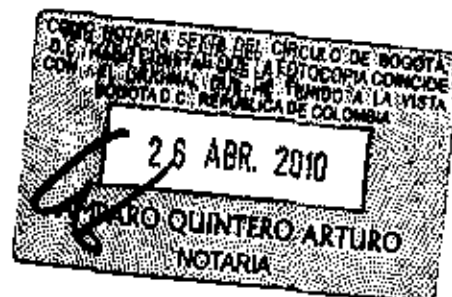
C.C. N° 438.019 de Usaquén

Acepto:


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

T.P.A. N° 23.555

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén



11

NOTARIA SEXTA DE BOGOTÁ

RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL

Bogotá, D.C.

Ante mí AMPARO QUINTERO ARTURO, 03 NOV 2009

NOTARIA SEXTA DEL CÍRCULO DE
BOGOTÁ, D.C.

Comparecieron(a)ron:

Emilio Fariña
Walter Sosa - Lic. C. Clemente
Socorro de Pérez

Quien(es) exhibió(eron) la(s) C.C.

438 011 TP 31929

85456344 TP 23555

Y declaró(aron) que la(s) firma(s) que se ofrece(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto.

En constancia se firma esta diligencia.

Emilio Fariña
Lic. Clemente Socorro de Pérez

