

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

2020
Bogotá D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	09 025 822
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	519
	Oficio	 12 4 8 7
	Folios	21

Patente de Invención ☒

Patente de Modelo de Utilidad ☐

Via Nacional ☐

Via PCT (Fase Nacional) ☒

Capítulo I ☐

Capítulo II ☒

No. Solicitud Internacional

PCT/EP2007/059538

Fecha de Presentación Internacional

11/septiembre/2007

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 comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción:	Folios 136 a 271	12/Enero/2009
Reivindicaciones:	Folios 272 a 280	12/Enero/2009
Dibujos:	Folio 292	12/Enero/2009
Prioridad:	US 60/844,023	12/Septiembre/2006

2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486) y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

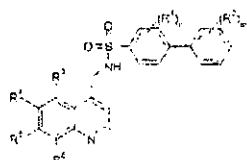
3. Objeto de la invención

Título de la solicitud: "Compuestos de Quinolinilmetilo".

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de proporcionar compuestos que tengan buena actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de diferentes plagas animales, en especial contra la dificultad de controlar insectos, arácnidos y nematodos.

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona compuestos de (quinolin-4-ilmetil)-amida de ácido bifenil-4-sulfonónico de la

Expediente 09 025 822 1er Art 45



fórmula (I) , donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , m y n están definidos.

El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): C 07 D 215/12 // 215/18 // 215/20.

4. Excepción a la Patentabilidad (Art 20 D 486 literales (c) – (d))

El objeto de la reivindicación 24 no es patentable, puesto que la solicitud menciona las semillas y están hacen parte de lo citado como plantas en el Art citado, literal (c).

El objeto de la reivindicación 25 no es patentable, puesto que la solicitud menciona un método de tratamiento de animales y esto hace parte del Art citado, literal (d).

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (Art 14 y 21 D 486)

El uso de la reivindicación 17 no es patentable, de acuerdo con el Art 14.

Los métodos de la reivindicación 19 – 23 corresponden al uso del compuesto de fórmula I definido en las reivindicaciones 1 – 13 para controlar plagas de artrópodos o nematodos, para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación y para proteger semillas, respectivamente. Es evidente que las llamadas etapas de “poner en contacto el insecto...”, “aplicar” y “poner en contacto las semillas” corresponden a la forma de usar el compuesto de fórmula I, aunque en sus preámbulos se reclame como método. Se le aclara al solicitante que un método cuya única etapa es contactar o dejar actuar corresponde a una aplicación y esta aplicación es un uso.

Por lo tanto dicho método no es patentable de acuerdo con el artículo 14.

6. De la Solicitud de Patente

Título

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque tal como lo menciona el resumen el compuesto es un (quinolin-4-ilmetil)-amida de ácido bifenil-4-sulfónico, puesto que la quinolina no es el único grupo central de la molécula, por lo cual se sugiere al Solicitante hacer la corrección necesaria.

Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

Las reivindicaciones 1 a 13 no se encuentran debidamente soportadas en la descripción puesto que las realizaciones preferidas sólo hacen referencia a la actividad de los compuestos mencionados en la tabla 1, lo cual no es una generalización de todos los compuestos. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que ha sido sintetizado y

probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados en el capítulo descriptivo. Teniendo en cuenta la descripción en los ejemplos se encuentra:

Tabla 1. Ejemplos de los compuestos soportados	
Sustituciones	Soporte de los ejemplos presentados
R ¹	Posición meta:CH ₃ , Cl, F, CF ₃ ,
	Posición orto:OCF ₃ , CH ₃ , Cl, F,
R ²	R ^{2a} :H, Cl, F, CF ₃ , CH ₃
	R ^{2b} :H, CF ₃ ,Cl,
	R ^{2c} :Cl, CF ₃ , OCF ₃ , O-CF=CF ₂ , Br, CN
R ³	H
R ⁴	H
R ⁵	H
R ⁶	H
m	3
n	1

El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción.

Las reivindicaciones 1 – 13 no se encuentran debidamente sustentadas en la descripción e ilustradas en los ejemplos puesto que no se presenta una muestra significativa de ensayos teniendo en cuenta las posibles estructuras mencionadas en los ejemplos (folios 153 – 174), puesto que sólo se está mencionando en los ensayos a los compuestos: B1 - B3, B7 – B10, B12, B14, B16, B23, B26, B27, B31, B32, B45, B56, B59, B60, B68, B84, B85, B90, B98, B103, B115 – B117 Y B21 – B23 además aparentemente según todos los ensayos los compuestos B1, B3, B12, B14, B27, B56, B84, B85, B115 y B117, presentan una mejor actividad puesto que aparecen en tres o más de los ensayos mencionados (folios 258 – 271). El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción

En las reivindicaciones 18 y 26 se menciona una composición y una mezcla pesticida, respectivamente, pero están no se encuentran debidamente sustentadas en la descripción puesto que en sus realizaciones preferidas no se menciona emplear el compuesto de fórmula I combinado con algún otro compuesto activo o material portador. El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción

En la reivindicación 14 no es concisa porque términos como “base”, “catalizador de metal de transición” y “grupo saliente adecuado” abarcan muchos compuestos, además no deben definirse sólo en términos de su función sino por su nombre común o IUPAC y teniendo en cuenta lo sustentado en la descripción y realizaciones preferidas.

La reivindicación 18 no es concisa porque el término “material portador” abarcan muchos compuestos, además no deben definirse sólo en términos de su función sino por su nombre común o IUPAC y teniendo en cuenta lo sustentado en la descripción y realizaciones preferidas.

En la reivindicación 14 se menciona un procedimiento, pero no se menciona si

además de los reactivos mencionados la síntesis requiere condiciones de temperatura, presión o pH específicas. Además no es claro si la otra reacción que se lleva a cabo es otra etapa para la obtención del compuesto de fórmula I o es un proceso aparte para la realización de un intermediario de la reacción.

En las reivindicaciones 18 y 26 se menciona una composición y una mezcla pesticida, respectivamente, pero están no se encuentran debidamente sustentadas en la descripción puesto que en sus realizaciones preferidas no se menciona emplear el compuesto de fórmula I combinado con algún otro compuesto activo o material portador. El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción

En las reivindicaciones 18 y 26 se menciona una composición y una mezcla pesticida, respectivamente, pero no se menciona la proporción de los componentes, se recuerda al solicitante que una mezcla o composición está definida por sus componentes y proporciones.

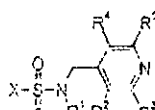
7. Determinación del Estado de la Técnica

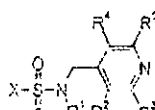
El Estado de la Técnica se determinó con base en la Fecha de Presentación de la Solicitud de Prioridad: Septiembre 12 de 2006 y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

Item	Documento	Título	Fecha de Publicación*
D1	CO 0624528	Derivados de 4-pirilmetil sulfonamida como agentes fungicidas para protección de plantas	10/03/2006*
D2	CA2537486	4-piridinylmethylsulphonamide derivatives as fungicidal plant protection agents	14/Abril/2005

*Este documento corresponde a la publicación internacional WO2005/033081 con fecha de prioridad del 18-09-2003

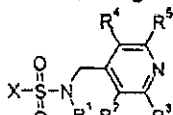
D1

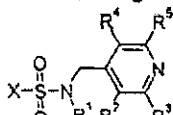


Divulga (anexo) compuestos de sulfonamida de fórmula I , donde X es un anillo de 5 miembros con un heteroátomo, O, S, N, sustituido por R^a, entre otros; R¹, es hidrógeno, metilo, entre otros; R², R³, R⁴ y R⁵ significan hidrógeno, metilo entre otros; además estos compuestos son empleados para combatir hongos nocivos fitopatógenos, además del procedimiento para prepararlos.

D2

http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20050414&CC=CA&NR=2537486A1&KC=A1 divulga (página 1 y página 2, renglones 1 – 9; página 20, renglones 14 – 19 y 25 – 38; página 21, renglones 1 – 24)

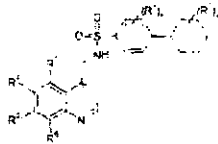


compuestos de fórmula I son , donde sus sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵, están definidos y composiciones que pueden ser usadas como fungicidas, también junto con otros compuestos activos, tales como herbicidas, insecticidas, reguladores de crecimiento, mezclando estos compuestos con los compuestos de fórmula I, donde estos compuestos activos pueden ser derivados de amina, azoles, dicarboximidas, fenil pirroles, entre otros.

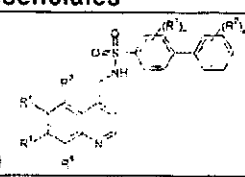
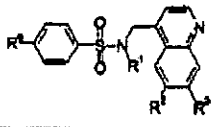
8. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

Novedad (Art 16 D486)

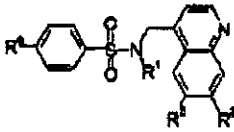
La **reivindicación 1** consiste en "Compuestos de quinolina de fórmula (I)



" , donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, m y n están debidamente definidos (folios 272 – 273).

Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:	
Características esenciales	D1
 Compuestos de la fórmula (I)	Compuestos de la fórmula IA.4' 
R ¹ , R ² : halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , entre otros	R ^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, , 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-isopropil-fenilo, entre otros
m: 0, 1, 2, 3, 4 ó 5	
n: 1 ó 2	
R ³ , R ⁴ , R ⁵ , R ⁶ : independientemente, H, halógeno, hidroxilo, haloalcoxi C ₁ -C ₆ , entre otros	R ² y R ³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi,
H	R ¹ es hidrógeno o metilo
Sus N-óxidos y sus sales	Sus N-óxidos y sus sales

Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1º, las características **esenciales** de los compuestos de fórmula (I) de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual, revela unos compuestos de fórmula IA.4'



, donde R² y R³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi (página 17, folio 305; página 18, renglones 1 – 4, folio 306), R¹ es hidrógeno o metilo y R^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, , 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-isopropil-fenilo, entre otros (página 35 – 41, folios 307 – 313).

En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

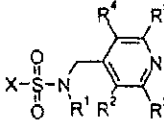
Las reivindicaciones dependientes 2 – 11 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.

La **reivindicación 26** consiste en "Mezclas pesticidas sinérgicas, que comprenden un compuesto de la fórmula (1) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales como se define en las reivindicaciones 1 a 13 y un pesticida seleccionado de organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento, neonicotinoides, compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico..." (folios 279 – 280)

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D2
Mezclas pesticidas sinérgicas que comprenden: un compuesto de la fórmula (I) y/o uno de sus N-óxidos o una de sus sales	Composiciones que comprenden Compuestos de fórmula (I)
un pesticida seleccionado de organo(tio)fosfatos, carbamatos, piretroides, reguladores del crecimiento, neonicotinoides, compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico, entre otros	Junto con fungicidas, herbicidas, insecticidas, reguladores de crecimiento

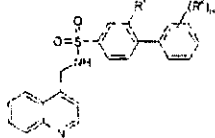
Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1º, las características **esenciales** de la composición de la reivindicación 26 habían sido divulgadas previamente en D2, el cual da a conocer composiciones que pueden ser usadas como fungicidas, también junto con otros compuestos activos, tales como herbicidas, insecticidas, reguladores de crecimiento, mezclando estos compuestos con los compuestos de fórmula I (página 20, renglones 14 – 19), donde estos compuestos activos pueden ser derivados de amina, azoles, dicarboximidas, fenil pirroles, entre otros (página 20, renglones 25 – 38; página 21, renglones 1 – 24); donde los compuestos de

fórmula I son , y sus sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵, están definidos (página 1 y página 2, renglones 1 – 9)

En consecuencia, la reivindicación 26 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D2.

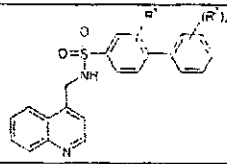
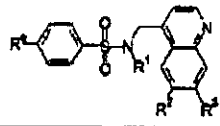
Nivel Inventivo (Art18 D486)

La **reivindicación 12** consiste en “Compuestos de quinolina de fórmula (I)

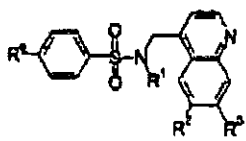


denominados como compuestos de quinolina de fórmula (I.1.a)”, donde R¹, R², m y n están debidamente definidos (folios 272 – 273).

Comparación de las características técnicas **esenciales**, con las del Estado de la Técnica:

Características esenciales	D1
Compuestos de la fórmula (I) 	Compuestos de la fórmula IA.4' 
R ¹ : halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , entre otros	H
R ² : halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , entre otros	R ^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-isopropil-fenilo, entre otros
m: 0, 1, 2, 3, 4 ó 5	R ² y R ³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi,
H	R ¹ es hidrógeno o metilo
H	

Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1º, el documento D1 considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 12 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual, revela unos compuestos de fórmula Expediente 09 025 822 1er Art 45



IA.4' , donde R² y R³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi (página 17, folio 305; página 18, renglones 1 – 4, folio 306), R¹ es hidrógeno o metilo y R^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, , 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-isopropil-fenilo, entre otros (página 35 – 41, folios 307 – 313).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 12 y los compuestos revelados en el documento D1 consiste en el radical R¹ en posición meta respecto a la sulfonamida, que para la presente invención corresponde a halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, entre otros, mientras que para el documento D1 en esa posición se encuentra un hidrogeno.

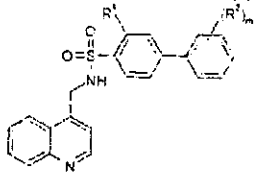
No existe evidencia que las diferencias estructurales entre el compuesto de D1 y el compuesto de la reivindicación 12 introduzcan un efecto técnico inesperado, que represente para la persona de nivel medio versada en la materia una mejor eficiencia en su actividad pesticida.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a los compuestos de fórmula IA.4' conocidos según D1 para que sea más eficiente su actividad pesticida y que muestre un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de diferentes plagas animales, en especial contra la dificultad de controlar insectos, arácnidos y nematodos.

Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivara de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 12 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1, toda vez que estos se limitan a variaciones en un sustituyente de los compuestos revelados en dicho documento, sin que ese hecho confiera una mayor actividad como pesticida a los mismos.

Conclusión:
La reivindicación 12 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

La **reivindicación 13** consiste en "Compuestos de quinolina de fórmula (I)

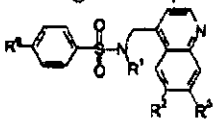


denominados como compuestos de quinolina de fórmula (I.2.a) " donde R¹, R², m y n están debidamente definidos (folios 272 – 273).

Comparación de las características técnicas esenciales , con las del Estado de la Técnica:	
Características esenciales	D1
Compuestos de la fórmula (I) 	Compuestos de la fórmula IA.4'
R ¹ , R ² : halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C ₁ -C ₆ , haloalquilo C ₁ -C ₆ , entre otros	R ^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-

m: 0, 1, 2, 3, 4 ó 5	isopropil-fenilo, entre otros
H	R ² y R ³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi,
H	R ¹ es hidrógeno o metilo

Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1º, el documento D1 considerado el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 12 habian sido divulgadas previamente en D1, el cual, revela unos compuestos de fórmula



IA.4', donde R² y R³ significan, hidrógeno, metilo, flúor, cloro, metoxi, trifluorometoxi (página 17, folio 305; página 18, renglones 1 – 4, folio 306), R¹ es hidrógeno o metilo y R^a significa fenilo, 4-terc-butilfenilo, 4-cloro-fenilo, 4-metil-fenilo, 4-metoxi-fenilo, , 4-trifluorometoxi-fenilo, 4-isopropil-fenilo, entre otros (página 35 – 41, folios 307 – 313).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 13 y los compuestos revelados en el documento D1 consiste en el radical R¹ en posición orto respecto a la sulfonamida, que para la presente invención corresponde a halógeno, hidroxí, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, entre otros, mientras que para el documento D1 en esa posición se encuentra un hidrogeno.

No existe evidencia que las diferencias estructurales entre el compuesto de D1 y el compuesto de la reivindicación 12 introduzcan un efecto técnico inesperado, que represente para la persona de nivel medio versada en la materia una mejor eficiencia en su actividad pesticida.

Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a los compuestos de fórmula IA.4' conocidos según D1 para que sea más eficiente su actividad pesticida y que muestre un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de diferentes plagas animales, en especial contra la dificultad de controlar insectos, arácnidos y nematodos.

Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivara de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 13 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1, toda vez que estos se limitan a variaciones en un sustituyente de los compuestos revelados en dicho documento, sin que ese hecho confiera una mayor actividad como pesticida a los mismos.

Conclusión:
La reivindicación 12 cumple el requisito de novedad (Art. 16), pero no cumplen con el requisito de nivel inventivo (Art. 18).

9. Conclusión

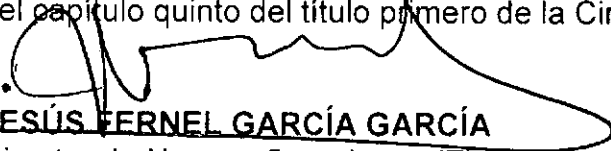
Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

Ítem	Documento	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	CO0624528	1 – 11 / 12 y 13	Novedad / Nivel Inventivo
D2	CA2537486	26	Novedad

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 (60) 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.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante y presentarla por escrito

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 No. 10 de 2001.



JESÚS FERNEL GARCÍA GARCÍA
Director de Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha
18 JUN. 2012

Elaborado por: Jhonattan Sánchez Sánchez
Revisado por: Ana Delia Pinzón García.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

06-24528

54. TÍTULO

DERIVADOS DE 4-PIRIDILMETIL SULFONAMIDA COMO AGENTES
FUNGICIDAS PARA PROTECCION DE PLANTAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

Ludwigshafen, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén.

22. BOGOTÁ, D. C.,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Edificación : 6524383 INMUEBLES

Folios : 121

Fecha : 2006-10-11 17:17:35

Trámite : 211 PCT-PATENT 209 FASE NACI 411 PRESENTA

Superintendencia : 2826 DIVISION DE TERCERAS EXCEPCIONES

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

SOLICITUD DE:

☒ Patente de Invención.
☐ Capítulo I.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☒ Capítulo II.

2
SOLICITANTE
(71)

Nombre: BASF AKTIENGESELLSCHAFT
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de: República Federal de Alemania
Dirección: 67058 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania
Domicilio: Ludwigshafen,
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.G. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número _____

3
**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: EMILIO FERRERO
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-38
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@camva.com
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.G. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número 439.018 T.P. \$1.928

4
INVENTOR (ES)
(72)

- | | |
|--|---|
| 1. Wassilios GRAMMENOS
Alexander-Fleming-Strasse. 13,
67071 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania | 9. Frank SCHIEWECK
Lindenweg 4,
67258 Hessheim,
República Federal de Alemania |
| 2. Carsten BLEYNER
Richard-Wagner-Strasse. 46,
68166 Mannheim,
República Federal de Alemania | 10. Anja SCHWÖGLER
Heinrich-Lanz-Strasse. 3,
68166 Mannheim
República Federal de Alemania |
| 3. Bernd MÜLLER
Stockingerstrasse. 7,
67227 Frankenthal,
República Federal de Alemania | 11. Oliver WAGNER
Im Meisental 50,
67433 Neustadt
República federal de Alemania |
| 4. Markus GEWEHR
Goethestrasse. 21,
66288 Kastellaun,
República Federal de Alemania | 12. Norbert GÖZT
Stöckerstr. 25,
67547 Worms,
República Federal de Alemania |
| 5. Jordi TORMO I BLASCO
Carl-Benz-Strasse. 10-3,
68514 Laudenbach,
República Federal de Alemania | 13. Siegfried STRATHMANN
Donnersbergstrasse. 9,
67117 Limburgerhof
República Federal de Alemania |
| 6. Thomas GROTE
Im Köhnhausen 18,
67167 Wachenheim,
República Federal de Alemania | 14. Ulrich SCHÖFL
Erlenstr. 5,
68782 Brühl,
República Federal de Alemania |
| 7. Joachim RHEINHEIMER
Merziger Strasse. 24,
67063 Ludwigshafen,
República Federal de Alemania | 15. Maria SCHERER
Hermann-Jürgens-Strasse. 30,
75829 Godesmarien
República Federal de Alemania |

CAVELIER ABOGADOS

CCLO 00361-841-081-9

ID-43901WPCLO881

2

8. Peter SCHÄFER Römerstrasse. 1, 67308 Ottersheim República Federal de Alemania		16. Reinhard STIERL Jahnstrasse.8, 67261 Freinsheim, República Federal de Alemania	
5 PCT (88) Solicitud Internacional No <u>PCT/EP2004/010124</u> Fecha: <u>10/09/2004</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2005/033081 A1</u> Fecha: <u>14/04/2005</u>			
6 TÍTULO (54) <u>DERIVADOS DE 4-PIRIDINIUMETILSULFONAMIDA COMO AGENTES FUNGICIDAS PARA PROTECCIÓN DE PLANTAS</u>			
7 Clasificación Internacional (81) <u>C07D 213/42</u>			
8 Prioridad SI ☒ NO ☐		(33) País de Origen <u>EP</u>	(32) Fecha <u>18 de septiembre de 2003</u>
		(31) Número de Solicitud <u>03021098.3</u>	
9 Comprobante de pago No.: <u>06 - 17.858</u> Fecha: <u>06 de marzo de 2006</u>			
10 Anexos:			
☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 483.000.00. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☒ Poderes, si fuere el caso. ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso. ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS			

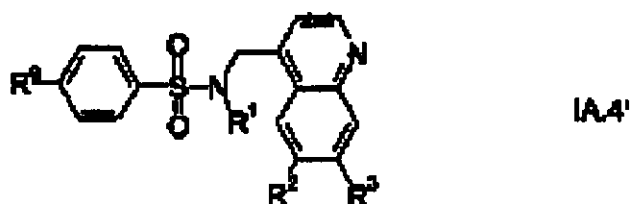
PF 54897

~~86~~
86

17

Tabla 17

Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa hidrógeno y la combinación de R¹ y R² equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A



5

Tabla 18

Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa metilo y la combinación de R¹ y R² equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

10

Tabla 19

Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa fluoro y la combinación de R¹ y R² equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15 Tabla 20

Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa cloro y la combinación de R¹ y R² equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 21

20 Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa metoxi y la combinación de R¹ y R² equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

PF 54897

87

18

Tabla 22

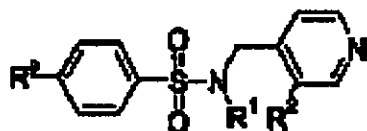
Compuestos de la fórmula IA.4', en los que R² y R³ significa trifluorometoxi y la combinación de R¹ y R⁴ equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

A

5

Tabla 23

Compuestos de la fórmula IA.5, en los que R² significa metilo y la combinación de R¹ y R³ equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A



IA.5

10

Tabla 24

Compuestos de la fórmula IA.5, en los que R² significa fluoro y la combinación de R¹ y R³ equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

15 Tabla 25

Compuestos de la fórmula IA.5, en los que R² significa cloro y la combinación de R¹ y R³ equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

Tabla 26

20 Compuestos de la fórmula IA.5, en los que R² significa metoxi y la combinación de R¹ y R³ equivale a un compuesto de una línea respectivamente de la Tabla A

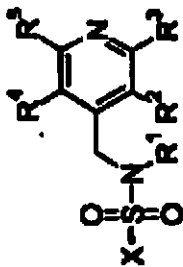


Tabla I

No.	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos (p.f. [°C]); ¹H-NMR δ [ppm]; MS m/e [M+H ⁺]
I-1	4-(C(CH₃)₂=NOCH₃)-C₆H₄	H	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,0 (3H); 2,25 (3H)
I-2	4-(C(CH₃)₂=NOCH₂CH₃)-C₆H₄	H	H	H	H	H	4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,25 (3H); 1,3 (3H)
I-3	4-(C(CH₃)₂=NOCH₂CH=CH₂)-C₆H₄	H	H	H	H	H	5,2 (2H); 4,7 (2H); 4,05 (2H); 2,25 (3H)
I-4	4-(C(CH₃)₂=NOCH(CH₃)₂)-C₆H₄	H	H	H	H	H	4,45 (1H); 4,2 (2H); 2,25 (3H); 1,3 (3H)
I-5	4-(C(CH₃)₂=NOCH₂C≡CH)-C₆H₄	H	H	H	H	H	4,8 (2H); 4,2 (2H); 2,5 (1H); 2,3 (3H)
I-6	4-(C(CH₃)₂=NO(CH₂)₅CH₃)-C₆H₄	H	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,1 (2H); 2,25 (3H); 0,9 (3H)

[Handwritten signature]

03171

Nº.	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos finales (p.f. [°C]): 1H-NMR δ [ppm]: MS m/e [M+H ⁺]
I-7	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ C ₆ H ₅)-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	5,3 (2H); 4,25 (2H); 2,25 (3H)
I-8	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂)-C ₆ H ₄	CH ₃	H	H	H	H	4,2 (2H); 4,05 (3H); 2,65 (3H); 2,25 (3H)
I-9	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₂)-C ₆ H ₄	CH ₃	H	H	H	H	4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,7 (3H); 1,35 (3H)
I-10	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₂)-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	4,3 (2H); 4,2 (2H); 3,2 (2H); 2,2 (3H); 1,3 (3H); 0,9 (3H)
I-11	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₂)-C ₆ H ₄	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	4,35 (2H); 4,25 (2H); 4,0 (2H); 2,25 (1H)
I-12	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₂)-C ₆ H ₄	C ₆ H ₅ CH ₂	H	H	H	H	4,3 (2H); 4,25 (2H); 4,2 (2H); 2,26 (3H)
I-13	4-(C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₂)-C ₆ H ₄	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	H	5,5 (1H); 5,0 (2H); 4,3 (2H); 3,75 (2H)
I-14	4-COOCH ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	8,45 (1H); 8,0 (1H); 7,4 (1H); 4,5 (2H)

106

106

- 0 3 1 8

No.	X	R ¹	R ²	R ²	R ³	R ⁴	Datos Espectro (p.p.m. [°C]): 1H-NMR 0 [ppm]: MS m/e [M+H] ⁺
I-15	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	8,1 (1H); 7,3 (1H); 4,85 (2H); 1,3 (3H)
I-16	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	8,1 (1H); 4,8 (1H); 3,0 (1H); 1,3 (3H)
I-17	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 339
I-18	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 367
I-19	1-naftilo	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 348
I-20	2-CH ₃ -8-CF ₃ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 381
I-21	2-Cl-5-OCH ₃ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 363
I-22	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 367
I-23	4-CN-C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 324
I-24	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 367
I-25	2-Br-C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 379
I-26	2,3-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 367
I-27	3,4-(OCH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 358
I-28	2-CH ₃ -6-Cl-C ₆ H ₃	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	m/e 347

No.	X	R ¹	R ²	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos (p.f. °C): 'H-NMR δ [ppm]: MS m/e [M+H ⁺])
I-29	2-Cl-C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	m/e 333 8,45 (1H); 8,0 (1H); 7,4 (1H); 4,6 (2H)
I-30	C ₆ H ₅	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 7,3 (1H); 4,65 (2H); 1,3 (3H)
I-31	4-Cl(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,1 (1H); 4,6 (1H); 3,0 (1H); 1,3 (3H)
I-32	4-CH(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,75 (1H); 8,0 (1H); 5,8 (1H); 4,7 (2H)
I-33	4-OCF ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,8 (1H); 4,7 (2H)
I-34	4-OCF ₂ CHF ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	8,8 (1H); 7,3 (1H); 4,6 (2H); 2,6 (3H)
I-35	4-COOCH ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	6,2 (NH); 4,6 (2H); 4,0 (3H); 2,2 (3H)
I-36	4-(ClCH ₂)=NOCH ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	6,0 (NH); 4,6 (2H); 4,3 (3H); 2,3 (3H); 1,35 (3H)
I-37	4-(ClCH ₂)=NOCH ₂ CH ₃ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	6,1 (NH); 4,6 (2H); 4,6 (3H); 2,25 (3H); 1,3 (3H)
I-38	4-(ClCH ₂)=NOCH(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	

No.	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos (p. 1. °C): 1H-NMR δ [ppm]; MS m/e [M+H] ⁺
I-39	4-(ClCH ₂)=NOCH ₂ CH=CH ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-		H	H	5,3 (NH); 5,2 (2H); 4,75 (2H); 4,6 (2H); 2,35 (3H)
I-40	4-(ClCH ₂)=NOCH ₂ CH=CH ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-		H	H	5,1 (NH); 4,6 (2H); 4,6 (2H); 2,5 (2H); 2,3 (3H)
I-41	4-(ClCH ₂)=NOCH ₂ CH=CH ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-		H	H	5,2 (NH); 4,6 (2H); 4,2 (2H); 2,26 (2H); 0,9 (3H)
I-42	4-(ClCH ₂)=NOCH ₂ CH=CH ₂ -C ₆ H ₄	H	-CH=CH-CH=CH-		H	H	5,3 (2H); 5,2 (NH); 4,8 (2H); 2,3 (3H)
I-43	C ₆ H ₆	CH ₃	-CH=CH-CH=CH-		H	H	4,6 (2H); 2,7 (3H)
I-44	5-Cl-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	m/e 338
I-45	tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	m/e 306
I-46	5-(4-C(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₄)-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	166
I-47	5-Br-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	148
I-48	4-NO ₂ -5-Cl-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	182
I-49	5-Cl-1,3-(CH ₃) ₂ -1H-pirazol-4-ilo	H	H	H	H	H	147
I-50	3-Br-2,5-Cl ₂ -tiofen-4-ilo	H	H	H	H	H	186
I-51	1-CH ₃ -1H-imidazol-4-ilo	H	H	H	H	H	126

No.	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos Nucleos (a.t. [°C]): 1H-NMR δ [ppm]; MS m/e [M+H ⁺]
I-52	5-(4-tert.-butilfenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	186
I-53	5-cloro-1,8-dimetil-1H-pirazol-4-il	H	H	H	H	H	147
I-54	5-bromo-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	148
I-55	5-cloro-4-nitro-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	182
I-56	1-metil-1H-imidazol-4-il	H	H	H	H	H	126
I-57	4-bromo-2,5-dicloro-tiofen-3-il	H	H	H	H	H	106
I-58	6-bifenil-4-il-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	204
I-59	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	138
I-60	5-(4-propil-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	144
I-61	5-(4-etil-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	144
I-62	5-(3-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	130
I-63	5-(4-cloro-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	176
I-64	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-il	H	H	H	H	H	165

110

Handwritten signature

0322

No.	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Datos físicos (p.t. [°C]: 'H-NMR δ [ppm]; MS m/e [M+H ⁺])
I-65	5-(4-metoxi-fenil)-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	175
I-66	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-ilo	propargilo	H	H	H	H	116
I-67	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-ilo	n-propil	H	H	H	H	97
I-68	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-ilo	metilo	H	H	H	H	101
I-69	5-(4-isopropil-fenil)-tiofen-2-ilo	H	H	H	H	H	125
I-70	5-bromo-tiofen-2-ilo	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	137
I-71	5-(4-trifluorometil-fenil)-tiofen-2-ilo	H	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	180
I-72	4-terc.butil-fenilo	metilo	-CH=CH-CH=CH-	-CH=CH-CH=CH-	H	H	145-148