

Señor Director

DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

E. S. D.

DC
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-130271- -00005-0000

Fecha: 2015-10-13 17:01:33 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra: 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act: 523 RESPUESTA Folios: 24

Referencia : Expediente No. 14130271
Asunto : Solicitud de patente para "COMPUESTOS DE ISOTIAZOLINA
PARA COMBATIR PLAGAS DE INVERTEBRADOS"
Solicitante : BASF SE
Fecha de solicitud : 16 de Junio 2014

1. Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad solicitante de la patente de la referencia, me refiero al oficio No. 5992 notificado por fijación en lista el 02 de junio de 2015.

2. Mediante oficio No. 5992 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Las observaciones realizadas en el oficio se refieren a la claridad de la reivindicaciones 1, 42 a 52, 53 y 54, y el nivel inventivo de las reivindicaciones 1, 2 a 41, 53 y 54 en vista de los documentos D1: WO2011092287A1 y D2: WO2010072781.

3. Respuesta a las objeciones

De este modo y con el objeto de atender las objeciones arriba mencionadas, se desea presentar las siguientes modificaciones, aclaraciones y argumentos:

3.1 Modificación de una solicitud en trámite

De acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, 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, me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio conformado por 27 reivindicaciones.

En este nuevo pliego reivindicatorio se han limitado de forma significativa las definiciones de los radicales de conformidad con los ejemplos incluidos en la descripción tal como fue originalmente presentada, con el fin de hacer claridad sobre la materia que se solicita proteger y el alcance de la misma. En particular,

Frente a la objeción respecto al término “anillo heterociclo”, se pone de presente que éste ha sido reemplazado por la definición específica soportada en la descripción.

Por otra parte, las reivindicaciones 3-12, 14-23, 25-29, 31, 32, 34, 36, 39, 40 y 55-61 han sido eliminadas. De modo que las objeciones formuladas a las mismas se deben tener por superadas.

En la nueva reivindicación 1, A⁴ ha sido definida como 1,2,4-triazol-1-il con base en lo descrito en el ejemplo C4.

En las reivindicaciones enmendadas 15 a 25 (reivindicaciones originales 42 a 52) se introdujeron condiciones de reacción e información adicional acerca de los métodos generales de síntesis divulgados en la descripción. Sin embargo, no se indicó si A' es un precursor de A o es convertido en A toda vez que dichos radicales se encuentra definidos de forma clara y precisa en la

descripción de la presente solicitud y por lo tanto, el alcance del pliego reivindicatorio también se encuentra claramente definido. Lo anterior, si se tiene en cuenta que de conformidad con lo señalado en el artículo 51 de la Decisión 486 la descripción de una solicitud sirve para interpretar las reivindicaciones: *"El alcance de la protección conferida por la patente estará determinado por el tenor de las reivindicaciones. La descripción y los dibujos, o en su caso, el material biológico depositado, servirán para interpretarlas"*. De modo que, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

Finalmente, las nuevas reivindicaciones 26 y 27 (antes reivindicaciones 53 y 54) fueron corregidas de manera que se limitan los componentes de la composición agrícola a un grupo reducido de compuestos y se establece el rango de cantidad en función del peso de la composición. Así entonces, teniendo en cuenta que dichas reivindicaciones fueron modificadas de acuerdo con las sugerencias del Examinador, es claro que la objeción formulada a este respecto se tiene por superada.

Por lo anterior, las objeciones formuladas por el Examinador en cuanto a la claridad y concisión del pliego reivindicatorio se ven superadas. En consecuencia, se solicita atentamente tener en cuenta este nuevo pliego reivindicatorio y título para el nuevo análisis de patentabilidad.

3.2 Argumentos a favor del nivel inventivo de la presente solicitud

El artículo 18 de la Decisión 486 señala lo siguiente:

"Artículo 18.- Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

Consecuentemente, una invención se considerará inventiva si la misma no hubiese resultado obvia a partir del arte previo, para una persona del oficio normalmente versada en la materia. Esto a su vez implica que el Examinador a cargo de esta evaluación debe colocarse en el momento exacto

CAVELIER

A B O G A D O S

en el que el inventor buscaba resolver el problema técnico contemplado en la solicitud y para el cual poseía la literatura y el conocimiento disponibles en dicho momento.

Siguiendo entonces los lineamientos de la Jurisprudencia aplicable al análisis del nivel inventivo de una solicitud de patente, se considera que una anterioridad o una combinación de dos anterioridades puede afectar dicho requerimiento de patentabilidad, si una persona medianamente versada en la materia encuentra enseñanzas o sugerencias claras que, a partir de un conocimiento medio en dicho campo, le permitan llegar de manera obvia a la invención reivindicada. Adicionalmente se considera que una mejora sustancial, un efecto inesperado o una ventaja con respecto al arte previo es un indicio de nivel inventivo, por cuanto aporta un salto tecnológico en la regla técnica.

Respecto a lo anterior, el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha expuesto en la Interpretación Prejudicial del proceso 13-IP-2010:

"En este orden de ideas, se puede concluir que una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no es consecuencia clara y directa de dicho estado".

[señalado fuera del texto]

En consecuencia, se entiende que para que una persona medianamente versada en la materia pudiera derivar de manera obvia una invención, requeriría simplemente aplicar sus conocimientos técnicos. En contraste, todo aquello que va más allá de la simple aplicación de los conocimientos técnicos y que no ha sido revelado en el estado de la técnica, debe ser considerado inventivo.

Con base en lo anterior, respetuosamente manifestamos nuestro desacuerdo con el análisis llevado a cabo por el Examinador y con las conclusiones del mismo y solicitamos atentamente la

reconsideración de las razones por las cuales se objeta el nivel inventivo, con base en la siguiente información:

La presente invención se refiere a compuestos de isotiazolina que son útiles para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de artrópodos y nematodos, y a un método para producirlos. Tal como se señala en la descripción de la presente solicitud, las plagas de invertebrados y, en particular, los artrópodos y nematodos destruyen cultivos en crecimiento y cosechados, y atacan viviendas y estructuras comerciales de madera, lo que causa grandes pérdidas económicas al suministro alimenticio y a la propiedad. Si bien se conocen varios agentes plaguicidas, debido a la capacidad de las plagas blanco de desarrollar resistencia a dichos agentes, hay una continua necesidad de hallar nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados, en particular, insectos, arácnidos y nematodos. En particular, existe la necesidad de proporcionar (i) compuestos que tengan buena actividad plaguicida, en particular actividad insecticida, y que muestren un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de plagas de invertebrados diferentes, en especial, contra las plagas de artrópodos y/o nematodos difíciles de controlar y además, (ii) que sean menos persistentes, bioacumulativos y/o tóxicos que los compuestos del estado de la técnica toda vez que en especial, los insecticidas de isoxazolina muestran una gran persistencia en el suelo y, por ello, se acumulan allí.

Ahora bien, de acuerdo con lo señalado por el Examinador, D1 (WO 2011/092287) está relacionado con compuestos ceto. En contraste, los compuestos indicados en la presente solicitud son amidas (donde A es A^2 y Y es $N(R^5)R^6$; el otro significado de A es estructuralmente muy distinto. El centro del anillo está principalmente conformado por un anillo isotiazolina (si X es S). Sin embargo esto no significa que sea el único preferido (por ejemplo como se indica en la reivindicación 4 o en la página 19, línea 7 o página 20, línea 1; X= O es el único significado preferido para este grupo); ver los ejemplos, donde solo isoxazolininas (X= O) son utilizadas.

El examinador considera que las reivindicaciones carecen de nivel inventivo, argumentando que los compuestos reclamados no presentan una ventaja técnica en la actividad pesticida frente a los compuestos revelados en los documentos citados. A este respecto, vale la pena resaltar que el

CAVELIER ABOGADOS

"INSTRUCTIVO EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTES DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD" de su Despacho señala lo siguiente en el apartado 3.2.4 en relación con el nivel inventivo de un compuesto:

"Cuando un compuesto es nuevo dado que su estructura no es similar a la de un compuesto conocido, y tiene un cierto uso o efecto, el examinador puede considerar que tiene nivel inventivo, sin requerir que el efecto sea un efecto sorprendente".

De modo que, teniendo en cuenta que los documentos citados D1 y D2 por si solos o combinados no enseñan compuestos estructuralmente similares a los acá recitados toda vez no enseñan o sugieren un sustituyente "A" tal como se define en la reivindicación 1, es claro que se debe reconocer el nivel inventivo del compuesto acá reivindicado. Adicionalmente, se pone de presente que no existe enseñanza o sugerencia alguna en dichos documentos que motive a una persona versada en la materia a realizar dicha modificación con el fin de obtener compuestos para combatir o controlar plagas (i) que tengan buena actividad plaguicida, en particular actividad insecticida, y que muestren un amplio espectro de actividad contra una gran cantidad de plagas de invertebrados diferentes, en especial, contra las plagas de artrópodos y/o nematodos difíciles de controlar y además, (ii) que sean menos persistentes, bioacumulativos y/o tóxicos que los compuestos del estado de la técnica.

Es importante resaltar que de acuerdo a los principios generales en la práctica, una actividad superior solo puede ser probada si la estructura reivindicada es *per se* una variación obvia de las estructuras del estado de la técnica. Sin embargo, ese no es el presente caso. Los grupos amido y ceto son química y biológicamente diferentes en todo sentido. Por ejemplo, los grupos amida pueden ser hidrolizado por grupos carboxílicos bajo condiciones suaves, mientras que la transformación de los grupos ceto en otros grupos funcionales requiere condiciones drásticas de reacción, ya que implica la ruptura de un enlace C-C. *In vivo*, los grupos amida y los grupos ceto son metabolizados por caminos completamente diferentes. Además, el grupo ceto es un elemento obligatorio en los compuestos de D1, lo que significa que a este grupo se le atribuye un roll importante en la actividad biológica de los compuestos.

Por lo tanto, una persona versada en la materia, no encontraría motivación alguna para reemplazar el grupo ceto obligatorio $-C(O)-C(R^1)(R^2)-(G)_m$ por un grupo amido $-C-(O)-N(R^5)R^6$, así como esperaría pérdida de actividad. Ninguna persona versada en la materia habría estado motivada a usar una isotiazolina como un anillo intermedio en vez de usar un anillo que claramente favorecería, como la isoxazolina, en donde, por tanto esperaría disminución de la actividad.

Con respecto a los compuestos en donde A es A^2 y Y es H o OR^9 , estos son compuestos intermedios en la preparación de compuestos amida (I) donde A es A^2 y Y es $N(R^5)R^6$. El documento D1 no podría ninguna idea para utilizar dichos compuestos en la síntesis de los presentes compuestos amida.

Los compuestos D2 (WO 2010/072781) difieren de los compuestos reclamados en la presente solicitud en que tienen un anillo centrado isoxazolina y no isotiazolina. Esta referencia no sugiere de ninguna manera el reemplazo del anillo obligatorio isoxazolina por un anillo isotiazolina.

Los inventores de la presenta aplicación encuentran que las isotiazolinas tienen una distintiva vida media corta en comparación con el análogo isoxazolininas y por lo tanto son menos persistentes (revisar página 184, líneas 4-6 en la descripción en Inglés). Esta ventaja no podría ser predicha a partir del documento D2, donde está completamente ausente esta propiedad.

La materia que se desea proteger en las reivindicaciones no es obviamente derivada a partir de los conocimientos mostrados en los documentos D1 y D2. El documento D1 menciona la isotiazolina como anillo central, pero claramente favorece a la isoxazolina. Por tanto, una persona normalmente versada en la materia no podría presentar ningún interés en reemplazar los compuestos mostrados en D1 con un anillo central isotiazolina, esperando pérdida en la actividad. De manera sorprendente, por el contrario, los compuestos presentados en esta solicitud de patente tienen una alta actividad insecticida. Más aún, debido al anillo isotiazol, los compuestos de la presente invención tienen una distintiva vida media más corta que su análogo isoxazolina. Esta ventaja no era posible predecirla a partir del estado de la técnica.

Adicionalmente, en los argumentos arriba presentados se pueden identificar claramente un indicio de presencia de nivel inventivo de acuerdo con el numeral 2.13.5.3.1 de la "GUÍA PARA EXAMEN DE SOLICITUDES DE PATENTE DE INVENCION Y MODELO DE UTILIDAD" de su despacho:

Efecto técnico sorprendente, ya que se conserva la integridad estructural a pesar de que se utilizan menos elementos de refuerzo y un panel de piso más liviano.

Como consecuencia de lo anterior, la reivindicación independiente 1 es inventiva sobre el estado del arte citado. Consecuentemente, las reivindicaciones dependientes son también inventivas en virtud de su dependencia de la reivindicación 1.

3.3 Conclusión

Por todo lo anterior, consideramos que el Examinador está pasando por alto que una sola diferencia con respecto al estado de la técnica, permite concluir que el objeto reivindicado es nuevo. Además, está excluyendo el hecho de que el inventor en el momento de solucionar el problema técnico de la solicitud tuvo que emplear habilidad inventiva, pues la presente invención no resulta de la mera extrapolación de las enseñanzas del arte previo, como se afirma. Se está desconociendo el mérito investigativo empleado y que está aportando una ventaja al arte previo.

4. Puesto que se ha dado respuesta a todas las objeciones formuladas por el Examinador, se solicita atentamente proceder al otorgamiento de la solicitud de patente. En este sentido, respetuosamente recordamos al Examinador que la patente no podrá ser negada con base en objeciones diferentes a las expuestas en la acción oficial No. 5992, toda vez que al no haber sido trasladadas a mi representada, dicha decisión violaría tanto el tenor literal del artículo 45 de la Decisión 486 como el derecho constitucional al debido proceso. En este evento, y con base en el inciso 2 del artículo 45, respetuosamente solicitamos al Examinador expedir una nueva acción

oficial que permita a mi representada contra argumentar las mismas o modificar la solicitud con el fin de cumplir los requisitos de patentabilidad.

5. Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 27 reivindicaciones

Señor Director,


LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. No. 23.555

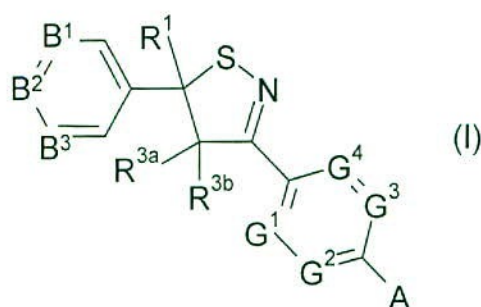
COLO-16452-0841-0123-8

DPG\DPG\ID-283529\WPC16452

No. M-2015-283529\DPG

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de isotiazolina de la Fórmula I



caracterizados porque

A es un grupo A¹, A², A³ o A⁴;
en donde

A¹ es -C(=NR⁶)R⁸, -S(O)_nR⁹ y -N(R⁵)R⁶; donde

R⁶ en -N(R⁵)R⁶ se selecciona de -OR⁹ y -NR¹⁰ᵃR¹⁰ᵇ; en donde

R⁹ es hidrógeno;

R¹⁰ᵃ se selecciona de hidrógeno, C₁-C₆ alquilo y C₁-C₆ haloalquilo; y

R¹⁰ᵇ se selecciona de C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alquilcarbonilo, C₁-C₆ haloalquilcarbonilo, -C(=O)OR¹⁵,

C(=O)N(R¹⁴ᵃ)R¹⁴ᵇ, -C(=S)N(R¹⁴ᵃ)R¹⁴ᵇ, y un anillo

heteroaromático de 6 miembros seleccionado de 2-piridinil,

3-piridinil, 4-piridinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil, 2-pirimidinil, 4-

pirimidinil, 5-pirimidinil y 2-pirazinil;

en donde

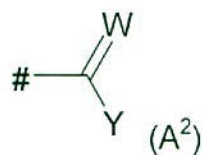
R¹⁴ᵃ es hidrógeno o, C₁-C₆ alquilo;

R¹⁴ᵇ se selecciona de hidrogeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ haloalquenilo, C₂-C₆ alquinilo, C₂-C₆ haloalquinilo, C₃-C₆ cicloalquilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, C₃-C₆ cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆ alcoxilo y C₁-C₆ haloalcoxilo; y

R¹⁵ es C₁-C₆ alquilo; y

R⁸ en -C(=NR⁶)R⁸ es hidrógeno;

A² es un grupo de la siguiente Fórmula:



en donde

indica el enlace al anillo aromático de la Fórmula (I);

W es O;

Y es $-\text{N}(\text{R}^5)\text{R}^6$;

R^5 se selecciona de hidrógeno, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alquilo, $\text{C}_2\text{-C}_3$ alquinilo y $\text{CH}_2\text{-CN}$; y

R^6 se selecciona de $\text{C}_1\text{-C}_6$ alquilo, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalquilo, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alquilo el cual contiene un radical R^8 , $\text{C}_2\text{-C}_6$ alquenilo, $\text{C}_2\text{-C}_{10}$ haloalquenilo, $\text{C}_2\text{-C}_6$ alquinilo, $\text{C}_3\text{-C}_6$ cicloalquilo el cual está no sustituido o sustituido por 1 o 2 sustituyentes seleccionados de F, CN y piridil;

OH, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alcoxi, $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalcoxi, $\text{N}(\text{R}^{10a})\text{R}^{10b}$, en

donde R^{10a} se selecciona de hidrógeno y $\text{C}_1\text{-C}_6$ alquilo

y R^{10b} se selecciona de un anillo heteroaromático de 6

miembros seleccionado de 2-piridinil, 3-piridinil, 4-

piridinil, 3-piridazinil, 4-piridazinil, 2-pirimidinil, 4-

pirimidinil, 5-pirimidinil y 2-pirazinil;

fenil, un anillo heteroaromático saturado de 3-, 4-, 5-,

6- miembros se selecciona de oxiranilo, tiiranilo,

aziridinilo, oxetanilo, tietanilo, 1- oxotietanilo, 1,1-

dioxodietanilo, azetidino, tetrahidrofuran-2-il,

tetrahidrofuran-3-il, tetrahidrotien-2-il, tetrahidrotien-3-

il, pirrolidin-1-il, pirrolidin-2-il, pirrolidin-3-il, pirazolidin-

1-il, pirazolidin-3-il, pirazolidin-4-il, pirazolidin-5-il,

imidazolin-1-il, imidazolin-2-il, imidazolin-4-il,

oxazolidin-2-il, oxazolidin-3-il, oxazolidin-4-il,

oxazolidin-5-il, isoxazolidin-2-il, isoxazolidin-3-il,

isoxazolidin-4-il, isoxazolidin-5-il, tiazolidin-2-il,

tiazolidin-3-il, tiazolidin-4-il, tiazolidin-5-il,

isotiazolidin-2-il, isotiazolidin-3-il, isotiazolidin-4-il,

isotiazolidin-5-il, 1,2,4-oxadiazolidin-3-il, 1,2,4-

oxadiazolidin-5-il, 1,2,4-tiadiazolidin-3-il, 1,2,4-

tiadiazolidin-5-il, 1,2,4-triazolidin-3-il, 1,3,4-oxadiazolidin-2-il, 1,3,4-tiadiazolidin-2-il, 1,3,4-triazolidin-1-il, 1,3,4-triazolidin-2-il, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-il, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-il, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5 hexahidrotriazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotriazin-2-ilo y 1,2,4 hexahidrotriazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, donde el anillo heteromonocíclico está no sustituido o sustituido con uno o más padres sustituyentes R^{11} ; y un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros seleccionado de 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, isoxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo, donde el anillo heteroaromático está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^{11} ;

en donde

cada R^{11} se selecciona independientemente de un grupo consistente en halógeno, C_1-C_4 alquilo y C_1-C_4 haloalquilo; o dos R^{11} presentan el mismo átomo de carbono de un anillo heterocíclico saturado en conjunto con $=O$; y R^8 se selecciona de OH , CN , C_3-C_8 cicloalquilo que no está sustituido o contienen un CN o un sustituyente piridilo, C_3-C_8 -halocicloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi, C_1-C_6 -haloalcoxi,

C_1-C_6 -alquiltio, C_1-C_6 -haloalquiltio, C_1-C_6 -alquilsulfonilo, C_1-C_6 -haloalquilsulfonilo, $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$, fenilo que está sin sustituir o sustituido con 1, 2, 3, 4 ó 5 sustituyentes R^{16} , un grupo 3-, 4-, 5- ó 6 miembros de anillo heteromonocíclico saturado seleccionado de oxiranilo, tiiranilo, aziridinilo, oxetanil, tietanilo, 1-oxotietanil, 1,1-dioxotietanil, azetidínilo, tetrahidrofurano-2-ilo, tetrahidrofurano-3-ilo, dioxolan-2-ilo, tetrahidrotien-2-ilo, tetrahidrotien-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-4-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropiridazin-3-ilo, hexahidropiridazin-4-ilo, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-1-ilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tiomorfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-

dioxotiomorfolin-3-il, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, donde el anillo heteromonocíclico está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^{16} ; y un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros seleccionado de 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, isoxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo, donde el anillo heteroaromático es no sustituido o sustituido con R^{16} ;

en donde

R^{10a} se selecciona de un grupo consistente de hidrógeno y C_1 - C_6 -alquilo;

R^{10b} se selecciona de un grupo consistente de hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_4 -alquínil, CH_2 -CN, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_3 - C_6 cicloalquilo, C_3 - C_6 halocicloalquilo, C_1 - C_4 alcoxi y C_1 - C_4 haloalcoxi, y

cada R^{16} como un sustituyente de fenilo o un heterociclo saturado o un anillo heteroaromático que es independientemente seleccionado de un grupo consistente de un halógeno, ciano, nitro, C_1 - C_4 alquilo, C_1 - C_4 haloalquilo, C_1 - C_4 alcoxi, C_1 - C_4 cicloalcoxi, C_1 - C_4 alquiltio, C_1 - C_4 haloalquiltio, C_1 - C_4 alquilsulfonil y C_1 - C_4 haloalquilsulfonil;

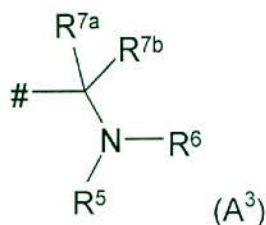
o

R^5 y R^6 , en conjunto con el átomo de nitrógeno, el cual está unido formado un anillo heterocíclico saturado seleccionado de azirid-1-ilo, azetidín-1-ilo, pirrolidín-1-ilo, piperidín-1-ilo, piperidin-1-ilo, morfolín-4-ilo, tiomorfolín-4-ilo, tiazolidín-1-ilo, 1-oxo-1,4-tiazinan-4-il y 1,1-dioxo-1,4-tiazinan-4-ilo;

R^5 y R^6 , en conjunto con un grupo $=S(R^9)_2$, en donde R^9 se selecciona

de C₁-C₆-alquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

A³ es un grupo de la siguiente Fórmula:



en donde

indica el enlace al anillo aromático de la Fórmula (I);

R^{7a} y R^{7b} son hidrógenos;

R⁵ se selecciona de hidrógeno, y C₁-C₄-alquilo; y

R⁶ es -C(=O)R⁸;

en donde

R⁸ se selecciona de un grupo consistente de C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo sustituido por uno radical R¹³, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, -N(R^{10a}) R^{10b}, fenilo que está sin sustituir o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes seleccionados cada uno independientemente de un grupo que consiste en halógeno; y un anillo heterocíclico seleccionado del oxiranilo, tiiranilo, aziridinilo, oxetanilo, tietanilo, 1-oxotietanil, 1,1-dioxotietanil, azetidinilo, tetrahidrofurano-2-ilo, tetrahidrofuran-3-ilo, dioxolan-2-ilo, tetrahidrotien-2-ilo, tetrahidrotien-3-ilo, pirrolidin-1-ilo, pirrolidin-2-ilo, pirrolidin-3-ilo, pirazolidin-1-ilo, pirazolidin-3-ilo, pirazolidin-4-ilo, pirazolidin-5-ilo, imidazolidin-1-ilo, imidazolidin-2-ilo, imidazolidin-4-ilo, oxazolidin-2-ilo, oxazolidin-3-ilo, oxazolidin-4-ilo, oxazolidin-5-ilo, isoxazolidin-2-ilo, isoxazolidin-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, isoxazolidin-5-ilo, tiazolidin-2-ilo, tiazolidin-3-ilo, tiazolidin-4-ilo, tiazolidin-5-ilo, isotiazolidin-2-ilo, isotiazolidin-3-ilo, isotiazolidin-4-ilo, isotiazolidin-5-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-1-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxano -2-ilo, piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, hexahidropyridazin-3-ilo, hexahidropyridazin-

4-il, hexahidropirimidin-2-ilo, hexahidropirimidin-4-ilo, hexahidropirimidin-5-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, 1,3,5 hexahydrotriazin-1-ilo, 1,3,5-hexahydrotriazin 2-ilo y 1,2,4 hexahydrotriazin-3-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, morfolin-4-ilo, tio-morfolin-2-ilo, tiomorfolin-3-ilo, tiomorfolin-4-ilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin 3-ilo, 1-oxotiomorfolin-4-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-4-ilo, 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, isoxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo,

en donde

R^{10a} y R^{10b} , independiente uno del otro, se seleccionan de hidrógeno y C_1 - C_4 -alquilo; y

R^{13} se selecciona de C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -cicloalquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfonil y C_1 - C_6 -haloalquilsulfonil;

A^4 es un anillo heteroaromático seleccionado de 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 1-pirrolilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 1-pirazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 1-imidazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo;

B^1 , B^2 y B^3 se seleccionan, cada uno independientemente CR^2

G^1 , G^2 , G^3 y G^4 son CR^4 ; o G^1 , G^3 y G^4 son CR^4 y G^2 es N; o G^2 , G^3 y G^4 son CR^4 y G^1 es N

R^1 es CF_3 ;

cada R^2 se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno y C_1 - C_2 -haloalquilo;

R^{3a} , R^{3b} se seleccionan, cada uno independientemente, del grupo que consiste en hidrógeno y halógeno;

R^{3a} y R^{3b} forman juntos un grupo $=O$, $=C(R^{3c})_2$, $=NOH$ o $=NOCH_3$;

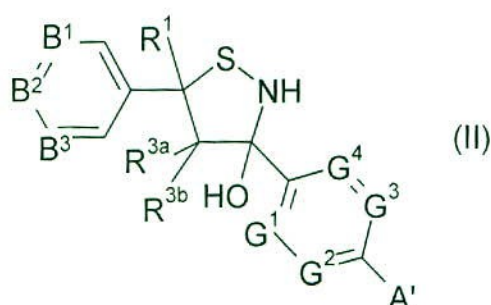
cada R^4 se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -alquiltio y C_1 - C_4 -haloalquiltio;

y los N-óxidos, estereoisómeros y sales de aquellos aceptables en agricultura o veterinaria.

2. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque A es A¹.
3. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque A es A².
4. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque A es A³.
5. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados** porque A es A⁴.
6. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 5, en donde A⁴ es 1,2,4-triazol-1-il.
7. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizados** porque B¹ y B³ son CR², en donde R² no es hidrógeno, y B² es CR², en donde R² tiene uno de los significados indicados en la reivindicación 1.
8. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizados** porque R² se selecciona de hidrógeno, F, Cl, Br y CF₃.
9. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 8, donde R² se selecciona de hidrógeno y Cl.
10. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizados** porque G¹, G³ y G⁴ son CH, y G² es CR⁴, en donde R⁴ tiene uno de los significados indicados en la reivindicación 1.
11. Los compuestos de acuerdo con alguna de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizados** porque G¹ es N o CH, G³ y G⁴ son CH y G² es CR⁴, en donde R⁴ tiene uno de los significados indicados en la reivindicación 1.
12. Los compuestos de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, **caracterizados** porque R^{3a} y R^{3b} se seleccionan, independientemente entre sí, de hidrógeno y flúor.
13. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 12, donde R^{3a} y R^{3b} son hidrógeno.
14. Un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, donde A es A²,

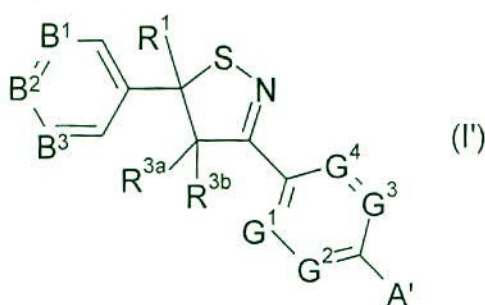
donde sin embargo Y es hidrógeno ó OR^9 , donde R^9 se selecciona de hidrógeno, C_1-C_6 -alquilo, C_1-C_6 -haloalquilo y C_1-C_6 -alquil sustituido con un radical R^{13} , donde R^{13} es un anillo heteroaromático de 6 miembros seleccionado entre 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo.

15. Un método para preparar los compuestos de la Fórmula I definidos en cualquiera de las reivindicaciones anteriores; **caracterizado** porque comprende deshidratar un compuesto de la Fórmula (II)



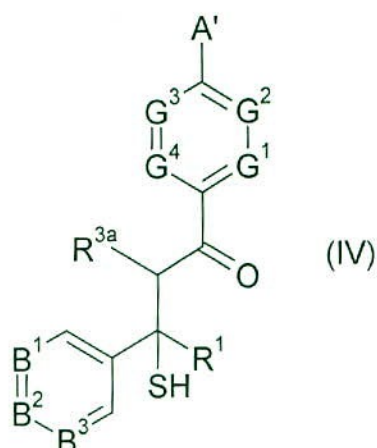
en donde B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , G^3 , G^4 , R^1 , R^{3a} y R^{3b} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones anteriores, y A' es A o un precursor de A seleccionado de un átomo de halógeno, CN, carboxi, terc-butoxicarbonilo, un grupo acetal, un grupo aldehído protegido ó $-OSO_2-R^{Z1}$, donde R^{Z1} es C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo o fenilo que está sin sustituir o sustituido por 1, 2 o 3 radicales seleccionados de C_1-C_4 -alquilo, C_1-C_4 -haloalquilo, C_1-C_4 -alcoxi o C_1-C_4 -haloalcoxi;

donde la deshidratación ocurre espontáneamente o con ayuda de agentes deshidratantes seleccionados de tamices moleculares, tamices moleculares lavados con ácido, sulfato de magnesio, sulfato de sodio, gel de sílice, $SOCl_2$, $POCl_3$, reactivo de Burgess, anhídrido trifluoroacético, ácido p-toluensulfónico, HCl anhidro y ácido sulfúrico o remviendo el agua formada mediante destilación azeotrópica; para obtener un compuesto I'

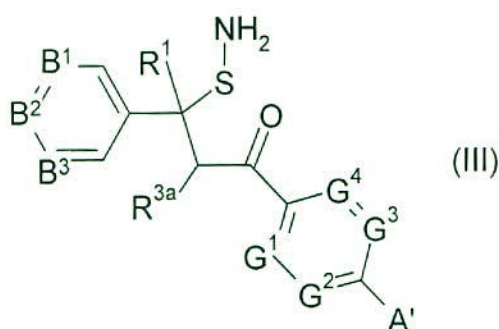


y, si el grupo A' no es el deseado grupo A, convertir el grupo A' en un grupo A.

16. El método de acuerdo con la reivindicación 15, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula II, en el que R^{3b} es hidrógeno, se obtiene haciendo reaccionar un compuesto de la Fórmula IV



con un agente de aminación para obtener un compuesto de la Fórmula III



que reacciona de manera espontánea con el compuesto II;

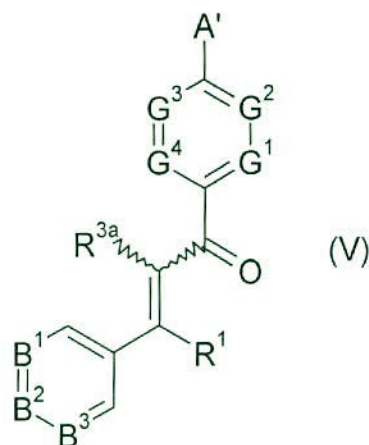
donde la aminación puede ser llevada a cabo en un solo paso de reacción, en donde el compuesto IV reacciona directamente con el compuesto III, o en una reacción de dos pasos, en donde el grupo SH del compuesto (IV) primero es oxidado formando un grupo S-Cl, el cual luego reacciona con el grupo S-NH₂ del compuesto (III),

donde agentes de aminación para el primer paso de la reacción se seleccionan de HOSA (ácido hidroxilamina-O-sulfónico), el cual es usado en presencia de una base, O- (difenilfosforil)hidroxilamina, el cual es usado en presencia de una base, 2,4-dinitrofenilhidroxilamina, O- mesitilensulfonilhidroxilamina y 2-oxa-1-azaspiro[2.5]octano, donde el primer paso de la reacción es llevado en temperatura baja desde -100 a 0 °C ó -78 a 0 °C,

y en el segundo paso de la reacción, el compuesto IV reacciona primero con un agente de cloración el cual convierte el grupo SH en un grupo S-Cl, en donde el agente de cloración se selecciona de sulfurilcloruro, N-cloro succinimida (NCS), hipoclorito de sodio, monocloroamina (NH₂Cl) y cloro, y el compuesto clorado reacciona sin ser aislado, con amonio o hidróxido de amonio, o la cloración/aminación es llevada a cabo en un solo paso de reacción. Por ejemplo reaccionando un tiol IV simultáneamente con un agente de cloración y amonio

acuoso o anhidro en disolventes etéreos o agua,
 en donde B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , G^3 , G^4 , R^1 y R^{3a} son como se definieron en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, y A' es A o un precursor de A.

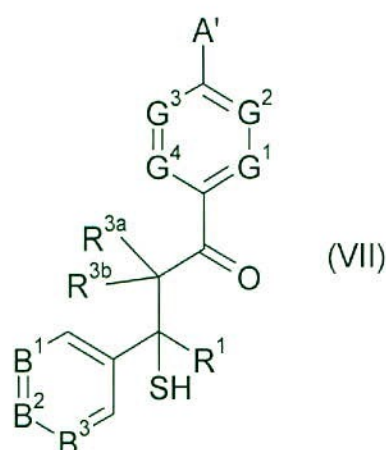
17. El método de acuerdo con la reivindicación 16, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula IV se prepara haciendo reaccionar un compuesto de la Fórmula V



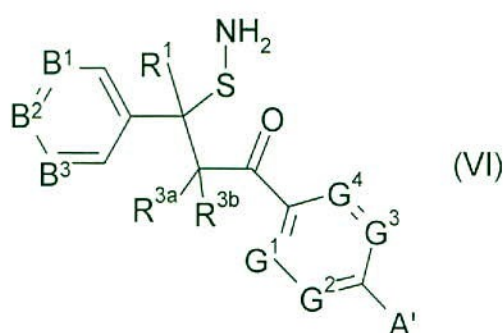
en donde B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , G^3 , G^4 , R^1 y R^{3a} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, y A' es A o un precursor de A como está definido en la reivindicación 15;

con una fuente de azufre seleccionada de H_2S , sulfuros de hidrógeno de metal, sulfuros metálicos, sulfuro de amonio $[(NH_4)_2S]$, sulfuro de tetraalquilamonio y sulfuro de bistrimetilsililo.

18. El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 15 a 17, **caracterizado** porque la reacción del compuesto IV al compuesto I' a través de los compuestos III y II se lleva a cabo como una reacción en un recipiente, o en donde la reacción del compuesto V al compuesto I' a través de los compuestos IV, III y II se lleva a cabo como una reacción en un recipiente.
19. El método de acuerdo con la reivindicación 15, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula II se obtiene haciendo reaccionar un compuesto de la Fórmula VII



con un agente de aminación para obtener un compuesto de la Fórmula VI

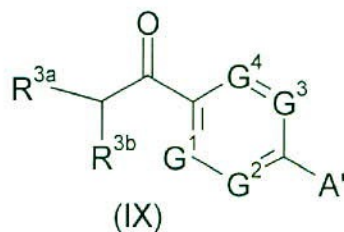
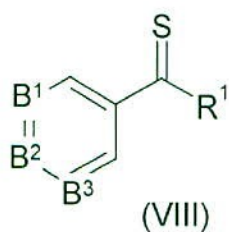


que reacciona de manera espontánea con el compuesto II;

en donde el agente de aminación es como el definido en la reivindicación 16,

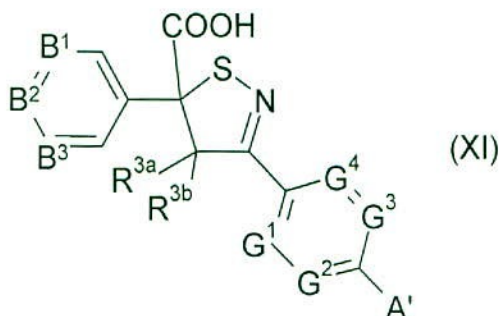
en donde B¹, B², B³, G¹, G², G³, G⁴, R¹, R^{3a} y R^{3b} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, y A' es A o un precursor de A como está definido en la reivindicación 15.

20. El método de acuerdo con la reivindicación 19, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula VII se obtiene haciendo reaccionar un compuesto de la Fórmula VIII con un compuesto de la Fórmula IX.



donde derivados del trialquilsilil-enolato del compuesto IX reacciona con el compuesto VIII en la presencia de un ácido de Lewis, o alternatively, la reacción es llevada a cabo en la presencia de una base fuerte.

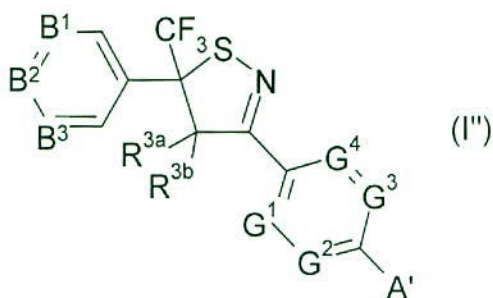
21. Un método para preparar compuestos de la Fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, **caracterizado** porque, sin embargo, R^1 es CF_3 ; dicho método comprende hacer reaccionar un compuesto de la Fórmula XI



en donde B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , G^3 , G^4 , R^{3a} y R^{3b} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, y A' es A o un precursor de A como está definido en la reivindicación 15;

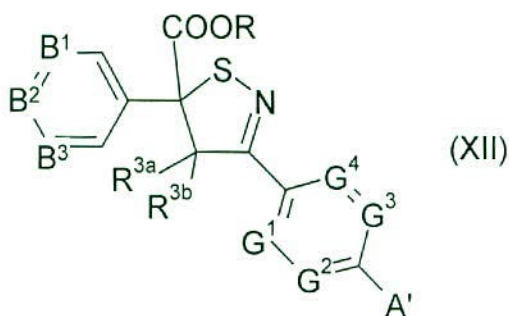
con un agente de fluorinación seleccionado de SF_4 , fenilsulfurtrifluoruro ($Ph-SF_3$), 4-terc-butil-2,6-dimetilfenilsulfurtrifluoruro ("Fluoled"), y bis(2-metoxietil)aminosulfurtrifluoruro $[(CH_3OCH_2CH_2)_2NSF_3]$;

para obtener un compuesto I''



y, si A' no es el grupo A, convertir el grupo A' en un grupo A.

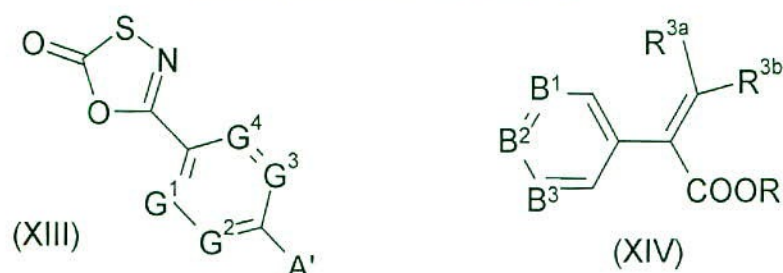
22. El método de acuerdo con la reivindicación 21, **caracterizado** porque el agente de fluorinación es SF_4 en combinación con HF.
23. El método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 210 y 22, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula XI se obtiene hidrolizando un compuesto de la Fórmula XII bajo condiciones ácidas o básicas



en donde B^1 , B^2 , B^3 , G^1 , G^2 , G^3 , G^4 , R^{3a} y R^{3b} son como se definieron en las reivindicaciones 1 a 13, A' es A o un precursor de A, como está definida en la

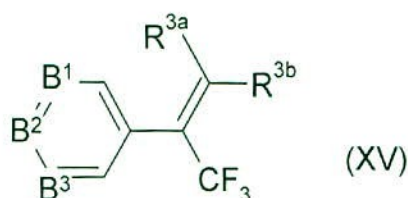
reivindicación 15 y R es C₁-C₄-alquilo.

24. El método de acuerdo con la reivindicación 50, **caracterizado** porque el compuesto de la Fórmula XII se obtiene haciendo reaccionar un compuesto XIII con un compuesto XIV a una temperatura alta entre 90 y 200 °C



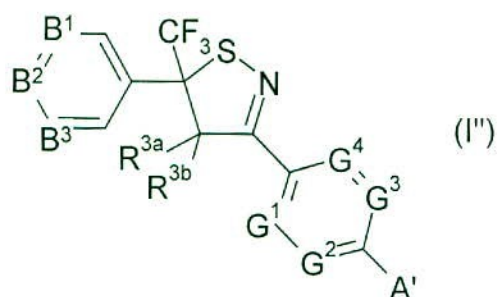
en donde B¹, B², B³, G¹, G², G³, G⁴, R¹ y R^{3a} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, A' es A o a precursor de A, como está definida en la reivindicación 15 y R es C₁-C₄-alquilo.

25. Un método para preparar compuestos de la Fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, **caracterizado** porque R¹ es CF₃; dicho método comprende hacer reaccionar un compuesto de la Fórmula XIII como se define en la reivindicación 24 con un compuesto de la Fórmula XV a una temperatura alta entre 90 y 200 °C



en donde B¹, B², B³, R^{3a} y R^{3b} son como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13,

para obtener un compuesto I''



y, si A' no es el grupo A, convertir el grupo A' en un grupo A.

26. Una composición agrícola **caracterizada** porque comprende un compuesto de la Fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, un estereoisómero y/o una sal de este aceptable en agricultura y un líquido inerte y/o

un portador sólido aceptables en la agricultura, en donde el líquido portador se selecciona de agua, solventes orgánicos y combinaciones entre ellos, y el portador sólido se selecciona de tierras minerales; polisacáridos, fertilizantes; productos de origen de vegetal seleccionados de harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez; y mezclas de ellos, y donde el compuesto está contenido en una cantidad de 0.01 a 95% por peso, basado en el peso total de la composición.

27. Una composición veterinaria **caracterizada** porque comprende un compuesto de la Fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, un estereoisómero de este y/o sal de este aceptable en veterinaria y un líquido inerte y/o un portador sólido aceptables en veterinaria, en donde el líquido portador se selecciona de agua, solventes orgánicos y combinaciones entre ellos, y el portador sólido se selecciona de tierras minerales; polisacáridos, fertilizantes; productos de origen de vegetal seleccionados de harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez; y mezclas de ellos, y donde el compuesto está contenido en una cantidad de 0.01 a 95% por peso, basado en el peso total de la composición.

DPG\DPG\ID-421274\WPC16452