

CAVELIER

ABOGADO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

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

EDIFICIO
CARRERA 4 N.
BOGOTÁ 8, CI

Radicación : 00050179 00000002
Fecha (Acto): 2003-04-25 16:56:02

Folios: 2

1) 347-3611
1) 310-4995

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 348 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

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

TRÁMITE: 002

EVENTO: 001

ACTUACIÓN: 538

Referencia : Expediente No. 00-050.179
Asunto : Solicitud de patente para "TRIFLUORBUTENOS NEMATICIDAS Y PROCESO PARA LA OBTENCIÓN DE LOS MISMOS"
Solicitante : NIHON BAYER AGROCHEM K.K.
Fecha de solicitud : 5 de julio de 2000
Publicada en : la Gaceta No. 521 del 30 de octubre de 2002

1. Yo, Emilio FERRERO, identificado como aparece al pie de mi firma, actuando como apoderado en el asunto de la referencia, atentamente solicito se efectúe el examen de patentabilidad de la solicitud en referencia según lo establecido en el artículo 44 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Para tal efecto presento junto con este escrito el recibo No. 03-26,208 por valor de \$335.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 41687 del 24 de diciembre de 2002.

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

Bogotá, 25 ABR 2003
Señora Jefe,


EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.929

COLO 08733 801 003 3
MRE/DIF/ID-000041/WPCL8733

NIT. 860.041.367-3

715

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00050179 00000002
Fecha (AND): 2003-04-23 16:56:02
Folios: 2
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 338 PETICION
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 26,208.
FECHA : ABRIL 14 DE 2003

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	11726188	14/04/2003	34,071,480.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	335,000.00
	TOTAL :	\$ 335,000.00

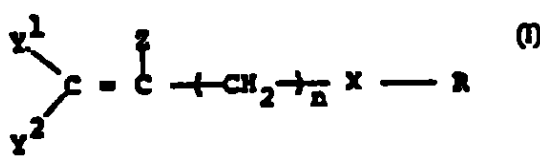
SON: TRESCIENTOS TREINTA Y CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Colo 08733-801-003-3

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification⁴ : C07C 33/42, 69/63, 69/767 C07D 271/06, 271/10, 277/26 C07D 285/06, 285/12 A01N 31/02, 37/02, 37/10 A01N 43/78, 43/82	A1	(11) International Publication Number: ... WO 86/ 07590 (43) International Publication Date: 31 December 1986 (31.12.86)
(21) International Application Number: PCT/US86/01284 (22) International Filing Date: 12 June 1986 (12.06.86) (31) Priority Application Numbers: 747,142 746,911 (32) Priority Dates: 20 June 1985 (20.06.85) 20 June 1985 (20.06.85) (33) Priority Country: US (71) Applicant: FMC CORPORATION [US/US]; 2000 Market Street, Philadelphia, PA 19103 (US). (72) Inventors: CULLEN, Thomas, Gerard ; 22 Harrison Avenue, Milltown, NJ 08850 (US). MARTINEZ, Anthony, Joseph ; 20 Weyburne Road, Hamilton Square, NJ 08690 (US).	(74) Agent: FELLOWS, Charles, C.; FMC Corporation, 2000 Market Street, Philadelphia, PA 19103 (US). (81) Designated States: AU, BR, CF (OAPI patent), CG (OAPI patent), CH (European patent), CM (OAPI patent), DE (European patent), DK, FR (European patent), GA (OAPI patent), GB (European patent), HU, IT (European patent), JP, KR, ML (OAPI patent), MR (OAPI patent), NL (European patent), SN (OAPI patent), TD (OAPI patent), TG (OAPI patent). Published With international search report. With amended claims and statement.	
(54) Title: PESTICIDAL POLYHALOALKENE DERIVATIVES 		
(57) Abstract Polyhaloalkene compounds of formula (I), wherein X is sulfur, oxygen, nitrogen or methylene, Y¹ and Y² independently are fluorine, chlorine or bromine, Z is hydrogen or the same as Y¹ or Y², and n is 1-4; provided that: (A) when X is sulfur, R is thiazolyl substituted thienyl, optionally substituted thianaphthyl, optionally substituted thiazolanyl, optionally substituted thiadiazolyl, optionally substituted oxadiazolyl or 3,4,4-trifluoro-3-butenyloxycarbonyl-methyl; (B) when X is oxygen, R is C(O)R¹ wherein R¹ is perfluoroalkyl, optionally substituted phenyl, optionally substituted thienyl, optionally substituted furanyl, optionally substituted pyrrolyl or dihydrothiazolylthiomethyl; (C) when X is nitrogen, R taken with the nitrogen is an isothiocyanate, succinimide or saccharine group; and (D) when X is methylene, R is hydroxy. The compounds exhibit activity against plant nematodes and helminths that are indicators of animal anthelmintic activity and therefore are useful in agriculture and veterinary practice.		

122
717

-1-

PESTICIDAL POLYHALOALKENE DERIVATIVES

This invention relates to pesticidal polyhalo-
alkene derivatives and use for combatting infestations
of nematodes in soil and in plant systems, particu-
larly agricultural crops, and for combatting plant-
destructive diseases caused wholly or in part by nema-
todes. The invention further concerns anthelmintic
applications of the compounds.

U.S. Patent 3,513,172 - Brokke and divisional
patents thereof disclose nematocidal trifluorobutenyl
derivatives of the formula

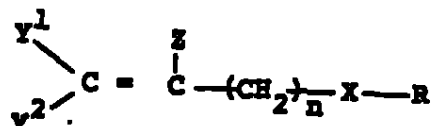


where R is selected from various substituents includ-
ing some heterocyclics such as 2-thio-4-alkylthia-
zoly1. These and other patents reflect ongoing
efforts of industry and governmental agencies to find
and commercialize chemicals for combatting nematodes
and nematode-induced plant diseases, to thereby reduce
the substantial economic losses resulting from
nematode infestations.

A new class of polyhaloalkene derivatives has now
been found having high nematocidal activity and good
soil mobility. In addition, the compounds exhibit
control of a variety of nematodes, and in some cases
systemic activity. The compounds also are effective
against helminths that are indicators of animal
anthelmintic activity.

The novel nematocidal compounds of the invention
are polyhaloalkene derivatives of the formula (I):

-2-



5

wherein X is sulfur, oxygen, nitrogen or methylene, Y¹ and Y² independently are fluorine, chlorine or bromine, Z is hydrogen or the same as Y¹ or Y², and n is 1-4, preferably 1 or 2; provided that:

10 (A) when X is sulfur, R is thiazolyl, optionally substituted thienyl, optionally substituted thianaphthyl, optionally substituted thiazoliny, optionally substituted thiadiazolyl, optionally substituted oxadiazolyl or 3,4,4-trifluoro-3-butenyloxycarbonyl-

15 methyl;

(B) when X is oxygen, R is C(O)R¹ wherein R¹ is perfluoroalkyl, optionally substituted phenyl, optionally substituted thienyl, optionally substituted furanyl, optionally substituted pyrrolyl or dihydro-

20 thiazolylthiomethyl;

(C) when X is nitrogen, R taken with the nitrogen is an isothiocyanate, succinimide or saccharine group; and

(D) when X is methylene, R is hydroxy.

25 Other aspects of the invention include methods of controlling nematode populations and arresting plant and animal diseases caused by nematodes and helminths, and nematocidal and anthelmintic formulations based on the polyhaloalkene derivatives. Typical nematode

30 species controlled in accordance with the invention are the root-knot, stunt, lesion, cyst and C. elegans nematodes.

In subclasses A and B of the compounds of formula I above, available carbon atoms of the heterocyclic

35 rings other than thiazolyl optionally may be substituted with any group or groups which are non-destructive.

-5-

wherein R⁵ is alkyl, haloalkyl, aryl, aryl-alkyl, aryloxyalkyl, arylthioalkyl, heterocyclo-alkyl, arylalkenyl or alkynyl (C₂-C₁₁).

- Aryl and the heterocycles described in (3) and
- 5 (4) above are optionally substituted with one or more groups selected independently from halogen, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy, cyano, nitro and phenyl. Aryl and the heterocycles described in (5)
- 10 above are optionally substituted with one or more groups selected independently from halogen, alkyl, alkoxy, nitro, amino, hydroxy, acetyloxy and alkylaminocarbonyloxy.
- (6) R is a thiazolyl group.

Synthesis

- 15 The compounds of formula I are prepared in a known manner. For example, a polyhaloalkene such as 4-bromo-1,1,2-trifluoro-1-butene is reacted with a mercaptothiazole (prepared by reaction of thiazole and elemental sulfur) or mercaptothiazoline in a reaction
- 20 solvent medium containing sodium ethoxide to form the thiazolyl or thiothiazoline derivative of the polyhaloalkene. Examples 1, 2, 8-14, 16 and 17 below are representative of this and other reaction schemes for synthesis of the subclass A compounds of formula I
- 25 (X = sulfur). Compounds of formula I wherein X is oxygen (subclass B) may be prepared as described in Examples 3 and 4. Similarly, the subclass C (X = nitrogen) and subclass D compounds (X = -CH₂-) are prepared as described in Examples 5 and 6 (subclass C)
- 30 and 7 (subclass D).

- Other polyhaloalkenes may be used in known ways to prepare other compounds of formula I. For example, trifluoroethylene can be chain-extended with methyl dibromide and the 1,3-dibromo-1,1,2-trifluoropropane
- 35 product then reacted with a mercaptan to form a thio

125
720

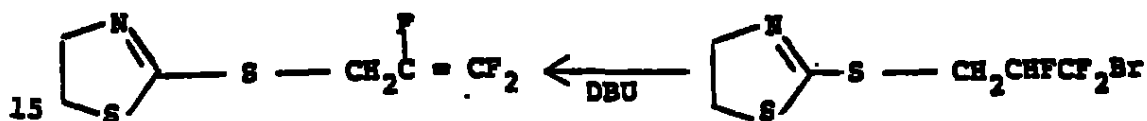
-6-

intermediate. The intermediate is then dehydrohalogenated, as follows, wherein "BP" is benzoyl peroxide and "DBU" is 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene catalyst, as described by Tarrant and Tandon, J. Org.

5 Chem. 34(4), 864 (1969):



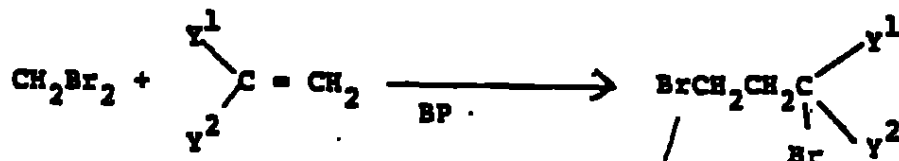
10



15

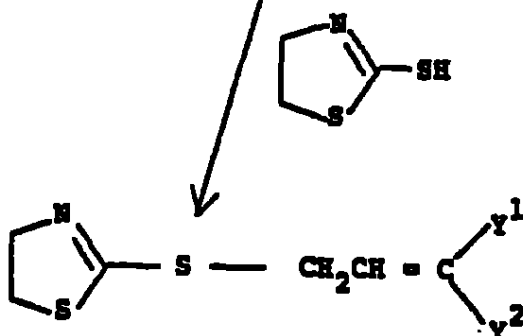
Dihalopropene derivatives within the scope of formula I may be prepared by the following general reaction, wherein Y^1 and Y^2 are as defined above and one of Y^1 and Y^2 also may be hydrogen:

20



25

30

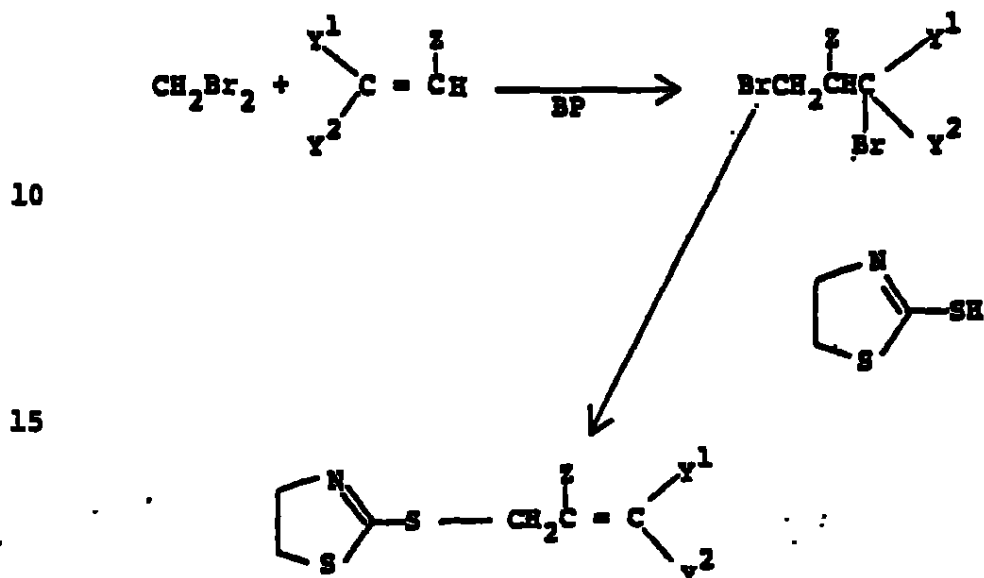


12/21

-7-

Trihalopropene derivatives also may be prepared in a manner and reaction similar to the Tarrant and Tandon scheme to form other compounds of formula I, wherein Y^1 , Y^2 and Z are as defined in formula I:

5



Methods of preparing propenes, butenes and other alkenes having mixed halogen substituents and therefore useful in the invention for preparing compounds of formula I are described in a Ph.D. thesis of M. R. Lillyguist, University of Florida (1955), pages 9, 39, 59 and 60. It will be apparent, therefore, that the polyhaloalkenes and heterocyclic or other compounds used to prepare the compounds of formula I generally are known materials or can be synthesized by known procedures.

The following examples further describe methods of preparing the compounds of the invention. In the examples all parts and percentages are by weight and all temperatures are °C unless otherwise stated. The

127
722

-8-

products of Examples 1-9 correspond to compounds 1-9 listed in Tables 1 and 1b. Examples 10-17 identify the tabulated compounds to which they relate.

Example 1

5 2-(3,4,4-Trifluoro-3-butenylthio)-
 4,5-dihydrothiazole

Sodium ethoxide was prepared by stirring 0.25 gram (0.011 mole) of sodium metal in 30 ml of absolute ethanol. To this was added 1.2 grams (0.01 mole) of 10 2-mercaptothiazoline. The reaction mixture was stirred for one hour and the excess ethanol was removed under reduced pressure. The residue was dissolved in 35 ml of methyl ethyl ketone and 2.0 grams (0.01 mole) of 4-bromo-1,1,2-trifluoro-1-butene was 15 added. The reaction mixture was stirred at ambient temperature for four hours, then concentrated under reduced pressure to a residue. The residue was dissolved in 50 ml of toluene and washed with three 25 ml portions of water. The organic layer was dried 20 with sodium sulfate and filtered. The filtrate was concentrated under reduced pressure to give 1.7 grams of 2-(3,4,4-trifluoro-3-butenylthio)-4,5-dihydrothiazole as an oil. The nmr and the ir spectra were consistent with the proposed structure.

25 Example 2

 5-Methylthio-2-(3,4,4-trifluoro-
 3-butenylthio)-1,3,4-thiadiazole

A solution of 2.0 grams (0.012 mole) of 2-mercapto-5-methylthio-1,3,4-thiadiazole in 25 ml of 30 distilled acetone was added to a stirred mixture of 0.84 gram (0.006 mole) of potassium carbonate and 0.2 gram (0.001 mole) of potassium iodide in 25 ml of distilled acetone. With continued stirring 2.2 grams (0.012 mole) of 4-bromo-1,1,2-trifluoro-1-butene was 35 added dropwise. Upon completion of addition the reaction mixture was heated under reflux for four hours.

-22-

pitated. The solid was collected by filtration to yield; when dried, 14.9 grams of 4-chlorophenylacetic acid hydrazide; m.p. 159-161°C. The nmr spectrum was consistent with the proposed structure.

- 5 (C) A stirred solution of 7.0 grams (0.038 mole) of 4-chlorophenylacetic acid hydrazide, 3.0 grams (0.039 mole) of carbon disulfide and 2.8 grams (0.050 mole) of potassium hydroxide in 10 ml of water and 200 ml of ethanol was heated under reflux for four hours.
- 10 The ethanol was removed under reduced pressure. The concentrate was taken up in water and the mixture washed with diethyl ether. The aqueous layer was acidified with aqueous 5% hydrochloric acid and then was extracted with diethyl ether. The extract was
- 15 dried with magnesium sulfate and filtered. The filtrate was concentrated under reduced pressure to yield 3.9 grams of 2-(4-chlorophenylmethyl)-5-mercapto-1,3,4-oxadiazole; m.p. 115°C. The nmr spectrum was consistent with the proposed structure.
- 20 (D) In a manner analogous to Example 2, 2.4 grams (0.011 mole) of 2-(4-chlorophenylmethyl)-5-mercapto-1,3,4-oxadiazole, 2.0 grams (0.011 mole) of 4-bromo-1,1,2-trifluoro-1-butene, 1.5 grams (0.011 mole) of potassium carbonate and 0.5 gram of potassium
- 25 iodide were reacted in 45 ml of acetone. The yield of 2-(4-chlorophenylmethyl)-5-(3,4,4-trifluoro-3-butenylthio)-1,3,4-oxadiazole was 1.5 grams as a liquid. The nmr spectrum was consistent with the proposed structure.

30 Example 16 (Compound 230)
Synthesis of 2-(3,4,4-trifluoro-3-butenylthio)thiazole

Under a nitrogen atmosphere, a stirred solution of 2.0 grams (0.024 mole) of thiazole in 30 ml of dry

35 tetrahydrofuran is cooled to -65°C and 16 ml of 1.55

129
124

-23-

molar n-butyllithium is added dropwise. Upon completion of addition the reaction mixture is stirred for 45 minutes and 0.8 gram (0.024 mole) of elemental sulfur is added portionwise. The reaction mixture is stirred for an additional one hour, the temperature then being adjusted to -60°C, and 4.5 grams (0.024 mole) of 4-bromo-1,1,2-trifluoro-1-butene is added dropwise. Upon completion of addition the reaction mixture is stirred for three hours during which time it is allowed to warm to ambient temperature. The solvent is removed under reduced pressure. The residue is dissolved in diethyl ether and washed with two portions of an aqueous solution saturated with sodium chloride. The organic layer is dried with magnesium sulfate and filtered. The filtrate is concentrated under reduced pressure to a residual semi-solid. The semi-solid is subjected to column chromatography on silica gel. Elution is accomplished with 1:1 - hexane:diethyl ether. The appropriate fractions are combined and concentrated under reduced pressure to give 0.4 gram of 2-(3,4,4-trifluoro-3-butenylthio)thiazole as an oil. The nmr and ir spectra are consistent with the proposed structure.

Example 17 (Compound 231)

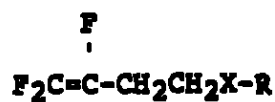
25 Synthesis of 2-(2,3,3-trifluoro-2-propenylthio)thiazole

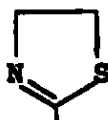
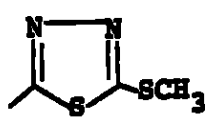
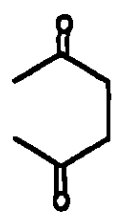
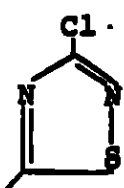
(A) A stainless steel autoclave is charged with 50 grams (0.6 mole) of trifluoroethylene, 300 grams (1.7 moles) of dibromomethane, and 5 grams (0.02 mole) of benzoyl peroxide. The reaction mixture is stirred and heated at 100°C for six hours, then is cooled to -70°C. The autoclave is opened and the reaction mixture fractionally distilled. The appropriate fractions are combined to give 1,3-dibromo-1,1,2-trifluoropropane.

12075

- 39 -

Table 1



<u>Compd. No.</u>	<u>X</u>	<u>R</u>	<u>Empirical Formula</u>
1	S		C ₇ H ₈ F ₃ NS ₂
2	S		C ₇ H ₇ F ₃ N ₂ S ₃
3	O	C(O)CF ₂ CF ₂ CF ₃	C ₈ H ₄ F ₁₀ O ₂
4	O	4-chlorobenzoyl	C ₁₁ H ₈ ClF ₃ O ₂
5	N		C ₈ H ₈ F ₃ NO ₂
6	N	=C=S	C ₅ H ₄ F ₃ NS
7	CH ₂	OH	C ₅ H ₇ F ₃ O
8	S		C ₆ H ₄ ClF ₃ N ₂ S ₂

1155W30113Wjd-1

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification 6 : C07D 307/64, 333/34, 333/36, 333/38, 333/62, 261/18, 413/04, 261/10, 275/02, 263/46, 277/36, 277/16, 277/56, 277/58, 277/40	A1	(11) International Publication Number: WO 95/24403 (43) International Publication Date: 14 September 1995 (14.09.95)																				
(21) International Application Number: PCT/GB95/00400 (22) International Filing Date: 27 February 1995 (27.02.95) (30) Priority Data: <table border="0"><tr><td>9404716.4</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9404717.2</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9404718.0</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9404719.8</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9404720.6</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9500521.1</td><td>10 March 1994 (10.03.94)</td><td>GB</td></tr><tr><td>9404721.4</td><td>11 January 1995 (11.01.95)</td><td>GB</td></tr></table> (71) Applicant (for all designated States except US): ZENECA LIMITED (GB/GB); 15 Stanhope Gate, London W1Y 6LN (GB). (72) Inventors; and (73) Inventors/Applicants (for US only): TURNBULL, Michael, Drysdale (GB/GB); 19 Somerton Gardens, Ebury, Reading, Berkshire RG6 2XG (GB). BANSAL, Harjinder, Singh (GB/GB); 10 Woodmancote Close, Forest Park, Bracknell, Berkshire RG12 3XU (GB). SMITH, Alison, Mary (GB/GB); 26 Albert Road, Richmond, Surrey TW10 6DP	9404716.4	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9404717.2	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9404718.0	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9404719.8	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9404720.6	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9500521.1	10 March 1994 (10.03.94)	GB	9404721.4	11 January 1995 (11.01.95)	GB	(GB). SALMON, Roger (GB/GB); 38 Tawfield, Bracknell, Berkshire RG12 4YU (GB). FITZJOHN, Steven (GB/GB); 47 Leicester, Crown Wood, Bracknell, Berkshire RG12 3TS (GB). GODFREY, Christopher, Richard, Ayles (GB/GB); 159 Viking, Great Hollands, Bracknell, Berkshire RG12 8UW (GB). HOTSON, Matthew, Brian (GB/GB); 41 Crockford Place, Binfield, Berkshire RG12 5UT (GB). SILLARS, Nan, Catherine (GB/GB); 53 Branksome Hill Road, College Town, Camberley, Surrey GU15 4QF (GB). DOWLING, Alan, John (GB/GB); 7 Moor End, Maidenhead, Berkshire SL6 2YW (GB). (74) Agents: MALLALIEU, Catherine, Louise et al; Intellectual Property Dept., Zeneca Agrochemicals, Jealott's Hill Research Station, P.O. Box 3538, Bracknell, Berkshire RG12 6YA (GB). (81) Designated States: AM, AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SD, SG, SI, SK, TJ, TT, UA, US, UZ, VN, European patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO patent (KE, MW, SD, SZ, UG). Published With international search report.
9404716.4	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9404717.2	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9404718.0	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9404719.8	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9404720.6	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9500521.1	10 March 1994 (10.03.94)	GB																				
9404721.4	11 January 1995 (11.01.95)	GB																				
(54) Title: (4,4-DIFLUOROBUT-3-ENYLTHIO)-SUBSTITUTED HETEROCYCLIC OR CARBOCYCLIC RING COMPOUNDS HAVING PESTICIDAL ACTIVITY (57) Abstract A compound of formula (I), or a salt thereof, wherein n is 0, 1 or 2; and R is a group of formulas (II) to (XXI), wherein: the S(O)nCH2CH2CH-CF2 group is at least one of R1 (when attached to a carbon atom), R2, R3, R4, R5 or R6; R1 (when attached to a carbon atom), R2, R3, R4, R5 and R6 are each independently hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkynyl, alkynyl, cycloalkyl, alkylcycloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted arylalkyl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroarylalkyl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted arylalkoxy, optionally substituted aryloxyalkyl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroarylalkoxy, optionally substituted heteroaryloxyalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloalkoxy, haloalkenyloxy, haloalkynyloxy, halogen, hydroxy, cyano, nitro, -NR7R8, -NR7COR8, -NR7CSR8, -NR7SO2R8, -N(SO2R7)(SO2R8), -COR7, -CONR7R8, -alkylCONR7R8, CR7NR8, -COOR7, -OCOR7, -SR7, -SOR7, -SO2R7, -alkylSR7, -alkylSOR7, -alkylSO2R7, -OSO2R7, -SO2NR7R8, -CSNR7R8, -SIR7R8R9, -OCH2CO2R7, -OCH2CH2CO2R7, -CONR7SO2R8, -alkylCONR7SO2R8, -NHCONR7R8, -NHCSNR7R8, or an adjacent pair of R1, R2, R3, R4, R5 and R6 when taken together form a fused 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring; R1 (when attached to a nitrogen atom) is hydrogen, optionally substituted alkyl, cycloalkyl, alkylcycloalkyl, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted arylalkyl, optionally substituted aryloxyalkyl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroarylalkyl, optionally substituted heteroaryloxyalkyl, haloalkyl, hydroxy, cyano, nitro, -NR7R8, -NR7COR8, -NR7CSR8, -NR7COOR8, -NR7SO2R8, -N(SO2R7)(SO2R8), -COR7, -CONR7R8, -alkylCONR7R8, -CR7NR8, -COOR7, -OCOR7, -SOR7, -SO2R7, -alkylSR7, -alkylSOR7, -alkylSO2R7, -OSO2R7, -SO2NR7R8, -SR7, -SOR7, -SO2R7, -CSNR7R8, -SIR7R8R7, -OCH2CO2R7, -OCH2CH2CO2R7, -CONR7SO2R8, -alkylCONR7SO2R8, -NHCONR7R8, or -NHCSR7R8; and R7, R8 and R9 are each independently hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, alkynyl, optionally substituted aryl or optionally substituted arylalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, halogen, or hydroxy.																						

132
727**(4,4-Difluorobut-3-enylthio)-substituted heterocyclic or carbocyclic ring compounds having pesticidal activity**

The present invention relates to novel heterocyclic and phenyl derivatives having nematicidal, insecticidal and acaricidal activity, to processes for their preparation, to compositions containing them, and to methods for killing or controlling nematode, insect or acarid pests using them.

According to the present invention there is provided a compound of formula (I), or a salt thereof, wherein n is 0, 1 or 2; and R is a group of formula (II) to (XXI), wherein:

the $S(O)_nCH_2CH_2CH=CF_2$ group is at least one of R1 (when attached to a carbon atom), R2, R3, R4, R5 or R6;

R1 (when attached to a carbon atom), R2, R3, R4, R5 and R6 are each independently hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, alkylcycloalkyl, alkoxy, alkoxymethoxy, alkoxymethoxy, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted arylalkyl; optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroarylalkyl, optionally substituted aryloxy, optionally substituted arylalkoxy, optionally substituted aryloxyalkyl, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heteroarylalkoxy, optionally substituted heteroaryloxyalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl, haloalkoxy, haloalkoxymethoxy, haloalkoxymethoxy, halogen, hydroxy, cyano, nitro, -NR7R8, -NR7COR8, -NR7CSR8, -NR7SO2R8, -N(SO2R7)(SO2R8), -COR7, -CONR7R8, -alkylCONR7R8, -CR7NR8, -COOR7, -OCOR7, -SR7, -SOR7, -SO2R7, -alkylSR7, -alkylSOR7, -alkylSO2R7, -OSO2R7, -SO2NR7R8, -CSNR7R8, -SiR7R8R9, -OCH2CO2R7, -OCH2CH2CO2R7, -CONR7SO2R8, -alkylCONR7SO2R8, -NHCONR7R8, -NHCSNR7R8, or an adjacent pair of R1, R2, R3, R4, R5 and R6 when taken together form a fused 5- or 6-membered carbocyclic or heterocyclic ring;

R1 (when attached to a nitrogen atom) is hydrogen, optionally substituted alkyl, cycloalkyl, alkylcycloalkyl, hydroxyalkyl, alkoxyalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted arylalkyl, optionally substituted aryloxyalkyl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroarylalkyl, optionally substituted heteroaryloxyalkyl, haloalkyl, hydroxy, cyano, nitro, -NR7R8, -NR7COR8, -NR7CSR8, -NR7COOR8, -NR7SO2R8, -N(SO2R7)(SO2R8), -COR7, -CONR7R8, -alkylCONR7R8, -CR7NR8, -COOR7, -OCOR7, -SOR7, -SO2R7, -alkylSR7, -alkylSOR7, -alkylSO2R7, -OSO2R7, -SO2NR7R8, -SR7, -SOR7, -SO2R7, -CSNR7R8, -SiR7R8R9, -OCH2CO2R7, -OCH2CH2CO2R7, -CONR7SO2R8, -alkylCONR7SO2R8, -NHCOR7R8, or -NHCSR7R8; and

133/18

- 15 -

VI.118	2-NO ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VI.119	2-SO ₂ F	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VI.120	2-SO ₂ NH ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂

Examples of compounds of Formula (VII) according to the invention are set out in Table VII.

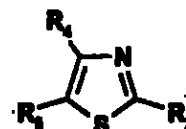


TABLE VII

No.	R ₂	R ₄	R ₅
VII.1	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-H
VII.2	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-H
VII.3	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-H
VII.4	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CF ₃	5-H
VII.5	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CF ₃	5-H
VII.6	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CN	5-H
VII.7	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CONH ₂	5-H
VII.8	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOCH ₂ CH ₃	5-H
VII.9	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOCH ₂ CH ₃	5-H
VII.10	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOH	5-H
VII.11	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Br
VII.12	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Br
VII.13	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-COOH	5-Br
VII.14	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Br
VII.15	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Br
VII.16	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Br
VII.17	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-C ₆ H ₅
VII.18	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-C ₆ H ₅
VII.19	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-C ₆ H ₅
VII.20	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CF ₃
VII.21	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CH ₃
VII.22	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CH ₃
VII.23	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CH ₃

VII.24	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Cl
VII.25	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Cl
VII.26	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-Cl
VII.27	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-Cl
VII.28	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-Cl
VII.29	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CN
VII.30	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CN
VII.31	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CN
VII.32	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-CN
VII.33	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-CN
VII.34	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-CN
VII.35	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-CONH ₂
VII.36	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-CONH ₂
VII.37	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-CONH ₂
VII.38	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-COOCH ₂ CH ₃
VII.39	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-COOCH ₂ CH ₃
VII.40	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-COOCH ₂ CH ₃
VII.41	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-COOCH ₃
VII.42	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-COOCH ₃
VII.43	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-COOCH ₃
VII.44	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-COOH
VII.45	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-COOH
VII.46	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-F
VII.47	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-NO ₂
VII.48	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-NO ₂
VII.49	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-NO ₂
VII.50	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-SO ₂ F
VII.51	2-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-SO ₂ F
VII.52	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-SO ₂ F
VII.53	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-SO ₂ F
VII.54	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-SO ₂ NH ₂
VII.55	2-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-H	5-SO ₂ NH ₂
VII.56	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-CH ₃	5-SO ₂ N(CH ₂ CH ₃) ₂

134
129

VIL57	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-H
VIL58	2-H	4-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-H
VIL59	2-H	4-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-H
VIL60	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-Br
VIL61	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-C ₆ H ₅
VIL62	2-H	4-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-C ₆ H ₅
VIL63	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CF ₃
VIL64	2-H	4-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CF ₃
VIL65	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-Cl
VIL66	2-H	4-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-Cl
VIL67	2-H	4-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-Cl
VIL68	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CN
VIL69	2-CH ₃	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CN
VIL70	2-CH ₃	4-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CN
VIL71	2-CH ₃	4-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CN
VIL72	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CONH ₂
VIL73	2-CH ₃	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-CONH ₂
VIL74	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-COOCH ₂ CH ₃
VIL75	2-CH ₃	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-COOCH ₃
VIL76	2-CH ₃	4-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-COOCH ₃
VIL77	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-COOH
VIL78	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-F
VIL79	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-NO ₂
VIL80	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-SO ₂ F
VIL81	2-H	4-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	5-SO ₂ NH ₂
VIL82	2-H	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL83	2-H	4-H	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL84	2-H	4-H	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL85	2-H	4-Br	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL86	2-H	4-C ₆ H ₅	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL87	2-H	4-CF ₃	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL88	2-H	4-CF ₃	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VIL89	2-H	4-Cl	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂

136
137

VII.90	2-H	4-CN	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.91	2-H	4-CN	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.92	2-H	4-CN	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.93	2-CH ₃	4-CN	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.94	2-H	4-CONH ₂	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.95	2-H	4-CONH ₂	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.96	2-H	4-CONH ₂	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.97	2-CH ₃	4-CONH ₂	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.98	2-H	4-COOCH ₂ CH ₃	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.99	2-H	4-COOCH ₂ CH ₃	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.100	2-H	4-COOCH ₂ CH ₃	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.101	2-CH ₃	4-COOCH ₃	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.102	2-H	4-COOH	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.103	2-H	4-F	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.104	2-H	4-NO ₂	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.105	2-H	4-NO ₂	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.106	2-H	4-SO ₂ F	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.107	2-H	4-SO ₂ NH ₂	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.108	2-Br	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.109	2-C ₆ H ₅	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.110	2-C ₆ H ₅	4-H	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.111	2-C ₆ H ₅	4-H	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.112	2-CF ₃	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.113	2-CF ₃	4-H	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.114	2-Cl	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.115	2-Cl	4-H	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.116	2-Cl	4-H	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.117	2-CN	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.118	2-CN	4-CH ₃	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.119	2-CONH ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.120	2-CONH ₂	4-H	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.121	2-CONH ₂	4-H	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.122	2-CONH ₂	4-CH ₃	5-SO ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂

137
132

- 19 -

VII.123	2-COOCH ₂ CH ₃	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.124	2-COOCH ₃	4-CH ₃	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.125	2-COOH	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.126	2-F	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.127	2-F	4-H	5-SOCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.128	2-NH ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.129	2-NO ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.130	2-O(4-CN-C ₆ H ₄)	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.131	2-SO ₂ F	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.132	2-SO ₂ NH ₂	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.133	2-S-(2)-(5-Cl 1,3,4-oxadiazole)	4-H	5-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂
VII.134	2-SCH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	4-dihydro	5-dihydro

138
133

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

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor (señor):
Emilio Ferrero

Oficio N° **4574**

REFERENCIA: Radicación No. 00-50179.
 Trámite 002.
 Evento 001.
 Actuación 430.
 Folios 005.

Realizado el examen de patentabilidad de la presente solicitud según el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, **"art. 45.- Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales.**

Cuando la oficina nacional competente estimara que ello es necesario para los fines del examen de patentabilidad, podrá notificar al solicitante dos o más veces conforme al párrafo precedente.

Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente." se notifica el siguiente Concepto Técnico:

1. DOCUMENTOS ESTUDIADOS

- Para el presente estudio se tuvo en cuenta el capítulo descriptivo, folios 86 a 108 y reivindicaciones 1 a 10, folios 109 a 111 anexados como respuesta al requerimiento formal; lo cual fue aceptado dado que éste no implica una ampliación de la solicitud originalmente presentada conforme lo establece el artículo 34 de la decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina **"art. 34.- El solicitante de una patente podrá pedir que se modifique la solicitud en cualquier momento del trámite. La modificación no podrá implicar una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial.**
Del mismo modo, se podrá pedir la corrección de cualquier error material."
- Se acepta reivindicación de prioridad JPHe11-191638 del 6 de julio de 1999.

2. OBJETO DE LA INVENCION

- Título: Trifluorbutenos nematocidas y proceso para la obtención de los mismos.
- La invención consiste en:

Reivindicaciones 1 a 4: Compuestos de fórmula (I) tal como se describe en el folio 109.

Reivindicación 5: Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) visible en el folio 109 donde X es un halógeno y n representa 0; caracterizado porque se hace reaccionar 2-(3,4,4-difluor-3-butenil)tiazol con un agente halogenante a una temperatura entre 0 y 200°C y con una presión entre 10 y 1000 kPa si es adecuado en presencia de solventes inertes.

Reivindicación 6: Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) visible en el folio 110 donde X es un halógeno y n representa 1 ó 2; caracterizado porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (Ib) definido en el folio 110 con un agente oxidante a una temperatura entre 0 y 150°C y a una presión entre 10 y 1000 kPa, si es adecuado en presencia de solventes inertes.

Reivindicación 7: Composiciones nematicidas caracterizadas porque contienen al menos un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 4.

Reivindicación 8: Un método para combatir nemátodos caracterizados porque los compuestos de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 4 se dejan actuar sobre los nemátodos y/o su hábitat.

Reivindicaciones 9: Uso de los compuestos de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 4 para combatir nemátodos.

Reivindicación 10: Procedimiento para la preparación de composiciones nematicidas caracterizado porque los compuestos de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 4 se mezclan con entendedores y/o agentes de superficie activa.

- ❖ La clasificación según la IPC correspondiente al objeto de la solicitud es A01N43/74.

3. REIVINDICACIONES DE USO

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

En cumplimiento a este artículo se procedió a evaluar la patentabilidad de la reivindicación 9 que se refiere al uso de los compuestos de fórmula (I) en el control de nemátodos. En consecuencia de lo anterior se considera que en ningún momento la Decisión estipula que se le otorgue una patente de USO, sino que simplemente se otorgará el privilegio a las que sean de producto y procedimiento, por lo tanto esta reivindicación no es patentable.

4. DETERMINACIÓN DEL ESTADO DE LA TÉCNICA

- ❖ La fecha a partir de la cual se realizó la búsqueda de anterioridades corresponde al 5 de julio de 1999.
- ❖ Con base a lo anterior y la definición dada en el art. 16.- "Una invención se considerará nueva cuando no está comprendida en el estado de la técnica.
El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso, de la prioridad reconocida.

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente

48
735

que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40.", se realizó la búsqueda de anterioridades en los archivos con que cuenta esta Oficina y se encontraron los siguientes documentos relacionados con la materia de la presente solicitud:

N°	DOCUMENTO	TÍTULO	FECHA DE PUBLICACIÓN
D1	WO 86/07590	Pesticidal polyhaloalkene derivatives	1986-12-31
D2	WO 95/24403	(4,4-difluorobut-3-enylthio)-substituted heterocyclic or carbocyclic ring compounds having pesticidal activity	1995-09-14

5. EVALUACIÓN DE LOS REQUISITOS DE PATENTABILIDAD

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología , siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

5.1 Evaluación del NIVEL INVENTIVO

De acuerdo al art. 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.", se conceptúa:

La anterioridad D1 divulga compuestos derivados de polihaloalquenos de fórmula (I) descritos en la página 2 de este documento. Específicamente esta publicación revela el compuesto 230 (página 23 de D1) en el cual se puede observar que corresponde al mismo tipo de sustancias que se reclaman en la presente solicitud con la única diferencia de la sustitución en la posición 5 por un halógeno.

La anterioridad D2 enseña en la tabla VII compuestos que pertenecen a la misma familia de las sustancias reclamadas en la presente solicitud. De manera puntual, se encuentra que los inventores de esta publicación han ensayado una gran cantidad de compuestos variando algunos sustituyentes donde el núcleo difluoro butenil puede estar unido a un grupo tio, sulfinil o sulfonil y éste a su vez a un anillo tiazol; con lo que se tienen los compuestos VII.1 a VII.3, sin sustitución en la posición 5 y luego los compuestos VII.14 a VII.16 y de VII.24 a VII.26 con una sustitución de un halógeno en R5.

Se considera que a partir del estado del arte es posible que una persona medianamente versada en el tema correspondiente pueda derivar los compuestos que se reclaman ya que si en 1986 era conocido el núcleo básico de los trifluorbutenos con actividad nematocida, la inclusión de un átomo de halógeno en el anillo tiazol de estos polihaloalquenos se puede evidenciar de una manera lógica por medio de un análisis de D2. Vale anotar que en 1995 este mismo tipo de polihaloalquenos habían sido estudiados realizando varias sustituciones desde halógenos en la posición 5 hasta la variación de todos los sustituyentes del anillo en las diferentes posiciones. Así, el estudio completo de D2 inicia en los compuestos básicos VII.1 a VII.3 donde no hay sustitución hasta la inclusión de diferentes halógenos o de otro tipo de radicales en la

misma posición o en otra así como, el cambio de posición en el anillo del polihaloalquénil.

El estudio realizado en D2 permite obtener una visión bastante amplia del tipo de compuestos derivados del núcleo (4,4-difluorobut-3-enililo)-sustituido) sin que ello implique una modificación en el tipo de actividad (nematicida). Si bien es cierto, serán unos más activos que otros pero también es cierto que estos resultados pueden ser obtenidos de manera obvia por la persona del oficio a partir de ensayos sistemáticos convencionales altamente conocidos en el estado de la técnica.

La combinación de D1 y D2 pone en evidencia que los trifluorbutenos-tiazol sustituidos pueden ser derivados del arte ya que antes se habían ensayado compuestos con el mismo núcleo en los que precisamente se había sustituido específicamente esa posición por un átomo de halógeno.

En conclusión los derivados que se reclaman se podrían derivar de aquellas sustancias reveladas por D1 y D2 y por ello se considera que, es lógico para la persona del oficio que si la actividad nematicida persiste aún con los cambios o modificaciones realizadas en el arte entonces intercambiar sustituyentes de manera sistemática en las mismas posiciones hasta encontrar alguna estructura distinta no supone un salto cualitativo en la formulación de la regla técnica y por tanto las reivindicaciones 1 a 4 y 7 relacionadas con los compuestos y la composición nematicida no tendrían nivel inventivo.

En cuanto a los procedimientos de preparación de los compuestos de fórmula (I) definidos en las reivindicaciones 5 y 6, es importante anotar que éstos corresponden a procesos de halogenación y oxidación convencionales conocidos ampliamente por la persona medianamente versada en el arte técnico correspondiente donde los intervalos de temperatura y de presión son bastante amplios que prácticamente incluye condiciones muy generales de operación en las que seguramente existen posibilidades donde efectivamente no se lleve a cabo la reacción. Tal como se presentan, los procedimientos de preparación corresponden a materia que resultaría obvia de deducir y proponer con el fin de llegar a los compuestos de las reivindicaciones 1 a 4 por la persona del oficio sin que ello implique un salto en la formulación de la regla técnica que amerite el privilegio requerido.

Es de información básica para el técnico en química conocer los medios de halogenar un anillo, así como el de oxidar un átomo de azufre que se encuentre en una cadena de una sustancia orgánica. En este orden de ideas, se considera que la materia reclamada es del conocimiento básico y de conjunto del técnico, es decir que si se quiere halogenar se utiliza un agente halogenante y si se desea oxidar se selecciona o se realiza la reacción en presencia de un oxidante, obviamente bajo determinadas condiciones de presión o de temperatura y por tanto no tendrían nivel inventivo, las reivindicaciones 5 y 6.

Respecto al método para combatir nemátodos de la reivindicación 8, este método tal como está reivindicado no define ninguna condición o etapa característica diferente a la forma comúnmente utilizada para aplicar un nematicida para que ejerza su acción, ya que, es obvio que si se quieren combatir nemátodos, lo más lógico es que se aplique un producto que tenga propiedades nematicidas; se considera que tal como se reivindica no se indican en forma específica las condiciones especiales de aplicación de la composición que lo diferencien de los demás métodos convencionales de aplicación. Por lo anterior, carecería de nivel inventivo.

Igualmente ocurre con el procedimiento para la preparación de composiciones nematicidas que consiste en la única etapa o acción de mezclar el principio activo con los extensores y/o agentes de superficie activa; este tipo de procedimientos resultan verdaderamente obvios para cualquier persona que desee hacer una composición. Vale decir que esta única etapa es la más ampliamente conocida en el estado del arte para llegar a una composición o en el quehacer rutinario de las formulaciones. En

148
137

consecuencia carecería a todas luces de nivel inventivo, máxime porque los principios activos o los compuestos por ningún motivo ni circunstancia caracterizan a las reivindicaciones de procedimiento de formulación del mismo ya que como es de conocimiento general, los procedimientos se caracterizan por la secuencia de etapas especiales y las condiciones específicas bajo las cuales se realicen.

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 la 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 No. 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha **27 ABR. 2006**

CONCEPTO TÉCNICO N° 539 (2006-04-21)	EXAMINADOR TÉCNICO CÓDIGO 202001	EXAMINADOR JURÍDICO CÓDIGO
--	--	--------------------------------------

270406