

TM TAMAYO & ASOCIADOS
INTERNATIONAL PATENT AND TRADEMARK OFFICE

Trademark
Patent
Health Permit
Software
Commercial Name
Design

Marcas
Patentes
Registros Sanitarios
Soporte Lógico
Nombres Comerciales
Diseños

12
364

Señores
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**
E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-108139-00007-0000

Fecha: 2007-11-29 12:15:09 Dep. 2020 NULCRLACIONI
Código: 05-108139-00007-0000 Live: 579 FASENACIONALII
Código de FASENACION Folios: 2

REF: EXPEDIENTE No. 05-108139
SOLICITUD INTERNACIONAL: PCT/US/2004/012890
ACTUACIÓN: SOLICITUD DE EXAMEN PATENTABILIDAD

Estimados señores:

Con fundamento jurídico en lo dispuesto por el Artículo (44) de la Decisión (486) de la Comisión de la Comunidad Andina de Naciones (CAN) ruego a ustedes disponer lo pertinente para proceder al Examen de Patentabilidad de la Solicitud citada en la referencia, para lo cual estamos adjuntando el recibo de pago correspondiente a la tasa vigente para este caso.

En consecuencia, esperamos se surta este trámite para que el expediente siga su curso normal, hasta su concesión.

Atentamente,


CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ.

C.C. No. 17.117.818- Bogotá

T.P. No. 17.402- C.S.J.

Anexo.- Recibo de Pago No. 07 - 97441

Carrera 13 A No. 28-38 Mz 2 Bufette 245 Parque Central Bavaria
Tel. (57 1) 341 9841 - FAX (57 1) 336 8592 - Cel. (315) 317 1181
E-mails: consultas@tmtamayo.net, carlos.tamayo@tmtamayo.net
www.tmtamayo.com / Bogotá D.C., COLOMBIA, S.A.

100176089-2

REAGENZIE E REATTIVI ANALITICI

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CARLOS TAMAYO Y ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-8	57478275	29/11/2007	1.667.000.00

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	404,000.00
		TOTAL :	\$ 404,000.00

RESPONSIBLE : _____ *W*

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N.º.

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-108139

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **578** DE

FECHA **31 DE JULIO DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL **26 DE OCTUBRE DE 2007**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO X

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2001年6月21日 (21.06.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/44154 A1(51) 国際特許分類: C07C 47/575, 49/84, 251/48,
251/52, 251/54, 239/20, A01N 35/10, 43/40, 43/80, 43/82,
C07D 213/64, 213/62

山田里砂 (YAMADA, Risa) [JP/JP]; 〒227-0033 神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番地 三菱化学株式会社 横浜総合研究所内 Kanagawa (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/08870

(74) 代理人: 弁理士 小栗昌平, 外(OGURI, Shohei et al.);
〒107-6028 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク
森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2000年12月14日 (14.12.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願平 11/339045
1999年12月17日 (17.12.1999) JP
特願平 11/363517
1999年12月21日 (21.12.1999) JP(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV,
MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT,
RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA,
UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三菱化学株式会社 (MITSUBISHI CHEMICAL CORPORATION) [JP/JP]; 〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 Tokyo (JP).

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) 発明者: および

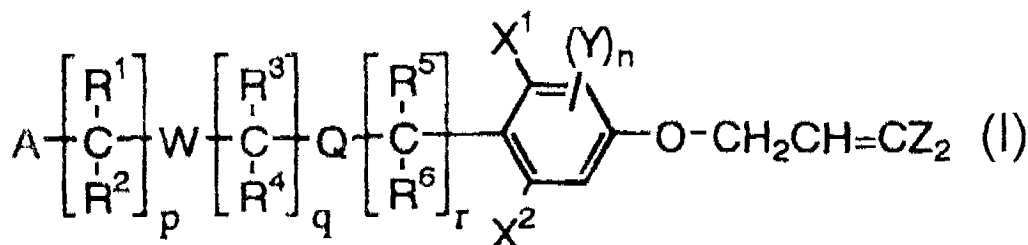
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 桂田 学 (KAT-SURADA, Manabu) [JP/JP]; 〒100-0005 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 三菱化学株式会社内 Tokyo (JP). 川田晋司 (KAWATA, Shinji) [JP/JP]. 興村伸夫 (KYOMURA, Nobuo) [JP/JP]. 志賀 靖 (SHIGA, Yasushi) [JP/JP]. 福地俊樹 (FUKUCHI, Toshiaki) [JP/JP].

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DIHALOPROPENYLOXYBENZENE DERIVATIVES AND PESTICIDES CONTAINING THE SAME AS THE ACTIVE INGREDIENT

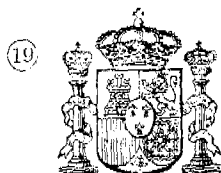
(54) 発明の名称: ジハロプロペンルオキシベンゼン誘導体及びこれを有効成分とする有害生物防除剤

(57) Abstract: Dihalopropenyloxybenzene derivatives represented general formula (I) which have a very excellent effect of controlling pests in the field of agriculture, horticulture, daily life, livestock, pets, etc. (in particular, injurious insects and mites in the fields of agriculture and horticulture) and are highly safe to mammals and fishes wherein A represents aryl, a heterocycle, etc.; W represents oxygen, sulfur, etc.; Q represents aryl, a heterocycle, etc.; R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and R⁶ represent each hydrogen, alkyl, etc., or R¹ and R², R³ and R⁴, and R⁵ and R⁶ may form together each alkylidene or alkylenedioxy; p, q and r are each an integer provided that p + q + r is not more than 9; X¹ and X² represent each halogeno, alkyl, etc.; Y represents halogeno, alkyl or haloalkyl; n is an integer of 0 to 2; and Z represents halogeno.

[続葉有]



WO 01/44154 A1



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

⑪ Número de publicación: **2 187 652**

⑤① Int. Cl. 7: A01N 43/40

A01N 43/54

C07D 401/10

C07D 403/10

C07D 413/10

C07D 417/10

⑫

TRADUCCION DE PATENTE EUROPEA

T3

⑧⑥ Número de solicitud europea: **96915881.5**

⑧⑥ Fecha de presentación: **17.05.1996**

⑧⑦ Número de publicación de la solicitud: **0 844 825**

⑧⑦ Fecha de publicación de la solicitud: **03.06.1998**

⑤④ Título: **N-(arimetil-sustituidas)-4-(bis(fenil o piridil sustituidas)metil) piperidinas insecticidas.**

③⑩ Prioridad: **19.05.1995 US 444698**

⑦③ Titular/es: **FMC CORPORATION**
1735 Market Street
Philadelphia, PA 19103, US

④⑤ Fecha de la publicación de la mención BOPI: **16.06.2003**

⑦② Inventor/es: **Silverman, Ian R.;**
Cohen, Daniel H.;
Lyga, John W.;
Szczepanski, Steven W.;
Ali, Syed F.;
Cullen, Thomas G.;
Henrie, Robert N., II y
Peake, Clinton J.

④⑥ Fecha de la publicación del folleto de patente: **16.06.2003**

⑦④ Agente: **González Palmero, Fé**

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

ES 2 187 652 T3

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula:

5

10

15

en la que

U es $-(CH_2)_n$;

20

Q es hidroxilo;

R es

25

30

35

en la que

V, W, Y y Z son, cada uno, hidrógeno;

40

X es un heterociclo de cinco o seis miembros; opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, o aminocarbonilo; y el heterociclo está opcionalmente conectado al anillo fenilo a través de una unión $-O-$, $-S-$, $-(CH_2)_p$, $-C(O)-$, o $-O-(CR^3R^4)_q$;

45

R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de fenilo o piridilo sustituido con haloalquilo o alcoxilo;

R^3 y R^4 se seleccionan independientemente de hidrógeno y metilo;

n y p son, independientemente, 1, 2 ó 3; y q es 1 ó 2;

50

con la condición de que al menos uno de R^1 y R^2 está sustituido en la posición para; no más de dos de R^3 y R^4 son metilo; cada resto alifático contiene no más de 4 átomos de carbono; halógeno significa bromo, cloro o flúor; cada heterociclo contiene de 1 a 4 átomos de nitrógeno, o 1 ó 2 átomos de oxígeno o azufre, o 1 ó 2 átomos de nitrógeno y un átomo de oxígeno o azufre;

55

y los correspondientes N-óxidos y sales agrícolamente aceptables.

60

2. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que en X el heterociclo se selecciona de 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, oxazolin-2-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirimidin-2-ilo, pirol-3-ilo, 2H-tetrazol-5-ilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo y 1,2,4-triazol-3-ilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alcoxialquilo, o haloalcoxialquilo, y la unión opcional se selecciona de $-O-$, $-(CH_2)_p$, $C(O)$ o $-O-CH(CHR^3)_q$;

ES 2 187 652 T3

R^1 y R^2 se seleccionan, independientemente, de trifluorometilfenilo, trifluorometoxifenilo, 5-trifluorometilpirid-2-ilo y 5-trifluorometoxipirid-2-ilo;

n es 1, y p y q se seleccionan, independientemente, de 1 y 2;

con la condición de que halógeno significa cloro o flúor.

3. Un compuesto de la reivindicación 2, en el que el sustituyente opcional X se selecciona de alquilo, alcoxilo, ciano, $-(CH_2)_rF$, donde r es 1, 2 ó 3, CHF_2 , CF_3 , y CH_2OCH_3 ; la unión opcional se selecciona de $-O-$, $-O-CH_2-$, y $-O-CH(CH_3)-$; y tanto R^1 como R^2 están sustituidos en la posición para.

4. Un compuesto de la reivindicación 3, en el que R^1 y R^2 se seleccionan independientemente de trifluorometilfenilo y trifluorometoxifenilo.

5. Un compuesto de la reivindicación 4, en el que en el heterociclo X es 2H-tetrazol-5-ilo sustituido en la posición 2.

6. El compuesto de la reivindicación 5, que es N-[4(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenilmetil]-4-[bis(4 trifluorometilfenil)hidroximetil]piperidina.

7. El compuesto de la reivindicación 5, que es N-óxido de N-[4-(2-metil-2H-tetrazol-5-il)fenilmetil]-4-[bis(4-trifluorometilfenil)hidroximetil]piperidina.

8. El compuesto de la reivindicación 5, que es N-[4(2-etil-2H-tetrazol-5-il)fenilmetil]-4-[bis(4 trifluorometilfenil)hidroximetil]piperidina.

9. El compuesto de la reivindicación 5, que es N-[4-[2 (2-fluoroetil) -2H-tetrazol-5-il] fenilmetil]-4-[bis(4-trifluorometilfenil)hidroximetil]piperidina.

10. Un compuesto de la reivindicación 4, en el que en el heterociclos en X es piridin-2-ilo, opcionalmente sustituido en la posición 6.

11. El compuesto de la reivindicación 10 que es N-[4-(piridin-2-il)fenilmetil]-4-[bis(4-trifluorometilfenil)-hidroximetil]piperidina.

12. El compuesto de la reivindicación 10 que es N-[4-(piridin-2-iloxi)fenilmetil] (4) [bis(4-trifluorometilfenil)-hidroximetil]piperidina.

13. Un compuesto de la reivindicación 4, en el que en el heterociclo en X es pirimidin-2-ilo, opcionalmente sustituido en la posición 4.

14. El compuesto de la reivindicación 13 que es N-[4-(pirimidin-2-iloxi)fenilmetil]-4-[bis(4-trifluorometilfenil)hidroximetil]piperidina.

15. El compuesto de la reivindicación 12 que es N-[4-(pirimidin-2-il)fenilmetil]-4-[bis(4-trifluorometilfenil)-hidroximetil]piperidina.

16. Un compuesto de la reivindicación 3, en el que R^1 y R^2 se seleccionan, independientemente, de 5-trifluorometilpirid-2-ilo y 5-trifluorometoxipirid-2-ilo.

17. El compuesto de la reivindicación 16, que es N-[4-(2-etil-2H-tetrazol-5-il)fenilmetil]-4-[bis(5-trifluorometilpirid-2-il)hidroximetil]piperidina.

18. Una composición que contiene una cantidad insecticidamente eficaz de un compuesto de la reivindicación 1, en mezcla con al menos un diluyente o adyuvante.

19. Un procedimiento de control de insectos que comprende aplicar al lugar donde se desea el control, una cantidad insecticidamente eficaz de una composición de la reivindicación 18.

20. El compuesto N-óxido de N-[4-(2-etil-2H-tetrazol-5-il)fenilmetil]-4-[bis(5-trifluorometilfenil)-hidroximetil]piperidina.

ES 2 187 652 T3

21. Una composición insecticida que comprende una cantidad insecticidamente eficaz de un compuesto de la reivindicación 20 en mezcla con adyuvantes y vehículos.

22. Un procedimiento para controlar insectos que comprende la etapa de aplicar a un lugar donde se desea el control, una cantidad insecticidamente eficaz de una composición de la reivindicación 21.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

NOTA INFORMATIVA: Conforme a la reserva del art. 167.2 del Convenio de Patentes Europeas (CPE) y a la Disposición Transitoria del RD 2424/1986, de 10 de octubre, relativo a la aplicación del Convenio de Patente Europea, las patentes europeas que designen a España y solicitadas antes del 7-10-1992, no producirán ningún efecto en España en la medida en que confieran protección a productos químicos y farmacéuticos como tales.

Esta información no prejuzga que la patente esté o no incluida en la mencionada reserva.



US005922880A

United States Patent [19]**Sakamoto et al.**[11] **Patent Number:** **5,922,880**[45] **Date of Patent:** **Jul. 13, 1999**

[54] **DIHALOPROPENE COMPOUNDS,
INSECTICIDAL/ACARICIDAL AGENTS
CONTAINING SAME, AND INTERMEDIATES
FOR THEIR PRODUCTION**

[75] **Inventors:** Noriyasu Sakamoto; Sanshiro
Matsuo, both of Toyonaka; Masaya
Suzuki, Takarazuka; Taro Hirose,
Osaka; Kazunori Tsushima, Sanda;
Kimitoshi Umeda, Funabashi, all of
Japan

[73] **Assignee:** Sumitomo Chemical Company,
Limited, Osaka-fu, Japan

[21] **Appl. No.:** 08/809,865

[22] **PCT Filed:** Oct. 12, 1995

[86] **PCT No.:** PCT/JP95/02080

§ 371 Date: May 20, 1997

§ 102(e) Date: May 20, 1997

[87] **PCT Pub. No.:** WO96/11909

PCT Pub. Date: Apr. 25, 1996

[30] **Foreign Application Priority Data**

Oct. 14, 1994 [JP] Japan 6-249296
Apr. 17, 1995 [JP] Japan 7-091187

[51] **Int. Cl.⁶** C07D 211/72; C07D 211/84;
C07D 213/69; C07D 213/70

[52] **U.S. Cl.** 546/296; 546/153; 546/156;
546/159; 546/168; 546/152; 546/303; 546/304;
546/290; 546/326; 546/329; 546/339; 546/346;
546/296; 546/293; 546/301; 546/302; 546/294;
504/247; 504/248; 504/249; 504/244; 504/254

[58] **Field of Search** 546/153, 160,
546/159, 168, 152, 303, 304, 290, 326,
329, 339, 346, 293, 301, 302, 192, 337,
296, 294; 504/247, 248, 249, 244, 254

[56] **References Cited****U.S. PATENT DOCUMENTS**

4,048,235 9/1977 Karrer 568/631
4,123,556 10/1978 Karrer 514/719

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

0203798 12/1986 European Pat. Off. .
0218543 4/1987 European Pat. Off. .
60-237056 11/1985 Japan .
4-342568 11/1992 Japan .
4342568 11/1992 Japan .

OTHER PUBLICATIONS

J. Org. Chem., 31, 3666-3671 (1966), Dorman, Linneaus.
English language abstract of JP 04-342568 A.
English language abstract of JP 60-237056 A.

Primary Examiner—D. Margaret M. Mach
Attorney, Agent, or Firm—Birch, Stewart, Kolasch & Birch,
LLP

[57] **ABSTRACT**

The dihalopropene compounds of the general formula [I]
have excellent insecticidal/acaricidal activity, so that they
are satisfactorily effective for the control of noxious insects,
mites and ticks.

73 Claims, No Drawings

5,922,880

1 **DIHALOPROPENE COMPOUNDS, INSECTICIDAL/ACARICIDAL AGENTS CONTAINING SAME, AND INTERMEDIATES FOR THEIR PRODUCTION**

This application is a 371 of PCT/JP95/02080, filed Oct. 12, 1995.

TECHNICAL FIELD

The present invention relates to dihalopropene compounds, insecticidal/acaricidal agents containing these compounds as active ingredients, and intermediates for their production.

BACKGROUND ART

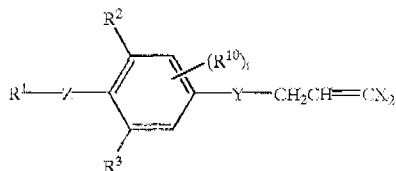
As disclosed in JP-A 48-86835/1973 and JP-A 49-1526/1974, for example, it is well known that some kinds of propene compounds can be used as an active ingredient of insecticides.

In view of their insecticidal/acaricidal activity, it cannot always be said that these compounds are satisfactorily effective for the control of noxious insects, mites and ticks.

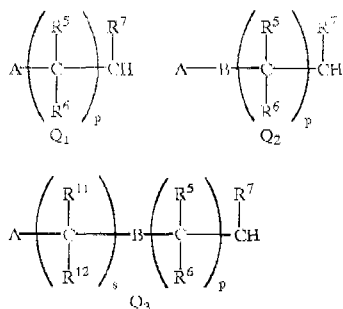
DISCLOSURE OF INVENTION

The present inventors have intensively studied to find a compound having excellent insecticidal/acaricidal activity. As a result, they have found that particular dihalopropene compounds have satisfactory insecticidal/acaricidal activity for the control of noxious insects, mites and ticks, thereby completing the present invention.

That is, the present invention provides a dihalopropene compound (hereinafter referred to as the present compound) of the general formula:

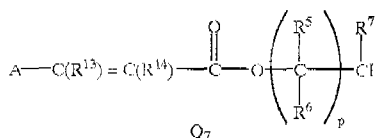
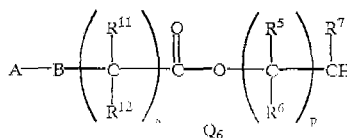
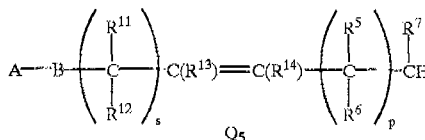
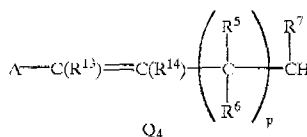


wherein Z is oxygen, sulfur or NR⁴ (wherein R⁴ is hydrogen or C₁-C₃ alkyl); Y is oxygen, sulfur or NH; X's are independently chlorine or bromine; R², R³ and R¹⁰ are independently halogen, C₁-C₃ haloalkyl or C₁-C₃ alkyl; t is an integer of 0 to 2; and R¹ is Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅, Q₆ or Q₇ of the general formula:



2

continued

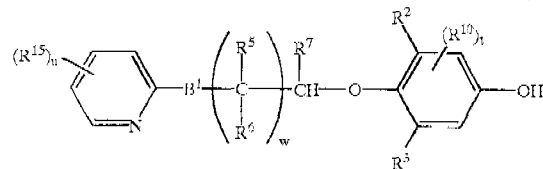


wherein A is an optionally substituted heterocyclic ring group, provided that when A is an optionally substituted heterocyclic ring group containing two oxygen atoms and a condensed benzene ring, A is optionally substituted 1,3-benzodioxolan-2-yl or optionally substituted 1,4-benzodioxan-2-yl; B is oxygen, S(O)_q, NR⁹, C(=G¹)G² or G³C(=G²); q is an integer of 0 to 2; R⁹ is hydrogen, acetyl or C₁-C₃ alkyl; G¹ and G² are independently oxygen or sulfur; R⁵, R⁶, R⁷, R¹¹ and R¹² are independently hydrogen, C₁-C₃ alkyl or trifluoromethyl; R¹³ and R¹⁴ are independently hydrogen, C₁-C₃ alkyl, trifluoromethyl or halogen; p is an integer of 0 to 6; and s is an integer of 1 to 6.

The present invention further provides an insecticidal/acaricidal agent containing the above dihalopropene compound as an active ingredient.

The present invention further provides the following compounds which are useful as intermediates for producing some of the present compounds:

a phenol compound which is 3,5-dichloro-4-(2-(2-(4-chlorophenyl)-1,3-dioxolan-4-yl)ethoxy)phenol; compounds of the general formula:



wherein R⁵, R⁶ and R⁷ are independently hydrogen, C₁-C₃ alkyl or trifluoromethyl; R¹⁵ is halogen, C₁-C₃ alkyl, C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy or C₁-C₃ haloalkoxy; R², R³ and R¹⁰ are independently halogen, C₁-C₃ alkyl or C₁-C₃ haloalkyl; t is an integer of 0 to 2; u is an integer of 1 to 4; w is an integer of 1 to 4; and B¹ is oxygen, S(O)_q or NR⁹ wherein R⁹ is hydrogen, acetyl or C₁-C₃ alkyl and q is an integer of 0 to 2; compounds of the general formula [I] wherein R⁵, R⁶ and R⁷ are all hydrogen; and R² and R³ are independently halogen or C₁-C₃ alkyl; and



US005952386A

United States Patent [19]

Matsuo et al.

[11] Patent Number: 5,952,386

[45] Date of Patent: Sep. 14, 1999

[54] DIHALOPROPENE COMPOUNDS,
INSECTICIDES CONTAINING THEM AS
ACTIVE INGREDIENTS, AND
INTERMEDIATES FOR THEIR
PRODUCTION

[75] Inventors: Sanshiro Matsuo, Toyono-gun; Taro
Hirose; Kelichi Izumi, both of
Toyonaka; Masaya Suzuki, Takarazuka;
Noriyasu Sakamoto, Toyonaka;
Kazunori Tsushima, Sanda; Shigeru
Saito, Toyonaka; Hirotaka Takano,
Sanda, all of Japan

[73] Assignee: Sumitomo Chemical Company,
Limited, Osaka, Japan

[21] Appl. No.: 08/913,879

[22] PCT Filed: Apr. 11, 1996

[86] PCT No.: PCT/JP96/00989

§ 371 Date: Sep. 24, 1997

§ 102(e) Date: Sep. 24, 1997

[87] PCT Pub. No.: WO96/33160

PCT Pub. Date: Oct. 24, 1996

[30] Foreign Application Priority Data

Apr. 18, 1995 [JP] Japan 7-092868
Jan. 9, 1996 [JP] Japan 8-001774

[51] Int. Cl.⁶ A01N 33/02; C07C 47/56;
C07C 333/00; C07C 303/00; C07C 69/76;
C07D 319/02; C07C 327/00; C07C 325/00;
C07C 49/23; C07C 39/12

[52] U.S. Cl. 514/651; 514/452; 514/464;
514/465; 514/466; 514/476; 514/482; 514/485;
514/486; 514/488; 514/489; 514/510; 514/513;
514/522; 514/524; 514/538; 514/543; 514/544;
514/580; 514/584; 514/585; 514/588; 514/594;
514/595; 514/596; 514/597; 514/598; 514/599;
514/602; 514/603; 514/605; 514/608; 514/613;
514/617; 514/618; 514/619; 514/621; 514/625;
514/626; 514/629; 514/646; 514/649; 514/651;
558/234; 558/236; 558/238; 558/239; 558/240;
558/242; 558/413; 558/414; 558/422; 558/423;
558/425; 560/12; 560/13; 560/15; 560/16;
560/18; 560/24; 560/27; 560/29; 560/30;
560/34; 560/37; 560/38; 560/39; 560/41;
560/42; 560/43; 560/45; 560/47; 560/17;
560/20; 560/21; 560/22; 560/23; 560/51;
560/53; 560/54; 560/102; 560/104; 560/106;
560/163; 549/365; 549/436; 549/438; 549/437;
549/439; 549/440; 549/443; 549/445; 564/23;
564/27; 564/28; 564/29; 564/45; 564/49;
564/50; 564/52; 564/53; 564/54; 564/57;
564/59; 564/60; 564/74; 564/77; 564/84;
564/85; 564/86; 564/88; 564/91; 564/92;

564/162; 564/164; 564/168; 564/169; 564/212;
564/219; 564/366; 564/372; 568/20; 568/39;
568/41; 568/49; 568/45; 568/51; 568/52;
568/54; 568/56; 568/74; 568/325; 568/329;
568/331; 568/335; 568/337; 568/631; 568/634;
568/649; 568/655; 568/745

[58] Field of Search 568/647, 674;
424/406; 514/345, 657, 720; 564/123, 133,
85; 560/148, 157

[56] References Cited

U.S. PATENT DOCUMENTS

5,530,015 6/1996 Sakamoto et al. .

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

0169169 1/1986 European Pat. Off. .
0218543 4/1987 European Pat. Off. .
1420171 1/1976 United Kingdom .
1424211 2/1976 United Kingdom .
9604228 2/1996 WIPO .

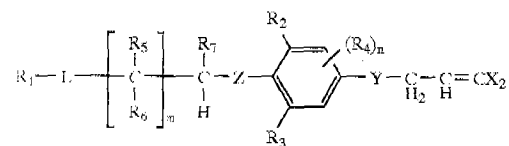
Primary Examiner—Shailendra Kumar

Assistant Examiner—Sreeni Padmanabhan

Attorney, Agent, or Firm—Birch, Stewart, Kolasch & Birch,
LLP

[57] ABSTRACT

The present invention provides dihalopropene compounds
of the general formula:



wherein R_1 is C_1 - C_{10} alkyl or the like; L is $C(=O)NH$ or
the like; R_2 , R_3 and R_4 are independently halogen or the like;
 R_5 , R_6 and R_7 are independently hydrogen or the like; m is
an integer of 0 to 4; n is an integer of 0 to 2; X is chlorine
or the like; Y is oxygen or the like; and Z is oxygen or the
like, which have excellent insecticidal activity so that they
are satisfactorily effective for the control of noxious insects.

43 Claims, No Drawings

5,952,386

1

**DIHALOPROPENE COMPOUNDS,
INSECTICIDES CONTAINING THEM AS
ACTIVE INGREDIENTS, AND
INTERMEDIATES FOR THEIR
PRODUCTION**

This is the US National stage Application of PCT/JP96/
6098 filed Apr. 11, 1996 now WO96/33160 published Oct.
24, 1996.

TECHNICAL FIELD

The present invention relates to dihalopropene
compounds, insecticides containing them as active
ingredients, and intermediates for their production.

BACKGROUND ART

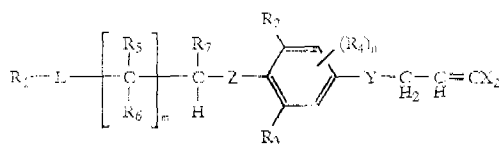
As disclosed in JP-A48-86835/1973 and JP-A 49-1526/
1974, for example, it is well known that some kinds of
propene compounds can be used as active ingredients of
insecticides.

In view of their insecticidal activity, however, it cannot
always be said that these compounds are satisfactorily
effective for the control of noxious insects.

DISCLOSURE OF INVENTION

The present inventors have intensively studied to find a
compound having excellent insecticidal activity. As a result,
they have found that particular dihalopropene compounds
have satisfactory insecticidal activity for the control of
noxious insects, thereby completing the present invention.

That is, the present invention provides dihalopropene
compounds of the general formula:



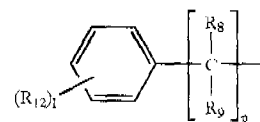
wherein

- m is an integer of 0 to 4;
- n is an integer of 0 to 2;
- X's are independently chlorine or bromine;
- Y is oxygen, NH or sulfur; and
- Z is oxygen, sulfur or NR₁₅ in which R₁₅ is hydrogen or
C₁-C₃ alkyl;
- R₂, R₃ and R₄ are independently halogen, C₁-C₃
haloalkyl or C₁-C₃ alkyl;
- R₅, R₆ and R₇ are independently hydrogen, C₁-C₅ alkyl
or trifluoromethyl;
- L is C≡W, C(=W)NR₁₃, NR₁₃C(=W), SO₂NR₁₃,
NR₁₃SO₂, NR₁₃C(=W₁)-W, W(C(=W₁)NR₁₃ or
NR₁₄C(=W)NR₁₃ in which W and W₁ are indepen-
dently oxygen or sulfur, and R₁₃ and R₁₄ are indepen-
dently hydrogen, C₁-C₁₀ alkyl, C₁-C₅ haloalkyl,
C₂-C₁₀ alkenyl, C₁-C₆ haloalkenyl, C₃-C₆ alkynyl or
C₃-C₅ haloalkynyl;
- R₁ is C₁-C₁₀ alkyl, C₃-C₅ haloalkyl, C₂-C₁₀ alkenyl,
C₂-C₆ haloalkenyl, C₃-C₉ alkynyl, C₃-C₅ haloalkynyl,
C₂-C₇ alkoxyalkyl, C₂-C₇ alkylthioalkyl,
- C₄-C₆ cycloalkyl optionally substituted with C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₃ haloalkoxy,

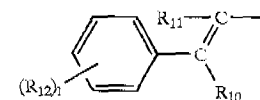
2

- C₄-C₉ cycloalkylalkyl optionally substituted with C₁-C₄
alkyl,
- C₅-C₆ cycloalkenyl optionally substituted with C₁-C₄
alkyl, C₆-C₈ cycloalkenylalkyl optionally substituted
with C₁-C₄ alkyl,
- an optionally substituted heterocyclic group, Q₁, Q₂, Q₃
or Q₄ of the general formula:

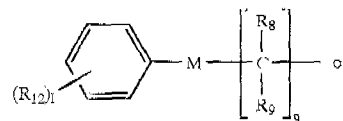
[II]



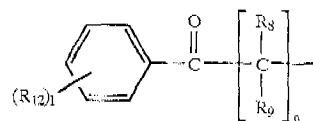
Q₁



Q₂



Q₃



Q₄

in which

- M is oxygen, NH or sulfur,
- l is an integer of 0 to 5,
- p is an integer of 0 to 5, and
- q is an integer of 1 to 5;
- R₁₂ is halogen, cyano, nitro, pentafluorosulfanyl (F₅S),
C₁-C₈ alkyl, C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₇ alkoxy, C₁-C₃
haloalkoxy, C₁-C₃ alkylthio, C₁-C₃ haloalkylthio,
C₃-C₆ alkenyloxy, C₃-C₆ haloalkenyloxy, C₁-C₃
hydroxyalkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ haloalkenyl,
C₂-C₄ alkynyl, C₂-C₄ alkynyloxy, C₂-C₄ haloalkynyl,
C₂-C₄ haloalkynyloxy, C₂-C₄ alkoxyalkyl, C₂-C₄
alkylthioalkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₃-C₆ cycloalkenyl,
C₂-C₅ alkoxyalkyl, C₃-C₆ cycloalkyloxy, C₃-C₆
cycloalkenyloxy,
- phenyl optionally substituted with halogen, C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy or C₁-C₃ haloalkoxy,
phenoxy optionally substituted with halogen, C₁-C₄
alkyl, C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy or C₁-C₃
haloalkoxy,
- benzyl optionally substituted with halogen, C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy or C₁-C₃ haloalkoxy,
benzyloxy optionally substituted with halogen, C₁-C₄
alkyl, C₁-C₃ haloalkyl, C₁-C₃ alkoxy or C₁-C₃
haloalkoxy;
- or when l is an integer of 2 to 5, adjacent two R₁₂ are
combined together at their ends to form trimethylene or
tetramethylene, methylenedioxy optionally substituted
with halogen or C₁-C₃ alkyl, or ethylenedioxy option-
ally substituted with halogen or C₁-C₃ alkyl; and
- R₈, R₉, R₁₀ and R₁₁ are independently hydrogen, C₁-C₃
alkyl or trifluoromethyl.

375
376

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
CARLOS ORLANDO MAYA RODRÍGUEZ

ASUNTO	Radicación	05108139
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Oficio	
	Folios	14 0731

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒ Cap. I ☐ Cap. II ☒

No. Sol. Internacional: PCT/US2004/012890
Fecha de Presentación Internacional: 2004-04-27

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

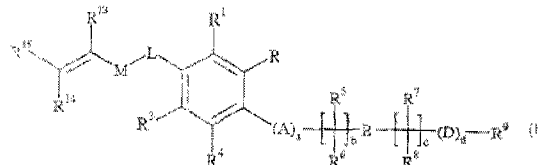
1. Documentos estudiados

- 1.1. Capítulo descriptivo: Folios 9 a 111 tal y como fueron presentados.
- 1.2. Capítulo reivindicatorio: Folios 112 a 127 tal y como fueron presentados.
- 1.3. Prioridad: folio 1 US 60/466674 2003-04-30.

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Derivados cíclicos sustituidos de fenilo. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a derivados cíclicos sustituidos de fenilo de fórmula (I) y sus sales aceptables en agricultura, composiciones que los contienen y métodos para su uso en el control de insectos y acáridos.



La presente solicitud indica que no hay ninguna revelación ó sugerencia en los documentos citados, de las estructuras y actividad pesticida de los compuestos de la presente invención. Y además que estos son sorprendentemente activos en el control de insectos y acáridos.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC A01N43/30; A01N43/32; C07D307/79; C07D307/83; C07D311/04.

376
377

3. De la solicitud de Patente

El título de la solicitud en estudio "Derivados cíclicos sustituidos de fenilo" no refleja el objeto de la invención ni el campo industrial específico al cual esta aplicado. De acuerdo con el artículo 6 del decreto 2591 de 2000. Sírvase modificar el título para que sea representativo del objeto de la invención.

3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En general el capítulo reivindicatorio es **demasiado amplio**. La gran cantidad de sustituyentes y la amplitud para definirlos conllevan a un gran número de posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I).

El capítulo reivindicatorio se considera muy amplio y por lo tanto no cumple con el requisito de concisión.

Es importante aclarar que son tantas las posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I) debido a la gran cantidad y variedad de sustituyentes (*es decir la naturaleza química de estos sustituyentes es muy variada y por lo tanto los compuestos resultantes pueden ser estructural y funcionalmente diferentes*) que la descripción no divulga de manera suficientemente clara y completa la materia divulgada en las reivindicaciones; es más la descripción solo presenta ensayos y resultados con 16 compuestos.

De modo tal que las reivindicaciones son especulativas y sólo presentan una generalización a partir de ensayos puntuales. En consecuencia la reivindicación 1 no solo es demasiado amplia sino que no se encuentra enteramente sustentada en la descripción.

Adicionalmente son tantas las posibilidades de sustitución que se incluyen radicales adicionales a los presentados en la estructura (I); por solo mencionar algunos, G, E, J, K, W, X, Y, R¹⁶ a R²³, etc. Los cuales le restan concisión al capítulo reivindicatorio.

Por otra parte las reivindicaciones 10 y 16 presentan estructuras contenidas en la reivindicación 1. Sin embargo esta presentación de compuestos en reivindicaciones independientes, pueden llegar a afectar la concisión del capítulo reivindicatorio, y no dejar claro el objeto y el alcance de la materia de la invención. En consecuencia se le recomienda al solicitante que limite el objeto de la invención y que enuncie una reivindicación independiente que presente de forma puntual los compuestos de interés, lo cuales deben estar enteramente sustentados en la descripción.

Las reivindicaciones 5, 6, 12 y 13 hacen referencia a composiciones que incluyen el compuesto de interés correspondiente. Sin embargo son descritas de forma muy general y no se indican los componentes específicos y las proporciones de ellos en la combinación. Lo único que presentan es la posibilidad de formular el agroquímico en una composición cualquiera. Se le recomienda al solicitante que retire dichas reivindicaciones, una vez que solo presentan una generalización de una composición y no se encuentran enteramente sustentadas en la descripción. Además de ser concedida la patente tal como lo indica el artículo 52 de la Decisión 486, el titular tendrá derecho a fabricar el producto y comercializarlo.

En conclusión, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión, y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486 o art.22 Tratado PCT.

377
378

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

La reivindicación 1 revela un compuesto de fórmula general (I) el cual puede sustituirse por múltiples radicales (de naturaleza química diferente y que pueden ser sustituidos a su vez) solo por mencionar algunos:

Alquilo, cicloalquilo, alquiltio, ciano, nitro amino, alcoxicarbonilo, imidazolinilo, triazolilo, alquiltiofosfaminato, pantahalotio, etc. Obteniendo así compuestos de estructuras diferentes y naturaleza química diferente.

Por lo tanto la solicitud en estudio no presenta un mismo concepto común inventivo puesto que, el compuesto de fórmula (I) puede derivar en moléculas que no tienen una estructura común representativa. De este modo, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo al art. 25 de la Decisión 486.

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

Los métodos de la reivindicaciones 7, 8, 14 y 15 no hacen referencia a un método propiamente dicho. Pues un método ó proceso es definido por una secuencia lógica de etapas ó pasos que conducen a la fabricación de un producto que reviste una forma tangible. Y resulta evidente que la llamada etapa de "aplicación" no conduce a la fabricación de un producto con una forma tangible. Más bien el método reivindicado se refiere al uso del compuesto de fórmula (I) para el control de insectos ó su locus. Lo cual no es patentable a partir del artículo 21 de la Decisión 486.

2. Determinación del Estado de la Técnica

Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 2003-04-30, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

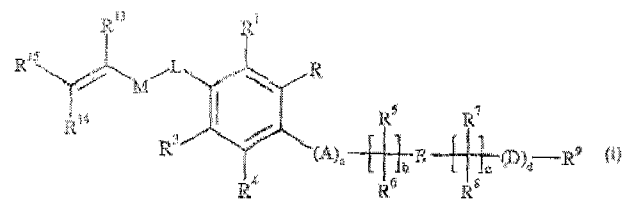
Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	W001/44154	Dihalopropenyloxybenzene derivates and pesticides containing the same as the active ingredient	2001-06-21
D2	ES 2187652	N-(arilmetil-sustituidas)-4-(bis(fenil ó piridil sustituidas)metil) piperidinas insecticidas	1996-05-17
D3	US 5922880	Dihalopropene compounds, insecticidal/acaricidal agents containing same, and intermediates for their production.	1999-07-13
D4	US 5952386	Dihalopropene compounds, insecticidal/acaricidal agents containing same, and intermediates for their production.	1999-09-14

3. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

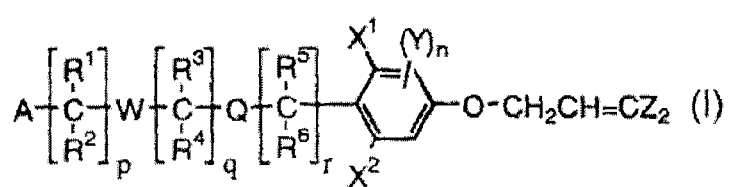
a. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

La presente solicitud de patente de invención divulga derivados cíclicos sustituidos de fenilo de fórmula (I) que son útiles en agricultura por su actividad insecticida.

378
379



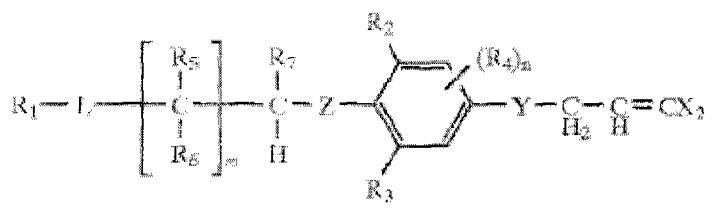
El documento D1 divulga compuestos tipo dihalopropeniloxibenceno de fórmula (I) y su actividad como insecticida.



Cuando se comparan las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (I) de la presente solicitud con las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (I) de D1 se obtienen estructuras **muy cercanas**.

Lo mismo sucede con las estructuras divulgadas en D2, D3 y D4. Donde también se presentan compuestos derivados cíclicos sustituidos de fenilo, como por ejemplo [I].

[I]



La amplia cantidad y variedad de sustituyentes, que son sustituidos a su vez, hacen que cualquiera de las anterioridades citadas sea relevante para la evaluación de nivel inventivo y algunos casos puedan afectar directamente la novedad de los compuestos acá reivindicados. Sin embargo cualquiera de los documentos citados ya había divulgado un núcleo central de derivados cíclicos de fenilo con actividad insecticida.

De este modo un técnico medio en la materia a partir de las enseñanzas de D1, ó combinando las enseñanzas de D1 y D2, D1 y D3 ó D1 y D4 podría fácilmente modificar la estructura reemplazando algunos sustituyentes y aún así seguir esperando una actividad insecticida, tal como ya lo había divulgado el arte previo.

Más aún los derivados de la presente solicitud no representan un salto cualitativo en la técnica, una vez que siguen presentando la misma actividad insecticida, ya conocida. Además no se mostraron resultados que evidencien una mejora ó superioridad respecto al estado del arte, en términos de mayor actividad ó menores dosis de aplicación.

En consecuencia la materia acá presentada surge tan solo como una alternativa evidente para un técnico medio en la materia, y por lo tanto carece de altura inventiva.

379
380

Es importante aclarar varios puntos:

- i. No se mostraron resultados que evidencien un salto cualitativo en la técnica ó un efecto sorpréndete en términos de mayor actividad y menor toxicidad u otro parámetro que justifique la frase “sorprendentemente activos” citada inicialmente.
- ii. La composición de la reivindicaciones 5, 6, 12 y 13 carece de nivel inventivo; pues solo presenta la posibilidad de combinar el compuesto de interés con un auxiliar de formulación aceptable en agricultura, lo cual corresponde a la práctica común en el arte de formular agroquímicos. Se le recomienda al solicitante que retire estas reivindicaciones.
- iii. Por último el método de las reivindicación 13, que como se menciono anteriormente solo se refiere al uso del compuesto de interés; también carece de nivel inventivo debido a que la etapa de “aplicación” corresponde a un proceso universalmente conocido y utilizado (aplicación ó tratamiento) en el campo de los agroquímicos.

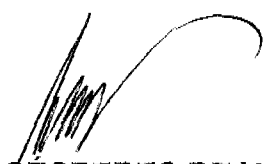
6. Conclusión

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	WO01/44154	1-18	Nivel Inventivo
D2	ES 2187652	1-18	Nivel Inventivo
D3	US 5922880	1-18	Nivel Inventivo
D4	US 5952386	1-18	Nivel Inventivo

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

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


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de División de Nuevas Creaciones
El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

CONCEPTO TÉCNICO No. 3851	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202085
---------------------------	--