

CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 38
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8680
(57-1) 840 0860

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 05-117738-00004-0000

Dep. 2020 NUECREACION
Lvs. 379 FASE NACIONAL II
Folios 2

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 05.117.738
Asunto : Solicitud de Patente para
**DIFLUORMETILBENZOANILIDAS Y SU EMPLEO
PARA LA LUCHA CONTRA LOS
MICROORGANISMOS, ASI COMO PRODUCTOS
INTERMEDIOS Y SU OBTENCION.**
Solicitante : BAYER CROPSCIENCE AG
Clase : A01N 037/018, C07C 233/065
Publicada en : La Gaceta No. 574 Del 30 de marzo de 2007
Fecha de Solicitud : 21 de noviembre de 2005

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 presentada de acuerdo con el Capítulo I del PCT y 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 por valor de \$404.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la resolución No. 38155 de 28 de diciembre de 2006.

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.

Señora Jefe,

EMILIO FERRERO
T.P.A. No. 31.928

COLO-13549-841-038-0
FEH:ASGND-108860/WPC13549
No. M-2007-108860/FEH

170

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176039-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 67,412
FECHA : AGOSTO 22 DE 2007

MINISTERIO DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0
Caja 13549-841-035-0

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABORDOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	63767910	22/08/2007	35,155,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	
	05 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	404,000.00
	TOTAL :	404,000.00

SOM: CUATROCIENTOS CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Bo 13549-841-035-0

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 05-117738

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No 674 DE

FECHA 30 DE MARZO DE 2007 EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA LEY

EXPIRA EL 03 DE JULIO 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



US006534532B1

(12) **United States Patent**
Elbe et al.

(10) Patent No.: **US 6,534,532 B1**
(45) Date of Patent: **Mar. 18, 2003**

(54) **CARBANILIDES AS PESTICIDES**

(75) Inventors: Hans-Ludwig Elbe, Wuppertal (DE);
Bernd-Wieland Krüger, Bergisch
Gladbach (DE); Robert Markert, Köln
(DE); Ralf Thiemann, Leverkusen (DE);
Dietmar Kulmt, Burscheid (DE);
Stefan Detzmann, Langenfeld (DE);
Klaus Stenzel, Düsseldorf (DE);
Christoph Erdelen, Leichlingen (DE);
Martin Kugler, Leichlingen (DE);
Hans-Ulrich Buschhaus, Krefeld (DE)

(73) Assignee: Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen
(DE)

(*) Notice: Subject to any disclaimer, the term of this
patent is extended or adjusted under 35
U.S.C. 154(b) by 38 days.

(21) Appl. No.: 09/955,783

(22) Filed: Sep. 18, 2001

Related U.S. Application Data

(62) Division of application No. 09/230,162, filed as application
No. PCT/EP97/03694 on Jul. 11, 1997, now Pat. No. 6,310,
940.

(30) **Foreign Application Priority Data**

Jul. 24, 1996 (DE) 196 29 828

(51) Int. Cl.⁷ A01N 43/78; A01N 43/40;
A01N 43/26; A01N 43/10; A01N 37/18

(52) U.S. Cl. 514/370; 504/154; 504/155;
504/156; 514/355; 514/374; 514/370; 514/365;
514/432; 514/459; 514/448; 514/517; 546/316;
548/194; 548/200; 548/233; 548/236; 549/113;
549/72; 549/425; 564/86

(58) Field of Search 548/194, 200;
514/370, 365; 504/156

(56) **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

3,057,449 A 4/1972 Davis et al. 424/270
3,074,787 A 7/1972 Frey et al. 260/247

5,223,526 A 6/1993 McLoughlin et al. 514/406
5,330,995 A 7/1994 Ficken et al. 514/355
5,416,103 A 5/1995 Ficken et al. 514/335
5,438,070 A 8/1995 Ficken et al. 514/403
5,480,897 A 1/1996 Ficken et al. 514/365
5,556,988 A 9/1996 Ficken et al. 548/374.1
5,589,493 A 12/1996 Ficken et al. 514/355

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

DE 1913178 10/1999
EP 0 371 950 1/1995
EP 0 292 990 2/1995
WO 95/25723 9/1995

OTHER PUBLICATIONS

J. Org. Chem. (Month Unavailable), 1994, 59, pp.
5214-5229 XP002044965.

Pestic. Biochem. & Physiol. 25, pp. 168-204 (Month
Unavailable), 1986.

Tetrahedron, vol. 51, No. 41, pp. 11165-11176, (Month
Unavailable), 1995—XP002044964.

Chem. Abstr., vol. 106, No. 25, Abstract No. 20935D.

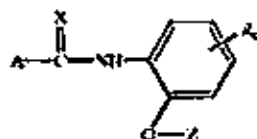
Chem. Abstr., vol. 15, No. 19, Abstract No. 207662.

Primary Examiner—Peter O'Sullivan

(74) Attorney, Agent, or Firm—Joseph C. Gili; John E.
Mrozinski, Jr.

(57) **ABSTRACT**

The invention concerns novel carbanilides of formula (I),



in which A, O, R, X, Z and m have the meanings given in
the description. The invention further concerns a plurality of
processes for preparing these substances, in their use as
microbiocides for controlling undesirable microorganisms
both in crop protection and in the protection of materials.
Additionally, they are suitable for controlling animal pests.

4 Claims, No Drawings

CARBANILIDES AS PESTICIDES

This application is a divisional application of U.S. application Ser. No. 09/230,162, filed Jan. 20, 1999, now U.S. Pat. No. 6,319,940, which in turn was a National Stage application under 37 USC 371 of International application PCT/JP97/02694, filed Jul. 11, 1997.

TECHNICAL FIELD OF THE INVENTION

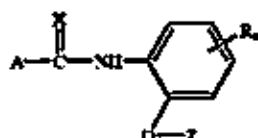
The present invention relates to novel carbanilides, to a plurality of processes for their preparation and to their use for controlling plant and animal pests.

BACKGROUND OF THE INVENTION

It is already known that numerous carboxamides have fungicidal properties (cf. WO 93-11 117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 and EP-A 0 589 313). The activity of these compounds is good, but in some cases leaves something to be desired.

DETAILED DESCRIPTION OF THE INVENTION

This invention, accordingly, provides novel carbanilides of the formula

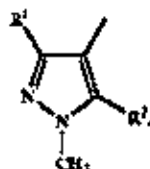


in which

R represents halogen, nitro, cyano, alkyl having 1 to 8 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 to 6 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, alkoxy having 1 to 8 carbon atoms, halogenoalkoxy having 1 to 6 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, allylthio having 1 to 8 carbon atoms, halogenoalkylthio having 1 to 6 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, alkylthio having 1 to 8 carbon atoms, alkoxy having 2 to 8 carbon atoms, alkylthio having 2 to 8 carbon atoms, cycloalkyl having 3 to 8 carbon atoms, carbalkoxy having 1 to 8 carbon atoms in the alkoxy moiety or alkylaminoalkyl having 1 to 6 carbon atoms in the alkoxy moiety and 1 to 6 carbon atoms in the alkyl moiety,

m represents numbers 0, 1, 2, 3 or 4,

A represents a radical of the formula

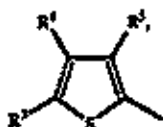


in which

R¹ represents halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms and

R² represents hydrogen, halogen, cyano or alkyl having 1 to 4 carbon atoms, or

A represents a radical of the formula

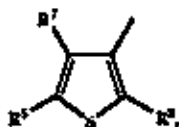


in which

R⁴ and R⁵ independently of one another each represent hydrogen, halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms and

R⁶ represents halogen, cyano, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkoxy having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

A represents a radical of the formula

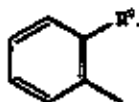


in which

R⁸ and R⁹ independently of one another each represent hydrogen, halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms and

R¹⁰ represents hydrogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or represents halogen, or

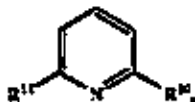
A represents a radical of the formula



in which

R¹¹ represents halogen, cyano, alkyl having 1 to 6 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, halogenoalkoxy having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms or represents halogenoalkylthio having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

A represents a radical of the formula



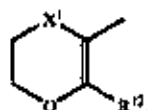
in which

R¹³ represents halogen, cyano, alkyl having 1 to 4 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, alkoxy having 1 to 4 carbon atoms, alkylthio having 1 to 4 carbon atoms or represents halogenoalkoxy having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms and

R¹⁴ represents hydrogen, halogen, cyano, alkyl having 1 to 4 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, alkoxy having 1 to 4 carbon atoms, alkylthio having 1 to 4 carbon atoms or represents halogenoalkoxy having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

3

A represents a radical of the formula

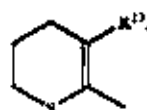


in which

R¹² represents alkyl having 1 to 4 carbon atoms or represents halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms,

X¹ represents a sulphur atom, represents SO, SO₂ or —Cl₁₂, or

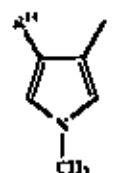
A represents a radical of the formula



in which

R¹³ represents alkyl having 1 to 4 carbon atoms or represents halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

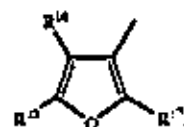
A represents a radical of the formula



in which

R¹⁴ represents halogen, cyano, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

A represents a radical of the formula

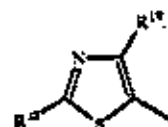


in which

R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each represent hydrogen, halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms and

R¹⁷ represents hydrogen, halogen or alkyl having 1 to 4 carbon atoms, or

A represents a radical of the formula



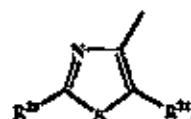
in which

R¹⁸ represents hydrogen, halogen, amino, cyano or alkyl having 1 to 4 carbon atoms and

4

R¹⁹ represents halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

A represents a radical of the formula

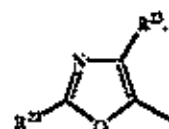


in which

R²⁰ represents hydrogen, halogen, amino, cyano or alkyl having 1 to 4 carbon atoms and

R²¹ represents halogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms or halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms and 1 to 5 halogen atoms, or

A represents a radical of the formula

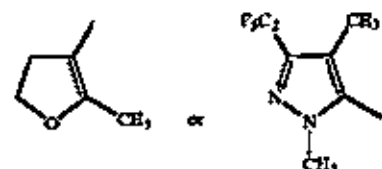


in which

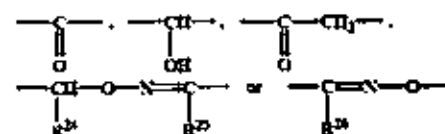
R²² represents hydrogen or alkyl having 1 to 4 carbon atoms and

R²³ represents halogen or alkyl having 1 to 4 carbon atoms, or

A represents a radical of the formula



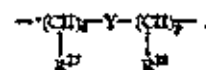
Q represents alkylene having 1 to 4 carbon atoms, alkylene having 2 to 4 carbon atoms, alkynylene having 2 to 4 carbon atoms or a group of the formula



in which

R²⁴, R²⁵ and R²⁶ independently of one another each represent hydrogen, alkyl having 1 to 4 carbon atoms, cycloalkyl having 3 to 6 carbon atoms, alkenyl having 2 to 4 carbon atoms or alkynyl having 2 to 4 carbon atoms, or

Q represents a group of the formula



in which

R²⁷ and R²⁸ independently of one another each represent hydrogen or alkyl having 1 to 4 carbon atoms,

5

Y represents an oxygen atom or represents S(O)_n ,
where

r represents the numbers 0, 1 or 2, and
n and p independently of one another each represent
the numbers 0, 1 or 2,

where the molecular moiety labelled (*) is in each
case attached to the phenyl radical of the anilino
moiety.

X represents oxygen or sulphur and

Z represents optionally substituted phenyl, optionally
substituted naphthyl, optionally substituted anthra-
cenylyl or represents optionally substituted butaryl.

Furthermore, it has been found that carbamides of the
formula (I) are obtained when

a) acyl halides of the formula

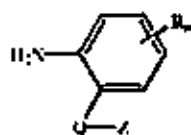


in which

A and X are each as defined above and

Hal represents halogen

are reacted with aniline derivatives of the formula

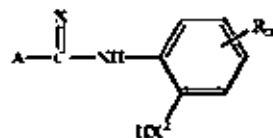


in which

Q, R, Z and m are each as defined above,

if appropriate in the presence of an acid binder and if
appropriate in the presence of a diluent, or

b) carbamides of the formula

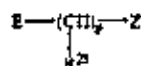


in which

A, R, X and m are each as defined above and

X^2 represents oxygen or sulphur,

are reacted with compounds of the formula



in which

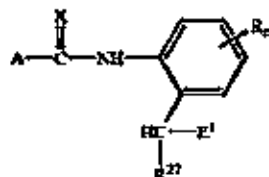
R^2 , Z and p are each as defined above and

E represents a leaving group,

if appropriate in the presence of an acid binder and if
appropriate in the presence of a diluent, or

6

c) carbamides of the formula

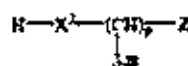


in which

A, R, R^{27} , X and m are each as defined above and

E^1 represents a leaving group

are reacted with compounds of the formula



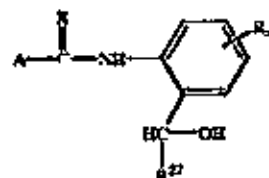
in which

R^{28} , Z and p are each as defined above and

X^3 represents oxygen or sulphur,

if appropriate in the presence of an acid binder and if
appropriate in the presence of a diluent, or

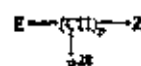
d) carbamides of the formula



in which

A, R, R^{27} , X and m are each as defined above

are reacted with compounds of the formula



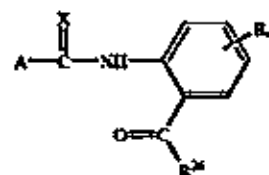
in which

R^{28} , Z and p are each as defined above and

E represents a leaving group,

if appropriate in the presence of an acid binder and if
appropriate in the presence of a diluent, or,

e) carbamides of the formula



in which

A, R, R^{28} , X and m are each as defined above

are reacted with hydroxylamine derivatives of the for-
mula



in which

Z is as defined above,

if appropriate in the presence of a catalyst and if appropriate
in the presence of a diluent.

7

Finally, it has been found that the novel carbonilides of the formula (I) are very suitable for use as pesticides. They have microbicidal properties and can be employed for controlling undesirable microorganisms both in crop protection and in the protection of materials. Additionally, they are suitable for controlling animal pests.

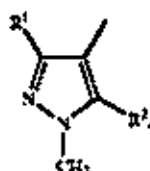
Surprisingly, the carbonilides of the formula (I) according to the invention have considerably better fungicidal activity than the constitutionally most similar prior-art carbonilides of the same direction of action.

The formula (I) provides a general definition of the carbonilides according to the invention.

R preferably represents fluorine, chlorine, bromine, nitro, cyano, alkyl having 1 to 6 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, alkoxy having 1 to 6 carbon atoms, halogenoalkoxy having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, allylthio having 1 to 6 carbon atoms, halogenoallylthio having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, alkenyloxy having 2 to 6 carbon atoms, alkinyloxy having 2 to 6 carbon atoms, cycloalkyl having 3 to 7 carbon atoms, carbalkoxy having 1 to 4 carbon atoms in the alkoxy moiety or represents alkoximinioalkyl having 1 to 4 carbon atoms in the alkoxy moiety and 1 to 4 carbon atoms in the alkyl moiety.

n preferably represents the numbers 0, 1, 2 or 3, where R represents identical or different radicals if n represents 2 or 3.

A preferably represents a radical of the formula

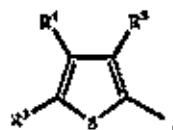


in which

R¹ represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, isopropyl or halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

R² represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl or ethyl.

A furthermore preferably represents a radical of the formula



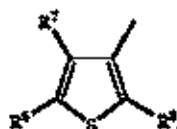
in which

R³ and R⁴ independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

R⁵ represents fluorine, chlorine, bromine, cyano, methyl, ethyl or halogenoalkoxy having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

8

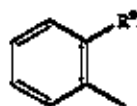
A furthermore preferably represents a radical of the formula



in which

R⁸ and R⁹ independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and R⁷ represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl or ethyl.

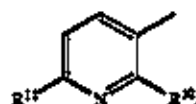
A furthermore preferably represents a radical of the formula



in which

R¹⁰ represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, alkyl having 1 to 4 carbon atoms, halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, halogenoalkoxy having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms or represents halogenoalkylthio having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

A furthermore preferably represents a radical of the formula

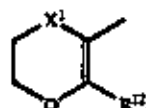


in which

R¹⁰ represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, methyl, ethyl, halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio or represents halogenoalkoxy having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

R¹¹ represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, methyl, ethyl, halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio or represents halogenoalkoxy having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

A furthermore preferably represents a radical of formula



in which

R¹² represents methyl, ethyl or halogenoalkyl having 1 or 2 carbon atoms and 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

(10)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) N.º de publicación: **ES 2 098 421**

(61) Int. Cl.º: C07D 213/82

C07D 231/14, C07D 277/56

C07D 263/34, C07D 307/68

C07D 309/28, C07D 327/06

C07C 233/64, A01N 37/22

A01N 43/00

(12)

TRADUCCION DE PATENTE EUROPEA

T3

(48) Número de solicitud europea: 92119105.2

(86) Fecha de presentación: 07.11.92

(87) Número de publicación de la solicitud: 0 545 099

(87) Fecha de publicación de la solicitud: 09.06.93

(51) Título: Derivados de anilida de ácido y su empleo para la lucha contra Botrytis.

(30) Prioridad: 22.11.91 DE 41 38 387
18.02.92 DE 42 04 764
18.02.92 DE 42 04 766
18.02.92 DE 42 04 767
18.02.92 DE 42 04 768

(43) Fecha de la publicación de la mención BOPI:
01.05.97

(45) Fecha de la publicación del folleto de patente:
01.05.97

(73) Titular/es: Basf Aktiengesellschaft
Carl-Bosch-Strasse 38
67063 Ludwigshafen, DE

(72) Inventor/es: Eicken, Karl;
Götz, Norbert;
Harren, Albrecht;
Ammermann, Eberhard;
Lorenz, Gisela y
Rung, Harald

(74) Agente: Hernández Cervera, Arturo

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 (artº 99 1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

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

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
EMILIO FERRERO

ASUNTO	Radicación	05117738
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio	1 5 5 9 3
	Folios	13

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional: PCT/EP2004/005087
Fecha de Presentación Internacional: 2004-05-12

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

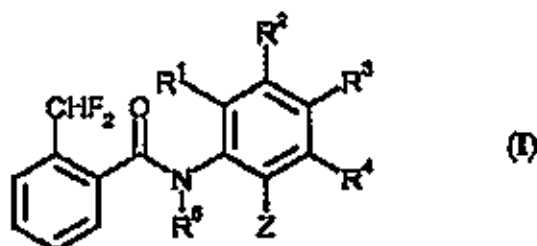
1. Documentos estudiados

Capítulo descriptivo: Folios 48 a 126 tal y como fueron presentados.
Capítulo reivindicatorio: Folios 127 a 144 tal y como fueron presentados.
Prioridad: folio 1 DE 10322909.4 2003-05-21
DE10325438.2 2003-08-05

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Difluorometilbenzoanilidas y su empleo para la lucha contra los microorganismos, así como productos intermedios y su obtención. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a nuevas difluorometilbenzoanilidas de la fórmula (I).



El problema técnico planteado en la presente solicitud de patente indica que las carboxanilidas conocidas en el arte previo presentan una buena actividad

fungicida, sin embargo dicha actividad deja mucho que desear en algunos casos, por ejemplo cuando se requieren cantidades bajas de aplicación. Por lo tanto existe la necesidad de nuevas carboxamidas con actividad mejorada. Para solucionar este problema técnico la solicitud plantea difluormetilbenzoanilidas de fórmula (I).

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC C07C 233/85, A01N 37/18.

De la solicitud de Patente

2.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En términos generales el capítulo reivindicatorio es demasiado amplio. La gran cantidad de radicales hacen que la fórmula Markush (I) pierda importancia y no se considere representativa.

Más aún, términos y expresiones tales como "con respectivamente, en caso dado, una ó varias veces, de forma igual ó de formas diferentes, iguales ó diferentes, y/o, por su lado, al menos, pudiendo estar sustituido" hacen al capítulo reivindicatorio cada vez más y más ambiguo y no permiten definir el objeto y el alcance de la invención de la invención. Así las cosas el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión. Sírvase suprimir ó reemplazar dichas expresiones.

Es importante aclarar que son tantas las posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I), debido a la gran cantidad y variedad de sustituyentes que en muchos incluyen radicales con nomenclatura diferente a la presentada en la Markush inicial, restándole claridad al capítulo reivindicatorio.

Ahora 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 a partir de compuestos específicos. Así que las reivindicaciones llegan a ser especulativas y sólo presentan una generalización desde ensayos puntuales. En consecuencia el capítulo reivindicatorio no solo es demasiado amplio sino que no se encuentra enteramente sustentado en la descripción.

Por otra parte se presentan frases confusas que le restan claridad al capítulo reivindicatorio, por ejemplo:

- "Z¹ significa fenilo sustituido, en caso dado,..." Folio 129: puesto que en esa reivindicación no se indica con que radicales es sustituido.
- "Z² significa cicloalquilo ó bicicloalquilo sustituidos, en caso dado,..." Folio 129: puesto que en esa reivindicación no se indica con que radicales son sustituidos.
- "Z y R⁴ forman junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un anillo... sustituido en cada caso" puesto que no aclara con que radicales esta sustituido dicho anillo.

Por último hay que tener en cuenta que la reivindicación 2 esta ampliando la materia descrita en la reivindicación 1. Puesto que ella incluye otras familias de radicales (el sustituyente W¹ que a su vez contienen nuevos radicales Q¹ y Q²) y que hacen al compuesto de fórmula (I) mucho más amplio; nuevamente no se puede establecer el objeto y el alcance de la invención.

La reivindicación 3 por su parte, presenta diversos procedimientos de obtención de los compuestos de interés; sin embargo las etapas presentadas en cada caso, son enunciadas de forma muy general y solo corresponden a reacciones comunes en química. Dichos procedimientos no presentan ninguna condición que defina específicamente el proceso. Por ejemplo las frases "hacer reaccionar, en caso dado, catalizador, agente de condensación, agente aceptor de ácido, diluyente, ácido" no definen un procedimiento, de hecho la expresión "en caso dado" no define ningún tipo de condición, solo señala la posibilidad de utilizar ó no un elemento determinado. En consecuencia esta reivindicación no es clara ni concisa. Se le solicita que retire la reivindicación 3 y que limite el objeto de la invención especificando la estructura de interés.

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

3. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Los posibles compuestos de fórmula (I) son estructuralmente diferentes, puesto que cada uno de los significados de los radicales R^5 y Z, son extremadamente diferentes. Es decir la naturaleza química de estos sustituyentes es muy variada y por lo tanto los compuestos resultantes podrían ser estructural y funcionalmente diferentes.

Son tantos y tan variados los significados de R^5 que se incluye una nomenclatura adicional donde se indican 7 radicales más, de R^6 a R^{12} . Así las cosas, es evidente que la estructura de la fórmula (I) no es representativa de la invención. Pero si además se tienen en cuenta únicamente los significados de Z, se podría determinar otro grupo de compuestos con estructura química diferente que no son descritos por medio de la estructura de fórmula (I).

Así las cosas es evidente que la Markush inicialmente planteada pierde importancia a medida que se sustituye la gran variedad de radicales planteados. De modo tal que dicha fórmula no se considera una estructura que relacione un mismo concepto común inventivo.

Por otra parte las reivindicaciones 8 a 10 presentan compuestos de fórmulas (VII) y (II) así como su procedimiento de obtención; los cuales resultan ser estructuralmente diferentes al compuesto de fórmula (I) y no comparten un mismo concepto común inventivo con él. Asimismo la descripción no presenta resultados que evidencien la actividad fungicida de estos otros compuestos. Se le sugiere al solicitante que retire estas reivindicaciones.

En conclusión el capítulo reivindicatorio no presenta un mismo concepto común inventivo y no cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo al art. 25 de la Decisión 486.

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

La reivindicación 5 hace referencia al empleo de las difluorometilbenzoanilidas de la fórmula (I). Lo cual de acuerdo con el artículo 14 no es patentable pues no corresponde a una invención de producto ni de procedimiento.

Asimismo el procedimiento de la reivindicación 6 no divulga un procedimiento propiamente dicho. Pues un método ó procedimiento 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 "se aplican" no conduce a la fabricación de un producto con una forma tangible. Más bien el método reivindicado se refiere al uso de las difluorometilbenzoanilidas para el control de microorganismos. Lo cual no es patentable a partir del artículo 21 de la Decisión 486.

5. Determinación del Estado de la Técnica

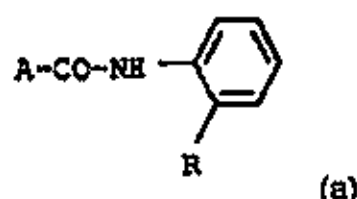
Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 2003-05-21, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D1	ES2098421	Derivados de anilida de ácido y su empleo para la lucha contra Botrytis	1993-06-09
D2	US6534532	Carbanilidas as pesticidas	2003-03-18

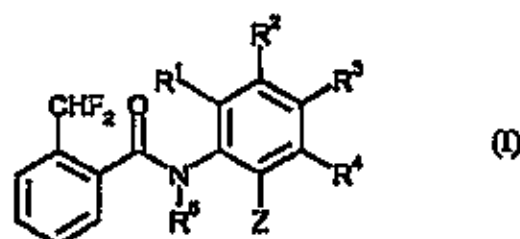
6. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

6.1. Nivel inventivo (artículo 18 D486)

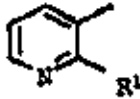
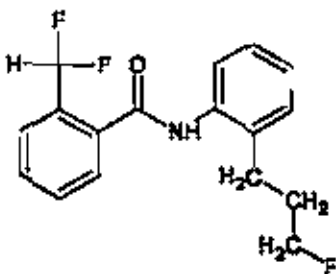
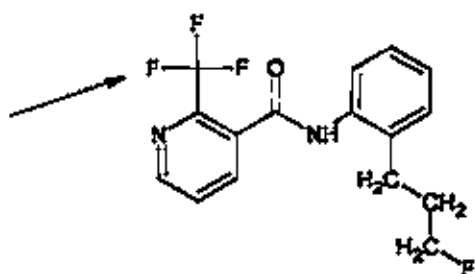
El documento D1 divulga derivados de anilida de ácido carboxílico de fórmula (a) y su actividad como fungicida



La solicitud de patente en estudio presenta difluorometilbenzoanilidas de fórmula (I)

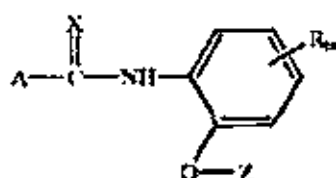


Cuando se comparan las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (I) de la presente solicitud con las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (a) de D1 se obtienen estructuras muy cercanas. A continuación se presentara un ejemplo con el fin de ilustrar la similitud de las estructuras.

Cuando en la solicitud $R^1 R^2 R^3 R^4$ y R^5 es hidrógeno.	Cuando en la anterioridad D1 $A =$ 
Z significa alquilo sustituido por halógeno, por ejemplo $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{F}$	Donde R^1 es trifluorometilo R significa alquilo sustituido por halógeno, por ejemplo $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{F}$
Se tendrían las siguientes estructuras	
	

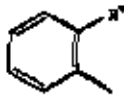
Es evidente que el compuesto de la fórmula (I) de la presente solicitud, resulta novedoso respecto a D1 debido al radical difluorometilo. Sin embargo D1 ya había divulgado claramente un núcleo central con actividad fungicida.

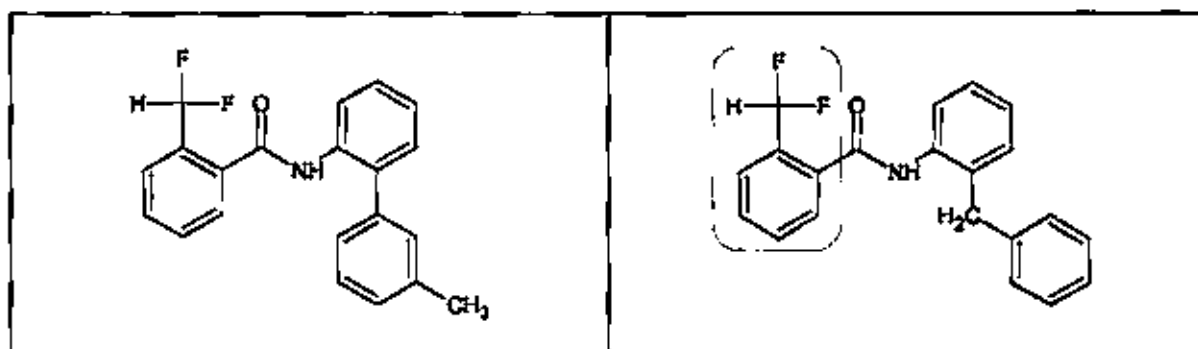
El documento D2 divulga carbanilidas de fórmula (b) y su aplicación como pesticidas:



(b)

Cuando se comparan las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (I) de la presente solicitud con las posibles sustituciones del compuesto de fórmula (b) de D1 también se obtienen estructuras muy cercanas. A continuación se presentará un ejemplo con el fin de ilustrar la similitud de las estructuras.

Cuando en la solicitud $R^1 R^2 R^3 R^4$ y R^5 es hidrógeno.	Cuando en la anterioridad D1 $m = 0$
Z es fenilo sustituido con por ejemplo metilo.	$X = O$
	$A =$ 
	Donde R^9 es un grupo halogenoalquilo de un carbono, por ejemplo $-\text{CHF}_2$
	Q = alqueno de un átomo de carbono, por ejemplo $-\text{CH}_2-$
	Z = fenilo
Se tendrían las siguientes estructuras	



Más aún la parte de la estructura que era diferente en el caso anterior (comparando con D1) es ahora igual. Por lo tanto un técnico medio en la materia a partir de las enseñanzas D1 ó combinando las enseñanzas de D1 y D2 hubiera podido modificar la estructura planteada en D1 utilizando otros radicales comunes y similares (por ejemplo un anillo de piridina por un anillo de benceno) ó utilizar los radicales planteados en D2 (los cuales corresponden específicamente al grupo difluorometilbenzil) y seguir esperando un actividad fungicida como ya lo había divulgado D1.

De modo tal que el compuesto de fórmula (I) no representa un salto cualitativo en la técnica, se deriva de manera obvia del arte previo y carece de nivel inventivo.

Del mismo modo los compuestos de las reivindicaciones 8 y 9 se derivan del arte previo y carecen de nivel inventivo, al igual que sus procedimientos de obtención (reivindicaciones 2 y 10).

Es importante aclarar varios puntos:

- i. Se demostró que la fórmula Markush (I) de la reivindicación 1 no es inventiva y por lo tanto no se puede considerar como concepto común inventivo.
- ii. Debido a que las difluorometilbenzoanilidas de la fórmula (I) no son inventivas, su proceso de obtención tampoco es inventivo. Dicho procedimiento es descrito de forma muy general y simplemente ilustra reacciones comunes en química orgánica, mas aún la descripción no divulga un efecto técnico sorprendente ó una mejora en el proceso planteado.
- iii. Los compuestos de las reivindicaciones 8 y 9 también carecen de nivel inventivo. Además se consideran derivados que no están enteramente sustentados en la descripción. Pues allí no se demostró una actividad específica para ellos. Se le recomienda al solicitante que retire estas reivindicaciones.
- iv. La solicitud no presenta resultados que evidencien un salto cualitativo en la técnica en términos de mayor actividad ó menor dosis de aplicación.

Ahora bien, el agente para la lucha contra microorganismos indeseados como su procedimiento de obtención (reivindicaciones 4 y 7) carecen de nivel inventivo; pues solo presentan de forma general la posibilidad de combinar el compuesto de fórmula (I) con extendedores y/o productos tensioactivos (lo cual solo corresponde a una práctica común en el arte de formular agroquímicos) a través de una "mezcla" (que no es más que el proceso universalmente conocido de mezcla). Se le recomienda al solicitante que retire estas reivindicaciones.

Por último el procedimiento de la reivindicación 6 solo se refiere al uso del compuesto de fórmula (I); pero además carece de altura inventiva debido a que la

etapa de "aplicar sobre microorganismos ó su ambiente" corresponde a un proceso universalmente conocido y utilizado en el campo de los agroquímicos.

8. Conclusión

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

N°	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D1	ES2098421	1-10	Nivel Inventivo
D2	US6834532	1-10	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

05 DIC. 2008

CONCEPTO TÉCNICO No. 3523	EXAMINADOR TÉCNICO Código No.202085
---------------------------	--