

# CAVELIER

ABOGADOS

www.cavelier.com  
cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI  
CARRERA 4 No. 72 - 35  
BOGOTA 8, COLOMBIA

378  
328

Teléfono: (57-1) 347 3611  
Telefax: (57-1) 211 8650  
(57-1) 540 0860

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-042086- -00005-0000

Fecha: 2008-05-26 17:57:57 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tr: 11 PATENTE/II Eve: 378 FASENACIONAL  
Act. 538 PETICION Folios: 2

Trámite : 011

Evento : 378

Actuación : 538

Referencia : Expediente No. 06.042.086  
Asunto : Solicitud de patente para: **DERIVADOS DEL ÁCIDO  
TETRAMICO SUBSTITUIDOS POR 2-HALOGENO-6-  
ALQUIL-FENILO**  
Solicitante : **BAYER CROPSCIENCE AG**  
Publicada en : Gaceta No. 580 del 28 de septiembre de 2007  
Fecha solicitud : 4 de mayo de 2006

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 \$420.000.00, que corresponde a la tasa fijada según lo dispuesto en la Resolución No. 44372 del 26 de diciembre de 2007.

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. 31.929

66/ COLO-13549-841-057-4  
JGG\JGG\ID-122229\WPC13549  
No. M-2008-122229\JGG

329  
328

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 00 - 23,411  
FECHA : MARZO 17 DE 2000



NO. 06-042080-00005-0000

Dep. 2020 NUECREACIONE  
Eve: 378 FASENACIONALI  
Folios: 2

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE       | TIPO PAGO      | BANCO | CUENTA | Nº. PAGO | FECHA PGO  | Vr. PAGO      |
|-------------------|----------------|-------|--------|----------|------------|---------------|
| CAVELIER ABOGADOS | RECIBO DE CAJA |       |        | 23181    | 17/03/2000 | 40,710,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. | RENTISTICO              | CONCEPTO                             | TOTAL CONCEPTO |
|-------|-------------------------|--------------------------------------|----------------|
| 1     | 50005-01-01 SOLICITUDES | 05 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN | 420,000.00     |
|       |                         | TOTAL :                              | \$ 420,000.00  |

SON: CUATROCIENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE Nº. \_\_\_\_\_

Colo 13549-841-057-4

**DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES**

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-42086

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

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **580** DE

FECHA **28 DE SEPTIEMBRE DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR

LA LEY EXPIRA EL **27 DE DICIEMBRE 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.

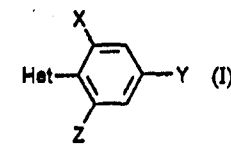
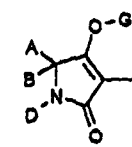
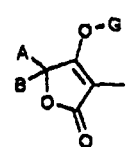
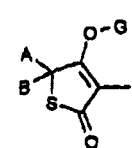
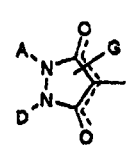
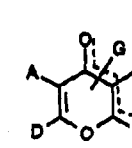
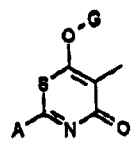
SI \_\_\_\_\_

NO       X

330  
331



**PCT**  
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                         |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>6</sup> :<br/><b>C07D 207/38, 209/54, 307/60, 307/94, 333/32, 333/50, 309/38, 279/06, A01N 43/36, 43/02, C07D 491/10</b></p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | <p><b>A1</b></p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | <p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 96/35664</b></p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 14. November 1996 (14.11.96)</p> |
| <p>(21) Internationales Aktenzeichen: <b>PCT/EP96/01781</b></p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 29. April 1996 (29.04.96)</p> <p>(30) Prioritätsdaten:<br/> <div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div>195 16 258.7</div> <div>9. Mai 1995 (09.05.95)</div> <div>DE</div> </div> <div style="display: flex; justify-content: space-between;"> <div>195 45 467.7</div> <div>6. December 1995 (06.12.95)</div> <div>DE</div> </div> </p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): <b>BAYER AKTIENGESellschaft [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).</b></p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): <b>LIEB, Folker [DE/DE]; Alfred-Kubin-Strasse 1, D-51375 Leverkusen (DE). HAGEMANN, Hermann [DE/DE]; Kandinskystrasse 52, D-51375 Leverkusen (DE). WIDDIG, Arno [DE/DE]; Eifgenstrasse 8, D-51519 Odenthal (DE). RUTHER, Michael [DE/DE]; Grabenstrasse 23, D-40789 Monheim (DE). FISCHER, Reiner [DE/DE]; Nelly-Sachs-Strasse 23, D-40789 Monheim (DE). BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Talstrasse 29b, D-53797 Lohmar (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 15, D-42799 Leichlingen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markeweg 85, D-56566 Neuwied</b></p>                                                          | <p>(DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Alterbrückerstrasse 63, D-41470 Neuss (DE). DOLLINGER, Markus [DE/DE]; Burscheider Strasse 154 b, D-51381 Leverkusen (DE). SANTEL, Hans-Joachim [DE/DE]; Grünstrasse 9a, D-51371 Leverkusen (DE). GRAFF, Alan [DE/DE]; Im Schlag 16, D-51427 Bergisch Gladbach (DE). ANDERSCH, Wolfram [DE/DE]; Schlodderdicher Weg 77, D-51469 Bergisch Gladbach (DE). MENCKE, Norbert [DE/DE]; Grundermühle 2, D-51381 Leverkusen (DE). TURBERG, Andreas [DE/DE]; Naheweg 19, D-40699 Erkrath (DE).</p> <p>(74) Gemeinsamer Vertreter: <b>BAYER AKTIENGESellschaft; D-51368 Leverkusen (DE).</b></p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: <b>AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, TR, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, 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).</b></p> <p><b>Veröffentlicht</b><br/><i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p> |                                                                                                                                                         |
| <p>(54) Title: <b>ALKYL DIHALOGENATED PHENYL-SUBSTITUTED KETOENOLS USEFUL AS PESTICIDES AND HERBICIDES</b></p> <p>(54) Bezeichnung: <b>ALKYL-DIHALOGENPHENYLSUBSTITUIERTE KETOENOLE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL UND HERBIZIDE</b></p> <p>(57) Abstract</p> <p>New compounds have the formula (I), in which X stands for halogen, Y stands for halogen or alkyl and Z stands for halogen or alkyl, provided that one of the residues Y and Z always stands for halogen and the other for alkyl, and Het stands for one of the groups (1), (2), (3), (4), (5) or (6), in which A, B, D, and G have the meanings given in the description. Also disclosed are several processes for preparing said compounds and their use as pesticides and herbicides.</p> <p>(57) Zusammenfassung</p> <p>Die vorliegende Erfindung betrifft neue Verbindungen der Formel (I), in welcher X für Halogen steht, Y für Halogen oder Alkyl steht und Z für Halogen oder Alkyl steht, mit der Maßgabe, daß immer einer der Reste Y und Z für Halogen und der andere für Alkyl steht, Het für eine der Gruppen (1), (2), (3), (4), (5), (6) steht, worin A, B, D und G die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel und Herbizide.</p> |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                         |
| <div style="display: flex; justify-content: space-around; align-items: center;"> <div style="text-align: center;">  <p>(I)</p> </div> </div> <div style="display: grid; grid-template-columns: 1fr 1fr; gap: 10px; margin-top: 20px;"> <div style="text-align: center;">  <p>(1)</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>(2)</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>(3)</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>(4)</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>(5)</p> </div> <div style="text-align: center;">  <p>(6)</p> </div> </div>                                                                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                         |

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Der erfindungsgemäße Wirkstoff kann in seinen handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

10 Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

**Fungizide:**

2-Aminobutan; 2-Anilino-4-methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin; 2',6'-Dibromo-2-methyl-4'-trifluoromethoxy-4'-trifluoro-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid; 2,6-Dichloro-N-(4-trifluoromethylbenzyl)-benzamid; (E)-2-Methoxyimino-N-methyl-2-(2-phenoxyphenyl)-acetamid; 8-Hydroxyquinolinsulfat; Methyl-(E)-2-{2-[6-(2-cyano-phenoxy)-pyrimidin-4-yloxy]-phenyl}-3-methoxyacrylat; Methyl-(E)-methoximino-[alpha-(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat; 2-Phenylphenol (OPP), Aldimorph, Ampropylfos, Anilazin, Azaconazol, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blastocidin-S, Bromuconazole, Bupirimate, Butiobate, Calciumpolysulfid, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Chinomethionat (Quinomethionat), Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinal, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazole, Cyprofuram, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrrithion, Ditalimfos, Dithianon, Dodine, Drazoxolon, Edifenphos, Epoxyconazole, Ethirimol, Etridiazol, Fenarimol, Fenbuconazole, Fenfuram, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzone, Fluazinam, Fludioxonil, Fluoromide, Fluquinconazole, Flusilazole, Flusulfamide, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fthalide, Fuberidazol, Furalaxyl, Furmecyclo-x, Guazatine, Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Folio 89

2020  
Bogotá D.C.,

Doctor(a)  
ESCOBAR URIBE JIMENA  
Apoderado(a) y/o Representante de  
MC NEIL - P P C, INC.

|            |                         |
|------------|-------------------------|
| REFERENCIA | Radicación No. 8 101369 |
|            | Trámite 2               |
|            | Evento 1                |
|            | Actuación 416           |
|            | Oficio No. 9664         |
|            | Folios 1                |

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Siendo manifestación expresa del interesado de efectuar la publicación "inmediato", está se realizará en la próxima gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase  
Dado en Bogotá DC,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL  
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

jfernand

**Herbizide:**

beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxyphenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxyfop-methyl und Quizalofop-ethyl; Azinone, wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propam; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B. Alloxydim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiocarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate, Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; Triazine, wie z.B. Atrazin, Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphan.

Der erfindungsgemäße Wirkstoff kann ferner in seinen handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**

Folio 82

2020  
Bogotá D.C.,

Doctor(a)  
ESCOBAR URIBE JIMENA  
Apoderado(a) y/o Representante de  
MC NEIL - P P C, INC.

|            |                         |
|------------|-------------------------|
| REFERENCIA | Radicación No. 8 101376 |
|            | Trámite 2               |
|            | Evento 1                |
|            | Actuación 416           |
|            | Oficio No. 9663         |
|            | Folios 1                |

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Siendo manifestación expresa del interesado de efectuar la publicación "inmediato", está se realizará en la próxima gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase  
Dado en Bogotá DC,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL  
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

jfernand

worin

A für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl oder Alkylthioalkyl, für jeweils gesättigtes oder ungesättigtes und gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder Heterocyclyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Cyano oder Nitro substituiertes Aryl, Arylalkyl oder Hetaryl steht,

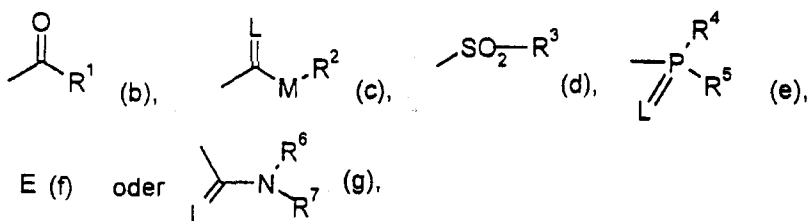
B für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht, oder

A und B gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom an das sie gebunden sind für einen gesättigten oder ungesättigten, gegebenenfalls substituierten Carbocyclus oder Heterocyclus stehen,

D für Wasserstoff oder für einen gegebenenfalls substituierten Rest aus der Reihe Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Cycloalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Arylalkyl, Aryl, Hetarylalkyl oder Hetaryl steht oder

A und D gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten und gegebenenfalls substituierten Carbocyclus oder Heterocyclus stehen,

G im Fall, daß Het für einen der Reste (1), (2), (3), (5) oder (6) steht, für Wasserstoff (a) oder, im Fall, daß Het für einen der Reste (1), (2), (3), (4), (5) oder (6) steht, für eine der Gruppen



steht,

worin

E für ein Metallionäquivalent oder ein Ammoniumion steht,

5 L für Sauerstoff oder Schwefel steht,

M für Sauerstoff oder Schwefel steht,

10 R<sup>1</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl oder Polyalkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl oder Alkoxy substituiertes Cycloalkyl oder Heterocyclyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Phenylalkyl, Hetaryl, Phenoxyalkyl oder Hetarylalkoxyalkyl steht,

15 R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxyalkyl oder Polyalkoxyalkyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,

20 R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> unabhängig voneinander für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylthio, Alkenylthio oder Cycloalkylthio oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenoxy oder Phenylthio stehen,

25 R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Benzyl stehen, oder gemeinsam mit dem N-Atom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls Sauerstoff oder Schwefel enthaltenden, gegebenenfalls substituierten Cyclus bilden.

# United States Patent [19]

Fischer et al.

[11] Patent Number: 4,985,063

[45] Date of Patent: Jan. 15, 1991

## [54] 3-ARYL-PYRROLIDINE-2,4-DIONES

[75] Inventors: Reiner Fischer, Monheim; Hermann Hagemann, Leverkusen; Andreas Krebs, Odenthal-Holz; Albrecht Marhold, Leverkusen; Klaus Lürssen; Robert R. Schmidt, both of Bergisch-Gladbach; Hans-Joachim Santel, Leverkusen; Benedikt Becker, Mettmann; Klaus Schaller; Wilhelm Stendel, both of Wuppertal, all of Fed. Rep. of Germany

[73] Assignee: Bayer Aktiengesellschaft, Leverkusen, Fed. Rep. of Germany

[21] Appl. No.: 391,227

[22] Filed: Aug. 8, 1989

### [30] Foreign Application Priority Data

Aug. 20, 1988 [DE] Fed. Rep. of Germany ..... 3828404  
Sep. 20, 1988 [DE] Fed. Rep. of Germany ..... 3831852  
Apr. 26, 1989 [DE] Fed. Rep. of Germany ..... 3913682

[51] Int. Cl.<sup>5</sup> ..... C07D 471/02; C07D 487/04; A61K 31/485; A61K 31/40

[52] U.S. Cl. .... 71/88; 71/90; 71/92; 71/94; 71/95; 514/183; 514/214; 514/256; 514/299; 514/339; 514/365; 514/406; 514/407; 514/413; 540/476; 540/593; 540/450; 540/610; 546/183; 546/272; 546/326; 548/181; 548/333; 548/453; 548/533; 548/374; 544/333  
[58] Field of Search ..... 540/593, 476; 546/183, 546/272; 548/453, 181, 374; 71/88, 94, 95, 90, 92; 514/183, 214, 299, 413; 544/333

### [56] References Cited

#### U.S. PATENT DOCUMENTS

3,274,202 9/1966 Mohrbacher ..... 546/183

#### FOREIGN PATENT DOCUMENTS

0262399 4/1988 European Pat. Off. .  
0259993 9/1988 Fed. Rep. of Germany .

#### OTHER PUBLICATIONS

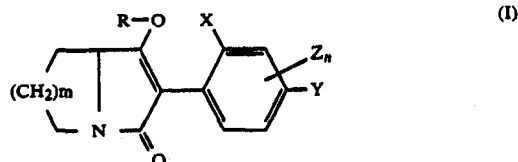
Schmierer Chemical Abstracts, vol. 103, 377 21g, Aug. 5, 1985.

Primary Examiner—Mark L. Berch

Attorney, Agent, or Firm—Sprung Horn Kramer & Woods

### [57] ABSTRACT

A 3-aryl-pyrrolidine-2,4-dione (e) derivative of the formula (I)



in which

X represents alkyl, halogen and alkoxy,

Y represents hydrogen, alkyl, halogen, alkoxy and halogenoalkyl,

Z represents alkyl, halogen and alkoxy,

m represents a number from 1-4,

n represents a number from 0-3, R represents hydrogen,



or A where

A represents a metal cation equivalent or represents an ammonium ion,

R<sup>1</sup> represents optionally halogen-substituted alkyl, alkenyl, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, polyalkoxyalkyl and optionally substituted cycloalkyl which can be interrupted by hetero atoms, or represents optionally substituted phenyl, optionally substituted phenylalkyl, substituted hetaryl, substituted phenoxyalkyl and substituted hetaryloxyalkyl and R<sup>2</sup> represents optionally halogen-substituted alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkoxyalkyl, polyalkoxyalkyl and optionally substituted phenyl,

as well as the pure enantiomeric forms of compounds of the formula (I). The compounds of formula (I) are effective as insecticidal, acaricidal, herbicidal and antimycotic agents.

6 Claims, No Drawings

weed-killers. By weeds, in the broadest sense, there are to be understood all plants which grow in locations where they are undesired. Whether the substances according to the invention act as total or selective herbicides depends essentially on the amount used.

It is characteristic of the compounds according to the invention that they have a selective activity against monocotyledon weeds when used in the pre- and post-emergence method, while being well tolerated by crop plants.

The active compounds according to the invention can be used, for example, in connection with the following plants:

Monocotyledon weeds of the genera: *Echinochloa*, *Setaria*, *Panicum*, *Digitaria*, *Phleum*, *Poa*, *Festuca*, *Eleusine*, *Brachiaria*, *Lolium*, *Bromus*, *Avena*, *Cyperus*, *Sorghum*, *Agropyron*, *Cynodon*, *Monochoria*, *Fimbristylis*, *Sagittaria*, *Eleocharis*, *Scirpus*, *Paspalum*, *Ischaemum*, *Sphenoclea*, *Dactyloctenium*, *Agrostis*, *Alopecurus* and *Apera*.

Monocotyledon cultures of the genera: *Oryza*, *Zea*, *Triticum*, *Hordeum*, *Avena*, *Secale*, *Sorghum*, *Panicum*, *Saccharum*, *Ananas*, *Asparagus* and *Allium*.

However, the use of the active compounds according to the invention is in no way restricted to these genera, but also extends in the same manner to other plants.

The compounds are suitable, depending on the concentration, for the total combating of weeds, for example on industrial terrain and rail tracks, and on paths and squares with or without tree plantings. Equally, the compounds can be employed for combating weeds in perennial cultures, for example afforestations, decorative tree plantings, orchards, vineyards, citrus groves, nut orchards, banana plantations, coffee plantations, tea plantations, rubber plantations, oil palm plantations, cocoa plantations, soft fruit plantings and hopfields, and for the selective combating of weeds in annual cultures.

In this context, the active compounds according to the invention not only have an excellent action against noxious plants but are also well tolerated by important crop plants, such as, for example, wheat, cotton, soya beans, citrus fruit and sugar beet, and they can therefore be used as selective weedkillers.

The active compounds can be converted into the customary formulations, such as solutions, emulsions, powders, foams, suspensions, pastes, granules, aerosols, natural and synthetic materials impregnated with active compound, very fine capsules in polymeric substances and in coating compositions for seed, furthermore in formulations using burning equipment, such as fumigating cartridges, fumigating cans, fumigating spirals and the like, as well as ULV cold-mist and warm-mist formulations.

These formulations are produced in a known manner, for example by mixing the active compounds with extenders, that is liquid solvents, liquefied gases under pressure and/or solid carriers, optionally with the use of surface-active agents, that is emulsifying agents and/or dispersing agents and/or foam-forming agents. In the case of the use of water as an extender, organic solvents can, for example, also be used as auxiliary solvents. As liquid solvents, there are suitable in the main: aromatics, such as xylene, toluene or alkyl-naphthalenes, chlorinated aromatics or chlorinated aliphatic hydrocarbons, such as chlorobenzenes, chloroethylenes or methylene chloride, aliphatic hydrocarbons, such as cyclohexane or paraffins, for example petroleum fractions, alcohols, such as butanol or glycol as well as their ethers and

esters, ketones, such as acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone or cyclohexanone, strongly polar solvents, such as dimethylformamide and dimethyl sulphoxide, as well as water; liquefied gaseous extenders or carriers are taken to mean those liquids which are gaseous at normal temperatures and under atmospheric pressure, for example, aerosol propellant, such as halogenohydrocarbons as well as butane, propane, nitrogen and carbon dioxide; as solid carriers there are suitable: for example ground natural minerals, such as kaolins, clays, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite or diatomaceous earth, and ground synthetic minerals, such as highly disperse silica, alumina and silicates, as solid carriers for granules there are suitable: for example, crushed and fractionated natural rocks such as calcite, marble, pumice, sepiolite and dolomite, as well as synthetic granules of inorganic and organic meals, and granules of organic material such as sawdust, coconut shells, corn cobs and tobacco stalks; as emulsifying and/or foamforming agents there are suitable: for example, non-ionic and anionic emulsifiers, such as polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty alcohol ethers, for example, alkylaryl polyglycol ethers, alkylsulphonates, alkyl sulphates, arylsulphonates and well as albumen hydrolysis products; as dispersing agents there are suitable: for example, lignin-sulphite waste liquors and methylcellulose.

Adhesives such as carboxymethylcellulose and natural and synthetic polymers in the form of powders, granules or latexes, such as gum arabic, polyvinyl alcohol and polyvinyl acetate, as well as natural phospholipids, such as cephalins and lecithins, and synthetic phospholipids, can be used in the formulations. Further additives can be mineral and vegetable oils.

It is possible to use colorants such as inorganic pigments, for example, iron oxide, titanium oxide and Prussian Blue, and organic dyestuffs, such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs and metal phthalocyanine dyestuffs, and trace nutrients such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

The formulations in general contain between 0.1 and 95 per cent by weight of active compound, preferably between 0.5 and 90%.

The active compounds according to the invention can be present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with other active compounds, such as insecticides, attractants, sterilizing agents, acaricides, nematocides, herbicides or fungicides. The insecticides include, for example, phosphates, carbamates, carboxylates, chlorinated hydrocarbons, phenylureas and substances produced by microorganisms, inter alia.

The active compounds according to the invention can furthermore be present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with synergistic agents. Synergistic agents are compounds which increase the action of the active compounds, without it being necessary for the synergistic agent added to be active itself.

The active compound content of the use forms prepared from the commercially available formulations can vary within wide limits. The active compound concentration of the use forms can be from 0.0000001 to 95% by weight of active compound, preferably between 0.001 and 1% by weight.

The compounds are employed in a customary manner appropriate for the use forms.

To produce a suitable preparation of active compound, three parts by weight of active compound are mixed with seven parts by weight of the abovementioned mixture and the concentrate thus obtained is diluted with water to the particular desired concentration.

About 20 *Lucilia cuprina* resistant larvae are introduced into a test tube which contains approx. 1 cm<sup>3</sup> of horse meat and 0.5 ml of the preparation of active compound. After 24 hours, the degree of destruction is determined.

In this test, for example, the following compounds of the Preparation Examples show a highly pronounced activity: 7, 54, 58, 62, 64, 67, 68, 213, 215, 216, 217, 222.

#### EXAMPLE E Test with *Psoroptes ovis*

##### Emulsifier:

35 parts by weight of ethylene glycol monomethyl ether  
35 parts by weight of nonylphenol polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, three parts by weight of active compound are mixed with seven part by weight of the abovementioned mixture, and the concentrate thus obtained is diluted with water to the desired concentration.

About 10-25 *Psoroptes ovis* are introduced into 1 ml of the active compound preparation to be tested, which has been pipetted into tablet nests of a deep-drawn pack. After 24 hours, the degree of destruction is determined.

In this test, for example, the following compounds of the Preparation Examples show a highly pronounced activity: 39, 55, 57, 62, 87, 89, 167, 201, 245.

#### EXAMPLE F Antimycotic in vitro activity

##### Description of the test:

The in vitro tests were carried out using microorganism inocular having an average of  $1 \times 10^4$  microorganisms/ml of substrate. The nutrient medium used was Yeast Nitrogen Base medium for yeasts and Kimmig medium for moulds and Dermatophytes.

The incubation temperature was 37° C. in the case of the yeasts and 28° C. in the case of molds and Dermatophytes, the incubation time was 24 to 96 hours for yeasts and 96 to 120 hours for Dermatophytes and molds.

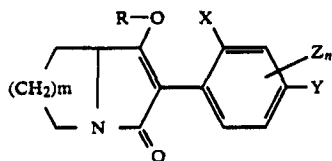
The fungicides were assessed by plating and reincubation of completely inhibited batches, fungicidal concentrations being those which contain fewer than 100 microorganisms c.f.u. (colony-forming unit) per ml.

In this test, the compounds of the formula (I) according to the invention, of the Preparation Examples 36, 40, 85, 91, 114, 116, 120, 167, 170, 174, 176, 178, 182, 184, 188, 194 show a highly pronounced antimycotic activity.

It will be appreciated that the instant specification and claims are set forth by way of illustration and not limitation, and that various modifications and changes may be made without departing from the spirit and scope of the present invention.

What is claimed is:

1. A compound of the formula (I)



in which

X represents alkyl and halogen,

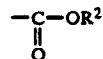
Y represents hydrogen, alkyl, halogen and halogenoalkyl,

Z represents alkyl and halogen,

m represents a number from 1-4,

n represents a number from 0-3,

R represents hydrogen, —COR<sup>1</sup>,



or A, where

15 A represents a metal cation equivalent or represents an ammonium ion.

R<sup>1</sup> represents a metal cation equivalent or represents an ammonium ion,

R<sup>1</sup> represents unsubstituted or halogen-substituted alkyl, alkenyl, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, polyalkoxyalkyl and unsubstituted cycloalkyl having 3 to 8 ring atoms and being uninterrupted by hetero atoms or being interrupted in the ring by oxygen and/or sulfur, or R<sup>1</sup> represents unsubstituted phenyl or phenyl substituted by halogen, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl, unsubstituted phenylalkyl or phenylalkyl substituted by halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkoxy, unsubstituted pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl, or pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl substituted by halogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl and unsubstituted or halogen, amino or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-substituted pyridyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or -thiazolyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, and

R<sup>2</sup> represents unsubstituted or halogen-substituted alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkoxyalkyl, polyalkoxyalkyl and unsubstituted phenyl or phenyl substituted by halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl, as well as the pure enantiomeric forms of the compounds of the formula (I).

2. A compound of the formula (I) according to claim 1, in which

X represents C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl and halogen

Y represents hydrogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, halogen and C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogenoalkyl

Z represents C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl and halogen,

m represents a number from 1-4,

n represents a number from 0-3,

R represents hydrogen, —CO—R<sup>1</sup>, —CO—O—R<sup>2</sup> or A, in which

A represents a metal cation equivalent or represents an ammonium ion,

R<sup>1</sup> represents unsubstituted or halogen-substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl and cycloalkyl which has 3-8 ring atoms and which is uninterrupted by hetero atoms or is interrupted in the ring by oxygen and/or sulphur, or represents unsubstituted phenyl or phenyl substituted by halogen, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl;

or represents unsubstituted phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl substituted by halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkoxy, or

R<sup>1</sup> represents unsubstituted pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl or pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl substituted by halogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 R<sup>1</sup> represents unsubstituted phenoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or phenoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl substituted by halogen or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 or represents unsubstituted or halogen, amino or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl substituted pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or thiazolyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 R<sup>2</sup> represents unsubstituted or halogen substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl and C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, or R<sup>2</sup> represents halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy- or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-halogenoalkyl-substituted phenyl, and enantiomeric forms thereof.  
 3. A compound of the formula (I) according to claim 1, in which  
 X represents C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl and halogen,  
 Y represents hydrogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, halogen and C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-halogenoalkyl,  
 Z represents C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl and halogen, alkyl, pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or thiazolyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 m represents a number from 1-3,  
 n represents a number from 0-3,  
 R represents hydrogen, -CO-R<sup>1</sup>, -CO-O-R<sup>2</sup> or A, in which  
 A represents a metal cation equivalent or represents an ammonium ion,  
 R<sup>1</sup> represents unsubstituted or halogen-substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl and cycloalkyl which has 3-7 ring atoms and which is uninterrupted by a hetero atom or interrupted by 1-2 oxygen and/or sulphur atoms in the ring, or represents unsubstituted or halogen-, nitro-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogenoalkyl- or C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogenoalkoxy-substituted phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, or represents unsubstituted or halogen- or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl-substituted pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl,  
 or represents unsubstituted or halogen- or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-substituted phenoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, or represents unsubstituted or halogen-, amino- and C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-substituted hetaryloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl,  
 R<sup>2</sup> represents unsubstituted or halogen-substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, or represents unsubstituted or halogen-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy- or C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogenoalkyl-substituted phenyl, and enantiomerically pure forms thereof.  
 4. A compound of the formula (I) according to claim 1, in which

X represents methyl, ethyl, propyl, i-propyl, fluorine, chlorine and bromine,  
 Y represents hydrogen, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, i-butyl, tert-butyl, chlorine, bromine and trifluoromethyl,  
 Z represents methyl, ethyl, i-propyl, butyl, i-butyl, tert-butyl, chlorine and bromine,  
 m represents a number from 1-2,  
 n represents a number from 0-3,  
 10 R represents hydrogen, -CO-R<sup>1</sup>, -CO-O-R<sup>2</sup> or a, in which  
 a represents a metal cation equivalent or an ammonium ion,  
 R<sup>1</sup> represents unsubstituted or fluorine- or chlorine-substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>14</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-polyalkoxyl-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl and cycloalkyl which has 3-6 ring atoms and which is uninterrupted by hetero atoms or interrupted by 1-2 oxygen and/or sulphur atoms in the ring,  
 or represents unsubstituted or fluorine-, chlorine-, bromine-, methyl-, ethyl-, propyl-, i-propyl-, methoxy-, ethoxy-, trifluoromethyl-, trifluoromethoxy-, or nitro-substituted phenyl,  
 or represents unsubstituted or fluorine-, chlorine-, bromine-, methyl-, ethyl-, propyl-, i-propyl-, methoxy-, ethoxy-, trifluoromethyl- or trifluoromethoxy-substituted phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl,  
 or represents unsubstituted or fluorine-, chlorine-, bromine-, methyl- or ethyl-substituted pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl and pyrazolyl,  
 or represents unsubstituted or fluorine, chlorine-, methyl- or ethyl-substituted phenoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, or represents unsubstituted or fluorine-, chlorine-, amino-, methyl- or ethyl-substituted pyridyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl and thiazolyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,  
 R<sup>2</sup> represents unsubstituted or fluorine- or chlorine-substituted: C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>14</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl and C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, or represents unsubstituted or fluorine-, chlorine-, methyl-, ethyl-, propyl-, i-propyl-, methoxy-, ethoxy- or trifluoromethyl-substituted phenyl, and enantiomerically pure forms thereof.  
 5. An insecticidal and/or acaricidal and/or herbicidal composition comprising an insecticidal and/or acaricidal and/or herbicidal effective amount of at least one compound of the formula (I) according to claim 1 in admixture with a diluent.  
 6. A method of combating insects and/or arachnids and/or weeds, comprising applying an insecticidal and/or acaricidal and/or herbicidal effective amount of a compound of the formula according to claim 1 to insects and/or arachnids and/or weeds and/or their environment.

\* \* \* \* \*

**United States Patent** [19]  
**Fischer et al.**

[11] **Patent Number:** 5,116,836  
[45] **Date of Patent:** May 26, 1992

[54] **3-PHENYL-PYRROLIDINE-2,4-DIONE  
DERIVATIVES HAVING PESTICIDAL  
ACTIVITY**

[75] **Inventors:** Reiner Fischer, Mopheim; Hermann  
Hagemann, Leverkusen; Andreas  
Krebs, Odenthal-Holz; Albrecht  
Marhold; Hans-Joachim Santel, both  
of Leverkusen; Robert R. Schmidt;  
Klaus Lürssen, both of  
Bergisch-Gladbach, all of Fed. Rep.  
of Germany; Benedikt Becker,  
Steinmannhof, Italy; Wilhelm  
Stendel, Wuppertal; Christoph  
Erdelen, Leichlingen, both of Fed.  
Rep. of Germany

[73] **Assignee:** Bayer Aktiengesellschaft,  
Leverkusen, Fed. Rep. of Germany

[21] **Appl. No.:** 567,872

[22] **Filed:** Aug. 15, 1990

[30] **Foreign Application Priority Data**

Sep. 1, 1989 [DE] Fed. Rep. of Germany ..... 3929087

[51] **Int. Cl.<sup>5</sup>** ..... C07D 279/08; A61K 31/54

[52] **U.S. Cl.** ..... 514/224.2; 544/47;  
514/368; 548/166; 548/178; 71/90; 71/91

[58] **Field of Search** ..... 544/47; 514/224.2

[56] **References Cited**

**U.S. PATENT DOCUMENTS**

4,139,364 2/1979 Wolf ..... 71/92

**FOREIGN PATENT DOCUMENTS**

0090312 5/1983 European Pat. Off. .

0262399 6/1988 European Pat. Off. .

**OTHER PUBLICATIONS**

CA 109(13):110249g (1988) Prep of 4-hydroxy 2(5H)--  
thiophenones and pynolidones . . . scavengers.  
Chem. Pharm. Bull., vol. 15 (1967) 1120-1123.  
Liebigs. Ann. Chem. 1985, 1095-1098.

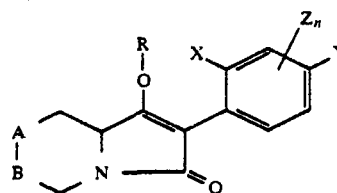
*Primary Examiner*—Cecilia Shen

*Assistant Examiner*—Jyothsna Venkat

*Attorney, Agent, or Firm*—Sprung Horn Kramer &  
Woods

[57] **ABSTRACT**

Novel 3-aryl-pyrrolidine 2,4-dione derivatives of the  
formula



having pesticidal activity.

**6 Claims, No Drawings**

342  
25

5,116,836

27

The formulations in general contain between 0.1 and 95 per cent by weight of active compound, preferably between 0.5 and 90%.

The active compounds according to the invention can be present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with other active compounds, such as insecticides, attractants, sterilizing agents, acaricides, nematocides, herbicides or fungicides. The insecticides include, for example, phosphates, carbamates, carboxylates, chlorinated hydrocarbons, phenylureas and substances produced by microorganisms.

The active compounds according to the invention can furthermore be present in their commercially available formulations and in the use forms, prepared from these formulations, as a mixture with synergistic agents. Synergistic agents are compounds which increase the action of the active compounds, without it being necessary for the synergistic agent added to be active itself.

The active compound content of the use forms prepared from the commercially available formulations can vary within wide limits. The active compound concentration of the use forms can be from 0.0000001 to 95% by weight of active compound, preferably between 0.0001 and 1% by weight.

The compounds are employed in a customary manner appropriate for the use forms.

For example, the active compounds can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom by further dilution or by combination with emulsifiable oils, surface-active substances and other additions, such as ready-to-use solutions, suspensions, emulsions, powders, pastes and granules. They are used in the customary manner, for example by watering, spraying, atomizing or scattering.

The active compounds according to the invention can be applied as herbicides both before and after emergence of the plants.

They can also be incorporated into the soil before sowing.

The amount of active compound used can vary within a substantial range. It depends essentially on the nature of the desired effect. In general, the amounts used are between 0.01 and 15 kg of active compound per hectare of soil surface, preferably between 0.01 and 5 kg per ha.

The active compounds which can be used according to the invention are also suitable for combating midges, ticks, etc., in the field of animal keeping and cattle breeding, it being possible to achieve better results, for example higher milk yields, greater weight, more attractive animal pelt, longer lifetime, etc., by combating the pests.

The active compounds which can be used according to the invention are administered in this field in a known manner such as by oral administration in the form of, for example, tablets, capsules, drinks, granules, by dermal or external use in the form, for example, of dipping, spraying, pouring-on and spotting-on and powdering in and also by parenteral administration in the form, for example, of injection and furthermore by the "feed-through" method. Administration is also possible as molded articles (collar, ear tag).

The use of the active compounds according to the invention can be seen from the following examples.

28

## EXAMPLE A

### Tetranychus test (resistant)

Solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide  
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and the stated amount of emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Bean plants (*Phaseolus vulgaris*) which are heavily infested with the common spider mite or two-spotted spider mite (*Tetranychus urticae*) in all stages of development are treated by being dipped into the preparation of the active compound of the desired concentration.

After the specified period of time, the destruction in % is determined. 100% means that all the spider mites have been killed; 0% means that none of the spider mites have been killed.

In this test, for example, the compounds of the Preparation Examples show superior activity compared to the prior art.

## EXAMPLE B

### Nephotettix test

Solvent: 7 parts by weight of dimethylformamide  
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and the stated amount of emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Rice seedlings (*Oryza sativa*) are treated by being dipped into the active compound preparation of the desired concentration and are infested with larvae of the green rice leafhopper (*Nephotettix cincticeps*) for as long as the seedlings are still moist.

After the specified period of time, the destruction in % is determined. 100% means that all the leaf-hoppers have been killed; 0% means that none of the leafhoppers have been killed.

In this test, for example, the compounds of the Preparation Examples show superior activity compared to the prior art.

## EXAMPLE C

### Pre-emergence test

Solvent: 5 parts by weight of acetone  
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent, the stated amount of emulsifier is added and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

Seeds of the test plants are sown in normal soil and, after 24 hours, watered with the preparation of the active compound. It is expedient to keep constant the amount of water per unit area. The concentration of the active compound in the preparation is of no importance, only the amount of active compound applied per unit area being decisive. After three weeks, the degree of damage to the plants is rated in % damage in compari-

son to the development of the untreated control. The figures denote:

In this test, for example, the compounds of the Preparation Examples show superior activity compared to the prior art.

### EXAMPLE D

#### Post-emergence test

Solvent: 5 parts by weight of acetone

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent, the stated amount of emulsifier is added and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

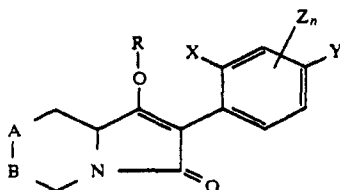
Test plants which have a height of 5-15 cm are sprayed with the preparation of the active compound in such a way as to apply the particular amounts of active compound desired per unit area. The concentration of the spray liquor is so chosen that the particular amounts of active compound desired are applied in 2,000 l of water/ha. After three weeks, the degree of damage to the plants is rated in % damage in comparison to the development of the untreated control. The figures denote:

In this test, for example, the compounds of the Preparation Examples show superior activity compared to the prior art.

It will be understood that the specification and examples are illustrative but not limitative of the present invention and that other embodiments within the spirit and scope of the invention will suggest themselves to those skilled in the art.

We claim:

1. A 3-phenyl derivative of the formula



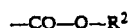
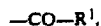
in which

A-B represents  $-S-CH_2-$ ,  $-SO-CH_2-$ ,  $-SO_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-S-$ ,  $-CH_2-SO-$  or  $-CH_2-SO_2-$ ,

X represents  $C_1-C_6$ -alkyl, halogen or  $C_1-C_6$ -alkoxy, Y represents hydrogen,  $C_1-C_6$ -alkyl, halogen,  $C_1-C_6$ -alkoxy or  $C_1-C_3$ -halogenoalkyl,

Z represents  $C_1-C_6$ -alkyl, halogen or  $C_1-C_6$ -alkoxy, n represents a number from 0-3,

R represents hydrogen, or a group of the formula



or

E,

in which

E represents a metal cation equivalent or an ammonium ion,

$R^1$  represents  $C_1-C_{20}$ -alkyl,  $C_2-C_{20}$ -alkenyl,  $C_1-C_8$ -alkoxy- $C_1-C_8$ -alkyl,  $C_1-C_8$ -alkylthio- $C_1-C_8$ -alkyl,  $C_1-C_8$ -polyalkoxy- $C_2-C_8$ -alkyl or cycloalkyl having 5-6 ring atoms, which may be interrupted by oxygen or sulphur, and which are optionally substituted by halogen, represents phenyl which is optionally substituted by halogen, nitro,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy,  $C_1-C_6$ -halogenoalkyl or  $C_1-C_6$ -halogenoalkoxy, represents phenyl- $C_1-C_6$ -alkyl which is optionally substituted by halogen,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy,  $C_1-C_6$ -halogenoalkyl or  $C_1-C_6$ -halogenoalkoxy, represents pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl optionally substituted by halogen or  $C_1-C_6$ -alkyl, represents phenoxy- $C_1-C_6$ -alkyl optionally substituted by halogen or  $C_1-C_6$ -alkyl, or represents pyridyloxy- $C_1-C_6$ -alkyl, pyrimidyloxy- $C_1-C_6$ -alkyl or thiazolyloxy- $C_1-C_6$ -alkyl optionally substituted by halogen, amino or  $C_1-C_6$ -alkyl, and

$R^2$  represents  $C_1-C_{20}$ -alkyl,  $C_2-C_{20}$ -alkenyl,  $C_1-C_8$ -alkoxy- $C_2-C_8$ -alkyl or  $C_1-C_8$ -polyalkoxy- $C_2-C_8$ -alkyl which are optionally substituted by halogen, or represents phenyl optionally substituted by halogen, nitro,  $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy or  $C_1-C_6$ -halogenoalkyl.

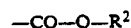
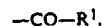
2. A 3-phenyl derivative according to claim 1, in which

A-B represents  $-S-CH_2-$ ,  $-SO-CH_2-$ ,  $-SO_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-S-$ ,  $-CH_2-SO-$  or  $-CH_2-SO_2-$ ,

X represents  $C_1-C_4$ -alkyl, halogen or  $C_1-C_4$ -alkoxy, Y represents hydrogen,  $C_1-C_6$ -alkyl, halogen,  $C_1-C_4$ -alkoxy or  $C_1-C_2$ -halogenoalkyl,

Z represents  $C_1-C_4$ -alkyl, halogen or  $C_1-C_4$ -alkoxy, n represents a number from 0-3,

R represents hydrogen, or a group of the formula



or

E,

in which

E represents a metal cation equivalent or an ammonium ion,

$R^1$  represents  $C_1-C_{16}$ -alkyl,  $C_2-C_{16}$ -alkenyl,  $C_1-C_6$ -alkoxy- $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -alkylthio- $C_1-C_6$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -polyalkoxy- $C_2-C_6$ -alkyl or cycloalkyl having 5-6 ring atoms, which can be interrupted by 1-2 oxygen or sulphur atoms, and which is optionally substituted by halogen, represents phenyl optionally substituted by halogen, nitro,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -alkoxy,  $C_1-C_3$ -halogenoalkyl or  $C_1-C_3$ -halogenoalkoxy, represents phenyl- $C_1-C_4$ -alkyl optionally substituted by halogen,  $C_1-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -alkoxy,  $C_1-C_3$ -halogenoalkyl or  $C_1-C_3$ -halogenoalkoxy, represents pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl optionally substituted by halogen or  $C_1-C_6$ -alkyl, optionally represents phenoxy- $C_1-C_5$ -alkyl substituted by halogen or  $C_1-C_4$ -alkyl, or represents pyridyloxy- $C_1-C_5$ -alkyl, pyrimidyloxy- $C_1-C_5$ -alkyl or thiazolyloxy- $C_1-C_5$ -alkyl optionally substituted by halogen, amino or  $C_1-C_4$ -alkyl,

344  
228

R<sup>2</sup> represents C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl which are optionally substituted by halogen, or represents phenyl optionally substituted by halogen, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkoxy or C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogenoalkyl.

3. A 3-phenyl according to claim 1, in which

A-B represents -S-CH<sub>2</sub>-, -SO-CH<sub>2</sub>-, -SO-  
2-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-, -CH<sub>2</sub>-SO-, or -CH-  
2SO<sub>2</sub>-,

X represents methyl, ethyl, propyl, i-propyl, fluorine, chlorine, bromine, methoxy or ethoxy,

Y represents hydrogen, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, butyl, i-butyl, tert.-butyl, chlorine, bromine, methoxy, ethoxy or trifluoromethyl,

Z represents methyl, ethyl, i-propyl, butyl, i-butyl, tert.-butyl, chlorine, bromine, methoxy or ethoxy, n represents a number from 0-3,

R represents hydrogen, or a group of the formula

-CO-R<sup>1</sup>,

-CO-O-R<sup>2</sup>

or

E.

in which

E represents a metal cation equivalent or an ammonium ion,

R<sup>1</sup> represents C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>14</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-polyalkoxyl-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or cycloalkyl having 5-6 ring atoms, which can be interrupted by 1-2 oxygen or sulphur atoms, and which are optionally substituted by fluorine or chlorine, repre-

sents phenyl optionally substituted by fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, methoxy, ethoxy, trifluoromethyl, trifluoromethoxy or nitro, represents phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl optionally substituted by fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, methoxy, ethoxy, trifluoromethyl or trifluoromethoxy, represents pyridyl, pyrimidyl, thiazolyl or pyrazolyl which are optionally substituted by fluorine, chlorine, bromine, methyl or ethyl, represents phenoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl optionally substituted by fluorine, chlorine, methyl or ethyl, or represents pyridyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, pyrimidyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or thiazolyloxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl which are optionally substituted by fluorine, chlorine, amino, methyl or ethyl,

R<sup>2</sup> represents C<sub>1</sub>-C<sub>14</sub>-alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>14</sub>-alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl or C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl which are optionally substituted by fluorine or chlorine, or represents phenyl optionally substituted by fluorine, chlorine, nitro, methyl, ethyl, propyl, i-propyl, methoxy, ethoxy or trifluoromethyl.

4. A 3-phenyl according to claim 1, in which

A-B represents -S-CH<sub>2</sub>-, -SO-CH<sub>2</sub>-, -SO-  
2-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-S-, -CH<sub>2</sub>-SO- or -CH-  
2SO<sub>2</sub>.

5. A pesticidal composition comprising a pesticidally effective amount of a compound according to claim 1 and a diluent.

6. A method of combating pests which comprises applying to such pests or to a locus from which it is desired to exclude such pests a pesticidally effective amount of a compound according to claim 1.

\* \* \* \* \*

40

45

50

55

60

65

345  
25



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

N.º de publicación: **ES 2 063 108**

Int. Cl.<sup>5</sup>: C07D 207/38

C07D 405/12

A01N 43/36

(12)

TRADUCCION DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Número de solicitud europea: **89123895.8**

(86) Fecha de presentación : **23.12.89**

(87) Número de publicación de la solicitud: **0 377 893**

(87) Fecha de publicación de la solicitud: **18.07.90**

(54) Título: **Derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona.**

(30) Prioridad: **07.01.89 DE 39 00 301**  
**18.08.89 DE 39 27 222**

(73) Titular/es: **Bayer AG**  
**D-51368 Leverkusen, DE**

(45) Fecha de la publicación de la mención BOPI:  
**01.01.95**

(72) Inventor/es: **Fischer, Reiner; Baasner, Bernd;**  
**Hagemann, Hermann; Krebs, Andreas;**  
**Marhold, Albrecht; Santel, Hans-Joachim;**  
**Schmidt, Robert R.; Lürssen, Klaus;**  
**Becker, Benedikt; Schaller, Klaus y**  
**Strang, Harry**

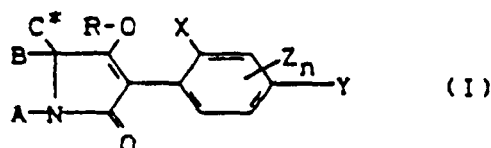
(45) Fecha de la publicación del folleto de patente:  
**01.01.95**

(74) Agente: **Gómez-Acebo Pombo, J. Miguel**

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).

REIVINDICACIONES

1. Derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona de la fórmula general (I)



en la que

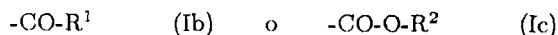
X significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,

Y significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono,

Z significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,

n significa 0 o 1,

R significa hidrógeno (Ia) o significa los grupos de fórmula



en los que

R<sup>1</sup> significa, en caso dado substituidos por halógeno: alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alqueno con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono y cicloalquilo con 3 a 8 átomos en el anillo, que puede estar interrumpido por oxígeno y/o azufre, significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono; significa fenil-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,

R<sup>2</sup> significa, en caso dado substituidos por halógeno: alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alqueno con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, significa fenilo o cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono substituidos en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

A significa alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alqueno con 3 a 8 átomos de carbono, alquino con 3 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 2 a 10 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada, substituido en caso dado por halógeno, cicloalquilo con 3 a 8 átomos en el anillo, que puede estar interrumpido por oxígeno y/o azufre o aril-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono-halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, nitro,

B, C\* independientemente entre sí significan hidrógeno, alquilo con 1 a 12 átomos de carbono, alcoxialquilo con 1 a 8 átomos de carbono de cadena lineal o de cadena ramificada,

así como las formas enantiómeras de los compuestos de la fórmula (I).

2. Derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona de la fórmula general (I) según la reivindicación 1, en la que

X significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

Y significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono,

Z significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono,

n significa 0 o 1,

R significa hidrógeno (Ia) o significa los grupos de la fórmula

-CO-R<sup>1</sup> (Ib) o -CO-O-R<sup>2</sup> (Ic)

en las que

R<sup>1</sup> significa, substituidos en caso dado por halógeno: alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alquienilo con 2 a 16 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono y cicloalquilo con 3 a 7 átomos en el anillo, que puede estar interrumpido por 1 o 2 átomos de oxígeno y/o de azufre,

significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono,

significa fenil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono,

R<sup>2</sup> significa, substituidos en caso dado por halógeno: alquilo con 1 a 16 átomos de carbono, alquienilo con 2 a 16 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 16 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono,

significa fenilo o cicloalquilo con 3 a 7 átomos en el anillo, substituidos en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono,

A significa alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alquienilo con 3 a 6 átomos de carbono, alquiniilo con 3 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 6 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 6 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos en caso dado por halógeno, cicloalquilo con 3 a 7 átomos en el anillo, que puede estar interrumpido por 1 o 2 átomos de oxígeno y/o de azufre o aril-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, nitro,

B, C\*, independientemente entre sí, significan hidrógeno, alquilo con 1 a 10 átomos de carbono, alcoxialquilo con 1 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o de cadena ramificada,

así como las formas enantiómeras de los compuestos de la fórmula (I).

3. Derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona de la fórmula general (I) según la reivindicación 1, en la que

X significa metilo, etilo, propilo, i-propilo, flúor, cloro, bromo, metoxi y etoxi,

Y significa hidrógeno, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, i-butilo, terc.-butilo, flúor, cloro, bromo, metoxi, etoxi y trifluormetilo,

Z significa metilo, etilo, i-propilo, butilo, i-butilo, terc.-butilo, flúor, cloro, bromo, metoxi y etoxi,

n significa 0 o 1,

R significa hidrógeno (Ia) o significa los grupos de la fórmula

-CO-R<sup>1</sup> (Ib) o -CO-O-R<sup>2</sup> (Ic)

en las que



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 N.º de publicación: **ES 2 066 944**

51 Int. Cl.<sup>5</sup>: C07D 487/04, C07D 471/04  
C07D 487/14, C07D 471/14  
C07D 491/147, A01N 43/90  
A01N 57/16, //(C07D 471/04  
C07D 221:00, C07D 209:00)  
(C07D 487/04, 209:00, 209:00)  
(C07D 487/14, 209:00, 209:00  
209:00), (C07D 471/14, 221:00  
209:00, 209:00)

12

TRADUCCION DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Número de solicitud europea: **90123777.6**  
86 Fecha de presentación : **11.12.90**  
87 Número de publicación de la solicitud: **0 442 073**  
87 Fecha de publicación de la solicitud: **21.08.91**

54 Título: **Derivados policíclicos de la 3-aril-pirrolidin-2,4-diona.**

30 Prioridad: **13.02.90 DE 40 04 321**  
**10.10.90 DE 40 32 090**

45 Fecha de la publicación de la mención BOPI:  
**16.03.95**

45 Fecha de la publicación del folleto de patente:  
**16.03.95**

73 Titular/es: **Bayer AG**  
**D-51368 Leverkusen, DE**

72 Inventor/es:  
**Bertram, Heinz-Jürgen; Fischer, Reiner;**  
**Hagemann, Hermann; Krüger, Bernd-Wieland;**  
**Schenke, Thomas; Erdelen, Christoph;**  
**Krauskopf, Birgit; Lurssen, Klaus;**  
**Santel, Hans-Joachim; Schmidt, Robert R. y**  
**Wachendorff, Ulrike**

74 Agente: **Gómez-Acebo Pombo, J. Miguel**

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).

349  
7/8

ES 2 066 944 T3

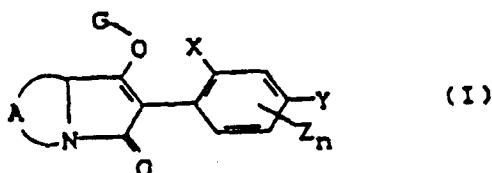
### DESCRIPCION

La invención se refiere a nuevos derivados policíclicos de la 3-aril-pirrolidin-2,4-diona, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo como insecticidas, acaricidas y herbicidas.

Se han descrito propiedades farmacéuticas de las 3-acil-pirrolidin-2,4-dionas (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 110 (1967)). Además se han sintetizado N-fenil-pirrolidin-2,4-dionas por R. Schmierer y H. Mildenberger Liebigs Ann. Chem. 1985 1095. No se ha descrito una actividad biológica de estos compuestos.

En la EP-A 0 262 399 se divulgan compuestos estructuralmente similares (3-aril-pirrolidin-2,4-dionas), no habiéndose dado a conocer sin embargo ninguna actividad herbicida, insecticida o acaricida de los mismos.

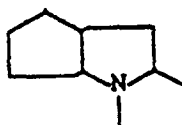
Se han encontrado nuevos derivados policíclicos de la 3-arilpirrolidin-2,4-diona de la fórmula (I)



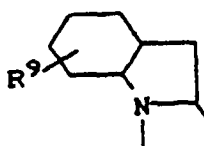
en la que  
el agrupamiento



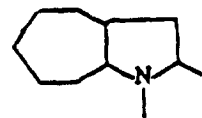
toma uno de los significados siguientes:



1

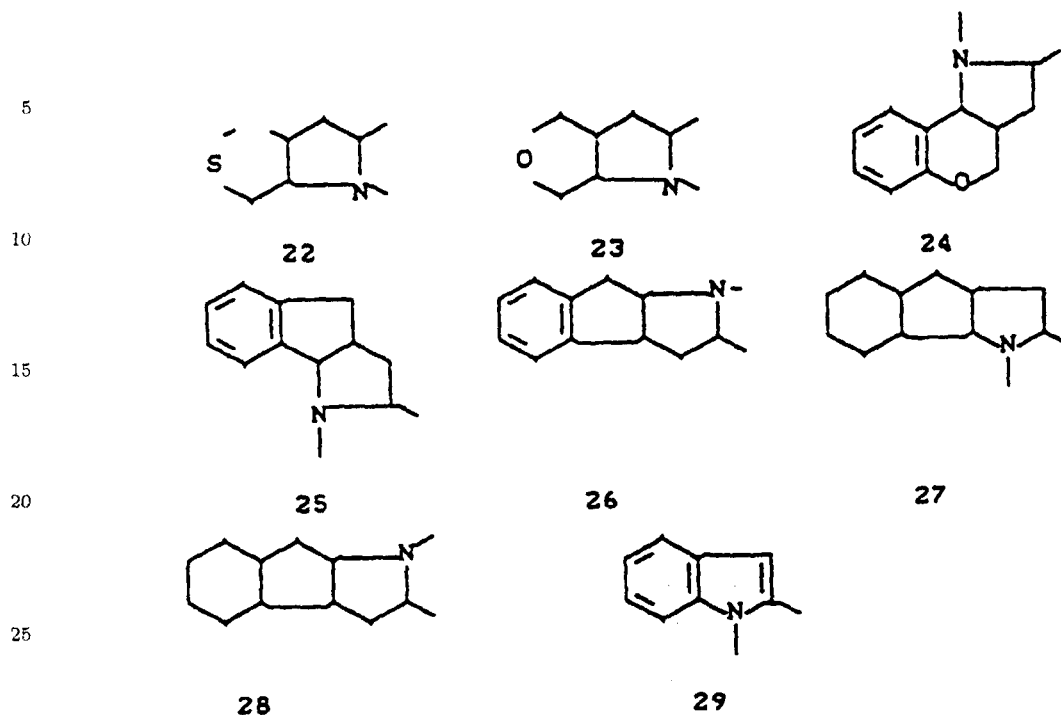


2

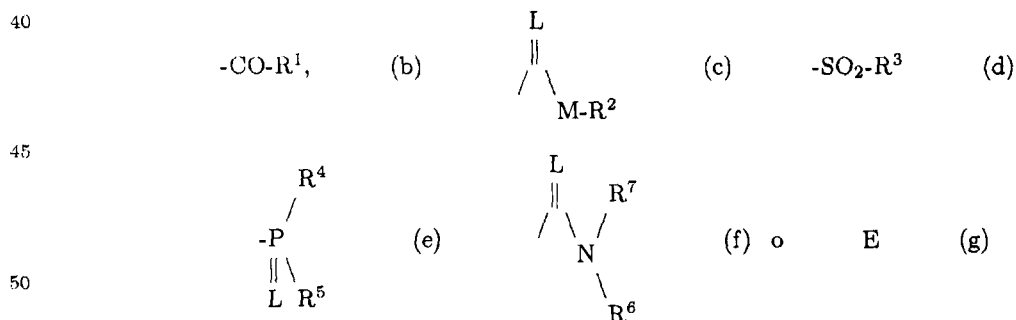


3

351  
25



30 X significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno o alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,  
Y significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,  
halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono,  
35 Z significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono,  
n significa un número de 0 a 3,  
G significa hidrógeno (a) o significa los grupos



donde

55 E significa un equivalente ión metálico o un ión amonio,  
L y M significan oxígeno y/o azufre,

60 R¹ significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, polialcoxilo con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 8 átomos en el anillo, que puede estar interrumpido por átomos de oxígeno y/o de azufre, substituidos en caso dado por halógeno,

352  
35

significa fenilo substituido en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono;

significa fenilo-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono;

significa piridilo, pirimidilo, tiazolilo o pirazolilo substituidos en caso dado por halógeno y/o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono;

significa fenoxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituido en caso dado por halógeno y alquilo con 1 a 6 átomos de carbono;

significa piridiloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, pirimidiloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono o tiazoliloxi-alquilo con 1 a 6 átomos de carbono substituidos en caso dado por halógeno, amino y alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

$R^2$  significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alqueno con 2 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono, polialcoxi con 1 a 8 átomos de carbono-alquilo con 2 a 8 átomos de carbono substituidos en caso dado por halógeno, significa fenilo o bencilo substituidos en caso dado por halógeno, nitro, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

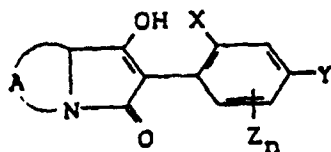
$R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$ , independientemente entre sí, significan alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alquilamino con 1 a 8 átomos de carbono, di-(con 1 a 8 átomos de carbono)-alquilamino, alquiltio con 1 a 8 átomos de carbono, alquenoiltio con 2 a 5 átomos de carbono, alquinoiltio con 2 a 5 átomos de carbono, cicloalquiltio con 3 a 7 átomos de carbono substituidos en caso dado por halógeno, significan fenilo, fenoxi o feniltio substituidos en caso dado por halógeno, nitro, ciano, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

$R^6$  y  $R^7$  independientemente entre sí, significan alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 20 átomos de carbono, alqueno con 2 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 20 átomos de carbono-alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, substituidos en caso dado por halógeno, significan fenilo substituido en caso dado por halógeno, halógenoalquilo con 1 a 20 átomos de carbono, alquilo con 1 a 20 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 20 átomos de carbono, significan bencilo substituido en caso dado por halógeno, alquilo con 1 a 20 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 20 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 20 átomos de carbono o significan conjuntamente un anillo alquilenos con 2 a 6 átomos de carbono interrumpido en caso dado por oxígeno,

$R^9$  significa hidrógeno, halógeno o alquilo con 1 a 2 átomos de carbono o alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono substituidos en caso dado por halógeno,

$R^{10}$  significa alcoxi con 1 a 7 átomos de carbono, amino, alquilamino con 1 a 4 átomos de carbono, dialquilamino con 1 a 4 átomos de carbono.

Teniendo en consideración los diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G de la fórmula general (I) se producen las estructuras (Ia) hasta (Ig) principales siguientes:



(Ia)

353  
352

pregnados con el producto activo, microencapsulados en materiales polímeros y en masas de revestimiento para semillas así como en formulaciones para el empleo con productos fumigantes, tales como cartuchos, botes, serpentinas, fumigantes y similares, así como para formulaciones de nebulizado en frío y en caliente según el procedimiento de volumen ultrabajo.

5 Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo mediante mezclado de los compuestos activos con extendedores, es decir, con disolventes líquidos, gases licuados bajo presión y/o excipientes sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

10 Cuando se emplea agua como extendedor, se pueden utilizar disolventes orgánicos, por ejemplo, como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración preferentemente: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los 15 hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones de petróleo, los alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, o los disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el agua; por extendedores o excipientes gaseosos licuados se entienden aquellos líquidos que son gaseosos a temperatura y presión normales, por ejemplo gases de 20 propulsión para aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono; como excipientes sólidos entran en consideración:

por ejemplo sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y los minerales sintéticos molturados, 25 tal como ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y silicatos; como excipientes sólidos para granulados entran en consideración:

por ejemplo los minerales naturales quebrados y fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita, así como los granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y granulados 30 de material orgánico, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o espumantes entran en consideración: por ejemplo, emulsionantes no ionogenos y aniónicos, tales como los ésteres polioxietilenados de los ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de los alcoholes grasos, por ejemplo, el alquilarilpoliglicoléter, los alquilsulfonatos, los alquilsulfatos, los arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración:

35 por ejemplo, las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulables o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, 40 acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tal es como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocia- 45 nina metálicos así como nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, en general, entre 0,1 y 95 % en peso, preferentemente entre 0,5 y 90 % de producto activo.

50 Los productos según la invención pueden presentarse, para el empleo como insecticidas, acaricidas y nematocidas, en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con otros productos activos, tales como insecticidas, cebos, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, productos reguladores del crecimiento o herbicidas. A 55 los insecticidas pertenecen por ejemplo ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, ésteres del ácido carbónico, hidrocarburos clorados, fenilureas, productos preparados por medio de microorganismos y similares.

Los productos activos según la invención pueden presentarse además en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla 60 con sinérgicos. Los sinérgicos son compuestos mediante los cuales se aumenta el efecto de los productos activos sin que el sinérgico agregado tenga que ser activo en sí mismo.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

202085  
Bogotá, D.C.,

Abogado  
**EMILIO FERRERO**

|        |            |          |
|--------|------------|----------|
| ASUNTO | Radicación | 06042086 |
|        | Trámite    | 011      |
|        | Evento     | 378      |
|        | Actuación  | 519      |
|        | Oficio     |          |
|        | Folios     | 30       |

**06656**

|                         |                                     |                               |                                     |
|-------------------------|-------------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------|
| Patente de Invención    | <input checked="" type="checkbox"/> | Patente de Modelo de Utilidad | <input type="checkbox"/>            |
| Vía Nacional            | <input type="checkbox"/>            |                               |                                     |
| Vía PCT (fase nacional) | <input checked="" type="checkbox"/> | Cap. I                        | <input checked="" type="checkbox"/> |
|                         |                                     | Cap. II                       | <input type="checkbox"/>            |

No. Sol. Internacional: PCT/EP2004/012444  
Fecha de Presentación Internacional: 2004-11-04

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:

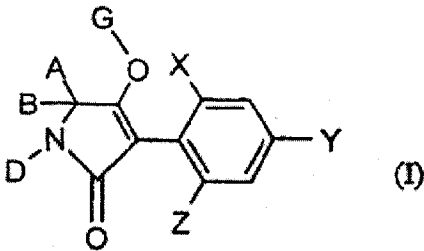
**1. Documentos estudiados**

Capitulo descriptivo: Folios 91 a 241 tal como fueron presentados.  
Capitulo reivindicatorio: Folios 242 a 274 tal y como fueron presentados.  
Folios 285 a 310 modificados.  
Prioridad: Folio 2 DE 10351647,6 2003-11-05.

**2. Objeto de la invención**

Título de la solicitud: Derivados del ácido tetrámico substituidos por 2-halógeno-6-alquil-fenilo. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a derivados del ácido tetrámico substituidos -halógeno-6-alquil-fenilo de fórmula (I), procedimientos y productos intermediarios para su obtención, y combinaciones de estos con al menos un compuesto mejorador de la compatibilidad con las plantas de cultivo.



La presente solicitud de patente indica que ya se conocen muchos derivados de ácido tetrámico a partir de varias publicaciones, sin embargo la actividad y el espectro de actividad de estos compuestos no son siempre satisfactorios, especialmente con ocasión de cantidades de aplicación y de concentraciones bajas. Además la compatibilidad con las plantas de los compuestos conocidos no es siempre suficiente.

Ahora se han encontrado compuestos de fórmula (I) que tiene un actividad muy buena como agentes para la lucha de plagas, y además se ha descubierto que determinados cetógenos cíclicos substituidos impiden los deterioros de las plantas de cultivo, de una manera especialmente buena cuando se utilizan junto con compuestos protectores ó antidotos, lo cual mejora la compatibilidad con las plantas de cultivo y pueden emplearse a modo de una combinación de amplia actividad.

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC C07D 207/38; A01N43/36; A01N43/90.

### 3. De la solicitud de Patente

#### 3.1. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Inicialmente hay que indicar que el capítulo reivindicatorio es demasiado amplio; las reivindicaciones tanto de producto como de proceso solo representan una generalización no sustentada en la descripción.

Son tantas las posibles estructuras para el compuesto de fórmula (I) (debido a la gran cantidad y variedad de sustituyentes) que la descripción no divulga de manera suficientemente clara y completa la materia divulgada en las reivindicaciones; es más la descripción únicamente presenta ensayos con compuestos y combinaciones específicos; y evidentemente la generalidad presentada en el capítulo reivindicatorio es demasiado ambiciosa y no esta enteramente sustentada.

Ahora bien, las reivindicaciones 6, 14, 15 y 16 por su parte, presentan diversos procedimientos de obtención de los derivados de interés y otros intermediarios; que también corresponden a generalizaciones no sustentadas en la descripción. El solicitante debe limitar el objeto de la invención.

En este mismo sentido, los agentes de las reivindicaciones 10 a 12, tampoco tienen sustento en la descripción. El gran número de posibles combinaciones corresponde nuevamente a una generalización demasiado ambiciosa a partir de ensayos puntuales citados en la descripción. Nuevamente se indica que el solicitante debe limitar el alcance de la invención, de modo que defina específicamente la materia que se desea proteger, la cual a su vez debe estar enteramente sustentada en la descripción.

Finalmente el capítulo reivindicatorio, presenta términos y expresiones ambiguos, que generan múltiples interpretaciones y que en otras palabras no definen claramente la materia de la invención; así por ejemplo "alquilo, halógeno, halogenoalquilo, alcoxialquilo, cicloalquilo, alquenoilo, alquinoilo, alquiltioalquilo, heteroátomo, ciclo saturado ó insaturado..., polialcoxiloalquilo, heterociclilo, fenilalquilo, fenilalquinoilo, hetarilo, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, alquenoiltio, cicloalquiltio, al menos, véase también los compuestos emparentados en las EP-

A-86750..." Sírvese suprimir ó reemplazar dichas expresiones y defina específicamente el objeto de la invención. Asimismo se le recuerda al solicitante que las reivindicaciones deben ser claras por si mismas.

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.

#### 4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

El capítulo reivindicatorio presenta claramente dos grupos inventivos, así:

Grupo inventivo (I): Reivindicaciones 1–9 y 14–16 las cuales hacen referencia al compuesto de fórmula (I), su proceso de obtención, intermediarios y posibles agentes pesticidas y/o herbicidas y procedimientos relacionados.

Grupo inventivo (II): Reivindicaciones 10–13 las cuales hacen referencia a las combinaciones del compuesto de fórmula (I) con otro ingrediente activo conocido, denominado protector ó antídoto.

Además cada grupo inventivo es presentado de forma tan amplia, que a su vez puede comprender otros grupos inventivos.

Así por ejemplo, los diversos significados de los sustituyentes del compuesto de fórmula (I) de la reivindicación 1, son tan variados, es decir, son de naturaleza química tan diferente, que los posibles compuestos resultantes, podrían también ser estructural y funcionalmente diferentes.

Nótese que cada uno de los significados de los radicales G, y las posibilidades de unión entre A y D pueden determinar un grupo inventivo diferente. En consecuencia no solo se podrían definir dos grupos inventivos, como se indico arriba, sino que a su vez el prime grupo inventivo eventualmente podría tener otros grupos inventivos.

Ahora bien, se tiene un panorama similar con las reivindicaciones de la combinación. Son tantas las posibilidades de combinación para los agentes de la reivindicación 12 que esta también, puede incluir otros grupos inventivos.

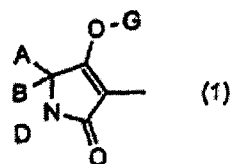
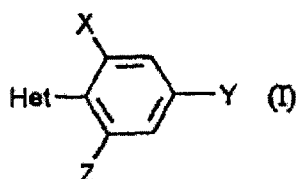
La reivindicación 12 incluye más de 50 combinaciones diferentes, que evidentemente no tienen sustento en la descripción, que no se relacionan entre sí y que no guardan ningún objeto común.

En este orden de ideas, se concluye que existen inicialmente dos grupos inventivos diferentes. Pero además que primero la estructura de la fórmula (I) no es representativa de la invención y segundo los agentes de la reivindicación 12 incluyen combinaciones diferentes, desde unas muy simples hasta unas muy complejas que no se encuentran sustentadas en la descripción y que no guardan un mismo concepto común inventivo.

Por lo tanto el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de unidad de invención de acuerdo al art. 25 de la Decisión 486.

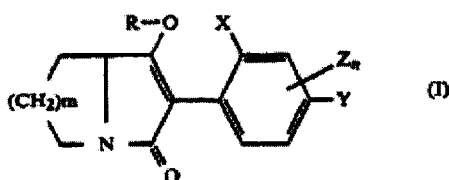
Nuevamente se indica al solicitante que debe limitar el alcance de la invención a aquella materia que se encuentren enteramente sustentada en la descripción.



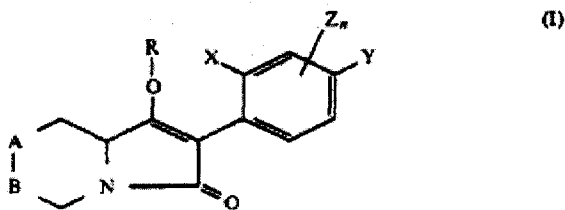


Donde Het puede significar

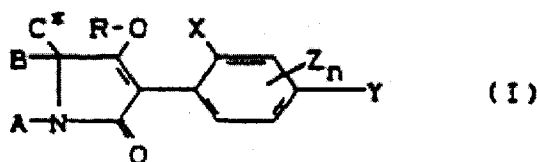
El documento D2 hace referencia a 3-aril-pirrolidin-3,4-dionas de fórmula (I) que tienen actividad insecticida, acaricida, herbicida y antimicótica. Asimismo hace referencia a su procedimiento de obtención, intermediarios y a composiciones que las contienen.



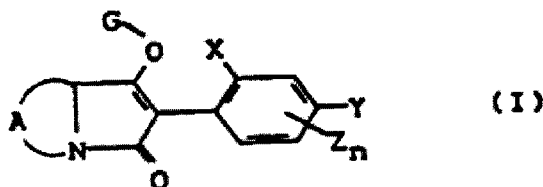
El documento D3 hace referencia a derivados de 3-fenil-pirrolidin-3,4-dionas de fórmula (I) que tienen actividad pesticida, a su procedimiento de obtención, intermediarios y a composiciones que las contienen.



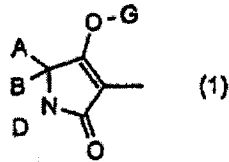
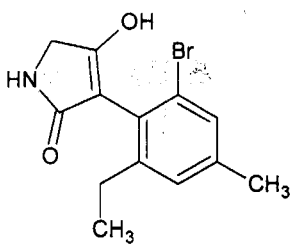
El documento D4 hace referencia a derivados de 3-fenil-pirrolidin-3,4-dionas de fórmula (I) que tienen actividad insecticida, acaricida y herbicida, a sus procedimientos de obtención, intermediarios y a composiciones que las contienen.

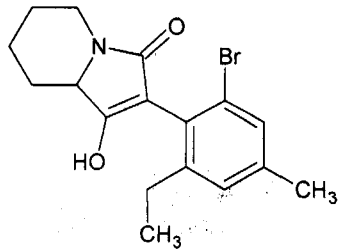


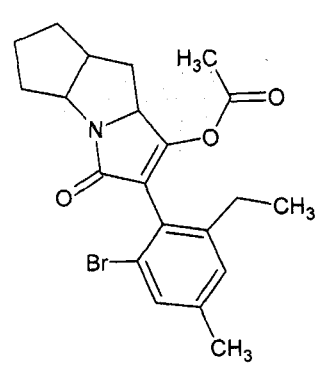
El documento D5 hace referencia a derivados policíclicos de la 3-aril-pirrolidin-2,4-diona de fórmula (I) que tienen actividad insecticida, acaricida y herbicida, a sus procedimientos de obtención, intermediarios y a composiciones que las contienen.



Al comparar los compuestos divulgados en cada una de las anterioridades citadas, sus procedimientos de obtención y sus composiciones, se observa que son iguales a los derivados de fórmula (I) de esta solicitud, así como su procedimiento de obtención y agentes que los contienen.  
Solo con el fin de esquematizar la igualdad estructural se presenta una comparación en las siguientes tablas.

| Cuando en la solicitud                                                              | Cuando en la anterioridad D1                                                                |
|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------|
| X = halógeno                                                                        | X = halógeno                                                                                |
| Y = alquilo                                                                         | Y = alquilo                                                                                 |
| Z = alquilo                                                                         | Z = alquilo                                                                                 |
| G = H                                                                               | G = H                                                                                       |
| A = B = D = H                                                                       | A = B = D = H                                                                               |
|                                                                                     | Het =<br> |
| Se obtiene la siguiente estructura                                                  |                                                                                             |
|  |                                                                                             |

| Cuando en la solicitud                                                               | Cuando en la anterioridad D2 |
|--------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|
| X = halógeno                                                                         | X = halógeno                 |
| Y = alquilo                                                                          | Y = alquilo                  |
| Z = alquilo                                                                          | Z = alquilo                  |
| G = B = H                                                                            | R = H                        |
| A y D = ciclosaturado                                                                | n = 1 y m = 2                |
| Se obtiene la siguiente estructura                                                   |                              |
|  |                              |

| Cuando en la solicitud                                                              | Cuando en la anterioridad D5                                                                                                                                                                         |
|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| X = halógeno                                                                        | X = halógeno                                                                                                                                                                                         |
| Y = alquilo                                                                         | Y = alquilo                                                                                                                                                                                          |
| Z = alquilo                                                                         | Z = alquilo                                                                                                                                                                                          |
| G = -CO-R' (b); R' = alquilo                                                        | G = -CO-R' (b); R' = alquilo                                                                                                                                                                         |
| B = H                                                                               | A = B = D = H                                                                                                                                                                                        |
| A y D = ciclosaturado con heteroátomo                                               | Agrupamiento<br><br>puede ser<br> |
| Se obtiene la siguiente estructura                                                  |                                                                                                                                                                                                      |
|  |                                                                                                                                                                                                      |

En consecuencia los compuestos de fórmula (I) de la reivindicación 1 no son nuevos a partir de cualquiera de los documentos D1 a D5. Así como tampoco es nuevo el procedimiento de obtención de la reivindicación 6, los intermediarios de las reivindicaciones 14 a 16 y los agentes y el procedimiento de mezcla de las reivindicaciones 7 y 9, respectivamente.

Asimismo la materia contenida en las reivindicaciones dependientes tampoco es nueva, pues no presenta ninguna otra característica que las pudiera hacer nuevas.

De otra parte, las reivindicaciones 10 a 12 (segundo grupo inventivo) hacen referencia a agentes que comprenden:

- a. Al menos un cetoenol cíclico de la fórmula la fórmula (I)
- b. Al menos un compuesto mejorador... del siguiente grupo de compuestos...

La anterioridad D1 divulga posibles composiciones entre los mismos cetoenoles cíclicos de esta solicitud y otro ingrediente activo conocido, entre los cuales se incluyen algunos de los compuestos del grupo b. por ejemplo el dicamba.

Al comparar los componentes de los agentes de esta solicitud con las posibles combinaciones de D1 se observa que tienen los mismos elementos. En consecuencia los agentes de interés carecen de novedad a partir de D1.

7.2. Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

Ahora bien, algunas combinaciones (agentes) de esta solicitud pueden resultar novedosas frente a las combinaciones de D1, no obstante el estado del arte ya había sugerido la posibilidad de combinación entre dichos cetoenoles y otros ingredientes activos conocidos. No solo D1, sino a partir de cualquiera de los documentos D2, D3 ó D5.

En consecuencia los agentes no solo no son nuevos, sino que además ya habían sido sugeridos en el estado de la técnica y carecen de nivel inventivo.

Por último el procedimiento de la reivindicación 9, tampoco tiene nivel inventivo, una vez que corresponde al proceso universalmente conocido de mezcla.

6. **Conclusión**

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

| Nº | Documento Nº | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta       |
|----|--------------|----------------------------|----------------------------|
| D1 | WO 96/35664  | 1-7, 9-11, 14-16<br>12     | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D2 | US 4985063   | 1-7, 9, 14-16<br>10-12     | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D3 | US 5116836   | 1-7, 9, 14-16<br>10-12     | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D4 | ES 2063108   | 1-7, 9, 14-16<br>10-12     | Novedad<br>Nivel Inventivo |
| D5 | ES 2066944   | 1-7, 9, 14-16<br>10-12     | Novedad<br>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 Nº 10 de 2001.

**ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL**

Directora de Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha

21 MAYO 2016

|                           |                                        |
|---------------------------|----------------------------------------|
| CONCEPTO TÉCNICO No. 1826 | EXAMINADOR TÉCNICO<br>Código No.202085 |
|---------------------------|----------------------------------------|