

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

**No. 06-076526- -00009-0000**Fecha: 2011-05-11 17:11:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 17

Señor

José Luis Salazar López

Director de Nuevas Creaciones (E)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

Referencia: Expediente No. 06.076.526

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Halogenoalquilcarboxamidas
para la lucha contra los microorganismos y su procedimiento de obtención "

Solicitante: Bayer CropScience Aktiengesellschaft.

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 41**DEL 11 DE FEBRERO DE 2011, OFICIO NO. 02269 (EXAMEN DE FONDO)**

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término legal:

1. Modificaciones al capítulo reivindicatorio

Con el objeto de atender a las observaciones de su Despacho, me permito presentar un nuevo pliego reivindicatorio como sustituto del anteriormente presentado conformado por (4) reivindicaciones.

Las modificaciones efectuadas están totalmente sustentadas en la memoria descriptiva inicialmente presentada, las modificaciones corresponden a limitaciones considerables, las cuales se han hecho con el fin de superar las observaciones del examinador.

2. Objeciones realizadas por su Despacho:**2.1. Título de la invención**

Su Despacho menciona que el título debe modificarse para que defina específicamente la invención.

2.2 Descripción

En forma resumida su Despacho establece que la descripción resulta ser insuficiente para el amplio alcance que tiene el capítulo reivindicatorio. Concluye su Despacho que la divulgación inicial se considera insuficiente para la amplia extrapolación reclamada. No hay evidencia suficiente para pensar que todos los patrones de sustitución reclamados presenten la misma ventaja que fue evidenciada para algunos muy puntuales.

2.3 Reivindicaciones

Su Despacho objeta la claridad del capítulo reivindicatorio argumentando que las reivindicaciones tanto de producto como de proceso son una generalización sin suficiente sustento en la descripción.

Menciona su Despacho que específicamente las extrapolaciones sin suficiente sustento en la descripción se presentan en los radicales R^4 , R^{12} , R^{13} y R^{14} .

Concluye su Despacho que debe existir sustento por lo menos en este caso, de actividad, y que la eventual mejora de actividad se demostró únicamente para patrones de sustitución muy específicos que se alejan bastante de la generalización reclamada.

2.4. Nivel Inventivo

Su Despacho afirma que **D3** (EP 0589301¹) afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones 1 a 5 de la presente invención.

En forma resumida su Despacho argumenta que la diferencia estructural entre los compuestos reclamados en la presente invención y los compuestos divulgados en **D3** se reduce tan solo a la presencia de uno o más átomos de halógeno en el radical alquilo. Sin embargo, dicha diferencia resulta obvia para un técnico medio en la materia a partir de la divulgación completa de **D3**.

¹ Carboxynilides derivatives, process for their preparation and fungicidal compositions containing them

Concluye su Despacho que la solicitud solo demostró un efecto técnico sorprendente en términos de una mejora de actividad para un patrón de sustitución muy específico que no se relaciona con las múltiples opciones de sustitución reclamadas.

Por último, su Despacho solicita que se limite el alcance de la invención y se defina específicamente la materia que se desea proteger, la cual a su vez debe estar enteramente soportada en la descripción.

3. Respuesta a las observaciones del examinador:

3.1 Título de la invención:

Con el propósito de atender a la observación del examinador, presente un nuevo título como sigue:

“Halogenoalquilcarboxamidas para la lucha contra los microorganismos y su procedimiento de obtención”.

El anterior título corresponde a lo que se desea proteger.

3.2. Descripción

Con respecto a las objeciones de sustento que realizó su Despacho, me permito manifestar que con las modificaciones realizadas al capítulo reivindicatorio, se limitó de manera considerable el alcance de las reivindicaciones, y por lo tanto, el nuevo pliego reivindicatorio está totalmente sustentado en la descripción presentada inicialmente.

3.3 Reivindicaciones

Como se mencionó anteriormente, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio como sustituto del anteriormente presentado conformado por (4) reivindicaciones, el cual se limitó de manera considerable. En particular se efectuaron las siguientes modificaciones:

Se limitó la reivindicación 1 a las halogenoalquilcarboxamidas de fórmula (I) donde:

R4 tiene como único significado Hidrógeno, R11 se definió como hidrógeno o cloro, R12 se definió como $-\text{CH}_3$ o CHF_2 , R13 tiene significado Hidrógeno o Flúor, R14 se definió como metilo. R1 se definió como hidrógeno o metilo, R como Hidrógeno, R2 se definió como $-\text{CH}_3$ o $-\text{C}_2\text{H}_5$ y R3 tiene el significado $-\text{CF}_3$ o cloro. De igual manera se efectuó limitación a la reivindicación de procedimiento.

Teniendo en cuenta las anteriores modificaciones es claro que se superan las observaciones hechas a la memoria descriptiva y a las reivindicaciones.

3.4. Nivel inventivo

Respetuosamente mi representada no está de acuerdo con su Despacho en cuanto a que D3 afecta el nivel inventivo del capítulo reivindicatorio de la solicitud en estudio.

En primer lugar, se presenta un nuevo pliego reivindicatorio el cual se limitó considerablemente tal como se discutió anteriormente.

En segundo lugar, D3 (EP-A-589 301) revela derivados de carboxanilida en donde se enseña una gran variedad de posibles heterociclos A el cual incluye pirazol (A5 de acuerdo con la definición de D3). Sin embargo, ninguno de los compuestos revelados en D3 tiene una sustitución haloalquilo en el anillo fenilo (por favor, ver por ejemplo, la tabla E en la página 21). Los compuestos preferidos con un anillo pirazol presentan todos una sustitución en el anillo de fenilo con un sustituyente que es diferente de haloalquilo (e.g compuestos preferidos con A=A5 (pirazol) en la página 10, líneas 17 a 20).

Por favor, nótese que los compuestos de acuerdo con la presente invención muestran una actividad fungicida mejorada en comparación con los compuestos enseñados en D3 (EP-A-589 301), que son carboxanilidas que comprenden un anillo pirazol y que están sustituidas en la posición 2 del anillo fenilo.

La característica que diferencia los compuestos de la presente solicitud y los compuestos del documento D3 es la sustitución en la posición 2 del anillo fenilo con un grupo haloalquilo. Esta característica distintiva conduce de manera sorprendente a una actividad fungicida mejorada. Por su puesto, es posible sustituir un sustituyente alquilo por un sustituyente haloalquilo. Sin embargo, en D3 no se enseña de ninguna manera que la actividad fungicida pueda mejorarse debido a esta sustitución.

Para sustentar lo anterior, me permito anexar datos biológicos adicionales, así como la forma de llevar a cabo dicho ensayo, en donde se muestra que los compuestos de acuerdo con la presente invención que están sustituidos con un grupo haloalquilo en el anillo fenilo, muestran actividad fungicida mejorada con relación a los compuestos del arte previo

revelados en D3 que están sustituidos únicamente con alquilo.

Los datos son comparables directamente ya que el compuesto de acuerdo con la presente invención es idéntico con respecto al compuesto de acuerdo con el arte previo D3, excepto por la sustitución del grupo -CH3 (en el sustituyente alquilo del grupo fenilo) por un grupo CF3. Por favor, nótese que hay un incremento realmente significativo en la actividad fungicida del 75% al 100%. Este incremento no habría sido previsible para una persona medianamente experta en el arte a partir de las enseñanzas del documento D3.

De esta manera, se demuestra que los compuestos reivindicados sí son inventivos en vista del efecto mejorado que presentan.

Lo anterior es sustentado, por el Manual Andino², en la página 82, que establece que un compuesto químico tiene nivel inventivo si *“presenta un efecto inesperado, (es el caso más frecuente sobre todo si el compuesto es similar a otros del estado de la técnica. El efecto inesperado puede ser completamente diferente de los descritos para los compuestos similares conocidos, o bien ser igual pero con una mejora en los resultados.”* El subrayado es mío. De acuerdo con esto, es claro que el nivel inventivo debe ser reconocido cuando la materia reclamada presente un efecto mejorado, como en el presente caso.

4. Solicitudes concedidas en otros países para esta misma invención.

Aunque compartimos la opinión de su Despacho en cuanto a que el otorgamiento de una patente equivalente a la presente solicitud Colombiana por otras Oficinas no obliga a su Despacho a actuar de la misma forma, a manera informativa es importante mencionar que la Oficina de Patentes de los Estados Unidos de América otorgó la patente US 7,910,746. (Anexo carátula y capítulo reivindicatorio para su información). Así mismo, la presente invención ya ha sido otorgada también en China y en México.

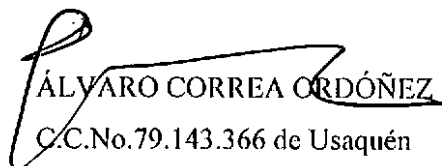
Es decir, dichas Oficinas reconocieron la novedad y el nivel inventivo de la invención

² Manual para el examen de solicitudes de patentes de invención en las oficinas de propiedad industrial de los países de la comunidad Andina, OMPI, Ecuador, 2004.

equivalente a la presente solicitud Colombiana.

En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas en el presente documento y en consecuencia, se continúe con el trámite para que pueda otorgarse el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

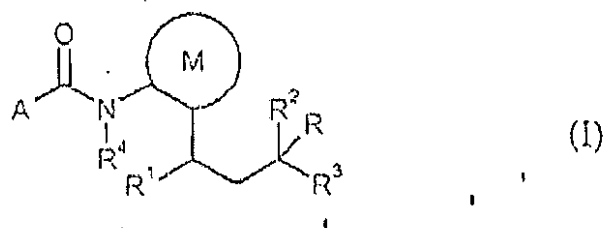
Atentamente,


ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexos: Capítulo reivindicatorio modificado conformado por 4 reivindicaciones
 Anexo A – Datos biológicos y ejemplo.
 Carátula y reivindicaciones de la patente US 7,910,746

REIVINDICACIONES

1.- Halógenoalquilcarboxamidas de la fórmula (I)



En la que

R significa hidrógeno,

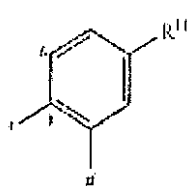
R¹ significa hidrógeno o metilo,

R² significa metilo o etilo,

R³ significa CF₃ o cloro,

R⁴ significa hidrógeno,

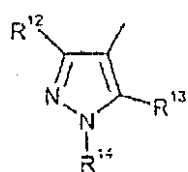
M significa un anillo de fenilo monosustituido por R¹¹,



R¹¹ significa hidrógeno o cloro,

Estando unido el enlace marcado con (“*”) con la amida, estando unido el enlace marcado con “#” con el resto halógenoalquilo.

A significa el resto de la formula (A1)



(A1), en la que

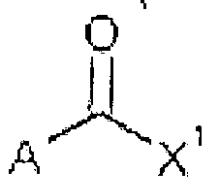
R¹² significa CH₃ o CHF₂,

R¹³ significa hidrógeno o flúor,

R¹⁴ significa metilo.

2. Procedimiento para la obtención de halógenoalquilcarboxamidas de la formula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque

a) se hace reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de la formula (II)



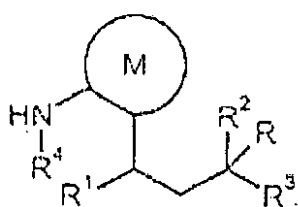
(II)

En la que

A tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

X¹ significa halógeno o hidroxilo,

Con un derivado de anilina de la fórmula (III)



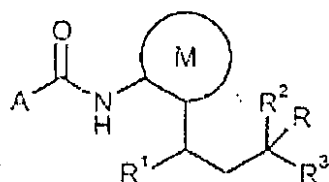
(III)

En la que

R, R¹, R², R³, R⁴ y M tienen los significados indicados en la reivindicación 1, en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o

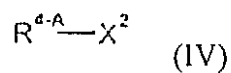
b) se hacen reaccionar hexilcarboxanilidas de la formula (I-a)



(I-a)

En la que

R, R¹, R², R³, M y A tienen los significados indicados en la reivindicación 1, con halogenuros de la fórmula (IV)



En la que

X² significa cloro, bromo o yodo,

R⁴-A significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono- alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6

átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilosulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono) carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono) carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono) carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono) carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono) carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono) carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono) carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono) carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono) carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono) carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono) carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono) carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$,

teniendo R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 los siguientes significados, en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

R^5 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^6 y R^7 significan respectivamente, de manera independiente entre sí hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^6 y R^7 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 o 6 átomos en el anillo substituido, en caso dado, de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,

R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

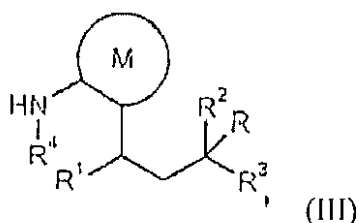
halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 o 6 átomos en el anillo, substituido, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,

R^{10} significa hidrogeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

3.- Agentes para la lucha contra los microorganismos indeseables, caracterizados porque tienen un contenido en, al menos, una halógenoalquilcarboxamida de la fórmula (I), según la reivindicación 1, junto a agentes extendedores y/o productos tensioactivos.

4.- Derivados de anilina de formula (III),



En la que R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y M tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

Example

Septoria tritici-test (wheat) / preventive

Solvent: 49 - parts by weight of n,n-dimethylacetamid

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound or active compound combination at the stated rate of application.

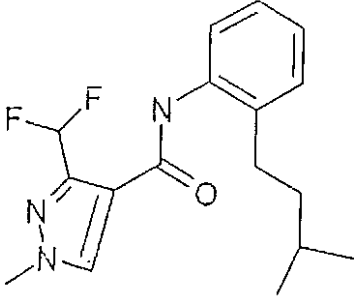
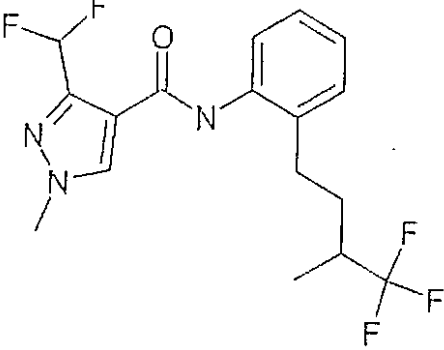
- 10 After the spray coating has been dried, the plants are sprayed with a spore suspension of *Septoria tritici*. The plants remain for 48 hours in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of approximately 100% and afterwards for 60 hours at approximately 15°C in a translucent incubation cabinet at a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

- 15 The plants are placed in the greenhouse at a temperature of approximately 15°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80%.

The test is evaluated 21 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

Table

Septoria tritici-test (wheat) / preventive

	Active compound	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
	<u>According to prior art::</u> 	500	75
	<u>According to the invention:</u>		
Example 2		500	100



US007910746B2

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

(10) Patent No.: **US 7,910,746 B2**
(45) Date of Patent: ***Mar. 22, 2011**

(54) **HALOALKYL CARBOXAMIDES**

(75) Inventors: **Ralf Dunkel, Lyons (FR); Hans-Ludwig Elbe, Langenfeld (DE); Benoit Hartmann, Langenfeld (DE); Jörg Nico Greul, Leichlingen (DE); Kerstin Ilg, Köln (DE); Ulrike Wachendorff-Neumann, Neuwied (DE); Peter Dahmen, Neuss (DE); Karl-Heinz Kuck, Langenfeld (DE)**

(73) Assignee: **Bayer CropScience AG, Monheim (DE)**

(*) Notice: Subject to any disclaimer, the term of this patent is extended or adjusted under 35 U.S.C. 154(b) by 979 days.

This patent is subject to a terminal disclaimer.

(21) Appl. No.: **10/597,723**

(22) PCT Filed: **Jan. 22, 2005**

(86) PCT No.: **PCT/EP2005/000608**

§ 371 (c)(1).

(2), (4) Date: **May 16, 2007**

(87) PCT Pub. No.: **WO2005/075411**

PCT Pub. Date: **Aug. 18, 2005**

(65) **Prior Publication Data**

US 2007/0203148 A1 Aug. 30, 2007

(30) **Foreign Application Priority Data**

Feb. 6, 2004 (DE) 10 2004 005 786

(51) **Int. Cl.**

C07D 231/10 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

(52) **U.S. Cl. 548/369.7; 514/406**

(58) **Field of Classification Search 548/369.7; 514/406**

See application file for complete search history.

(56) **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

3,978,091 A 8/1976 Tsuchiya et al.
5,330,995 A 7/1994 Eicken et al.
5,438,070 A 8/1995 Eicken et al.
5,914,344 A * 6/1999 Yoshikawa et al. 514/406
7,176,228 B2 2/2007 Elbe et al.
7,208,169 B2 4/2007 Dunkel et al.
7,314,958 B2 1/2008 Elbe et al.
7,538,073 B2 5/2009 Elbe et al.
7,598,389 B2 10/2009 Dunkel et al.
7,687,531 B2 3/2010 Dunkel et al.
2004/0204470 A1 10/2004 Elbe et al.
2006/0128769 A1 6/2006 Dunkel et al.
2007/0060579 A1 3/2007 Wachendorff-Neumann et al.
2007/0082877 A1 4/2007 Dunkel et al.
2007/0142327 A1 6/2007 Funke et al.
2007/0203148 A1 8/2007 Dunkel et al.
2007/0276022 A1 11/2007 Dunkel et al.

2007/0293455 A1 12/2007 Dunkel et al.
2008/0058389 A1 3/2008 Dunkel et al.
2008/0064874 A1 3/2008 Dunkel et al.
2008/0070863 A1 3/2008 Funke et al.
2008/0085924 A1 4/2008 Dunkel et al.
2008/0139389 A1 6/2008 Kneen et al.
2008/0242708 A1 10/2008 Dunkel et al.
2008/0261810 A1 10/2008 Fischer et al.
2008/0293566 A1 11/2008 Suty-Heinze et al.
2009/0036310 A1 2/2009 Jakobi et al.
2009/0076113 A1 3/2009 Dunkel et al.
2009/0105316 A1 4/2009 Dunkel et al.
2009/0118346 A1 5/2009 Dunkel et al.
2009/0209769 A1 8/2009 Straub
2009/0270254 A1 10/2009 Thielert et al.
2009/0286681 A1 11/2009 Dahmen et al.
2009/0298888 A1 12/2009 Thielert et al.
2010/0029730 A1 2/2010 Dunkel et al.
2010/0056786 A1 3/2010 Straub

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

CA 2 106 497 A1 3/1994
DE 2 006 472 A 8/1970
DE 2 409 011 A 9/1974
EP 0 545 099 A2 6/1993
EP 0 591 699 A1 4/1994
EP 0 824 099 B1 11/2001
EP 0 737 682 B1 1/2002
EP 0 589 301 B1 6/2002
GB 1 303 844 A1 1/1974

(Continued)

OTHER PUBLICATIONS

Office Action mailed on Feb. 3, 2009 for U.S. Appl. No. 10/588,293 inventors Dunkel, R., et al., filed May 16, 2007.

Office Action mailed on Aug. 12, 2009 for U.S. Appl. No. 10/588,293 inventors Dunkel, R., et al., filed May 16, 2007.

Co-pending U.S. Appl. No. 10/584,027 inventors Linker, Karl-Heinz et al., filed Dec. 18, 2004 (Not Published).

Co-pending U.S. Appl. No. 10/581,348 inventors Funke, Christian et al., filed Nov. 20, 2004 (Not Published).

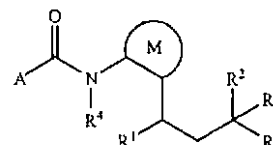
(Continued)

Primary Examiner — Shailendra Kumar

(74) *Attorney, Agent, or Firm* — Sterne, Kessler, Goldstein & Fox P.L.L.C.

(57) **ABSTRACT**

New haloalkyl carboxanides of formula (I)



(I)

in which

R, R¹, R², R³, R⁴, M and A have the meanings specified in the description,

several processes for synthesizing these materials and their use in combating undesirable microorganisms, as well as new intermediate products and their synthesis.

6 Claims, No Drawings

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

JP	53-72823 A	6/1978
JP	8-92223 A	4/1996
JP	8-176112 A	7/1996
JP	10-251240 A	9/1998
JP	2001-72510 *	3/2001
JP	2001-302605 A	10/2001
WO	WO 96/37494 A1	11/1996
WO	WO 98/25923 A1	6/1998
WO	WO 02/38542 A1	5/2002
WO	WO 02/059086 A1	8/2002
WO	WO 03/010149 A1	2/2003

OTHER PUBLICATIONS

Corey, E.J., "Studies on the Asymmetric Synthesis of α -Amino Acids. II. New System for Highly Specific Asymmetric Synthesis with Conservation of the Chiral Reagent," *J. Am. Chem. Soc.* 92:2488-2501, The American Chemical Society (1970).

Dialog File 351 Accession No. 297668, Derwent WPI English language abstract for DE 2 006 472 A (listed as document FP1 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 660648, Derwent WPI English language abstract for DE 2 409 011 A (listed as document FP2 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 1525166, Derwent WPI English language abstract for JP 53-72823 A (listed as document FP3 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 6611019, Derwent WPI English language abstract for EP 0 545 099 A2 (listed as document FP4 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 6720671, Derwent WPI English language abstract for EP 0 591 699 A1 (listed as document FP5 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 7617971, Derwent WPI English language abstract for JP 8-92223 A (listed as document FP6 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 7905153, Derwent WPI English language abstract for JP 8-176112 A (listed as document FP7 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 9058768, Derwent WPI English language abstract for JP 10-251240 A (listed as document FP10 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 11196304, Derwent WPI English language abstract for JP 2001302605 A (listed as document FP11 on accompanying form PTO/SB/08A).

Dialog File 351 Accession No. 6970179, Derwent WPI English language abstract for EP 0 589 301 A1 (listed as document FP15 on accompanying form PTO/SB/08A).

International Search Report for International Application No. PCT/EP2005/000608, European Patent Office, Netherlands, mailed on Jun. 20, 2005.

International Preliminary Report on Patentability for International Application No. PCT/EP2005/000608, European Patent Office, Netherlands, issued on Aug. 7, 2006.

Office Action mailed Dec. 8, 2008, in U.S. Appl. No. 10/557,083, Dunkel et al., filed May 27, 2006.

Office Action mailed May 12, 2009, in U.S. Appl. No. 10/557,083, Dunkel et al., filed May 27, 2006.

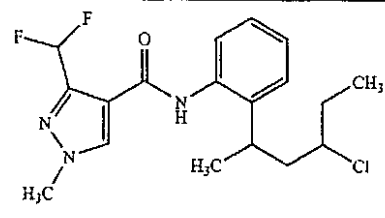
Office Action mailed Dec. 2, 2009, in U.S. Appl. No. 10/557,083, Dunkel et al., filed May 27, 2006.

Co-pending Application, U.S. Appl. No. 11/910,659, inventors Wachendorf-Neumann et al., filed on Oct. 4, 2007 (Not Published).

Co-pending Application, U.S. Appl. No. 12/654,384, inventors Fischer et al., filed on Dec. 17, 2009 (Not Published).

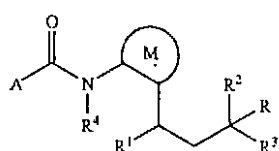
* cited by examiner

TABLE E-continued

Alternaria test (tomato)/protective		
Active substance according to the invention	Application rate of active substance in g/ha	Degree of effectiveness in %
	750	95

The invention claimed is:

1. A haloalkyl carboxamide of the formula (I)



in which

R stands for hydrogen or halogen,

R¹ stands for hydrogen or methyl,

R² stands for methyl, ethyl or C₁-C₄ haloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

R³ stands for halogen or C₁-C₄ haloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

R⁴ stands for hydrogen, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₆ alkylsulfinyl, C₁-C₆ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkoxy-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl; C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; formyl, formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; halo-(C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, halo-(C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl with 1 to 13 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; (C₁-C₈ alkyl) carbonyl, (C₁-C₈ alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈ cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆ haloalkyl)carbonyl, (C₁-C₆ haloalkoxy)carbonyl, (halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈ halocycloalkyl)carbonyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; or —C(=O)C(=O)R⁵, —CONR⁶R⁷ or —CH₂NR⁶R⁷,

R⁵ stands for hydrogen, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₈ alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl; C₁-C₆ haloalkyl, C₁-C₆ haloalkoxy, halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case,

R⁶ and R⁷ stand independently of one another in each case for hydrogen, C₁-C₈ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ allyl, C₃-C₈ cycloalkyl; C₁-C₆ haloalkyl, halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case, or

R⁶ and R⁷, together with the nitrogen atom to which they are bound, form a substituted, saturated heterocycle with

5 to 8 ring atoms, with single or multiple, the same or different substitution by halogen or C₁-C₄ alkyl, whereby the heterocycle optionally contains 1 or 2 additional, non-adjacent hetero atoms constituted of oxygen, sulfur or NR¹⁰,

R⁸ and R⁹ stand independently of one another for hydrogen, C₁-C₈ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl; C₁-C₈ haloalkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case, or

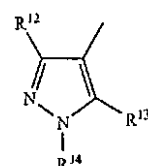
R⁸ and R⁹, together with the nitrogen atom to which they are bound, form a substituted, saturated heterocycle with 5 to 8 ring atoms, with single or multiple, the same or different substitution by halogen or C₁-C₄ alkyl, whereby the heterocycle optionally contains 1 or 2 additional, non-adjacent hetero atoms constituted of oxygen, sulfur or NR¹⁰,

R¹⁰ stands for hydrogen or C₁-C₆ alkyl,

M stands in each case for a phenyl ring with a single substitution by R¹¹,

R¹¹ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, isopropyl, methylthio or trifluoromethyl,

A stands for the group of the formula (A1)



(A1)

in which

R¹² stands for hydrogen, cyano, halogen, nitro, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkylthio, C₃-C₆ cycloalkyl, haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy or C₁-C₄ haloalkylthio, in each case with 1 to 5 halogen atoms, aminocarbonyl or aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl,

R¹³ stands for hydrogen, halogen, cyano, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoxy or C₁-C₄ alkylthio, and

R¹⁴ stands for hydrogen, C₁-C₄ alkyl, hydroxy-C₁-C₄ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C₃-C₆ cycloalkyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄-haloalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-haloalkoxy-C₁-C₄-alkyl in each case with 1 to 5 halogen atoms, or phenyl.

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

R stands for hydrogen, fluorine, chlorine or bromine,

R¹ stands for hydrogen or methyl,

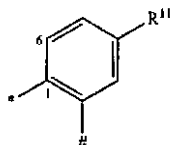
R² stands for methyl, ethyl or in each case for methyl, ethyl, n- or isopropyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl with single or multiple, the same or different, substitution by fluorine, chlorine or bromine,

R³ stands for fluorine, chlorine, bromine, iodine or in each case for methyl, ethyl, n- or isopropyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl with single or multiple, the same or different, substitution by fluorine, chlorine or bromine,

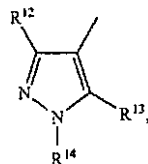
R⁴ stands for hydrogen, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkylsulfinyl, C₁-C₄ alkylsulfonyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl; C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, halo-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; formyl, formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; halo-

55

(C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, halo-(C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl with 1 to 13 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; (C₁-C₆ alkyl)carbonyl, (C₁-C₄ alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃ alkyl)carbonyl, (C₃-C₆ cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄ haloalkyl)carbonyl, (C₁-C₄ haloalkoxy)carbonyl, (halo-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆ halocycloalkyl)carbonyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; or —C(=O)C(=O)R⁵, —CONR⁶R⁷ or —CH₂NR⁸R⁹,
R⁵ stands for hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl; C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ haloalkoxy, halo-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case,
R⁶ and R⁷ stand independently of one another in each case for hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl; C₁-C₄ haloalkyl, halo-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case, or
R⁶ and R⁷, together with the nitrogen atom to which they are bound, form a substituted, saturated heterocycle with 5 to 8 ring atoms, with single or multiple, the same or different substitution by halogen or C₁-C₄ alkyl, whereby the heterocycle optionally contains 1 or 2 additional, non-adjacent hetero atoms constituted of oxygen, sulfur or NR¹⁰,
R⁸ and R⁹ stand independently of one another for hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl; —C₄ haloalkyl, C₃-C₆ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case, or
R⁸ and R⁹, together with the nitrogen atom to which they are bound, form a substituted, saturated heterocycle with 5 to 8 ring atoms, with single or multiple, the same or different substitution by halogen or C₁-C₄ alkyl, whereby the heterocycle optionally contains 1 or 2 additional, non-adjacent hetero atoms constituted of oxygen, sulfur or NR¹⁰,
R¹⁰ stands for hydrogen or C₁-C₄ alkyl,
M stands for the following cyclic



whereby the bond marked with an asterisk ("*") is a link with the amide, and the bond marked with "#" is a link with the haloalkyl group,
R¹¹ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl,
A stands for the group of the formula (A1)

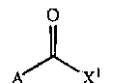


56

in which

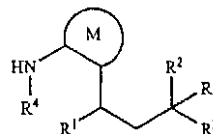
R¹² stands for hydrogen, cyano, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, isopropyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, cyclopropyl, C₁-C₂ haloalkyl, C₁-C₂ haloalkoxy in each case with 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, trifluoromethylthio, difluoromethylthio, aminocarbonyl, aminocarbonylmethyl or aminocarbonylethyl,
R¹³ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, methoxy, ethoxy, methylthio or ethylthio, and
R¹⁴ stands for hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, C₁-C₂ haloalkyl with 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, hydroxymethyl, hydroxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl or phenyl.

3. A process for synthesizing a haloalkyl carboxamide of the formula (I) according to claim 1, comprising
a) reacting a carboxylic acid derivative of the formula (II)



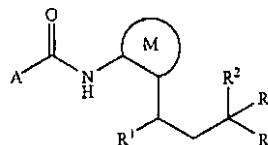
in which

A has the meaning as defined above in claim 1 and
X¹ stands for halogen or hydroxy,
with an aniline derivative of the formula (III)



in which

R, R¹, R², R³, R⁴ and M have the meanings as defined above in claim 1,
optionally in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a condensation agent, optionally in the presence of an acid binder and optionally in the presence of a diluent,
or
b) reacting a haloalkylcarboxanilide of the formula (I-a)



in which

R, R¹, R², R³, M and A have the meanings as defined above in claim 1, with a halide of the formula (IV)



in which

X² stands for chlorine, bromine or iodine,

R^{4-d} stands for C₁-C₈ alkyl, C₁-C₆ alkylsulfinyl, C₁-C₆ alkylsulfonyl, C₁-C₄ alkoxy-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₈ cycloalkyl; C₁-C₆ haloalkyl, haloalkylthio, C₁-C₄ haloalkylsulfinyl, C₁-C₄ haloalkylsulfonyl, halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈ halocycloalkyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; formyl, formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; halo-(C₁-C₃ alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, halo-(C₁-C₃ alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl with 1 to 13 fluorine, chlorine and/or bromine atoms in each case; (C₁-C₈ alkyl) carbonyl, (C₁-C₈ alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈ cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆ haloalkyl)carbonyl, (C₁-C₆ haloalkoxy)carbonyl, (halo-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈ halocycloalkyl)carbonyl with 1 to 9 fluorine, chlorine and/or

bromine atoms in each case; or —C(=O)C(=O)R⁵, —CONR⁶R⁷ or —CH₂NR⁸R⁹, whereby R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ and R⁹ have the meanings as defined above in claim 1, in the presence of a base and a dilution medium.

4. A composition for combating undesirable microorganisms, comprising at least one haloalkyl carboxamide of the formula (I) according to claim 1 together with extenders and/or surface-active materials.

5. A method for combating undesired microorganisms, comprising applying at least one haloalkyl carboxamide of the formula (I) according to claim 1 to the microorganisms and/or their environment.

6. A method for preparing a composition to combat undesired microorganisms, comprising mixing at least one haloalkyl carboxamide of the formula (I) according to claim 1 with extenders and/or surface-active materials.

* * * * *