

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-076526- -00007-0000

Fecha: 2010-09-30 17:19:31 Dep. 2020 DIR NUEVAS CR
Tra 11 PATENTE/II Lve: 378 FASENACIONAL
Act 444 RESPUESTA/QUE Folios: 18

Señora

Alix Carmenza Céspedes de Vergel

Jefe de División de Nuevas Creaciones

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"

Solicitante: Bayer CropScience Aktiengesellschaft.

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 181**DEL 21 DE MAYO DE 2010, OFICIO NO. 6659 (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 de prórroga solicitado en mi memorial 06-076526--00006-0000 de fecha 18 de agosto de 2010:

1. Modificaciones al capítulo reivindicatorio

Antes de dar respuesta a las objeciones realizadas por su Despacho, me permito señalar que es deseo del solicitante presentar un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por cinco (5) reivindicaciones en el cual se han realizado limitaciones considerables.

En este sentido, me permito manifestar que dichas modificaciones no amplían de manera alguna el alcance de la invención; por el contrario, corresponden a limitaciones sumamente considerables que encuentran pleno sustento en la descripción y que han sido realizadas con el fin de superar las objeciones realizadas por el señor Examinador.

2. Objeciones realizadas por su Despacho:**2.1. Reivindicaciones**

Su Despacho objeta la claridad del capítulo reivindicatorio argumentando que es muy amplio y corresponde a una generalización no sustentada en la descripción puesto que son muchas las estructuras posibles para el compuesto de fórmula I pero la descripción solo presenta ensayos que demuestran actividad con compuestos específicos.

2.2. Unidad de invención

De acuerdo con su Despacho, el capítulo reivindicatorio incluye un gran número de posibles compuestos de fórmula (I) que son estructuralmente diferentes. Adicionalmente, el señor Examinador señala que cada uno de los significados de A y M puede *determinar un grupo* inventivo diferente por lo que pide limitar el alcance de la invención.

2.3. Reivindicaciones dirigidas a usos

Su Despacho objeta las reivindicaciones 5 y 6 por referirse al uso de las halogenoalquilcarboxamidas de fórmula (I).

2.4. Novedad y Nivel Inventivo

Su Despacho establece que los documentos WO 02/38542 (D1), EP 0545099 (D2) y EP 0589301 (D3) *afectan* la novedad y el nivel inventivo de la presente solicitud tal como se muestra a continuación:

2.4.1 Novedad

Su Despacho señala que el arte previo citado ya había presentado estructuras tipo halogenoalquilcarboxamida que son iguales a las estructuras de la presente solicitud y que también tienen actividad fungicida. Posteriormente, presenta tablas comparativas.

2.4.2 Nivel Inventivo

Manifiesta su Despacho que debido a la amplitud del capítulo reivindicatorio de la presente invención, es posible que ésta reclame estructuras nuevas respecto al arte previo citado pero que éstas no serían inventivas por cuanto las anterioridades ya habían revelado que el núcleo central de tipo halogenoalquilcarboxamidas tenía actividad fungicida.

Adicionalmente, establece que la solicitud *“no demostró una mejora respecto al arte conocido esas eventuales estructuras novedosas no representan un salto cualitativo en la*

pirrolocoarboxamidas y pirrolocarbotoamidas. Sin embargo, dicha referencia no enseña pirazolcoarboxamidas tal como reclama el capítulo reivindicatorio modificado que se presenta junto con este memorial. En consecuencia, la presente invención es a todas luces novedosa frente al documento D1.

Por su parte, el documento D2 revela derivados de anilida y su uso en el tratamiento de la botritis. D2 se dirige principalmente a compuestos en donde A = piridina. Aunque D2 menciona —entre otras posibilidades— que A puede ser un grupo 1-metilpirazol sustituido en la posición 3 y 5 con metilo, cloro o trifluorometilo (e.g., página 2, línea 18); de ninguna manera los compuestos revelados por D2 tiene una sustitución haloalquilo en el anillo fenilo (e.g. tabla 10 en donde A = A6 (1-metilpirazol) de acuerdo con la definición de la fórmula (V) en la página 23). Por consiguiente, en vista de las diferencias existentes, es claro que la invención reclamada por la presente solicitud es novedosa frente a las enseñanzas de dicho documento D2.

Por último, con respecto al documento D3, me permito señalar que éste revela derivados de carboxanilida en donde se enseña una gran variedad de heterociclos A posibles. Aunque dichas posibilidades contemplan el pirazol como una posibilidad (A5 de acuerdo con la definición de D3), ninguno de los compuestos allí revelados tiene una sustitución haloalquilo en el anillo fenilo (eg. Tabla E en la página 21) Los compuestos preferidos con un anillo de 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). De esta manera, es claro que la invención reclamada por la presente solicitud es novedosa frente a las enseñanzas de dicho documento D3.

En este sentido, me permito dirigir la atención de su Despacho a las enseñanzas del Manual Andino de Patentes¹, específicamente al acápite 9.4 “Análisis de Novedad” (páginas 65 y 66) en donde se establece: “Para determinar la novedad de la invención, se debe comprobar si existen anticipaciones del estado de la técnica que contengan explícitamente todas las características técnicas esenciales de la invención (...) si todas las características técnicas de la reivindicación independiente se encuentran descritas en un mismo

¹ Manual para el examen de solicitudes de patentes de invención en las Oficinas de Propiedad Industrial de los países de la Comunidad Andina, 2004.

antecedente y además se encuentran íntimamente relacionadas, el objeto de dicha reivindicación carece de novedad. Si una característica, aunque sea banal, no se encuentra contenida en el antecedente, la reivindicación es nueva" (resaltado fuera de texto).

De esta manera, es posible establecer que la novedad de la presente invención solo podrá verse afectada por un documento del arte previo cuando éste provea una **revelación explícita de todas las características técnicas de la presente invención y no haya ninguna diferencia entre la materia reclamada y aquello revelado en un documento del arte previo**, lo cual no ocurre en este caso. En consecuencia, debe reconocerse la novedad de la materia reclamada por la presente solicitud frente al arte previo citado.

3.5. Nivel Inventivo

En relación con el nivel inventivo de la presente solicitud sobre el documento D1, me permito manifestar que dicho documento, en vista de la considerable diferencia existente entre los compuestos allí enseñados y los reivindicados por la presente solicitud, no revela ni sugiere las pirazolcarboxamidas de la invención en estudio por lo cual dicha referencia no afecta, de ninguna manera, el nivel inventivo de la presente solicitud.

Ahora bien, con respecto a los documentos D2 y D3, me permito manifestar que los compuestos de acuerdo con la invención muestran una actividad fungicida mejorada en comparación con los compuestos allí enseñados. Tal como fue señalado anteriormente, la característica que diferencia los compuestos de la presente solicitud y los compuestos de dichas referencias es la sustitución en la posición 2 del anillo fenilo con un grupo haloalquilo. En este punto, considero pertinente dirigir la atención de su Despacho al hecho de que el arte previo citado no solo no provee ningún indicio que pueda conducir a la persona versada en la materia a la obtención de los compuestos aquí reclamados sino que además, de manera sorprendente, esta característica lleva de manera sorprendente a una actividad fungicida mejorada; entonces, contrario a lo afirmado por su Despacho, las novedosas estructuras sí **presentan un efecto inesperado**. Por consiguiente, debe reconocerse el nivel inventivo de la presente solicitud frente a las enseñanzas de dichos documentos.

Para corroborar lo anterior, me permito anexar datos biológicos en donde se muestra que los compuestos de acuerdo con la invención que están sustituidos con un grupo haloalquilo en el anillo fenilo, muestran actividad fungicida mejorada sobre los compuestos de acuerdo con D2 o D3 que están sustituidos con alquilo. 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 Andino que establece que un compuestos 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."* (resaltado fuera de texto). 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.

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
Anexo A – Datos biológicos

BOGPA/MBOGDMS-W466317-V1.P2006_076526-0730.DOC

Example 1

Venturia test (apples) / protective

- 5 Solvent: 24,5 parts by weight of acetone
24,5 parts by weight of dimethylacetamide
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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

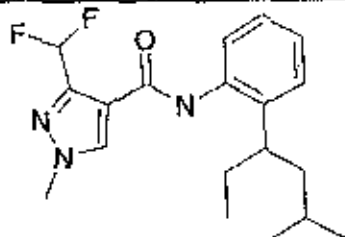
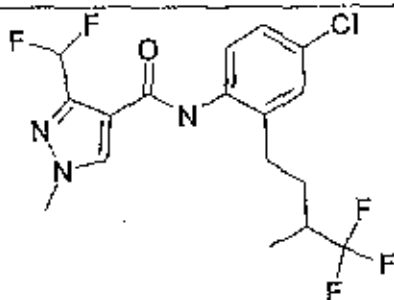
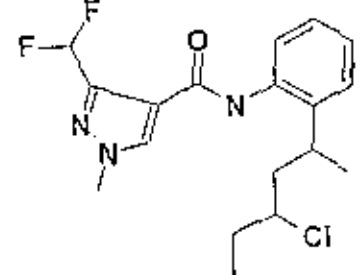
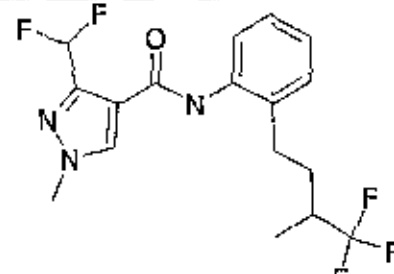
15 To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated rate of application. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous conidia suspension of the causal agent of apple scab (*Venturia inaequalis*) and then remain for 1 day in an incubation cabinet at approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 100 %.

20 The plants are then placed in a greenhouse at approximately 21°C and a relative atmospheric humidity of approximately 90 %.

The test is evaluated 10 days after the inoculation. 0% means an efficacy which corresponds to that of the control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed

Table 1

Venturia test (apples) / protective

Active compound	Rate of application of active compound in ppm	Efficacy in %
Known from EP-A-589301 (US 5,438,070):		
Example according to table E: 	100	82
According to the invention:		
Ex 7 	100	93
Ex 3 	100	100
Ex 2 	100	97

Example 2**Septoria tritici-test (wheat) / preventive**

- 5 Solvent: 49 parts by weight of n,n-dimethylacetamid
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

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
10 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.

- 15 After the spray coating has dried on, 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 then 60 hours at approximately 15°C in a translucent incubation cabinet at a relative atmospheric humidity of approximately 100%.

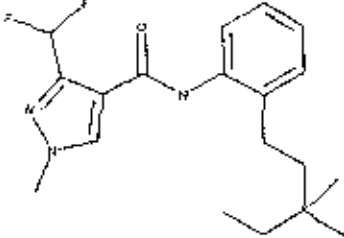
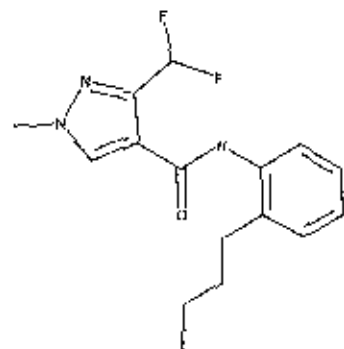
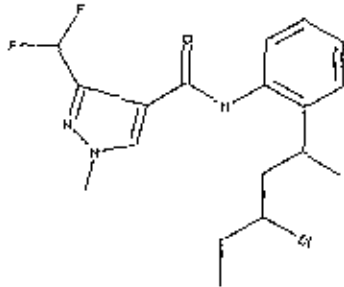
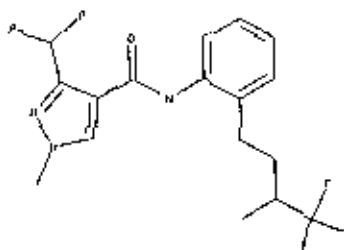
- 20 The plants are placed in a greenhouse at a temperature of approximately 15°C and a relative atmospheric humidity of approximately 80%.

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

25

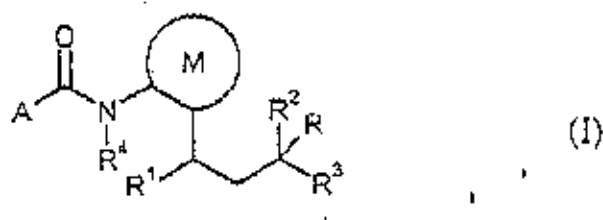
Table 2

Septoria tritici-test (wheat) / preventive:

Active compounds	Structures	Application rate of active compound in ppm	Efficacy in %
Known from EP-A-589301 (US 5,438,070): Example according to table E		1000	71
Known from EP-A-589301 (US 5,438,070): Example according to table E		1000	44
According to invention: Example 3		1000	93
According to invention: Example 2		1000	100

REIVINDICACIONES

1.- Halógenoalquilcarboxamidas de la fórmula (I)



en la que

R significa hidrógeno o halógeno,

R¹ significa hidrógeno o metilo,

R² significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R³ significa halógeno o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R⁴ significa hidrógeno, 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, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi 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 hasta 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 hasta 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 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$,

R^5 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 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, halogenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi 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 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí respectivamente hidrógeno, alquilo con 1 a 8 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 8 átomos de carbono, halógeno-alcoxi 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 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 hasta 8 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^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halogenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halogenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

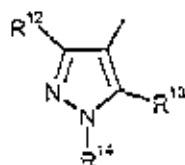
R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átomos en el anillo substituido, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener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

R^{10} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

M significa un anillo de fenilo monosustituido por R^{11} ,

R^{11} significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluormetilo,

A significa el resto de la fórmula (A1)



(A1), en la que

R^{12} significa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 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 o halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^{13} significa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono,

R^{14} significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, hidroxialquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono con respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno, o fenilo.

2. Halógenoalquilcarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

R significa hidrógeno, flúor, cloro o bromo,

R^1 significa hidrógeno o metilo,

R^2 significa metilo, etilo o significa metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo sustituidos respectivamente una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro o por bromo,

R^3 significa flúor, cloro, bromo, yodo o significa metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo substituidos respectivamente una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro o por bromo,

R^4 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo 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, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo 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 8 átomos de carbono con respectivamente, 1 hasta 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 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;

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

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,

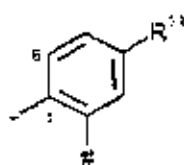
R^6 y R^7 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 o 6 átomos en el anillo substituido, en caso dado, de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener 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 hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

M significa

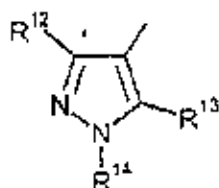


M-1

estando unido el enlace, marcado con „*” con la amida, estando unido el enlace marcado con „#” con el resto halógenoalquilo,

R^{11} significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluórometilo,

A significa el resto de la formula (A1)



(A1), en la que

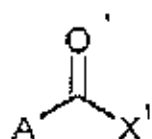
R¹² significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, trifluormetiltio, difluormetiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo.

R¹³ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio.

R¹⁴ significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo,

3.- Procedimiento para la obtención de halógenoalquilcarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque

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



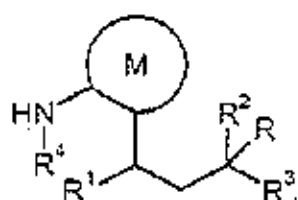
(II)

en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X¹ significa halógeno o hidroxi,

con un derivado de anilina de la fórmula (III)



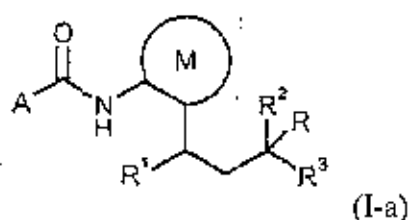
(III)

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,

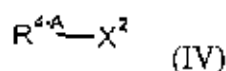
o

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



en la que

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



en la que

X² significa cloro, bromo o yodo,

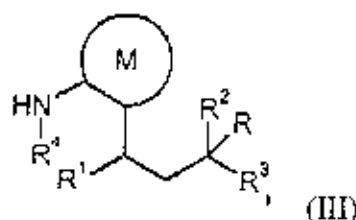
R^{4-A} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi 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;

19/18
24

(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, (halogenocicloalquilo 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 significados anteriormente indicados, en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

- 4.- 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.
- 5.- Derivados de anilina de la fórmula (II),

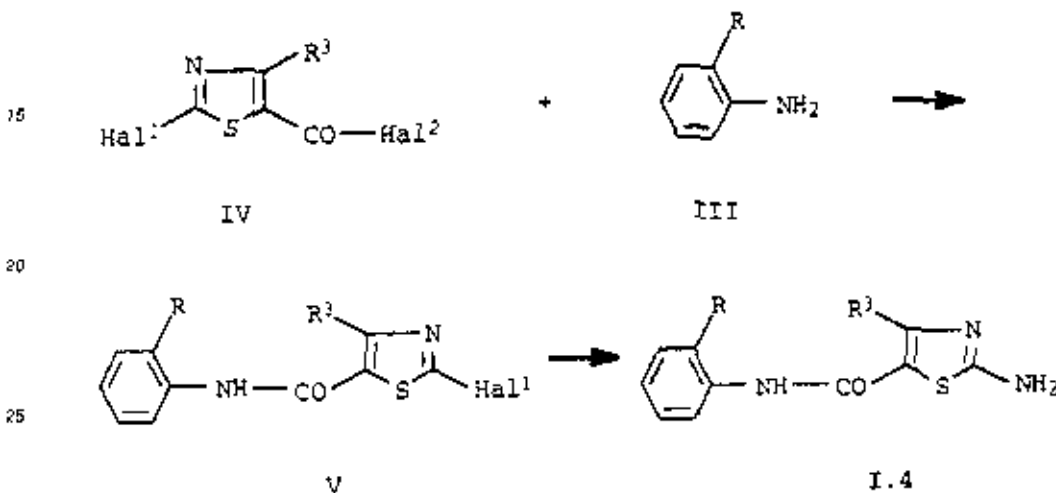


o en la que R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y M tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

mol-%, bezogen auf III einzusetzen.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe der Formel II und III sind bekannt oder können analog zu den bekannten Verbindungen synthetisiert werden (Helv. Chim. Acta, 60, 978 (1977); Zh. Org. Khim., 26, 1527 (1990); Heterocycles 26, 1885 (1987); Izv. Akad. Nauk. SSSR Ser. Khim., 2180 (1982); THL 28, 593 (1987); THL 29, 5463 (1988)).

Verbindungen I, in denen A für ein 2-Aminothiazol A4 steht, erhält man besonders vorteilhaft dadurch, daß man zunächst aus eine 2-Halogen-thiazol-5-carbonsäurehalogenid der Formel IV und einem Anilin der Formel III das entsprechende N-Phenyl-2-halogen-thiazol-5-carbonsäureamid V herstellt und V anschließend mit Ammoniak zum entsprechenden Carbonsäureanilid I.4 umsetzt.



Hal¹ und Hal² stehen jeweils für Halogenatome wie Chlor, Brom und Jod, wobei in der Position Hal¹ Chlor und in der Position Hal² Chlor und Brom bevorzugt sind.

Die Umsetzung von V mit Ammoniak erfolgt in an sich bekannter Weise bei Temperaturen von 50 °C bis 200 °C, bei einem Überdruck von 1 bis 200 atm., vorzugsweise 5 bis 50 atm. in einem inerten Lösungsmittel in Gegenwart eines Katalysators.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran. Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol sowie Dimethylsulfoxid und Dimethylformamid, besonders bevorzugt Alkohole wie Ethanol und Isopropanol.

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Katalysatoren kommen beispielsweise Phenylsulfonsäure und Hydroxybenzoesäure in Betracht.

Der Katalysator wird im allgemeinen in Mengen von 0,1 mol-% bis 20 mol-%, vorzugsweise von 0,5 mol-% bis 5 mol-%, bezogen auf V eingesetzt.

Im Hinblick auf ihre Verwendung in fungiziden Mitteln kommen Verbindungen der Formel I in Betracht, in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

R C₂-C₁₂-Alkyl wie Ethyl und geradkettiges oder verzweigtes Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl, Octyl, Nonyl, Decyl, Undecyl und Dodecyl, besonders geradkettiges oder verzweigtes C₃-C₆-Alkyl wie Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, n-Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1,1-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, n-Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 1,1-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1-Ethyl-3-methylpropyl, n-Heptyl, 1-Methylhexyl, 1-Ethylpentyl, 2-Ethylpentyl, 1-Propylbutyl, Octyl, 1-Methylheptyl, 2-Methylheptyl, 1-Ethylhexyl, 2-Ethylhexyl, 1-Propylpentyl, 2-Propylpentyl, Nonyl, 1-Methyloctyl, 2-Methyloctyl, 1-Ethylheptyl, 2-Ethylheptyl, 1-Propylhexyl, 2-Propylhexyl, Decyl, 1-Methylnonyl, 2-Methylnonyl, 1-Ethylloctyl, 2-Ethylloctyl, 1-Propylheptyl und 2-Propylheptyl.

295 293

insbesondere Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, Hexyl, Heptyl und 1-Methylheptyl, wobei diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können, d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch Halogenatome wie Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor ersetzt sein, beispielsweise Halogenalkyl wie Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlortetrafluormethyl, Dichlortetrafluormethyl, Chlorodifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

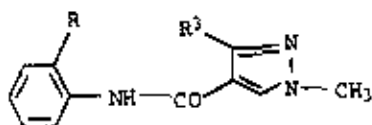
C₂-C₁₂-Alkoxy wie Ethoxy und geradkettiges oder verzweigtes Propyloxy, Butyloxy, Pentyloxy, Hexyloxy, Heptyloxy, Octyloxy, Nonyloxy, Decyloxy, Undecyloxy und Dodecyloxy, besonders geradkettiges oder verzweigtes C₂-C₁₀-Alkoxy wie Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy, 1,1-Dimethylethoxy, n-Pentyloxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, n-Hexyloxy, 1-Methylpentyloxy, 2-Methylpentyloxy, 3-Methylpentyloxy, 4-Methylpentyloxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1-Ethyl-2-methylpropoxy, n-Heptyloxy, 1-Methylhexyloxy, 2-Methylhexyloxy, 3-Methylhexyloxy, 4-Methylhexyloxy, 5-Methylhexyloxy, 1-Ethylpentyloxy, 2-Ethylpentyloxy, 1-Propylbutoxy, Octyloxy, 1-Methylheptyloxy, 2-Methylheptyloxy, 1-Ethylhexyloxy, 2-Ethylhexyloxy, 1-Propylpentyloxy, 2-Propylpentyloxy, Nonyloxy, 1-Methyloctyloxy, 2-Methyloctyloxy, 1-Ethylheptyloxy, 2-Ethylheptyloxy, 1-Propylhexyloxy, 2-Propylhexyloxy, Decyloxy, 1-Methylnonyloxy, 2-Methylnonyloxy, 1-Ethyl-octyloxy, 2-Ethyl-octyloxy, 1-Propylheptyloxy und 2-Propylheptyloxy, insbesondere Ethoxy, Propyloxy, 1-Methylethoxy, Butyloxy, 1-Methylpropyloxy, 2-Methylpropyloxy, 1,1-Dimethylethoxy, Pentyloxy, Hexyloxy und 2-Ethylhexyloxy, wobei diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können, d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch Halogenatome wie Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor ersetzt sein, beispielsweise Halogenalkoxy wie Chlormethyloxy, Dichlormethyloxy, Trichlormethyloxy, Fluormethyloxy, Difluormethyloxy, Trifluormethyloxy, Chlortetrafluormethyloxy, Dichlortetrafluormethyloxy, Chlorodifluormethyloxy, 1-Fluorethyloxy, 2-Fluorethyloxy, 2,2-Difluorethyloxy, 2,2,2-Trifluorethyloxy, 2-Chlor-2-fluorethyloxy, 2-Chlor-2,2-difluorethyloxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethyloxy, 2,2,2-Trichlorethyloxy und Pentafluorethyloxy;

C₃-C₁₂-Alkenyl wie geradkettiges oder verzweigtes Propenyl, Butenyl, Pentenyl, Hexenyl, Heptenyl, Octenyl, Nonenyl, Decenyl, Undecenyl und Dodecenyl, besonders geradkettiges oder verzweigtes C₃-C₁₂-Alkenyl wie 2-Propenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-2-hexenyl, 2-Methyl-2-hexenyl, 1-Methyl-3-hexenyl, 2-Methyl-3-hexenyl, 1-Ethyl-2-pentenyl, 2-Ethyl-2-pentenyl, 1-Ethyl-3-pentenyl, 2-Ethyl-3-pentenyl, 1-Methyl-2-heptenyl, 2-Methyl-2-heptenyl, 1-Methyl-3-heptenyl, 2-Methyl-3-heptenyl, 1-Ethyl-2-hexenyl, 2-Ethyl-2-hexenyl, 1-Ethyl-3-hexenyl, 2-Ethyl-3-hexenyl, 1-Methyl-2-octenyl, 2-Methyl-2-octenyl, 1-Methyl-3-octenyl, 2-Methyl-3-octenyl, 1-Ethyl-2-heptenyl, 2-Ethyl-2-heptenyl, 1-Ethyl-3-heptenyl, 2-Ethyl-3-heptenyl, 1-Ethyl-2-octenyl, 2-Ethyl-2-octenyl, 1-Ethyl-3-octenyl und 2-Ethyl-3-octenyl, insbesondere 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-(1-Methylethyl)-2-butenyl, 1-Butyl-2-butenyl, 1-Methyl-2-pentenyl und 1,4-Dimethyl-2-pentenyl, wobei diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können, d.h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch Halogenatome wie Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor ersetzt sein, insbesondere 3-Chlor-2-propenyl, 2,3-Dichlor-2-propenyl, 2,3,3-Trichlor-2-propenyl;

C₃-C₁₂-Alkenyloxy wie geradkettiges oder verzweigtes Propenyloxy, Butenyloxy, Pentyloxy, Hexenyloxy, Heptenyloxy, Octenyloxy, Nonyloxy, Decenyloxy, Undecenyloxy und Dodecenyloxy, besonders geradkettiges oder verzweigtes C₃-C₁₂-Alkenyloxy wie 2-Propenyloxy, 2-Buten-

294
294

Tabelle E



I.5

R ³	R
CF ₃	i-C ₃ H ₇
CF ₃	n-C ₃ H ₇
CF ₃	n-C ₄ H ₉
CF ₃	sec.-C ₄ H ₉
CF ₃	i-C ₄ H ₉
CF ₃	tert.-C ₄ H ₉
CF ₃	n-C ₅ H ₁₁
CF ₃	sec.-C ₅ H ₁₁
CF ₃	n-C ₆ H ₁₃
CF ₃	n-C ₇ H ₁₅
CF ₃	sec.-C ₇ H ₁₅
CF ₃	1-Methylvinyl
CF ₃	2-Methylvinyl
CF ₃	Allyl
CF ₃	2-Methylallyl
CF ₃	2-Ethylallyl
CF ₃	1-Methylallyl
CF ₃	1-Ethylallyl
CF ₃	1-Methyl-2-butenyl
CF ₃	1-Ethyl-2-butenyl
CF ₃	1-Isopropyl-2-butenyl
CF ₃	1-n-Butyl-2-butenyl
CF ₃	1-Methyl-2-pentenyl
CF ₃	1,4-Dimethyl-2-pentenyl
CF ₃	Propargyl
CF ₃	2-Butinyl
CF ₃	3-Butinyl
CF ₃	Ethoxy
CF ₃	Propoxy
CF ₃	1-Methylethoxy
CF ₃	n-Butoxy

245 295

EP 0 589 301 A1

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55

R ³	R
CF ₃	1-Methylpropoxy
CF ₃	2-Methylpropoxy
CF ₃	1,1-Dimethylethoxy
CF ₃	n-Pentyloxy
CF ₃	n-Hexyloxy
CF ₃	2-Ethylhexyloxy
CF ₃	2-Propenyloxy
CF ₃	2-Butenyloxy
CF ₃	2-Methyl-2-propenyloxy
CF ₃	2-Pentenyloxy
CF ₃	3-Pentenyloxy
CF ₃	3-Chlor-2-propenyloxy
CF ₃	2,3-Dichlor-2-propenyloxy
CF ₃	2,3,3-Trichlor-propenyloxy
CF ₃	2-Propinyloxy
CF ₃	2-Butinyl-oxy
CF ₃	3-Butinyl-oxy
CF ₃	1-Methyl-2-propinyloxy
CF ₃	Cyclopropyl
CF ₃	Cyclobutyl
CF ₃	3-Cyclopentenyl
CF ₃	1-Cyclopentenyl
CF ₃	3-Cyclohexenyl
CF ₃	Cyclopentyloxy
CF ₃	3-Cyclopentanyloxy
CF ₃	3-Cyclohexenyloxy
CH ₃	i-C ₃ H ₇
CH ₃	n-C ₃ H ₇
CH ₃	n-C ₄ H ₉
CH ₃	sec.-C ₄ H ₉
CH ₃	i-C ₄ H ₉
CH ₃	tert.-C ₄ H ₉
CH ₃	n-C ₅ H ₁₁
CH ₃	sec.-C ₅ H ₁₁
CH ₃	n-C ₆ H ₁₃
CH ₃	n-C ₇ H ₁₅
CH ₃	sec.-C ₇ H ₁₅
CH ₃	Ethoxy

R ³	R
CH ₃	Propoxy
CH ₃	1-Methylethoxy
CH ₃	n-Butoxy
CH ₃	1-Methylpropoxy
CH ₃	2-Methylpropoxy
CH ₃	1,1-Dimethylethoxy
CH ₃	n-Pentyloxy
CH ₃	n-Hexyloxy
CH ₃	Cyclopentenyl
CH ₃	1-Ethyl-propoxy
CH ₃	Cyclopentyloxy
CH ₃	2-Cyclohexenyloxy
CH ₃	2-Methyl-2-propenyloxy
CHF ₂	i-C ₃ H ₇
CHF ₂	n-C ₃ H ₇
CHF ₂	n-C ₄ H ₉
CHF ₂	sec.-C ₄ H ₉
CHF ₂	i-C ₄ H ₉
CHF ₂	tert.-C ₄ H ₉
CHF ₂	n-C ₅ H ₁₁
CHF ₂	sec.-C ₅ H ₁₁
CHF ₂	n-C ₆ H ₁₃
CHF ₂	n-C ₇ H ₁₅
CHF ₂	sec.-C ₇ H ₁₅
CHF ₂	Ethoxy
CHF ₂	Propoxy
CHF ₂	1-Methylethoxy
CHF ₂	n-Butoxy
CHF ₂	1-Methylpropoxy
CHF ₂	2-Methylpropoxy
CHF ₂	1,1-Dimethylethoxy
CHF ₂	n-Pentyloxy
CHF ₂	n-Hexyloxy
CHF ₂	Cyclopentenyl
CHF ₂	Cyclohexyl
CHF ₂	1-Ethyl-propoxy
CHF ₂	Cyclopentyloxy
CHF ₂	2-Cyclohexenyloxy

247

R ¹	R
CHF ₂	2-Methyl-2-propenyloxy
CHF ₂	Phenyl
CF ₃	2-Fluorphenyl
CH ₃	Phenyl
CH ₃	2-Fluorphenyl
CHF ₂	Phenyl
CHF ₂	2-Fluorphenyl

Die neuen Wirkstoffe eignen sich besonders zum Schutz von verschiedenen Materialien gegen den Abbau bzw. die Zerstörung durch Bakterien oder Pilze oder gegen den Befall und Bewuchs durch Mikroorganismen. Materialien, die mit den neuen Wirkstoffen konserviert bzw. mikrocid ausgerüstet werden können, sind beispielsweise Leime und Klebstoffe, Stärkelösungen, Wachsemlulsionen, Tonemulsionen, Schichten, Appreturen, Spinnbäder, Gelatinezubereitungen, Fensterkitt, Fugendichtungsmassen, Kühlschmierstoffe, Bohrröle, Treibstoffe, Kunststoffdispersionen, Dispersionsfarben, Textilien, Leder, Rohhäute und Kosmetika. Weiterhin sind die Verbindungen als Schieimbekämpfungsmittel in der Papierindustrie, in Rückkühlwerken und in Luftbefeuchtungsanlagen geeignet.

Des weiteren eignen sich die Verbindungen I zum Schutz folgender Pflanzenarten vor dem Befall durch Mikroorganismen:

Getreide (z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Reis, Sorghum und Verwandte); Rüben (z.B. Zucker- und Futterrüben); Kern-, Stein- und Beerenobst (z.B. Äpfel, Birnen, Pflaumen, Pfirsiche, Mandeln, Kirschen, Erdbeeren, Himbeeren und Brombeeren); Hülsenfrüchte (z.B. Bohnen, Linsen, Erbsen, Soja); Ölkulturen (z.B. Raps, Senf, Mohn, Oliven, Sonnenblumen, Kokos, Rizinus, Kakao, Erdnüsse); Gurkengewächse (z.B. Kürbis, Gurken, Melonen); Fasergewächse (z.B. Baumwolle, Flachs, Hanf, Jute); Citrusfrüchte (z.B. Orangen, Zitronen, Pampelmusen, Mandarinen); Gemüsesorten (z.B. Spinat, Kopfsalat, Spargel, Kohlrarten, Möhren, Zwiebeln, Tomaten, Kartoffeln, Paprika); Lorbeergewächse (z.B. Avocado, Cinnamomum, Kampfer) oder Pflanzen wie Mais, Tabak, Nüsse, Kaffee, Zuckerrohr, Tee, Weintrauben, Hopfen, Bananen- und Naturkautschukgewächse. Pflanzen seien im Rahmen vorliegender Erfindung aber auch alle Arten von sonstigen Grünbewachsungen, seien es Zierpflanzen (Compositen), Grasflächen, Böschungen oder allgemeine niedrige Bodenbedeckungen (cover crops).

Folgende Mikroorganismen lassen sich beispielsweise mit den neuen Verbindungen I bekämpfen:

Straphylococcus aureus, *Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Citrobacter freundii*, *Proteus vulgaris*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Desulfovibrio desulfuricans*, *Streptovorticillium rubricreticuli*, *Aspergillus niger*, *Aspergillus versicolor*, *Penicillium tuniculosum*, *Penicillium expansum*, *Penicillium glaucum*, *Paecilomyces varioti*, *Trichoderma viride*, *Chaetomium globosum*, *Aspergillus amstelodami*, *Phoma pigmentovora*, *Phoma violacea*, *Aureobasidium pullulans*, *Saccharomyces cerevisiae*, *Alternaria tenuis*, *Stemphylium macrosporioides*, *Cladosporium herbarum*, *Cladosporium resinae*, *Candida albicans*, *Trichophyton mentagrophytes*, *Geotrichum candidans*, *Monilia sitophila*, *Scenedesmus quadricauda*, *Chlorella vulgaris*, *Nostoc muscorum*, *Oscillatoria limosa* und *Anabaena constricta*.

Die neuen Substanzen können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollen in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der wirksamen Substanzen gewährleisten. Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiernmitteln, wobei im Falle der Benutzung von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Frage: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol, Benzol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser, Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle, z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikase), Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

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

202085
Bogotá, D.C.,

Abogado
ALVARO CORREA ORDOÑEZ

ASUNTO	Radicación	06076526
	Trámite	011
	Evento	378
	Actuación	519
	Oficio	DE 0 2 2 6 9
	Folios	11

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

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

No. Sol. Internacional: PCT/EP2005/000608

Fecha de Presentación Internacional: 2005-01-22

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

1. Documentos estudiados

Capítulo descriptivo: Folios 95 a 198 y 220 tal y como fueron presentados.

Capítulo reivindicatorio: Folios 199 a 219 tal y como fueron presentados.

Prioridad: Folio 2 DE 102004005786,9 2004-02-06.

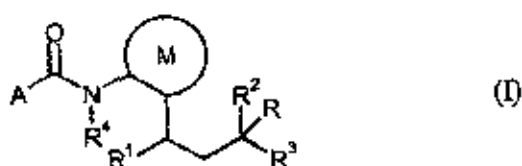
Respuesta del solicitante: Folios 274 a 283.

Nuevo capítulo reivindicatorio: Folios 284 a 291.

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Halogenoalquil carboxamidas para la lucha contra los microorganismos. Folio 1.

Objeto de la invención: El objeto de la presente solicitud de patente de invención se refiere a halogenoalquil-carboxamidas de la fórmula (I).



El problema técnico planteado en la presente solicitud de patente indica que las alquilcarboxamidas conocidas en el arte previo presentan una buena actividad fungicida, sin embargo dicha actividad deja mucho que desear en algunos casos, por ejemplo cuando se requieren cantidades bajas de aplicación. Por lo tanto existe la necesidad de nuevas alquilcarboxamidas con actividad mejorada. Para solucionar este problema técnico la solicitud plantea nuevas halogenoalquilcarboxamidas de fórmula (I).

El objeto de la solicitud definido anteriormente se clasificó en la IPC C07C 233/66.

3. De la solicitud de Patente

El título de la invención debe ser modificado y debe definir específicamente la materia objeto de invención.

3.1. Descripción (artículo 28 D 486)

La descripción resulta ser insuficiente para el amplio alcance que tiene el capítulo reivindicatorio. Se le recuerda al solicitante que la descripción debe ser una divulgación suficiente y adecuada para la materia que se está reclamando. Si bien es cierto que la descripción cita todas las posibles sustituciones reclamadas y presenta algunos ensayos de actividad también es cierto que dicha información es insuficiente para las extrapolaciones reclamadas.

Por lo tanto 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.

En consecuencia la descripción no cumple con el requisito de claridad y/o **divulgación completa** de acuerdo al art. 28 de la Decisión 486 o art. 22 del Tratado PCT.

3.2. Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En correspondencia con lo anterior las reivindicaciones tanto de producto como de proceso son una generalización sin suficiente sustento en la descripción.

Nótese que en el capítulo descriptivo se divulgan de manera suficiente una pocas estructuras con un patrón de sustitución específico. Y aunque el alcance de la invención ha sido restringido, la materia ahora reclamada continúa presentado generalizaciones muy amplias.

Específicamente las extrapolaciones sin suficiente sustento en la descripción se presentan en los radicales R^4 , R^{12} , R^{13} y R^{14} .

Así por ejemplo, la descripción no presenta información en donde se mostrara que una sustitución diferente a H en el radical R^4 , provocara un efecto técnico. El significado de R^4 fue H en todos los casos. Por lo tanto no hay ninguna razón para aceptar significados diferentes a H en este caso.

Lo mismo sucede con los radicales R^{12} , R^{13} y R^{14} en donde se incluyen sustituyentes tales como alcoxi, alquiltio, cicloalquilo, aminocarbonilo, halogenoalquiltio y otros, los cuales no tienen ningún soporte en la descripción.

Se le aclara al solicitante que si bien es cierto que todas las posibles sustituciones reclamadas se encuentran mencionadas dentro del capítulo descriptivo; la materia presentada en el nuevo capítulo reivindicatorio continua siendo una generalidad amplia que no se encuentra enteramente sustentada en la descripción.

Asimismo se le recuerda al solicitante que el capítulo reivindicatorio debe ser claro y conciso, de tal manera que se encuentre específicamente definida la materia objeto de protección. Para la cual, a su vez, debe existir pleno sustento, por lo menos en este caso, de actividad. Lo anterior se menciona, puesto que, la eventual mejora de actividad se demostró únicamente para patrones de sustitución muy específicos que se alejan bastante de la generalizada reclamada.

En consecuencia, el capítulo reivindicatorio no cumple con el requisito de concisión y sustento en la descripción de acuerdo al art. 30 de la Decisión 486 o art.22 Tratado PCT. El solicitante debe limitar el alcance del capítulo reivindicatorio, de lo contrario la solicitud será negada.

4. Determinación del Estado de la Técnica

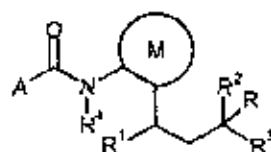
Considerando que la fecha de la prioridad de la solicitud internacional PCT es 2004-02-06, se realizó la búsqueda en el estado de la técnica y se encontraron los documentos relacionados a continuación, que pueden afectar la patentabilidad del objeto de la presente solicitud:

Nº	Documento	Título	Fecha de publicación
D3	EP 0589301	Carboxynilides derivatives, process for their preparation and fungicidal compositions containing them.	1994-03-30.

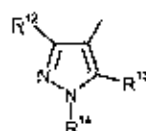
5. Análisis de patentabilidad (artículo 14 D486)

5.1. Nivel Inventivo (artículo 18 D486)

La solicitud de patente en estudio presenta halogenoalquilcarboxamidas de fórmula (I).



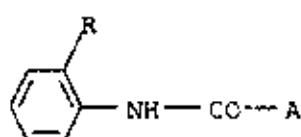
(I)



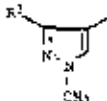
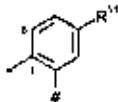
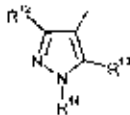
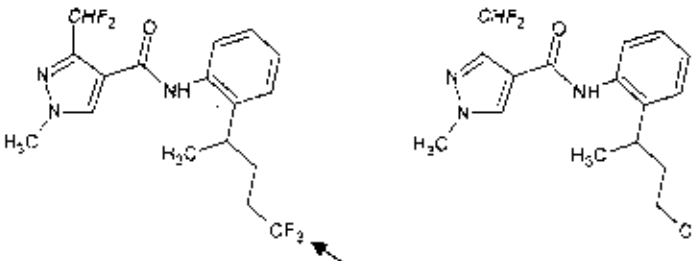
(A1)

En donde A representa (A-1) y M representa un anillo de fenilo monosustituido por R¹¹.

En contraste la anterioridad D3 divulga anilidas de ácido carboxílico de fórmula (I) que tienen actividad fungicida y son útiles para combatir hongos nocivos.



Al comparar los compuestos reclamados en esta solicitud y los compuestos divulgados en D3 se observan estructuras muy cercanas. En la siguiente tabla comparativa N° 2 se presenta un ejemplo para evidenciar dicha cercanía estructural:

Cuando en la solicitud	Cuando en la anterioridad D3	
R = H	A = A5  A5	
R ¹ = CH ₃	R = sec -C ₅ H ₁₁	
R ² = H	R ³ = CHF ₂	
R ³ = CF ₃		
R ⁴ = H		
M = M-1, R ¹¹ = H  M-1		
A = A1 		
R ¹² = CHF ₂ R ¹³ = H R ¹⁴ = CH ₃		
Se obtiene la misma estructura		
		

Por lo tanto la diferencia estructural 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.

Es decir, si bien es cierto que D3 no divulga de forma específica significados halógeno-alquilo para el radical R (tabla E, pagina 21-24), la divulgación inicial (pagina 6, líneas 2-4) indica que dichos radicales alquilo pueden estar parcial o completamente halogenados, de preferencia por **flúor y cloro**. Lo cual resulta ser sugerencia suficiente para que un técnico medio en la materia plantee derivados como los acá presentados, donde el radical alquilo R se encuentre sustituido por átomos de F ó Cl y que tengan igualmente buena actividad fungicida.

En consecuencia, para un técnico medio en la materia teniendo en cuenta las enseñanzas del documento D3, sería obvio incluir uno o más átomos de F ó Cl en el radical alquilo R de D3 y esperar igualmente una buena actividad fungicida.

Por lo tanto y teniendo en cuenta además la poca definición de la materia reclamada se concluye que las reivindicaciones 1-5 son alternativas obvias para un técnico medio y carecen de nivel inventivo.

6. Respuesta a los argumentos del solicitante

Aunque el solicitante restringió el alcance de la invención, se siguen presentando extrapolaciones sin suficiente sustento en la descripción. Más aun, los estudios comparativos presentados utilizan patrones de sustitución muy uniformes que no son evidencia suficiente para soportar las extrapolaciones que se desean proteger.

Ahora bien, respecto al nivel inventivo de la materia reclamada, se debe tener en cuenta la observación anterior, puesto 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.

El solicitante debe limitar el alcance de su invención y definir específicamente la materia que se desea proteger, la cual a su vez debe estar enteramente soportada en la descripción.

6. Conclusión

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

Nº	Documento N°	Reivindicaciones afectadas	Requisito que afecta
D3	EP 0589301	1-5	Nivel Inventivo

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

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


JOSE LUIS SALAZAR LÓPEZ

Director de Nuevas Creaciones (E)

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

11 FEB. 2011

CONCEPTO TÉCNICO No. 247

EXAMINADOR TÉCNICO
Código No.202085