

Doctor

José Luis Salazar

Jefe de División de Nuevas Creaciones (C)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. _____ S. _____ D. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-090313- -00006-0000

Fecha: 2012-09-18 16:53:58 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 22

Referencia: Expediente No. 08.090.313

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Derivados del fungicida N-cicloalquil-bencil-amida"

Solicitante: Bayer CropScience AG

RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA NO. 349
DEL 22 DE JUNIO DE 2012, OFICIO NO. 11031 (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. Objeciones del Examinador

1.1 Reivindicaciones

1.1.1. Considera su Despacho que la reivindicación 15 es realmente una reivindicación de uso y no cumpliría con el artículo 14 de la Decisión 486.

1.1.2. Su Despacho considera que la reivindicación 1 no es concisa por cuanto no todos los sustituyentes se encontrarían soportados en los ejemplos suministrados junto con

la especificación de la solicitud.

1.1.3. Su Despacho estima que la reivindicación 11 no es clara puesto que el al tratarse de una composición ésta se debería definir por sus componentes y proporciones y estima que los términos "soporte, vehículo o carga aceptable" son términos muy generales.

1.1.4. Se estima que las figuras de las reivindicaciones 13 y 14 no se encuentran bien diseñadas por cuanto no hace referencia a lo mencionado en las dichas reivindicaciones.

1.2. Unidad de Invención

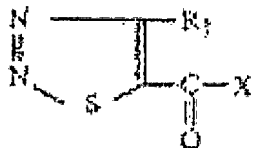
Considera su Despacho que la presente solicitud no tendría unidad de invención por cuanto el compuesto de fórmula I no se puede considerar el elemento unificador por cuanto esta divulgado en el documento D1. Se estima, además, que existirían 22 grupos inventivos.

1.3. Novedad

El Examinador plantea que, después de realizada la búsqueda de anterioridades, encontró documentos que afectan la novedad de las reivindicaciones 1-2 y 5-12 de la presente solicitud.

Particularmente, el Examinador considera que el documento US4177054 (D1) afecta la novedad de la presente solicitud por cuanto:

"Las características esenciales de la composición de la reivindicación 1 habían sido divulgadas previamente en D1, el cual enseña un compuesto de fórmula



[columna 1, líneas 35-41], donde R¹: H, alquilo C₁-C₄, el cual puede ir sustituido por cloro o bromo [columna 2, líneas 58-60], X:



[columna 3, líneas 35-41], R_3 y R_4 : residuo C_3 - C_8 -cicloalifático que puede ser ciclopropil, ciclopentil, ciclohexil, 2-metil-ciclohexil, 3-metilciclohexil, 1-etinilciclohexil, cicloheptil [columna 3, líneas 46-48].

En consecuencia la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.

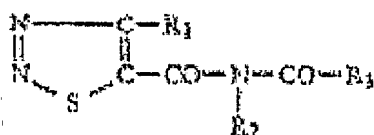
Las reivindicaciones 2, 5-10 no mencionan alguna características que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas."

1.2 Nivel Inventivo

Sobre el requisito del nivel inventivo, el Examinador establece que una persona del nivel técnico medio, versada en la materia, ensayaría las soluciones que se proponen en el documento US 4314839 (D2) y llegaría de manera obvia a la solución que se propone en la presente solicitud. Particularmente, el Examinador considera que las reivindicaciones 1-14 carecen de nivel inventivo debido a las enseñanzas contenidas en dicho documento D2.

El Examinador establece:

"El documento D2, considerado estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1, divulga un compuesto de fórmula



[columna 1, líneas 35-41], R^1 : H, alquilo C_1 - C_4 , el cual puede ir sustituido por cloro o bromo [columna 4, líneas 1-4], R^2 : residuo C_3 - C_8 -cicloalifático, que puede ser ciclopropil, ciclopentil, ciclohexil, 2-, 2-metilciclohexil, 3-metilciclohexil, 4-metilciclohexil, 1-etinilciclohexil, cicloheptil [column 4, líneas 34-39], R^3 : grupo aromáticos, que pueden ser fenilo, 2-clorofenil, 4-clorofenil, 3-clorofenil, 2,6-diclorofenil, 2,4-diclorofenil, 2-metilfenil, 3-metilfenilo, 4-metilfenil, 3-nitrofenil, 4-nitrofenil, 2-metoxifenil, 4-metoxifenil, 1-naftil, 2-naftil [columna 4, líneas 61-67].

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1, y el compuesto de D2 consiste en que el compuesto de D2 presenta un carbonilo entre el anillo aromático y el nitrógeno, mientras que en la invención presenta dos sustituyentes Z_2 y Z_3 .

(...)

En consecuencia, el experto en la materia, realizaría modificaciones en la naturaleza química de los sustituyentes, entre estos, el carbonilo ubicado entre el anillo aromático y el nitrógeno, y de este manera llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia."

2. Argumentos a favor de la patentabilidad de la solicitud

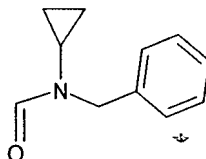
2.1 Reivindicaciones

En respuesta a las observaciones de su Despacho el solicitante ha decidido presentar un nuevo capítulo reivindicatorio modificado del cual se han eliminado la reivindicación 15 original, se ha limitado la reivindicación 1, se ha eliminado la reivindicación 11 lo mismo que las reivindicaciones 13 y 14 originales.

De acuerdo con lo anterior la reivindicación 1 se ha dirigido a los compuestos en donde:

- Z^1 representa un ciclopropilo sustituido o no sustituido;
- A representa $A^1, A^2, A^3, A^4, A^5, A^6, A^8, A^9, A^{10}, A^{12}, A^{13}, A^{15}, A^{16}$ o A^{19} .

En cuanto a la claridad y concisión de las reivindicaciones se desea mencionar que la reivindicación 1 esta completamente soportada por la descripción tal como se presentó, es decir, el solicitante ha confirmado de manera clara la eficacia de numerosos compuestos que comparten las características técnicas de la reivindicación corregida 1 y en particular cuando Z^1 es ciclopropilo. La especificación describió alrededor de 230 compuestos que muestran una buena protección total (al menos 70%) contra hongos (ejemplos A a D, páginas 44 a 46 de la publicación WO) mientras se comparte la estructura común



y tiene A representada por A¹, A², A³, A⁴, A⁵, A⁶, A⁸, A⁹, A¹⁰, A¹², A¹³, A¹⁵, A¹⁶ o A¹⁹.

La solicitud tal como se presentó también mostraba que este excelente y sorprendente efecto fungicida (más del 70% de protección total) que se obtiene con estos, alrededor de 230 compuestos que tienen un ciclopropilo unido al nitrógeno, no se obtiene con compuestos comparables que difieren por el sustituyente sobre el nitrógeno: los compuestos 7, 43, 45, 63, 96, 119, 156, 161, 197, 199, 232, 234, 360, 361, 362, 530 (Z1 es cicloheptilo), y los compuestos 52, 220, 231, 233, 340, 343, 416 (Z1 es ciclopentilo) no exhiben buena eficiencia (ver ejemplos biológicos de la presente invención).

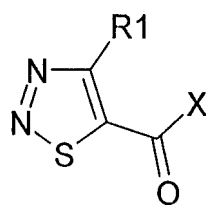
Adicionalmente a los datos comparativos que están presentes en la especificación tal como se presentó, el solicitante presenta datos biológicos adicionales obtenidos en invernadero que muestran mejor eficiencia para los compuestos de acuerdo con la invención (es decir, con un nitrógeno sustituido por un ciclopropilo) comparados con los compuestos que difieren solo por tener el nitrógeno sustituido por un hidrógeno, o con los compuestos que tienen el nitrógeno sustituido por un ciclohexilo.

También se incluyen los datos adicionales que muestran que la eficiencia se conserva cuando se sustituye el grupo ciclopropilo sobre el nitrógeno.

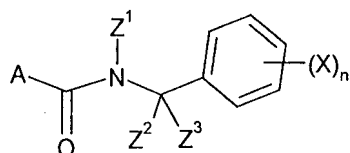
2.2 Novedad

La novedad de una solicitud está legalmente definida en el Artículo 16 de la Decisión 486 así: *“una invención se considerará nueva, cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso de la prioridad reconocida...”*

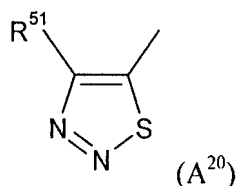
En virtud de la anterior definición, consideramos que el documento D1 no constituye documento del arte previo que afecte la novedad de la presente solicitud por cuanto el documento D1 (US4177054) describe los compuestos de fórmula



Teniendo en cuenta que los compuestos de fórmula (I)



en donde A es A²⁰



ya no son parte de la invención, entonces los compuestos de la reivindicación 1 corregida (anexos a la presente respuesta) son nuevos teniendo en cuenta la divulgación hecha por dicho documento D1.

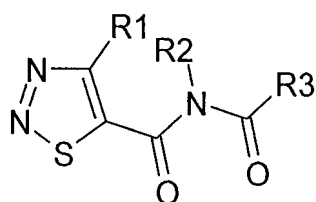
2.3 Nivel inventivo

El nivel inventivo de una solicitud se encuentra definido en el Artículo 18 de la Decisión 486 y se establece cuando “*si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica*”.

Contrario a lo que plantea el Examinador, el documento del arte previo citado no afecta el nivel inventivo de la presente solicitud por cuanto no es posible derivar la presente invención a partir de las enseñanzas presentadas en el documento D2.

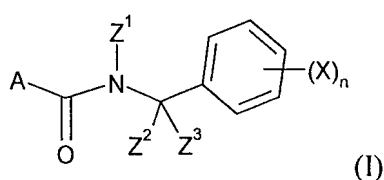
Dicho documento D2 se considera el documento del estado de la técnica mas cercano.

D2 describe los compuestos de fórmula



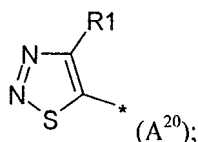
compuestos no ejemplificados de D2 tienen el átomo de nitrógeno sustituido por un ciclopropilo.

Los compuestos de la invención tal como se corrigió son los compuestos de fórmula (I)



en donde:

- A no puede ser



- Z1 es eventualmente sustituido por ciclopropilo.

Los compuestos de D2 difieren de los compuestos de la invención por cuenta de al menos tres características técnicas principales, la naturaleza del heterociclo (que es A²⁰ en la invención), el carbonilo entre el anillo aromático y el nitrógeno, mientras la invención muestra -CZ²Z³-, y el sustituyente del átomos de nitrógeno que no es ciclopropilo en los compuestos ejemplificados de D2.

Como se indicó anteriormente, la ejemplificación suministrada por el solicitante en la solicitud tal como se presentó, apoyada por los datos comparativos adicionales suministrados aquí, muestran que las diferencias entre los compuestos de la invención y la técnica anterior, particularmente cuando Z1 es ciclopropilo en los compuestos de la invención, muestran un efecto y ventaja inesperados.

2.3. Unidad de invención

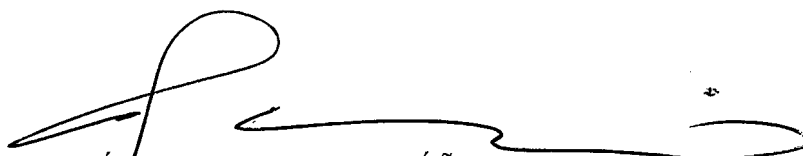
Tal como se explicó anteriormente, el concepto común de la reivindicación corregida es nueva e inventiva y por lo tanto se cumple con el requisito de nivel inventivo.

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

A manera informativa, pongo en conocimiento del Examinador que las patentes US 8,088,927 estadounidense, 5052531 japonesa además de patentes en Rusia, Ucrania, China y Australia equivalentes a la presente solicitud colombiana han sido otorgadas. Aún cuando entiendo que estas decisiones de ninguna manera obligan al Despacho para decidir de igual forma, considero que por tratarse de una pregunta fáctica la determinación de la existencia de novedad y nivel inventivo, las decisiones de otras oficinas de patentes constituyen un antecedente persuasivo en la materia.

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

Atentamente,

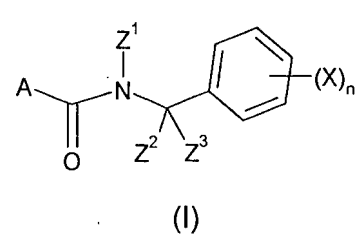


ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexos: Capítulo reivindicatorio modificado
 Datos de prueba

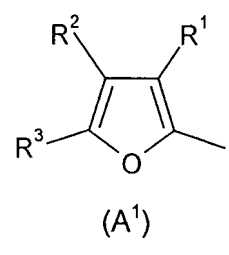
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



en el que

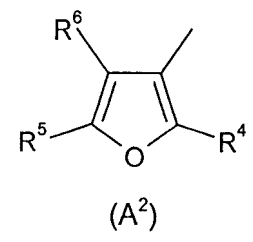
- A representa:
- un heterociclo de fórmula (A¹)



en donde:

R¹ a R³ que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomos de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₅ o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- un heterociclo de fórmula (A²)

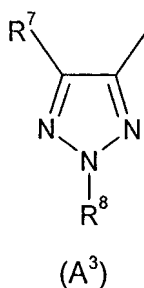


en donde:

R⁴ a R⁶ que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomos de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno

que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₅ o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- un heterociclo de fórmula (A³)

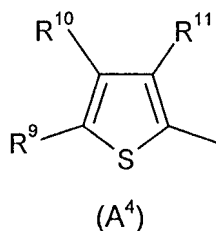


en donde:

R⁷ representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₅ o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R⁸ representa un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₅;

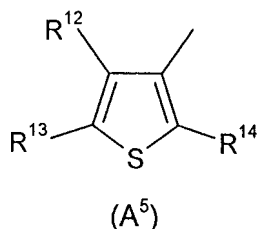
- un heterociclo de fórmula (A⁴)



en donde:

R⁹ a R¹¹ que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; amino; alcoxi C₁-C₅; alquiltio C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- un heterociclo de fórmula (A⁵)

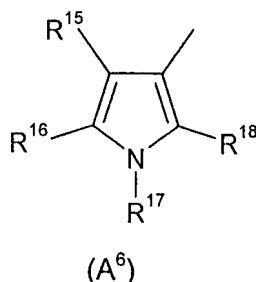


en donde:

R¹² y R¹³ que pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; alcoxi C₁-C₅; amino; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R¹⁴ representa átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; alcoxi C₁-C₅; amino; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- un heterociclo de fórmula (A⁶)



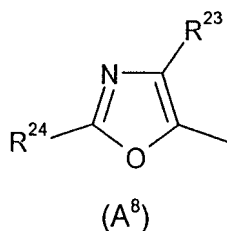
en donde:

R¹⁵ representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un ciano; alquilo C₁-C₅; alcoxi C₁-C₅; halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R¹⁶ y R¹⁸ que pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alcoxycarbonilo C₁-C₅; alquilo C₁-C₅; halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R^{17} representa un átomo de hidrógeno o alquilo C_1-C_5 ;

- un heterociclo de fórmula (A^8)

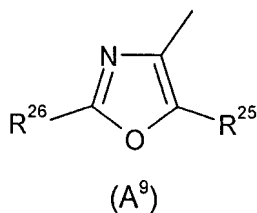


en donde:

R^{23} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; o alquilo C_1-C_5 ; o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R^{24} representa un átomo de hidrógeno o alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- un heterociclo de fórmula (A^9)

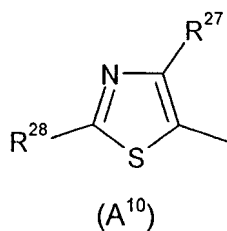


en donde:

R^{25} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R^{26} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

un heterociclo de fórmula (A^{10})

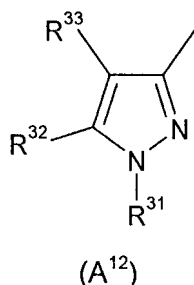


en donde:

R^{27} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R^{28} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; amino; alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

un heterociclo de fórmula (A^{12})



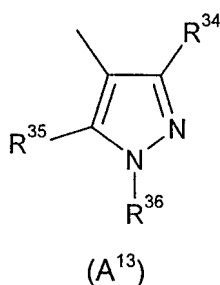
en donde.

R^{31} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno o alquilo C_1-C_5 ;

R^{32} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_5 o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R^{33} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; un nitro; alquilo C_1-C_5 ; alcoxi C_1-C_5 ; halogenoalcoxi C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

un heterociclo de fórmula (A^{13})



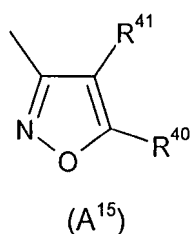
en donde:

R^{34} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_5 ; cicloalquilo C_3-C_5 ; halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_5 ; alquinoxio C_2-C_5 ; o halogenoalcoxi C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

R³⁵ representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; un ciano; alcoxi C₁-C₅; alquiltio C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; amino; alquilamino C₁-C₅; o di-(alquilo C₁-C₅) amino C₁-C₅;

R³⁶ representa un átomo de hidrógeno o alquilo C₁-C₅;

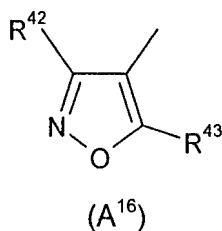
un heterociclo de fórmula (A¹⁵)



en donde:

R⁴⁰ y R⁴¹ que pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; o halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

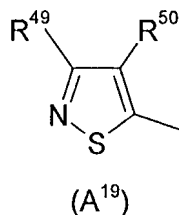
un heterociclo de fórmula (A¹⁶)



en donde:

R⁴² y R⁴³ que pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₅; halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o amino; o

un heterociclo de fórmula (A¹⁹)



en donde:

R^{49} y R^{50} que pueden ser iguales o diferentes representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_5 ; alcoxi C_1-C_5 ; halogenoalcoxi C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes o halogenoalquilo C_1-C_5 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- Z^1 representa un ciclopropilo no sustituido o un ciclopropilo sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_8 ; halogenoalcoxi C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_8 -carbonilo; halogenoalcoxi C_1-C_8 -carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -aminocarbonilo; alquil di(C_1-C_8)-aminocarbonilo;
- Z^2 y Z^3 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_8 ; alquenilo C_2-C_8 ; alquinilo C_2-C_8 ; ciano; nitro; un átomo de halógeno; alcoxi(C_1-C_8); alqueniloxi C_2-C_8 ; alquiniloxi C_2-C_8 ; cicloalquilo C_3-C_7 ; alquilsulfenilo C_1-C_8 ; amino; alquil(C_1-C_8)-amino; dialquil(C_1-C_8)-amino; alcoxi(C_1-C_8)-carbonilo; alquilcarbamoilo C_1-C_8 ; alquilcarbamoilo di(C_1-C_8); N-alquil C_1-C_8 -alcoxi C_1-C_8 -carbamoilo; o
- Z^2 y Z^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un cicloalquilo C_3-C_7 sustituido o no sustituido;
- X, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; nitro; ciano; hidroxilo; sulfanilo; amino; pentafluoro- λ 6-sulfanilo; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C_1-C_8)-amino; dialquil(C_1-C_8)-amino; alcoxi(C_1-C_8); halogenoalcoxi C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; C_1-C_8 -alcoxi-alquilo C_1-C_8 ; alquilsulfanilo C_1-C_8 ; halogenoalquilsulfanilo C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C_2-C_8 ;

halogenoalquenilo C_2-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C_2-C_8 ; halogenoalquinilo C_2-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser alqueniloxi C_2-C_8 iguales o diferentes; halogenoalqueniloxi C_2-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquiniloxi C_2-C_8 ; halogenoalquiniloxi C_2-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C_3-C_7 ; cicloalquilo C_3-C_7 -alquilo C_1-C_8 ; halogenocicloalquilo C_3-C_7 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; formiloxi; formilamino; carboxi; carbamoilo; N-hidroxicarbamoilo; carbamato; (hidroxiimino)-alquilo C_1-C_8 ; alquilcarbonilo C_1-C_8 ; halogenoalquilcarbonilo C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquilcarbamoilo C_1-C_8 ; alquilcarbamoilo $di(C_1-C_8)$; N-alquil C_1-C_8 -oxicarbamoilo; alcoxicarbamoilo C_1-C_8 ; N-alquil C_1-C_8 -alcoxi C_1-C_8 -carbamoilo; alcoxi(C_1-C_8)-carbonilo; halogenoalcoxi C_1-C_8 -carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -aminocarbonilo; alquil $di(C_1-C_8)$ -aminocarbonilo; alquil C_1-C_8 -carboniloxi; halogenoalquilcarboniloxi C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -carbonilamino; halogenoalquilcarbonilamino C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -aminocarboniloxi; alquil $di(C_1-C_8)$ -aminocarboniloxi; alquiloxicarboniloxi C_1-C_8 ; alquil C_1-C_8 -sulfenilo, halogenoalquil C_1-C_8 -sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -sulfinilo, halogenoalquil C_1-C_8 -sulfinilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 -sulfonilo, halógeno-alquilo C_1-C_8 -sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_8 -imino, (alcoxi C_1-C_8 -imino)-alquilo C_1-C_8 , (alquenil C_1-C_8 -oxiimino)-alquilo C_1-C_8 , (alquiniloxiimino C_1-C_8)-alquilo C_1-C_8 , un (benciloxiimino)-alquilo C_1-C_8 ; tri(alquil C_1-C_8)sililo; tri(alquil C_1-C_8)silil-alquilo C_1-C_8 ; benciloxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; naftilo que puede estar sustituido por hasta 6 grupos Q; fenoxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilmetileno que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; piridinilo que puede estar sustituido

17

por hasta cuatro grupo Q y piridiniloxi que puede estar sustituido por hasta cuatro grupo Q;

- dos sustituyentes X junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos pueden formar un carbociclo o heterociclo, saturado, de 5 o 6 elementos, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos Q que pueden ser iguales o diferentes;
- n representa 1, 2, 3, 4 o 5;
- Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; ciano; nitro; alquilo C₁-C₈; alcoxi(C₁-C₈); alquilsulfanilo C₁-C₈; halogenoalquilo C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil tri(C₁-C₈)-sililo y alquil tri(C₁-C₈) silil-alquilo C₁-C₈;

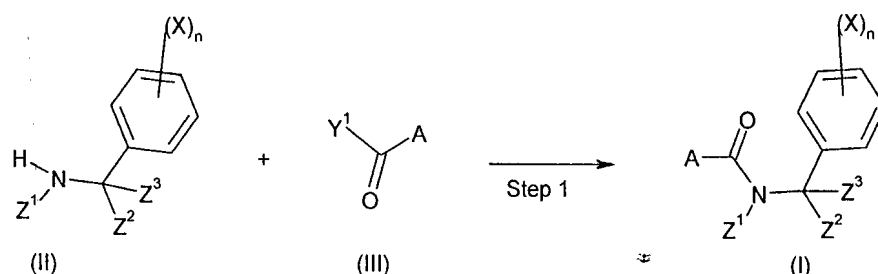
así como sus sales e isómeros ópticamente activos o geométricos.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que A se selecciona en la lista consistente en A², A⁵, A⁶, A¹⁰ y A¹³.
3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que A representa A¹³.
4. Un compuesto según la reivindicación 3 en el que A es A¹³, y R³⁴ representa alquil C₁-C₅ halogenoalquilo C₁-C₅ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; R³⁵ representa un átomo de hidrógeno o de flúor; R³⁶ representa metilo.
5. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 4 en el que Z¹ representa un ciclopropilo no sustituido.
6. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 4 en el que Z¹ representa un ciclopropilo sustituido por hasta 10 grupos o átomos que pueden ser iguales o diferentes y que puede ser el ion seleccionado en la lista consistente en átomos de halógeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₈ o halogenoalcoxi C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

7. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 6, en el que X, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₈ o halogenoalcoxi C₁-C₈ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

8. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 6, en el que dos sustituyentes X consecutivos junto con el anillo fenilo forman un 1,3-benzodioxolilo sustituido o no sustituido; 1,2,3,4-tetrahidro-quinoxalinilo; 3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazinilo; 1,4-benzodioxanilo; indanilo; 2,3-dihidrobenzofuranilo; indolinilo.

9. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 8 según el esquema siguiente:



en el que

A, Z¹, Z², Z³, X y n son como se define en las reivindicaciones 1 a 8;

Y¹ representa un átomo de halógeno o un hidroxilo.

Comparative data

In vivo preventive test on *Pyrenophora teres* (Barley net blotch)

The active ingredients tested are prepared by homogenisation in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

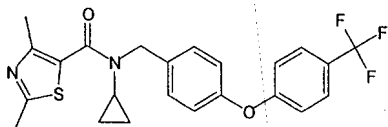
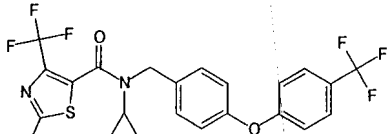
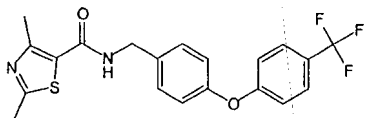
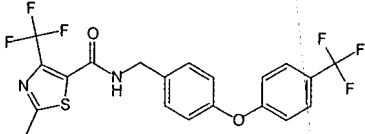
Barley plants (Express variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the active ingredient prepared as described above. Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Pyrenophora teres* spores (12,000 spores per ml). The spores are collected from a 12-day-old culture. The contaminated barley plants are incubated for 24 hours at about 20°C and at 100% relative humidity, and then for 12 days at 80% relative humidity.

Grading is carried out 12 days after the contamination.

Compounds of the invention have been tested in comparison with "equivalent" compounds which are differing only by the substituant Z¹ on the nitrogen (Z¹ is cyclopropyl for the compounds of the invention; Z¹ is hydrogen for the "equivalent" compounds).

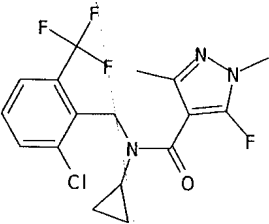
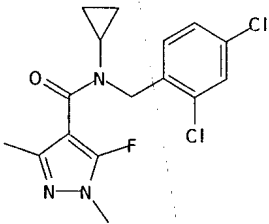
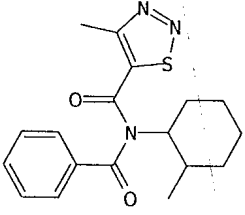
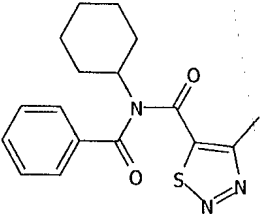
Compounds of the invention show a better efficiency (> 70% of efficiency at 500 ppm) compared to equivalent compounds (< 30% of efficiency at 500 ppm).

Compounds according to the invention	% efficiency at 500 ppm
	70
	70
"Prior art"	
	30
	10



Compounds of the invention have been tested in comparison with compounds of prior art which are differing by the substituant Z¹ on the nitrogen (Z¹ is cyclopropyl for the compounds of the invention; Z¹ is cyclohexyl for the "equivalent" compounds).

Compounds of the invention show total efficiency (100 % of efficiency at 500 ppm), while compounds of the prior art show no efficiency at all (0%)

<u>Compounds according to the invention</u>	% efficiency at 500 ppm
	100
	100
<u>"prior art"</u>	
	0
	0

in vivo preventive test on *Botrytis cinerea* (beans)

Solvent: 24.5 parts by weight of acetone
 24.5 parts by weight of dimethylacetamide

Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

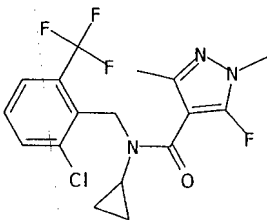
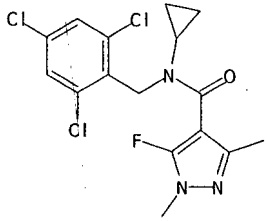
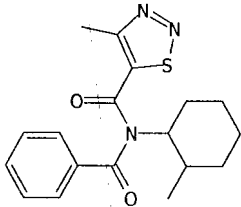
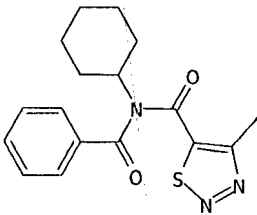
To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.



To test for preventive activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound. After the spray coating has dried on, 2 small pieces of agar covered with growth of *Botrytis cinerea* are placed on each leaf. The inoculated plants are placed in a darkened chamber at 20°C and a relative atmospheric humidity of 100%.

2 days after the inoculation, the size of the lesions on the leaves is evaluated. 0% means an efficacy which corresponds to that of the untreated control, while an efficacy of 100% means that no disease is observed.

Compounds of the invention show total efficiency (100 % of efficiency at 500 ppm), while compounds of the prior art show no efficiency at all (0%)

Compounds according to the invention	% efficiency at 500 ppm
	100
	100
"prior art"	
	0
	0

22



in vivo preventive test on Sphaerotheca fuliginea (cucumber)

Solvent: 49 parts by weight of N, N - Dimethylformamide
Emulsifier: 1 part by weight of Alkylarylpolyglycolether

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.

To test for preventive 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 spore suspension of Sphaerotheca fuliginea. The plants are then placed in a greenhouse at approximately 23°C and a relative atmospheric humidity of approximately 70 %.

The test is evaluated 7 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.

Compounds of the invention having a unsubstituted cyclopropyl linked to the nitrogen have been compared to compounds of the invention differing only by the fact that the cyclopropyl is substituted by a methyl. No decrease in the efficiency is observed between compounds of the invention with an unsubstituted cyclopropyl or a substituted cyclopropyl

Compounds with substituted cyclopropyl	% efficiency at 500 ppm	Compounds with unsubstituted cyclopropyl	% efficiency at 500 ppm
	98		100
	98		100
	99		92