



No. 08-092006- -00007-0000

Fecha: 2013-01-14 16:39:51 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 412 REPOSPRESRECU Folios: 16

Señor Superintendente
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 378
Actuación : 412

Referencia : Expediente No. **08.092.006**
Asunto : Solicitud de patente para: **COMPOSICIÓN HERBICIDA SÓLIDA**
Solicitante : **ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.**
Fecha solicitud : 02 de septiembre de 2008

I. RECURSO VÍA GUBERNATIVA

Yo, Luz Clemencia DE PÁEZ, en mi condición de apoderada de la sociedad **ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.** solicitante de la patente de la referencia, por el presente escrito atentamente manifiesto a usted que debidamente notificada de la Resolución No. **71559** del 26 de noviembre de 2012, interpongo en su contra el recurso de **REPOSICIÓN**, para que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para "**COMPOSICIÓN HERBICIDA SÓLIDA**" a favor de **ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.**

II. OPORTUNIDAD DE LA IMPUGNACIÓN

La Resolución No. **71559** del 26 de noviembre de 2012, con fecha de publicación listado único 4 de diciembre de 2012, fecha de vencimiento 4 de enero de 2013, y fecha del término legal 14 de enero de 2013.

III. LA DECISIÓN RECURRIDA

3.1 Mediante la Resolución objeto de la presente impugnación, el Superintendente de Industria y Comercio decidió:

"EXCELENCIA LEGAL EN UN MUNDO SIN FRONTERAS"

BOGOTÁ - Edificio Siski - Carrera 4 No. 72 - 35 - Tel: (57-1) 347 3611 - Fax (57-1) 211 8650 - Fax in U.S.A: (1-305) 675 7743 - COLOMBIA
MEDELLÍN - San Fernando Plaza - Carrera 43 A No. 1 - 50 - Torre Protección, Oficina 652 - Tel: (57-4) 604 4794 Ext. 6729 / 6731 - Fax: (57-4) 604 4731 - COLOMBIA

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

3.1.1 Denegar la patente de invención a la creación titulada: **“COMPOSICIÓN HERBICIDA SÓLIDA”**

3.2 En la parte motiva de la providencia, se mencionaron los siguientes fundamentos:

3.2.1 “Las características esenciales de la composición herbicida de la reivindicación 1 habían sido derivadas de manera evidente previamente en los documentos D1 (página 2 a página 3, tabla 2; reivindicación 1; página 3, líneas 4 y 10), D2 (párrafos [0013], [0017], [0041] y [0071]) y D3 (ejemplos 1, 2 y 4, columnas 5 y 6; columna 2, línea 40 a columna 3, línea 20), los cuales dan a conocer una composición herbicida sólida que consiste en:

0.1 a 90 partes en peso de $-(4,6\text{-dimetoxipirimidin-2-il})\text{-3-(3-trifluormetil-2-piridilsulfonil)urea}$ o su sal y de 0.1 a 90 partes en peso de un tensioactivo.

3.2.2 “Los documentos D1, D2 y D3 se consideran el estado de la técnica más cercano a la invención definida en la reivindicación 1.

3.2.3 “El documento D1 divulga las composiciones herbicidas granulares que comprenden como ingrediente activo flazasulfuron y opcionalmente uno o más ingredientes activos herbicidas. Asimismo, incluye un sistema estabilizante que comprende por lo menos un estabilizante que es seleccionado de por lo menos un compuesto dialquilsulfosuccinatos y benzoatos.

3.2.4 “Adicionalmente se pueden incluir diversos tensioactivos entre los cuales se incluyen policarboxilatos y naftalen sulfonatos condensados con formaldehído. El documento D1 enseña que los compuestos tensioactivos del tipo plicarboxilatos y naftalen sulfonatos condensados con formaldehído son especialmente útiles para estabilizar las propiedades del granulado.

3.2.5 “La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y D1, consiste en que D1 no divulga específicamente un sistema tensioactivo que comprende una combinación de alquilnaftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato o una combinación de naftalen sulfonato condensado con

formaldehído y un policarboxilato o una combinación de naftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato.

- 3.2.6 “El documento D2 divulga una formulación sólida herbicida que comprende por lo menos un derivado de sulfonilurea que puede ser flazasulfuron en combinación con componentes tensoactivos que mejoran la estabilidad de almacenamiento de la formulación. Entre dichos compuestos tensoactivos se incluyen específicamente derivados condensados entre naftaleno sulfonatos y formaldehído o sus derivados.
- 3.2.7 “La diferencia entre la invención definida en la reivindicación 1 y D2, consiste en que D2 no define específicamente un sistema tensoactivo que comprende una combinación de alquilnaftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato o una combinación de naftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato o una combinación de naftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato.
- 3.2.8 “El efecto que logra la diferencia consiste en que no sólo mejora la estabilidad del ingrediente activo flazasulfuron, sino que además mejora su desintegración en agua.
- 3.2.9 “Por lo tanto, el problema técnico objetivo que pretenden resolver esta invención se puede formular así: ¿Cómo modificar el granulado conocido en D1 o D2 para lograr una mayor estabilidad del ingrediente activo y al mismo tiempo lograr una mejor desintegración en agua?
- 3.2.10 “El documento D3 divulga granulados dispersables en agua que comprenden fluazinam como ingrediente activo plaguicida y un sistema tensoactivo que permite, no sólo una buena estabilidad del producto, sino además una buena re dispersión de éste en agua. El sistema tensoactivo comprende la mezcla entre derivados policarboxilatos y derivados naftalen sulfonatos condensados con formaldehído.
- 3.2.11 “Consecuentemente, la utilización de un sistema tensoactivo de policarboxilatos y derivados naftalen sulfonatos condensados con formaldehído ya había sido divulgada en D1 y D2. Asimismo, ya se había reportado que dicha combinación

mejoraba la estabilidad del ingrediente activo. Más aún, nótese que cualquiera de los documentos D1 y D2 sugiere la utilización de un sistema tensoactivo donde se combinen alquilnaftalen sulfonato condensado con formaldehído o naftalen sulfonato condensado con formaldehído para mejorar la estabilidad de almacenamiento del flazasulfuron, el documento D1 enseña que el sistema tensoactivo puede además incluir un derivado de policarboxilato.

- 3.2.12 “Además, el documento D3 hace referencia a las bondades de un sistema tensoactivo combinado entre un naftalen-sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato, en cuanto a la mejora en la dispersión de un sistema granulado en agua. El documento D3, pese a hacer referencia a otro ingrediente activo, enseña claramente que una presentación en forma de granulado tiene una redispersabilidad o desintegración en agua mejorada cuando se utiliza un sistema tensoactivo que combina un derivado de policarboxilato y un derivado naftalen-sulfonatos condensados con formaldehído.
- 3.2.13 “La persona del oficio medianamente versada en la materia, tendría información suficiente en los documentos para definir específicamente un granulado herbicida como el reivindicado en la presente reivindicación. Por lo cual se considera que la presente invención es obvia y no tiene nivel inventivo.
- 3.2.14 “La Superintendencia reitera el solicitante que si bien es cierto el documento D3 no utiliza como ingrediente activo el flazasulfuron, si hace referencia específica a la utilización de un sistema tensoactivo que comprende de naftalen sulfonato condensado con formaldehído y un policarboxilato para la formulación de composiciones que tienen una dispersabilidad en agua mejorada. Más aún, el documento D3 indica que dichas composiciones son estables en cuanto al color.
- 3.2.15 “Asímismo, el solicitante no debe olvidar que el análisis de nivel inventivo realizado requiere de las enseñanzas de esos documentos que se puede concluir que la composición de interés se deriva de manera obvia del arte previo y no es inventiva.
- 3.2.16 “Cualquiera de los documentos D1 o D2 hace referencia específica a formulaciones herbicidas estables de flazasulfuron. Dicha estabilidad se logra gracias a la inclusión de alquilnaftalen sulfonato condensado con formaldehído o

naftalen sulfonato condensado con formaldehído. Así entonces, para cualquier persona medianamente versada en la materia es evidente que si se formula una composición que incluya por un lado un tensoactivo de alquilnaftalen sulfonato condensado con formaldehído o naftalen sulfonato condensado con formaldehído y por otro lado un tensoactivo tipo plicarboxilato se obtendrá una formulación donde el ingrediente activo es estable y donde además se observará una buena redispersabilidad en agua de una formulación granulada del mismo.

IV. OBJETO DEL RECURSO

De acuerdo con los argumentos que expongo a continuación, solicito atentamente a su Despacho lo siguiente:

1. Revocar la Resolución No. **71559** del 26 de noviembre de 2012.
2. Conceder el privilegio de patente de invención para **“COMPOSICIÓN HERBICIDA SÓLIDA”** a favor de **ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.**

V. FUNDAMENTOS DEL RECURSO

Respetuosamente me permito disentir de lo expuesto por ese Despacho en la Resolución objeto del presente recurso, toda vez que la presente solicitud sí cumple con los requerimientos de novedad y nivel inventivo exigidos en la Decisión 486, como se demostrará a continuación:

5.1 La presente solicitud sí tiene nivel inventivo

Con el fin de demostrar que la presente solicitud cumple con el requerimiento de nivel inventivo, se pone de presente lo siguiente:

El artículo 18 de la Decisión 486 señala lo siguiente:

Artículo 18.- Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, 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.

Consecuentemente, una invención se considerará inventiva si la misma no hubiese resultado obvia a partir del arte previo, para una persona del oficio normalmente versada en la materia. Esto a su vez implica que el Examinador a cargo de esta evaluación debe colocarse en el momento exacto en el que el inventor buscaba resolver el problema técnico contemplado en la solicitud y para el cual poseía la literatura y el conocimiento disponibles en dicho momento.

Siguiendo entonces los lineamientos de la Jurisprudencia aplicable al análisis del nivel inventivo de una solicitud de patente, se considera que una anterioridad o una combinación de dos anterioridades puede afectar dicho requerimiento de patentabilidad, si una persona medianamente versada en la materia encuentra enseñanzas o sugerencias claras que, a partir de un conocimiento medio en dicho campo, le permitan llegar de manera obvia a la invención reivindicada. Adicionalmente se considera que una mejora sustancial, un efecto inesperado o una ventaja con respecto al arte previo es un indicio de nivel inventivo, por cuanto aporta un salto tecnológico en la regla técnica.

Respecto a lo anterior, el Tribunal de Justicia de la Comunidad Andina ha expuesto en la Interpretación Prejudicial del proceso 13-IP-2010:

“En este orden de ideas, se puede concluir que una invención goza de nivel inventivo cuando a los ojos de un experto medio en el asunto de que se trate, se necesita algo más que la simple aplicación de los conocimientos técnicos en la materia para llegar a ella, es decir, que de conformidad con el estado de la técnica el invento no es consecuencia clara y directa de dicho estado”.

[señalado fuera del texto]

Por lo anterior, se entiende que para que una persona medianamente versada en la materia pudiera derivar de manera obvia una invención, requeriría simplemente aplicar sus conocimientos técnicos. En contraste, todo aquello que va más allá de la simple aplicación de los conocimientos técnicos y que no ha sido revelado en el estado de la técnica, debe ser considerado inventivo.

A este respecto, respetuosamente manifestamos nuestro desacuerdo con el análisis llevado a cabo por el Examinador y con las conclusiones del mismo y solicitamos atentamente la reconsideración de las razones por las cuales se decidió negar la patente, con base en la siguiente información:

Del incorrecto análisis del nivel inventivo.

Su Despacho se ha pronunciado en diversas oportunidades sobre la forma de llevar a cabo el análisis de nivel inventivo, de acuerdo a las directrices dadas por el Tribunal Andino. En efecto, el Tribunal ha dicho que *"Para determinar si el objeto de la reivindicación resulta obvio o se deriva de manera evidente del estado de la técnica se recurre, siempre que sea posible, al método problema-solución"* (Proceso 36-IP-2010) y su Despacho en el "Instructivo Examen de Solicitudes de Patentes de Invención y Modelo de Utilidad" sintetiza cómo se lleva a cabo el procedimiento:

Método "problema-solución"

Durante el examen de nivel inventivo debe hacerse un juicio de valor y un análisis objetivo de las divulgaciones previas del estado de la técnica, no influenciados por el conocimiento que ya se tiene de la Invención que se está evaluando. Por tanto, con el fin de minimizar la subjetividad y evitar que se realice un análisis en retrospectiva ("hindsight" ó "a posteriori"), el examen debe relacionar la invención con la solución de un problema técnico, mediante el Método "problema-solución". Este consta de las siguientes etapas:

- *Identificar el estado de la técnica cercano a la invención reivindicada*

El estado de la técnica cercano es un documento que se encuentra en el mismo campo técnico que la invención o trata de solucionar el mismo problema o uno semejante. Suele ser el que tiene más características en común con la invención o presenta leves modificaciones de estructura e indica la misma función, propósito. En caso de que haya varios documentos relacionados, el estado de la técnica cercano es el documento que menciona una función, propósito, problema a resolver ó actividad semejante al de la invención.

- *Determinar la diferencia entre la invención y estado de la técnica cercano*
Comparar las características técnicas esenciales de la invención, con las del estado de la técnica cercano, mediante una matriz (...)

(...)- Definir el efecto técnico causado y atribuible al elemento diferencial

El examinador debe re plantear el problema técnico, que la solicitud había mencionado inicialmente, a la luz del informe de búsqueda. El problema

técnico objetivo se plantea en términos de: De manera que el problema técnico objetivo se formulará así: “¿cómo modificar ó adaptar el estado de la técnica cercano para obtener el efecto técnico que la invención proporciona?” La definición del problema técnico objetivo se basa en hechos objetivos concretos del estado de la técnica y en los resultados logrados por la invención. La expresión “problema técnico objetivo” deberá interpretarse en sentido amplio; no implica necesariamente que la solución constituya una mejora técnica en relación con el estado de la técnica; dado que puede ocurrir que el problema consista simplemente en buscar una solución de reemplazo a un dispositivo o a un procedimiento conocido que produzca efectos idénticos o similares.

- Evaluar si la invención reivindicada, partiendo del estado de la técnica cercano y del problema técnico objetivo, habría sido obvia para la persona medianamente versada en la materia

Esta etapa consiste en responder a la pregunta de si en el estado de la técnica en su conjunto hay un segundo documento que contiene una enseñanza que indicaría (no sólo que podría indicar, sino que indicaría) a la persona medianamente versada en la materia, enfrentada al problema técnico, cómo modificar o adaptar el estado de la técnica más cercano para resolver el problema, de la forma reivindicada, sin realizar una actividad inventiva. Si la respuesta es afirmativa, la Invención se considera obvia, y por tanto se concluye que no tiene nivel inventivo. Pero, si la respuesta es negativa, la invención no es obvia y se considera que tiene nivel inventivo.

Dentro de los errores que ha cometido su Despacho en la aplicación del método están:

- El Estado de la Técnica cercano **debe ser un documento** que se encuentra en el mismo campo técnico que la invención o trata de solucionar el mismo problema o uno semejante. **En caso de que haya varios documentos relacionados, el estado de la técnica cercano es el documento que menciona una función, propósito, problema a resolver ó actividad semejante al de la invención.** El Señor Examinador ha citado **tres documentos** como los más

cercanos; en consecuencia no ha utilizado el método de forma correcta pues debe escoger un documento de acuerdo a las reglas que dicta el método.

- Dado que se tomaron tres documentos simultáneamente para realizar el examen de nivel inventivo, no es posible que el Señor Examinador determine la diferencia entre la invención y estado de la técnica cercano pues se trata de tres diferencias disímiles procedentes de las anterioridades, lo que conlleva incongruencias en el análisis.
- Como se observa, la pregunta desarrollada por el Examinador es una pregunta no acorde con los planteamientos de este método, pues al no haberse identificado el estado del arte más cercano correctamente (el documento que lo representa), la misma carece de validez pues se refiere a diferencias puntuales entre documentos y no a un análisis global de las enseñanzas que una persona con conocimiento medio en el arte hubiera podido derivar.
- Dado que no se ha determinado el estado del arte más cercano, no es posible evaluar si la invención reivindicada, partiendo del estado de la técnica cercano y del problema técnico objetivo, habría sido obvia para la persona medianamente versada en la materia.
- El Tribunal es claro en establecer que *"El examinador no debe basarse en apreciaciones personales; toda objeción respecto a la falta de nivel inventivo de una invención debe probarse a partir del estado de la técnica"* (proceso 36-IP-2010). Como ya se ha demostrado, el Señor Examinador no ha probado la falta de nivel inventivo toda vez que siguió una metodología ajena a lo que dicta la práctica; en consecuencia las conclusiones a las que llega se basan en apreciaciones personales que son totalmente contrarias a lo que debería hacer el Señor Examinador

En consecuencia, consideramos que el análisis hecho por el señor Examinador carece de validez.

La presente solicitud sí tiene nivel inventivo

Experimento adicional

El solicitante realizó un experimento adicional para mostrar el nivel inventivo de la presente invención sobre D1 (EP 0764404) y D2 (EE.UU. 2004/0023803). La estabilidad del flazasulfuron (tasa de descomposición del flazasulfuron) fue probada mediante el uso de tensoactivos de D1 y D2. Las formulaciones se prepararon de la misma manera que en el Ejemplo Comparativo 1 de la presente descripción, y la estabilidad se ensayó de la misma manera que en el Ejemplo de Ensayo 1 de la presente memoria descriptiva.

Tabla A

	Tensoactivo	Tasa de descomposición del flazasulfuron (%)
D1	alquil sulfonato	54.6
	alquilaril sulfonato	59.1
D2	ácido lignosulfónico	41
	ácido fenolsulfónico	25.3

En cuanto a los tensoactivos de la Tabla A, el "alquil sulfonato" se menciona en D1, página 3, línea 5, el "alquilaril sulfonato" se menciona en D1, página 3, línea 6, el "ácido lignosulfónico" se menciona en D2, página 3, párrafo [0071], líneas 3 a 4, y el "ácido fenolsulfónico" se menciona en D2, página 3, párrafo [0071], línea 4.

Por otra parte, como se describe en la presente memoria descriptiva, la excelente estabilidad del flazasulfuron se puede conseguir por la presente invención. Por lo tanto, a continuación la Tabla B muestra la estabilidad del flazasulfuron en la presente invención:

Tabla B

Ejemplo	de descomposición del flazasulfuron (%)
1	1.1
2	3.9
3	2.1
4	0.4
5	0.9
6	0.6
7	3.1
8	0.9

Ejemplo	de descomposición del flazasulfuron (%)
9	1.3
10	3.3
11	2.0

En general, en el momento de preparar una formulación, un tensoactivo se selecciona dependiendo de las propiedades de un ingrediente activo. La estructura química y propiedades del flazasulfuron de la presente invención son básicamente diferentes de las de fluazinam contenido en la formulación de D3 (US 5.723.141). En consecuencia, una persona del oficio normalmente versada en la materia no estaría motivada a usar un tensoactivo utilizado para la preparación de una formulación de fluazinam, para preparar una formulación de flazasulfuron (Anexo 1).

Adicionalmente, D3 se refiere a una invención de gránulos dispersables en agua que contienen fluazinam como un ingrediente activo, y que además tiene un cambio de color después de haberse suprimido sin reducir la dispersabilidad y suspensibilidad en agua (columna 1 en el campo técnico). De esta forma, la estabilidad de un ingrediente activo no se describe ni sugiere en absoluto en D3.

Por lo tanto, una persona del oficio medianamente versada en la materia no estaría motivado para referirse a D3 con el fin de estabilizar el flazasulfuron.

Conclusión

El documento D1, el documento D2, el documento D3 o su combinación, no resultan anterioridades válidas capaces de afectar el nivel inventivo de la composición herbicida de la presente solicitud.

Por lo tanto, consideramos que el Examinador está pasando por alto el hecho de que el inventor en el momento de solucionar el problema técnico de la solicitud tuvo que emplear habilidad inventiva, pues la presente invención no resulta de la mera extrapolación de las enseñanzas del arte previo, como se afirma. Se está desconociendo el mérito investigativo empleado y que está aportando una ventaja al arte previo.

Por todo lo anterior, consideramos que la presente solicitud cumple a cabalidad con los requerimientos de patentabilidad exigidos por la legislación actual, por lo que atentamente solicitamos en consideración lo siguiente:

VI. PETICIÓN

Por todo lo anterior, solicito a ese Despacho lo siguiente:

6.1 Que al considerar las razones precedentes se revoque la decisión contenida en la Resolución No. **71559** del 26 de noviembre de 2012, en cuanto resuelve negar el privilegio de patente de invención.

6.2 Que se otorgue el privilegio de patente de invención para: que sea revocada y en consecuencia se conceda el privilegio de patente de invención para **“COMPOSICIÓN HERBICIDA SÓLIDA”** a favor de **ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.**

VII. NOMBRE Y DIRECCIÓN

El nombre y la dirección del solicitante recurrente son los siguientes:

ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD.

3-15, Edobori 1-chome,

Nishi-Ku,

Osaka-shi,

Osaka, 5500002,

Japón

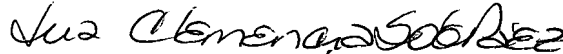
VIII. NOTIFICACIONES

Atentamente manifiesto a usted que recibiré notificaciones en la Secretaria de su Despacho o en mi oficina de abogada situada en la Carrera 4ª. No. 72-35, piso 4º, de esta ciudad de Bogotá, D.C.

IX. ANEXOS

- C D S Tomlin. A world Compendium: The Pesticide Manual. Promoting the Science and Practice of Sustainable Crop Production. *Flazasulfuron, Herbicide*. Fifth Edition.

Señor Superintendente,


LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén
T.P.A. No. 23.555

COLO-08028-0841-008-9
SGD\SGD\ID-234033\WPCL8028
No. M-2013-234033\SGD

A World Compendium

The Pesticide Manual

Fifteenth Edition

Editor: C D S Tomlin



Promoting the Science and Practice of Sustainable Crop Production

oral) >100 µg/bee. Worms LC₅₀ >1000 mg/kg. Other beneficial spp. Non-toxic to soil arthropods.

flamprop-M-methyl

Birds Acute oral LD₅₀ for bobwhite quail 4640, pheasants, mallard ducks, domestic fowl, partridges, pigeons all >1000 mg/kg. Fish LC₅₀ (96 h) for rainbow trout 4.0 mg/l. Daphnia Slightly to moderately toxic. Algae EC₅₀ (96 h) 5.1 mg/l. Other aquatic spp. Moderately toxic to freshwater and marine crustacea. Bees Non-toxic to bees. Worms Non-toxic.

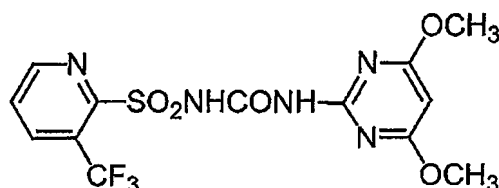
Other beneficial spp. Non-toxic to soil arthropods.

ENVIRONMENTAL FATE: **Animals** In mammals, following oral administration of flamprop-M-methyl or flamprop-M-isopropyl, complete metabolism and excretion occurs within 4 days. **Plants** In plants, flamprop-M-methyl and flamprop-M-isopropyl are hydrolysed to the biologically-active flamprop acid, which then undergoes conversion to a biologically-inactive conjugate. **Soil/Environment** The major soil degradate from both esters is flamprop free acid.

379 flazasulfuron

Herbicide

HRAC B WSSA 2; sulfonyleurea



NOMENCLATURE: Common name flazasulfuron (BSI, E-ISO, (m) F-ISO)

IUPAC name 1-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-3-(3-(trifluoromethyl)-2-pyridylsulfonyl)urea

Chemical Abstracts name N-[[4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)amino]carbonyl]-3-(trifluoromethyl)-2-pyridinesulfonamide

CAS RN [104040-78-0] **Development codes** SL-160 (Ishihara Sangyo); OK-1166 (Otsuka)

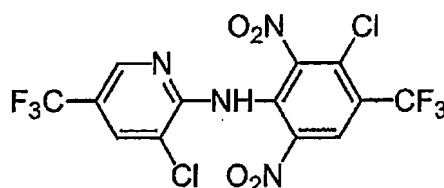
PHYSICAL CHEMISTRY: Mol. wt. 407.3 M.f. C₁₃H₁₂F₃N₅O₅S Form Odourless, white crystalline powder. M.p. 180 °C (purity 99.7%) V.p. <0.013 mPa (25 °C, 35 °C and 45 °C) K_{ow} logP = 1.30 (pH 5); -0.06 (pH 7) Henry <2.58 × 10⁻⁶ Pa m³ mol⁻¹ S.g./density 1.606 (20 °C) Solubility In water 0.027 (pH 5), 2.1 (pH 7) (both in g/l, 25 °C). In octanol 0.2, methanol 4.2, acetone 22.7, dichloromethane 22.1, ethyl acetate 6.9, toluene 0.56, acetonitrile 8.7 (all in g/l, 25 °C); in hexane 0.5 mg/l (25 °C). Stability DT₅₀ in water 17.4 h (pH 4); 16.6 d (pH 7); 13.1 d (pH 9) (all 22 °C) pKa 4.37 (20 °C) F.p. Non-flammable

COMMERCIALISATION: History Herbicide introduced by Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd in 1989, in Japan. Manufacturers Ishihara Sangyo

APPLICATIONS: Biochemistry Branched chain amino acid synthesis (ALS or AHAS) inhibitor. Acts by inhibiting biosynthesis of the essential amino acids valine and isoleucine, hence stopping cell division and plant growth. Selectivity may be due to differential rates of metabolism.

Mode of action Systemic herbicide, rapidly absorbed through the leaves and translocated throughout the plant. **Uses** Pre- and post- emergence control of grass and broad-leaved weeds and sedges (especially *Cyperus brevifolius* and *Cyperus rotundus*) in warm-season turf (*Zoysia* and *Cynodon* spp.), at 25-100 g/ha. Also used in vines and sugar cane, at 35-75 g/ha; and in citrus,

FRAC 29, C5; 2,6-dinitroaniline fungicide



NOMENCLATURE: Common name fluazinam (BSI, E-ISO); fluazinam ((m) F-ISO)
IUPAC name 3-chloro-N-(3-chloro-5-trifluoromethyl-2-pyridyl)- α,α,α -trifluoro-2,6-dinitro-p-toluidine
Chemical Abstracts name 3-chloro-N-[3-chloro-2,6-dinitro-4-(trifluoromethyl)phenyl]-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinamine
CAS RN [79622-59-6] **Development codes** B-1216; IKF-1216 (Ishihara Sangyo); ICIA0192 (ICI)

PHYSICAL CHEMISTRY: **Composition** Tech. is $\geq 94.5\%$ pure. **Mol. wt.** 465.1
M.f. $C_{13}H_4Cl_2F_6N_4O_4$ **Form** Yellow crystalline solid. **M.p.** Manufacturer values are 117°C (99.8% pure), 119°C (96.6%) **V.p.** 7.5 mPa (20°C) **K_{ow}** $\log P = 4.03$ **Henry** $6.71 \times 10^{-1} \text{ Pa m}^3 \text{ mol}^{-1}$ (calc.) **S.g./density** 1.81 (20°C) **Solubility** in n-hexane 8, acetone 853, toluene 451, dichloromethane 675, ethyl acetate 722, methanol 192 (all in g/l, 25°C). **Stability** Stable to acid, alkali and heat. Hydrolysis DT_{50} 42 d (pH 7), 6 d (pH 9), stable at pH 5. Aqueous photolysis DT_{50} 2.5 d (pH 5). **pKa** 7.34 (20°C)

COMMERCIALISATION: **History** Fungicide discovered and introduced by Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd and first marketed in 1990. **Manufacturers** Ishihara Sangyo; Cheminova; IPESA; Luba

APPLICATIONS: **Biochemistry** Uncouples mitochondrial oxidative phosphorylation, inhibiting spore germination, hyphal penetration, growth and sporulation. **Mode of action** Fungicide with protective action. Has little curative or systemic activity, but good residual effect and rain-fastness. **Uses** Control of grey mould and downy mildew on vines; apple scab; southern blight and white mould on peanuts; *Phytophthora infestans* and tuber blight on potatoes, at 150–750 g/ha. Applied to the soil, controls clubroot on crucifers, white and violet root rot (*Rosellinia necatrix* and *Helicobasidium mompa*) on fruit trees, scab and powdery scab on potatoes, at 2–2.5 kg/ha. Also for control of mites in apples. **Formulation types** DP; SC; WP.
Selected products 'Frownicide' (Ishihara Sangyo); 'Omega' (ISK Biosciences, Syngenta); 'Shirlan' (Syngenta); 'Tizca' (Cheminova).

ANALYSIS: Residues by gc/ECD (Resid. Anal. Methods). Details from Ishihara Sangyo.

TOXICOLOGICAL & ENVIRONMENTAL REVIEWS: EFSA Sci. Rep. (2008) 137, 1–82. EU Rev. Rep. SANCO/127/08 (2008). EPA Fact Sheet, Aug. 2001. 91/414/EC Annex I status Included, 2008/108/EC.

MAMMALIAN TOXICOLOGY: **Oral** Acute oral LD_{50} for male rats 4500, female rats 4100 mg/kg. **Skin and eye** Acute percutaneous LD_{50} for rats >2000 mg/kg. Irritating to eyes; slightly irritating to skin (rabbits). Tech. is a skin sensitiser, but purified material is not (guinea pigs). **Inhalation** LC_{50} for rats 0.463 mg/l. **NOEL** Chronic NOAEL for dogs 1.0 mg/kg daily, for male rats 1.9 mg/kg daily; carcinogenicity for male mice 1.1 mg/kg daily (EPA Fact Sheet). **ADI/RfD** (EC) 0.01 mg/kg b.w. [2008]; (EPA) aRfD 0.5, cRfD 0.011 mg/kg [2001].