

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

SOLICITUD DE :

1

☐

Corrección de error material

☒

Modificación a una solicitud

2

SOLICITANTE

Nombre: **Syngenta Participations AG**

Dirección: Schwarzwaldallee 215, CH-4058
Basilea, Suiza.

Nacionalidad o Domicilio: Basilea, Suiza
Lugar de Constitución: Suiza

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección: Cra. 11A No. 94-76 (Of. 305)

Teléfono: 6 162051/61 Fax: 6 161889

E-mail: tm-patent@escobaruribe.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 39.779.452 T.P.68.228

4 Número del expediente:

00-033.208

5 Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Que se anote la modificación que consiste en el **TRASPASO** que hace la sociedad **NOVARTIS AG**,
domiciliada en Basilea, Suiza a la sociedad **Syngenta Participations AG**, domiciliada en Basilea, Suiza.

6 Comprobante de pago No.

05 - 11,244

Fecha

14 de febrero de 2005

7 Anexos:

- ☐ Comprobante de pago de la tasa
- ☐ Poderes, si fuere el caso * Se encuentra radicado bajo el exp. No. 00-074.283
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas Jurídicas. * Se encuentra radicado bajo el exp. No. 00-074.283

8

NOMBRE: **JIMENA ESCOBAR URIBE**

FIRMA:



C.C. 39.779.452 de Usaquén T.P. 68228

2800
151A

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00033208 00000004

Folios: 2

Fecha (AMD): 2005-02-16 14:49:56

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 329 COMPLEMEN

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 11,244
FECHA : FEBRERO 14 DE 2005

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	37884256	14/02/2005	11,714,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	91,000.00
		TOTAL :	\$ 91,000.00

SON: NOVENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

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

020
Bogotá, D.C.:

Doctora:
Jimena Escobar Uribe

Oficio

1765

REFERENCIA: **Radicación No. 00-33208**
 Trámite 002
 Evento 001
 Actuación 430
 Folios 002

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 46 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. DEL ARTICULO 46

Artículo 46. *De ser necesario, a efectos del examen de patentabilidad y a requerimiento de la oficina nacional competente, el solicitante proporcionará, en un plazo que no excederá de 3 meses, uno o más de los siguientes documentos relativos a una o más de las solicitudes extranjeras referidas total o parcialmente a la misma invención que se examina:*

- a) copia de la solicitud extranjera;*
 - b) copia de los resultados de exámenes de novedad o de patentabilidad efectuados respecto a esa solicitud extranjera;*
 - c) copia de la patente u otro título de protección que se hubiese concedido con base en esa solicitud extranjera;*
 - d) copia de cualquier resolución o fallo por el cual se hubiese rechazado o denegado la solicitud extranjera; o*
 - e) copia de cualquier resolución o fallo por el cual se hubiese anulado o invalidado la patente u otro título de protección concedido con base en la solicitud extranjera.*
- La oficina nacional competente podrá reconocer los resultados de los exámenes referidos en el literal b) como suficientes para acreditar el cumplimiento de las condiciones de patentabilidad de la invención.*
- Si el solicitante no presentara los documentos requeridos dentro del plazo señalado en el presente artículo la oficina nacional competente denegará la patente.*

2. DE LA SOLICITUD EUROPEA

El solicitante presentó una solicitud europea de patente que corresponde a la misma solicitud colombiana y donde se reivindica prioridad del mismo documento citado para Colombia. Dicha solicitud europea corresponde a la publicación WO 00/68222 del 16 de noviembre de 2000. Dicha solicitud fue tramitada y se procedió a su examen al respecto de lo cual existen documentos relativos al reporte de búsqueda y resultado del examen.

3. DE LA SOLICITUD DE LA OFICINA

A efectos del examen de patentabilidad y como requerimiento de esta oficina, se solicita proporcionar, en un plazo que no exceda de 3 meses, los siguientes documentos relativos a la solicitud extranjera correspondiente a la misma invención que se examina:

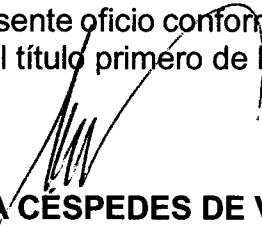
- a) copia de todos los resultados de exámenes de patentabilidad efectuados respecto

a la solicitud extranjera, junto con los siguientes documentos encontrados como consecuencia de la búsqueda de anterioridades de materia relacionada que eventualmente afectarían los requisitos de patentabilidad de esta solicitud:

1. J. Cryst. Growth, 166(1) 1996 900-903.

En cumplimiento del artículo 46 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe proporcionar éstos documentos, en un plazo que no excederá de tres meses, a partir de la fecha de la notificación de la presente comunicación. Si el solicitante no presentara los documentos requeridos dentro del plazo señalado, la oficina nacional competente denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2 literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

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

16 FEB. 2006

CONCEPTO TÉCNICO No. 091(2006-02-03)	EXAMINADOR TÉCNICO Código 202001	EXAMINADOR JURÍDICO Código
--	-------------------------------------	----------------------------------

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

2020
Bogotá, D.C.,

Doctora (señora):
Jimena Escobar Uribe

Oficio N°
1764

REFERENCIA: Radicación No. 00-33208.
 Trámite 002.
 Evento 001.
 Actuación 430.
 Folios 005.

Realizado el examen de patentabilidad de la presente solicitud según el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, **"art. 45.- Si la oficina nacional competente encontrara que la invención no es patentable o que no cumple con alguno de los requisitos establecidos en esta Decisión para la concesión de la patente, lo notificará al solicitante. Este deberá responder a la notificación dentro del plazo de sesenta días contados a partir de la fecha de la notificación. Este plazo podrá ser prorrogado por una sola vez por un período de treinta días adicionales. Cuando la oficina nacional competente estimara que ello es necesario para los fines del examen de patentabilidad, podrá notificar al solicitante dos o más veces conforme al párrafo precedente. Si el solicitante no respondiera a la notificación dentro del plazo señalado, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, la oficina nacional competente denegará la patente."** se notifica el siguiente Concepto Técnico:

1. DOCUMENTOS ESTUDIADOS

- ❖ Para el presente estudio se tuvo en cuenta el capítulo descriptivo, folios 3 a 33 presentados originalmente, folios 136 a 140 correspondiente a la descripción y reivindicaciones 1 a 8, folios 141 a 142 anexados como respuesta al requerimiento formal; lo cual fue aceptado dado que éste no implica una ampliación de la solicitud originalmente presentada conforme lo establece el artículo 34 de la decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina **"art. 34.- El solicitante de una patente podrá pedir que se modifique la solicitud en cualquier momento del trámite. La modificación no podrá implicar una ampliación de la protección que correspondería a la divulgación contenida en la solicitud inicial. Del mismo modo, se podrá pedir la corrección de cualquier error material."**
- ❖ Se acepta reivindicación de prioridad CH 905/99 y CH1606/99 del 12 de mayo y del 3 de septiembre de 1999 respectivamente. ✓

2. OBJETO DE LA INVENCION

- Título: Solvatos de pimetrozina, insecticidamente activos, composiciones que contienen estos compuestos y métodos tanto para producir dichos compuestos y composiciones como para controlar plagas animales con estas composiciones.
- La invención consiste en:

Reivindicaciones 1 a 3: Compuestos de la fórmula (I) tal como se definen en los folios 141 y 142.

Reivindicación 4: Una composición plaguicida que contiene un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 de la fórmula (I) y uno o más auxiliares

Reivindicación 5: Un método para controlar plagas, el cual comprende aplicar un ingrediente activo de la fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1 o una composición que contenga este ingrediente activo en una cantidad plaguicidamente activa como se describe en la reivindicación 4, a las plagas o a su lugar.

Reivindicación 6: Un método para la preparación de composiciones plaguicidas como se describen en la reivindicación 4 el cual comprende poner la mezcla plaguicida que contenga al compuesto esencialmente exento de solvato de la fórmula (I) en donde r y s son 0, en contacto con el agente de solvatación.

Reivindicación 7: Un método para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1, donde el compuesto no solvatado, plaguicidamente activo, se pone en contacto con el agente de solvatación.

Reivindicación 8: Una composición de acuerdo con la reivindicación 4, usada para el control de plagas.

- ❖ La clasificación según la IPC correspondiente al objeto de la solicitud es A01N43/707.

4. REIVINDICACIONES DE USO

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

No obstante la reivindicación 8 se encabeza por una composición, en realidad se precisa como útil en el control de plagas por lo tanto, en cumplimiento a este artículo se procedió a evaluar la patentabilidad de esta reivindicación y se considera que es importante recordar al solicitante que en ningún momento la Decisión estipula que se otorgue una patente de USO, sino que simplemente se otorgará el privilegio a las que sean de producto y procedimiento, por lo tanto esta reivindicación no es patentable.

6. DETERMINACIÓN DEL ESTADO DE LATÉCNICA

- ❖ La fecha a partir de la cual se realizó la búsqueda de anterioridades corresponde al 11 de mayo de 1999.
- ❖ Con base a lo anterior y la definición dada en el **art. 16.-** "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.

Sólo para el efecto de la determinación de la novedad, también se considerará dentro del estado de la técnica, el contenido de una solicitud de patente en trámite ante la oficina nacional competente, cuya fecha de presentación o de prioridad fuese anterior a la fecha de presentación o de prioridad de la solicitud de patente que se estuviese examinando, siempre que dicho contenido esté incluido en la solicitud de fecha anterior cuando ella se publique o hubiese transcurrido el plazo previsto en el artículo 40." , se realizó la búsqueda de anterioridades en los archivos con que cuenta esta Oficina y se encontró el siguiente documento relacionado con la materia de la presente solicitud:

N°	DOCUMENTO	TÍTULO	FECHA DE PUBLICACIÓN
D1	US 4 931 439	Pesticides	1990-06-05

3.EVALUACIÓN DE LOS REQUISITOS DE PATENTABILIDAD

El artículo 14 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina establece que: "Los Países Miembros otorgarán patentes para las invenciones, sean de producto o de procedimiento, en todos los campos de la tecnología, siempre que sean nuevas, tengan nivel inventivo y sean susceptibles de aplicación industrial."

En cumplimiento del artículo 14 de la Decisión 486, se procedió a evaluar los requisitos de novedad, nivel inventivo y aplicación industrial con el fin de establecer la patentabilidad de la invención reivindicada en la solicitud en estudio.

3.1 Evaluación del NIVEL INVENTIVO

De acuerdo al art. 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."*, se conceptúa:

Como bien dice el solicitante en el folio 4, la pimetrozina fue publicada en 1990 por la patente US 4931439, específicamente corresponde al ejemplo P3 como una sustancia con actividad en el control de plagas en y sobre animales y plantas. La presente solicitud reclama compuestos de pimetrozina acompañados a moléculas de solventes para formar los llamados solvatos o pseudopolimorfos. Entre los más preferidos, de acuerdo a las reivindicaciones 2 y 3, se encuentran el metanolato y el dihidrato.

Para examinar el nivel inventivo de esta solicitud conviene anotar que en 1965, las investigaciones de W. Mccrone y col¹ pusieron en evidencia la existencia de diferentes formas cristalinas. De esta manera, no se puede subestimar que cuando se trabaja con sustancias activas y parámetros cambiantes en los procesos pueden aparecer transformaciones de fases y con ello los polimorfos y pseudopolimorfos.

Es de conocimiento básico para una persona medianamente versada en el arte técnico correspondiente que el polimorfismo, es un fenómeno que experimenta un especie química y que se manifiesta con la formación de diferentes formas cristalinas cuando dicha especie es sometida a diferentes condiciones de temperatura, índice de cristalización, naturaleza del solvente, velocidad de enfriamiento, agitación, cantidad de solvente usado y pureza del solvente. Como este proceso de cristalización es controlable puede ocurrir que no se obtenga un polimorfo puro sino que en la red del cristal quede atrapado solvente en una cantidad estequiométrica originando un solvato o pseudopolimorfo. Ahora bien, el agua es ampliamente conocido como el solvente universal y además se sabe que en tiempos de exposición cortos bajo condiciones de humedad, los compuestos tienen cierta capacidad de incorporar moléculas de agua, en cuyo caso al pseudopolimorfo se le conoce como hidrato; para todos los otros solventes se denominan solvatos.

De acuerdo a lo anterior, se considera que no obstante el solvente usado en la cristalización afecte las propiedades físicas (presencia de polimorfos) del compuesto activo, éste no le imprime un cambio que signifique un salto en la formulación de la regla técnica ya que no se obtuvo un compuesto distinto sino que cada uno de estos solvatos corresponden a distintas formas físicas del mismo principio activo donde, con los conocimientos integrantes del estado de la técnica, el experto medio habría alcanzado la solución reivindicada para el problema técnico de estabilidad al almacenamiento y procesamiento hasta llegar a la formulación del ingrediente activo.

Si se tiene en cuenta la publicación de Ashizawa y colaboradores² se puede evidenciar que el estado del arte aún desde los trabajos de Mccrone en 1965 ha estado direccionado, como es lógico, hacia el estudio de la estabilidad de los componentes activos y con ello de las diferentes formas cristalinas y más específicamente del pseudopolimorfismo. Esta publicación que data de 1989, confirma que tanto la

¹ Mccrone, W.C.: "8 Polymorphism", in: Fox, D.; Labes, M.M.; Weissberger, A.: Physics and Chemistry of the Organic Solid State, Vol. II, Interscience Publishers, Wiley, New York, 1965.

² Ashizawa K., Uchikawa K., Hattori T., Ishibashi Y., Sato T., Miyake Y. J. Pharm. Sci. 1989 Nov;78(11) 893-899.

obtención de los solvatos como los mismos pseudopolimorfos ha sido motivo de estudios a lo largo de estos años y pone evidencia que en realidad después de la publicación en 1990 de la patente US4 931 439 (considerada como la anterioridad de esta solicitud) donde se divulgó la pimetrozina lo que hace (si no lo ha hecho antes) cualquier experto medio en el tema, es la caracterización de los compuestos. Para ello es importante recordar que los compuestos químicos, y de manera especial los principios activos, sólo pueden considerarse completamente caracterizados si se conoce:

- La estructura química,
- La estereoquímica,
- La fórmula molecular,
- El peso molecular,
- Propiedades generales (punto de ebullición y de fusión, rotación óptica, perfil de solubilidad, pH en solución, coeficientes de partición, constantes de disociación)
- La forma del sólido (monocristal, policristalino, el número, el tamaño, la forma y la distribución de las partículas cristalinas) o estructura del cristal,
- Los defectos cristalinos (tipo número y distribución),
- Las impurezas y su distribución al azar o no,
- La textura, entre otros.

En este orden de ideas, la presente solicitud carecería de nivel inventivo ya que tanto los solvatos como su obtención obedecen a una reproducción, en lo sustancial de los medios utilizados generalmente por la comunidad científica como es la producción de las pseudo formas cristalinas a través de la interacción de principios activos con solventes en búsqueda del mismo tipo de resultado encontrado en el estado del arte cual fuere la consecución de propiedades físicas adecuadas para llegar a una buena estabilidad al almacenamiento y en el procesamiento de la formulación.

Es bien claro, para cualquier persona con los mínimos conocimientos en este arte que las interacciones de las sustancias cristalinas con los solventes cambian únicamente las propiedades del estado sólido que dependen del hábito cristalino pero que una vez se modifique esta condición (por ej. en su aplicación o cuando es ingerido), la forma a la cual se convierta sólo dependerá de las condiciones del medio en las que se encuentre, que podría ser en este caso si es ingerido por el insecto, en las de la digestión de dicho insecto. Lo anterior pone de manifiesto que la sustancia es la misma y que la modificación física obviamente realizada no interfiere en su comportamiento y en sus efectos en condiciones de aplicación.

Así, es bien conocido que el objetivo principal de la industria en la formulación de un compuesto activo, es identificar la forma sólida óptima que es adecuada para el desempeño de la formulación, la manufactura y su almacenamiento sin embargo cualquier persona medianamente versada en este tema podría sin lugar a dudas llegar a las condiciones requeridas mediante la aplicación de ensayos sistemáticos y de protocolo ya que las transformaciones a nivel cristalino son propiedades inherentes a la molécula que no se pueden diseñar pero si identificar relativamente fácil por técnicas ampliamente difundidas como DSC, TGA, DRX, RMN de estado sólido, etc.

Así, la fórmula estructural química de la pimetrozina es la misma donde se ha agregado el solvente de manera estequiométrica pero no ha modificado como tal el núcleo de pimetrozina. Lo anterior se sustenta en que, como se sabe, en los pseudopolimorfos el solvente queda retenido en el retículo por uniones puentes de hidrógeno o fuerzas de Van Der Waals, así su estructura química se puede recuperar por la sola remoción de dicho solvente.

Como se puede observar los solvatos de pimetrozina que se reclaman continúan presentando actividad insecticida y no obstante en D1 no se revele expresamente algún solvato, conviene advertir que el hecho de que una molécula presente pseudopolimorfismo no le confiere nivel inventivo al compuesto denominado solvato o

158

hidrato ya que la presencia de pseudopolimorfos se deben a una propiedad intrínseca de la sustancia y no a una actividad creadora del hombre.

En relación al método de preparación de la composición y del compuesto se considera que el ejemplo P.3 de D1 muestra claramente que la pimetrozina obtenida en la mezcla de reacción disuelta en etanol es sometida a un proceso de cristalización; por lo que la preparación de la forma solvato se deriva de manera evidente del estado del arte en el que la sustancia exenta de solvente se pone en contacto con el agente de solvatación. De otro lado, es importante anotar que la obtención de cristales se realiza por el método convencional ampliamente difundido como cristalización en el que una sustancia se disuelve en un solvente hasta tener una solución saturada y se calienta a alta temperatura para aumentar la solubilidad en el solvente y luego se enfría para que el exceso de sólido disuelto a esta temperatura se pueda separar en forma de cristales. Además también conviene advertir que en referencia a la preparación de pseudopolimorfos, la Superintendencia de Industria y Comercio se ha manifestado anteriormente (Solicitud No. 95-29779), con ocasión de la falta de nivel inventivo para la obtención de cristales siguiendo un procedimiento normalmente conocido, tal como ocurre en la presente solicitud.

En conclusión, D1 afectaría determinadamente el nivel inventivo de las reivindicaciones 1 a 3 referentes a los compuestos, las reivindicaciones 4 y 8 relacionadas con la composición que los contiene y las reivindicaciones 6 y 7 que definen el método de preparación de los pseudopolimorfos.

Respecto al método para controlar plagas definido en la reivindicación 5, este método tal como está reivindicado no define ninguna condición o etapa característica diferente a la forma comúnmente utilizada para aplicar un plaguicida para que ejerza su acción, ya que, es obvio que si se quiere combatir plagas, lo más lógico es que se aplique un producto que tenga propiedades plaguicidas; se considera que tal como se reivindica no se indican en forma específica las condiciones especiales de aplicación de la composición que lo diferencien de los demás métodos convencionales de aplicación. Por lo anterior, carecería de 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 la notificación de la presente comunicación. **En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.**

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2,literal e), del capítulo quinto del título primero de la circular única No. 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

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

16 FEB. 2002

CONCEPTO TÉCNICO N° 090 (2006-02-03)	EXAMINADOR TÉCNICO CÓDIGO 202001	EXAMINADOR JURÍDICO CÓDIGO
---	-------------------------------------	-------------------------------

United States Patent [19]
Kristinsson

[11] **Patent Number:** 4,931,439
[45] **Date of Patent:** Jun. 5, 1990

[54] **PESTICIDES**

[75] **Inventor:** Haukur Kristinsson, Basel, Switzerland
[73] **Assignee:** Ciba-Geigy Corporation, Ardsley, N.Y.

[21] **Appl. No.:** 255,684

[22] **Filed:** Oct. 11, 1988

[30] **Foreign Application Priority Data**

Oct. 16, 1987 [CH] Switzerland 4062/87

[51] **Int. Cl.⁵** A01N 43/707; C07D 253/06; C07D 253/08

[52] **U.S. Cl.** 514/242; 514/243; 544/182; 544/183

[58] **Field of Search** 544/182, 183; 514/242, 514/243

[56] **References Cited**

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

1795785 8/1975 Fed. Rep. of Germany .

OTHER PUBLICATIONS

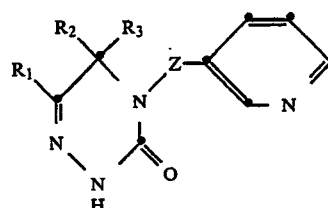
Liebigs Annalen der Chemie. 749, pp. 125-133 (1971) [Hetzheim et al.].

Primary Examiner—John M. Ford

Attorney, Agent, or Firm—Kevin T. Mansfield

[57] **ABSTRACT**

Novel substituted N-amino-1,2,4-triazinones of formula I



(I)

wherein

R₁ is hydrogen, C₁-C₁₂alkyl, C₃C₆cycloalkyl, C₁-C₄alkoxy-C₁-C₆alkyl, C₁-C₂haloalkyl, phenyl, benzyl, phenethyl, phenpropyl, phenbutyl or phenpentyl, or a phenyl, benzyl, phenethyl, phenpropyl, phenbutyl or phenpentyl radical that is mono- or di-substituted by halogen, C₁-C₅alkyl, C₁-C₂haloalkyl, methoxy and/or by ethoxy,

R₂ is hydrogen, C₁-C₆alkyl or C₃-C₆ cycloalkyl, or is phenyl that is unsubstituted or substituted by C₁-C₁₂alkyl, halogen or by C₁-C₁₂haloalkyl, or R₁ and R₂ together form a saturated or unsaturated 3- to 7-membered carbocycle,

R₃ is hydrogen or C₁-C₆ alkyl and

Z is —N=CH— or —NH—CH₂—,

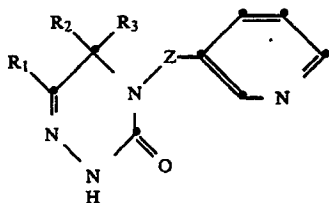
and their salts with organic or inorganic acids, processes and intermediates for their preparation, and their use in pest control and in pesticidal compositions that contain a compound of formula I as active ingredient are disclosed. The preferred field of application is the control of pests in and on animals and plants.

14 Claims, No Drawings

PESTICIDES

The present invention relates to novel insecticidally active N-amino-1,2,4-triazinones, processes and intermediates for their preparation, compositions containing these aminotriazinones, and their use in pest control.

The aminotriazinones according to the invention correspond to formula I



wherein

R₁ is hydrogen, C₁-C₁₂alkyl, C₃-C₆cycloalkyl, C₁-C₄alkoxy-C₁-C₆alkyl, C₁-C₂haloalkyl, phenyl, benzyl, phenethyl, phenpropyl, phenbutyl or phenpentyl, or a phenyl, benzyl, phenethyl, phenpropyl, phenbutyl or phenpentyl radical that is mono- or di-substituted by halogen, C₁-C₅alkyl, C₁-C₂haloalkyl, methoxy and/or by ethoxy,

R₂ is hydrogen, C₁-C₆alkyl or C₃-C₆cycloalkyl, or is phenyl that is unsubstituted or substituted by C₁-C₁₂alkyl, halogen or by C₁-C₁₂haloalkyl, or R₁ and R₂ together form a saturated or unsaturated 3- to 7-membered carbocycle,

R₃ is hydrogen or C₁-C₆alkyl and Z is —N=CH— or —NH—CH₂—.

The compounds of formula I can also be in the form of acid addition salts. Both organic and inorganic acids are suitable for the formation of such salts. Examples of such acids are, inter alia, hydrochloric acid, hydrobromic acid, nitric acid, various phosphoric acids, sulfuric acid, acetic acid, propionic acid, butyric acid, valeric acid, oxalic acid, malonic acid, maleic acid, fumaric acid, lactic acid, tartaric acid or salicylic acid.

The alkyl radicals that are suitable as substituents may be straight-chained or branched. Examples of such alkyl radicals are methyl, ethyl, propyl, isopropyl, butyl, isobutyl, sec.-butyl, tert.-butyl or pentyl, hexyl, octyl, decyl, dodecyl, etc. and their isomers.

The alkoxyalkyl radicals that are suitable as substituents may be straight-chained or branched, the alkyl and alkoxy radicals being as defined above. Suitable examples of such substituents are, inter alia, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxyethyl, methoxypropyl, ethoxypropyl, propoxypropyl, methoxybutyl, ethoxybutyl, propoxybutyl or butoxybutyl.

The cycloalkyl radicals that are suitable as substituents are, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl or cyclohexyl.

The halogen atoms that are suitable as substituents are fluorine and chlorine and also bromine and iodine, fluorine and chlorine being preferred.

The halogenated C₁-C₂alkyl radicals that are suitable as substituents may be only partially halogenated or may be perhalogenated, the halogen atoms being as defined above. Especially suitable examples of such substituents are, inter alia, methyl mono- to tri-substituted by fluorine, chlorine and/or by bromine, for example CHF₂ or CF₃; and ethyl mono- to penta-substituted by fluorine, chlorine and/or by bromine, for

example CH₂CF₃, CF₂CF₃, CF₂CCl₃, CF₂CHCl₂, CF₂CHF₂, CF₂CHBr₂, CF₂CHClF, CF₂CHBrF or CClFCHClF.

The 3- to 7-membered carbocycles formed by R₁ and R₂ may be saturated or unsaturated. They are preferably saturated 5- or 6-membered carbocycles.

Of the compounds of formula I, prominence should be given to those wherein R₁ is hydrogen, C₁-C₆alkyl, C₃-C₅cycloalkyl, phenyl or phenyl that is mono- or di-substituted by halogen, C₁-C₃alkyl, methoxy or by ethoxy; each of R₂ and R₃ is hydrogen or C₁-C₄alkyl and Z is —N=CH— or —NH—CH₂—.

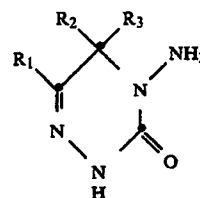
Of the above, the compounds of formula I that are preferred are those wherein

(a) R₁ is hydrogen, C₁-C₄alkyl, cyclopropyl or phenyl; R₂ is hydrogen, methyl or ethyl; R₃ is hydrogen or methyl; and Z is —N=CH— or

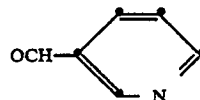
(b) R₁ is hydrogen, C₁-C₄alkyl, cyclopropyl or phenyl; R₂ is hydrogen, methyl or ethyl; R₃ is hydrogen or methyl; and Z is —NH—CH₂—.

The compounds of formula I according to the invention can be prepared in accordance with processes that are known in principle, for example by

(A) reacting an aminotriazinone of formula II

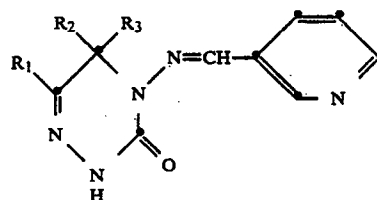


with an aldehyde of formula III

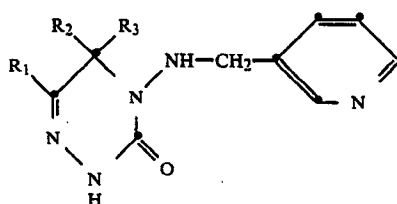


and, if desired,

(B) converting the resulting pyridyl-methyleneamino-triazinone of formula Ia

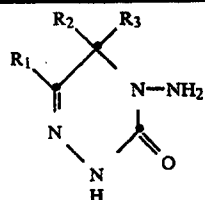


by selective reduction into the pyridyl-methylamino-triazinone of formula Ib



9

TABLE 2

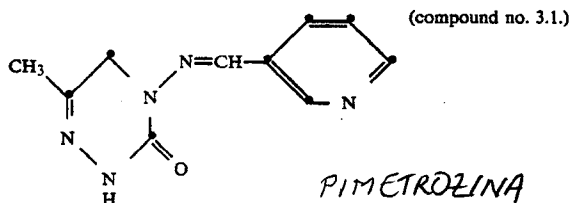


Compound no.	R ₁	R ₂	R ₃	m.p. °C.
2.1	CH ₃	H	H	117-119
2.2	CH ₃	CH ₃	H	172-174
2.3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	138-139
2.4	C ₂ H ₅	H	H	143-145
2.5	i-C ₃ H ₇	H	H	79-81
2.6	C(CH ₃) ₃	H	H	148-150
2.7		H	H	94-95
2.8	C ₆ H ₅	H	H	199-202
2.9	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	208-210
	H	H	H	
	CH ₃	C ₂ H ₅	H	
	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
	n-C ₃ H ₇	H	H	
	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	
	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	
	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	
	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	
	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	
		CH ₃	CH ₃	
		CH ₃	H	

Example P.3:

2,3,4,5-tetrahydro-3-oxo-4-[(pyridin-3-yl)-methyleneamino]-6-methyl-1,2,4-triazine

26.8 g (0.25 mole) of pyridine-3-carbaldehyde and 1 drop of concentrated HCl are added at 60° C. to 32 g (0.25 mole) of 2,3,4,5-tetrahydro-3-oxo-4-amino-6-methyl-1,2,4-triazine dissolved in 250 ml of ethanol. After boiling for half an hour under reflux, the reaction mixture is cooled and the solid portion is isolated by filtration, washed with ether and dried to give the title compound of formula

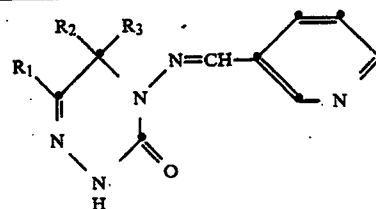


in the form of a colourless solid; m.p. 227°-228° C.; yield: 48 g (90%).

The following compounds are prepared in an analogous manner:

10

TABLE 3



Compound no.	R ₁	R ₂	R ₃	physical data
3.1	CH ₃	H	H	m.p. 227-228° C.
3.2	CH ₃	CH ₃	H	m.p. 139-141° C.
3.3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	m.p. 158° C.
3.4	C ₂ H ₅	H	H	m.p. 223-224° C.
3.5	i-C ₃ H ₇	H	H	m.p. 201-203° C.
3.6		H	H	m.p. 243-244° C.
3.7	C(CH ₃) ₃	H	H	m.p. 195-196° C.
3.8	C ₆ H ₅	H	H	m.p. 263-264° C.
3.9	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	m.p. 246-247° C.
	H	H	H	
	H	CH ₃	H	
	H	CH ₃	CH ₃	
	CH ₃	C ₂ H ₅	H	
	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	
	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	
	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	
	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	
	n-C ₃ H ₇	H	H	
	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	
	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	
	n-C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	CH ₃	
	i-C ₃ H ₇	CH ₃	H	
	i-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	
		CH ₃	H	
		CH ₃	CH ₃	
	C(CH ₃) ₃	CH ₃	H	
	C(CH ₃) ₃	CH ₃	CH ₃	
	n-C ₄ H ₉	H	H	
	C ₆ H ₅	CH ₃	H	
	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	

Example P.4:

2,3,4,5-tetrahydro-3-oxo-4-[(pyridin-3-yl)-methylamino]-6-isopropyl-1,2,4-triazine

37.8 g (1 mole) of sodium borohydride are introduced in portions into a suspension of 24.5 g (0.1 mole) of 2,3,4,5-tetrahydro-3-oxo-4-[(pyridin-3-yl)-methyleneamino]-6-isopropyl-1,2,4-triazine in 800 ml of methanol; the reaction mixture is then stirred for a few hours at room temperature and then boiled under reflux for 12 hours. After evaporation of the solvent, the residue is stirred with acetonitrile and then filtration is carried out. After concentrating the acetonitrile solution by evaporation, the residue is stirred with ether and the crystallate is isolated by filtration to give the title compound of formula