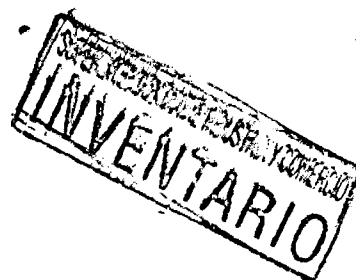




Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organización CSA Ltda



SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. **EXPEDIENTE No.**

2000-33208

54. **TITULO**

SOLVATOS DE PIMETROZINA, INSECTICIDAMENTE ACTIVOS, COMPOSICIONES

QUE CONTIENEN ESTOS COMPUESTOS Y METODOS TANTO PARA PRODUCIR

DICHOS COMPUESTOS Y COMPOSICIONES COMO PARA CONTROLAR PLAGAS

ANIMALES CON ESTAS COMPOSICIONES.

51. **CLASIFICACION INTERNACIONAL**

AOIN 43/707

71. **SOLICITANTE**

NOVARTIS AG

DOMICILIO

BASILEA, SUIZA

74. **APODERADO**

JIMENA ESCOBAR URIBE

22. **SANTAFE DE BOGOTA, D.C.**

MAYO 9 DEL 2000

EXAMEN TÉCNICO FONDO/			
Nº Radicación	00-33208	Fecha de presentación	2000-05-09
Nº Prioridad	CH905/99 CH1606/99	Fecha de Prioridad	1999-05-12 1999-09-03

Palabras clave	POLIMORFOS	SOLVATO	PIMETROZINA
----------------	------------	---------	-------------

CLASIFICACIONES INTERNACIONALES DE BÚSQUEDA
A01N43/707

DOCUMENTOS CORRESPONDITES EN OTROS PAÍSES	
EP1177189	
Patente Original	

BASES DE DATOS CONSULTADAS		
EPO	ESPACENET	USPTO

INFORMES DE EXÁMENES Y OTRAS OFICINAS		
Oficina	Fecha	Reivindicaciones

ANTERIORIDADES ENCONTRADAS		
Documento	Relevancia	Reivindicaciones afectadas

LITERATURA NO PATENTES		
Documento no Patentes	Relevancia	Reiv. Afect.

Observaciones	
---------------	--

Fecha del examen	2006-02-03

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



00 33208

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00033208 00000000

Folios: 41

Fecha (AMD): 2000-05-09 16:06:14

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social NOVARTIS AG F.P 1177189 (2000-11-16)
WU 0068222
B1 (2005-12-14)
No. de Identificación _____
Representante Legal (Persona Jurídica) _____
País de Domicilio SUIZA
Departamento o Estado _____
Dirección _____
Ciudad BASILEA Teléfono _____

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre JIMENA ESCOBAR URIBE
Dirección y Domicilio CRA. 11A No. 94-76, OFICINA 305
Ciudad SANTAFÉ DE BOGOTÁ Teléfono 6 162051/61

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es) 1. STEPHAN GUTMANN.
Identificación _____
Dirección 1. BAD SÄCKINGEN, ALEMANIA
Ciudad _____
Teléfono _____

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención 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.

PRIORIDAD REIVINDICADA: SÍ ☒ NO TIPO DE PRIORIDAD: ANDINA ☐ UNIONISTA ☒

(33) País SUIZA Fecha MAYO 12, 1999 (31) No. Solicitud 905/99
SUIZA SEPTIEMBRE 3, 1999 1606/99

Para publicar a los ☒ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C 07 2336/J

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

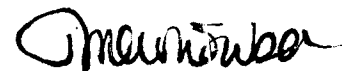
La presente invención se refiere a novedosos solvatos de pimetrozina insecticidamente activos, a un método para producirlos, a composiciones que contienen estos compuestos, a un método para producir estas composiciones, a un método para controlar plagas con estas composiciones, especialmente insectos y miembros de la orden Acarina, particularmente en cultivos de plantas cultivadas.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica No. 17.398	☒
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC No. 17.398	☒
Recibo de la tasa respectiva No. 20.976	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	☐
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista:	
Copia certificada de la primera solicitud:	☐
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	☐
Capítulo descriptivo	☒
Dibujos planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propiedad según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	☐
Otros documentos	☐

SOLICITO LA CONCESIÓN DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA
NOMBRE


JIMENA ESCOBAR URIBE

C.C. 39.779.452 Usaquén.

T.P. No. 68.228

2336

2



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-7

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 00033208 00000000

Folios: 41

Fecha (ACD): 2000-05-09 16:06:14

Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC.

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 20,976
FECHA : MARZO 30 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CECIBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	2245618	10,800,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.00
	TOTAL :	\$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

SOLVATOS DE PIMETROZINA

La presente invención se refiere a novedosos solvatos
5 de pimetrozina insecticidamente activos, a un método para
producirlos, a composiciones que contienen estos compuestos, a
un método para producir estas composiciones, a un método para
controlar plagas con estas composiciones, y a su uso en el
control de plagas animales, especialmente insectos y miembros
10 de la orden *Acarina*, particularmente en cultivos de plantas
cultivadas.

Diferentes solvatos, por ejemplo hidratos, de un
compuesto químico, pueden exhibir propiedades físicas muy
diferentes, que pueden conducir a problemas impredecibles
15 durante la preparación técnica y el procesamiento de estos
compuestos. Las características de estos solvatos con
frecuencia tienen una influencia crucial sobre la capacidad de
separación (filtración), la posibilidad de agitación (volumen
del cristal), la actividad superficial (espumación), la
20 velocidad de secado, la solubilidad, la calidad, la capacidad
de formulación, y la estabilidad al almacenamiento (por
ejemplo, higroscopía), de, por ejemplo, los compuestos
plaguicidamente activos. Por ejemplo, las propiedades de
molienda y formulación, así como la capacidad de manejo de
25 estas mezclas plaguicidas, pueden ser completamente diferentes,

dependiendo de la solvatación respectiva. Debido a que, en las diferentes etapas de síntesis de un proceso de preparación, son importantes diferentes propiedades físicas de los productos de síntesis respectivos, es especialmente conveniente encontrar la forma de solvatación óptimamente adecuada para la etapa de síntesis respectiva.

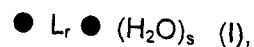
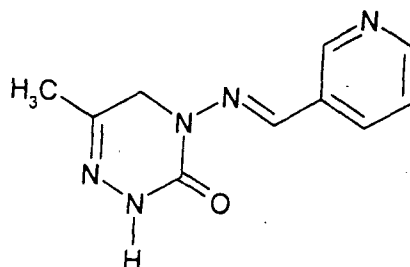
La pimetrozina se conoce, por ejemplo, de la Patente de los Estados Unidos de Norteamérica Número US-P-4931439, en donde se describe la preparación en el Ejemplo P3. Sin embargo, no se puede asumir, a partir de este ejemplo, que el producto obtenido hubiera sido solvatado con etanol, dietiléter, o agua, inclusive cuando el producto hubiera entrado en contacto con etanol, dietiléter, y agua en el transcurso de su preparación. Al final del proceso de preparación, el compuesto se secó, y se utilizó en los ejemplos de formulación como un producto esencialmente exento de agua y exento de solvente. Los parámetros físicos, tales como temperatura, humedad, y presión, que son cruciales para la preparación específica de ciertos solvatos, no se indican en ninguna parte de esta memoria descriptiva de patente.

Por consiguiente, es el objetivo de la presente invención preparar solvatos, en particular hidratos, y sales de estos solvatos de pimetrozina, cuyas características muestren las ventajas mencionadas inicialmente, en especial en la producción y el manejo de mezclas plaguicidas, particularmente

granulados.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se refiere a compuestos de la fórmula:

5

10

en donde:

r y *s*, independientemente uno del otro, significan cualquier valor entre 0.00 y 12.00; y L es metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, butanol terciario, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, etilenglicol, glicerol, acetato de metilo, acetato de etilo, lactato de etilo, butirolactona, carbonato de etileno, carbonato de propileno, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona, N-octil-2-pirrolidona, N-decil-2-pirrolidona, acetona, butanona, metil-
15 sobutilcetona, metilpropilcetona, acetofenona, ciclohexanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metilterbutiléter, etanolamina, piridina, clorobenceno, tolueno, xileno, o tetrametilurea;

20

con la condición de que *r* y *s* no sean simultáneamente

0;

en cada caso, en forma libre o en forma de sal, y sus tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal, un método para la preparación y uso de estos compuestos, sus sales y sus tautómeros; plaguicidas cuyo ingrediente activo se selecciona a partir de estos compuestos y sus tautómeros, y un método para la preparación de estos solvatos, y cuando sea apropiado, sus sales, un método para la preparación de estas composiciones, y su uso.

En lo siguiente, se hará una distinción entre el compuesto de la fórmula (I) o las sales del mismo, en donde r y s no son simultáneamente 0, y pimetrozina, que es el compuesto exento de solvato (en donde r y s son simultáneamente 0).

Los compuestos de la fórmula (I) tienen varios centros básicos. Por consiguiente, pueden formar sales de adición de ácido. Estas se forman, por ejemplo, con ácidos inorgánicos fuertes, tales como ácidos minerales, por ejemplo ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido nitroso, un ácido fosfórico, o un ácido halohídrico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como ácidos alcancarboxílicos de 1 a 4 átomos de carbono opcionalmente sustituidos, por ejemplo, por halógeno, por ejemplo ácido acético, tal como ácidos dicarboxílicos opcionalmente insaturados, por ejemplo ácido oxálico, malónico, succínico, maleico, fumárico, o ftálico, tales como ácidos

hidroxicarboxílicos, por ejemplo ácido ascórbico, láctico, málico, tartárico, o cítrico, o ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos alcansulfónicos de 1 a 4 átomos de carbono o arilsulfónicos opcionalmente sustituidos, por ejemplo, por halógeno, por ejemplo ácido metansulfónico o p-toluensulfónico. En adición, los compuestos de la fórmula (I) pueden formar sales con bases. Las sales con bases adecuadas son, por ejemplo, sales de metal, tales como sales de metal alcalino o alcalinotérreo, por ejemplo sales de sodio, potasio, o magnesio, o sales con amoníaco o una amina orgánica, tal como morfolina, piperidina, pirrolidina, o mono-, di-, ó tri-alquilamina inferior, por ejemplo etil-, dietil-, trietil-, ó dimetil-propilamina, o una mono-, di-, ó tri-hidroxialquilamina inferior, por ejemplo mono-, di-, ó tri-etanolamina.

En este caso, por una parte, se prefieren las sales con ácido fórmico, ácido acético, y ácido láctico, y por otra parte, se prefieren las sales de sodio, potasio, magnesio, y calcio, especialmente las sales de sodio. Por otra parte, también se prefiere el compuesto de la fórmula (I) en forma libre, es decir, en donde r es 0.

Los compuestos (I) también tienen un grupo ácido, y por consiguiente, pueden formar sales con bases. Las sales con bases adecuadas son, por ejemplo, sales de metal, incluyendo complejos de metal, tales como sales de metal alcalino o de metal alcalinotérreo, por ejemplo sales de sodio, potasio, o

magnesio, pero también sales complejas con, por ejemplo, cobre, níquel, o hierro; o sales con amoníaco o una amina orgánica, tal como morfolina, piperidina, pirrolidina, una mono-, di-, ó tri-alquilamina inferior, por ejemplo etil-, dietil-, trietil-,
5 ó dimetil-propilamina, o una mono-, di-, ó tri-hidroxialquilamina inferior, por ejemplo mono-, di-, ó tri-etanolamina. Si es apropiado, además se pueden formar las sales internas correspondientes. Las sales agroquímicamente convenientes son las preferidas en el contexto de la invención.

10 Anteriormente en la presente y más adelante en la presente, los compuestos (I) en forma libre, deben entenderse incluyendo a las sales correspondientes, y las sales deben entenderse incluyendo a los compuestos libres (I). En cada caso, se prefiere en general la forma libre.

15 Otros compuestos preferidos de la fórmula (I) se caracterizan porque L significa metanol; especialmente en donde L es metanol, y s es 0.

Los compuestos adicionalmente preferidos de la fórmula (I) se caracterizan porque r significa 0, y s es 0.5, <
20 0.75, 1, 1.25, 1.5, 1.75, 2, 2.25, 2.5, 2.75, 3, 3.25, 3.5, 3.75, 4, 5, 6, 7, 8 ó 12;

especialmente 1, 1.25, 1.5, 1.75, 2, 2.25, 2.5, 2.75, 3, 3.25, 3.5, 3.75, 4, 5, 6, 7, 8 ó 12;

en particular 1.5, 1.75, 2, 2.25, 2.5, 2.75, 3, 3.25,
25 3.5, 3.75, 4, 5, ó 6;

más preferiblemente 1.5, 2, 2.5, 3, 3.5, ó 4;
más particularmente 2.

Un objeto especialmente preferido de la invención es
5 un compuesto de la fórmula (I), en donde r es 0, y s es 2
(dihidrato de pimetrozina), y que muestra las reflexiones
enlistadas en la tabla 1, en el patrón de polvo de rayos X.

Tabla 1: Datos de polvo de rayos X de dihidrato de pimetrozina

	<u>d (Å)</u>	<u>Intensidad</u>
10	12.4	promedio ✓ 7
	7.1	débil
	6.8	muy fuerte ✓
	6.3	débil
	6.2	promedio ✓ 7
15	5.82	muy débil
	5.40	promedio ✓ 7
	5.14	muy débil
	4.85	débil
	4.68	muy débil
20	4.52	muy débil
	4.31	muy débil
	4.14	débil
	4.08	muy débil
	3.96	muy débil
25	3.83	muy débil

	3.71	muy débil
	3.58	débil
	3.47	muy fuerte
	3.44	muy fuerte
5	3.25	fuerte✓
	3.21	débil
	3.09	promedio
	3.03	débil
	2.99	débil
10	2.90	débil
	2.82	débil
	2.76	débil
	2.57	débil

- 15 Un objeto preferido adicional de la invención es un compuesto de la fórmula (I) en donde **r** es 1 y **s** es 0, y L es metanol (metanolato de pimetrozina), y que muestra las siguientes reflexiones en el patrón de polvo de rayos X:

Tabla 2: Datos de polvo de rayos X de metanolato de pimetrozina

20	d (Å)	Intensidad
	8.4	fuerte✓
	6.3✓	muy débil
	5.96	débil
	5.51	muy débil
25	5.31	muy débil

	5.18	muy débil
	4.97	muy débil
	4.81	muy débil
	4.55	promedio
5	4.42	débil
	4.22	débil
	3.94	muy débil
	3.75	muy débil
	3.48	fuerte✓
10	3.38	muy fuerte
	3.25	débil
	3.09	débil
	3.04	débil
	2.98	muy débil
15	2.94	muy débil
	2.84	muy débil
	2.81	muy débil
	2.77	muy débil
	2.74	muy débil
20	2.71	muy débil
	2.66	débil

Un objeto adicional de la invención se refiere a una nueva modificación de pimetrozina (posteriormente referida en la presente como modificación β de pimetrozina), en donde **r** y **s**

	2.95	muy débil
	2.82	promedio
	2.65	débil
	2.60	muy débil
5	2.53	muy débil
	2.48	muy débil
	2.30	débil
	2.25	muy débil
	2.20	muy débil
10	2.11	débil
	2.07	débil
	2.00	débil

Los datos de polvo de rayos X de la modificación α conocida de pimetrozina también se dan en seguida para una comparación:

Tabla 4: Datos de polvo de rayos X de modificación α de pimetrozina

	$d(\text{\AA})$	Intensidad
20	11.9	débil
	9.7	promedio
	7.6	promedio
	6.4	muy débil
	6.1	promedio
25	5.95	promedio

	5.65	promedio
	5.26	promedio
	4.76	débil
	4.49	débil
5	4.43	muy débil
	4.37	débil
	4.11	fuerte✓
	3.99	muy fuerte✓
	3.81	débil
10	3.57	débil
	3.52	débil
	3.48	fuerte
	3.34	muy fuerte✓
	3.26	muy débil
15	3.14	fuerte✓
	3.07	muy débil
	2.99	promedio
	2.90	débil
	2.82	promedio
20	2.80	débil
	2.75	débil
	2.66	muy débil
	2.61	débil

hizo con un difractómetro de polvo X'Pert (Philips) con una cámara TTK (Anton Paar), utilizando radiación CU ($\lambda = 1.54060\text{\AA}$). Las mediciones del dihidrato de la Tabla 1 y de los anhidratos de las tablas 3 y 4 se hicieron a temperatura ambiente. La medición del metanolato de la tabla 2 se hizo con enfriamiento ($5^{\circ}\text{C}-8^{\circ}\text{C}$) sobre una muestra sellada con película Kapton.

Ahora, de una manera sorprendente, se ha demostrado que la pimetrozina seca, exenta de agua y exenta de solvente, está en una posición para recuperar de una manera reversible agua o un solvente a partir de la atmósfera o durante la mezcla o molienda. Se encontró que, a temperatura ambiente y con una humedad relativa menor de aproximadamente el 10 por ciento, la pimetrozina que contiene agua desprende el agua completamente, y en una humedad relativa de entre el 60 por ciento y el 70 por ciento, recupera de aproximadamente el 16 al 17 por ciento en peso de agua nuevamente. El contenido de agua anteriormente mencionado del 16 al 17 por ciento en peso corresponde muy bien a un dihidrato. Inclusive las formulaciones plaguicidas que contienen pimetrozina exenta de agua y exenta de solvente, recupera normalmente agua o el solvente correspondiente de la atmósfera cuando se dejan reposar bajo una presión de vapor suficientemente alta. Esta solvatación, en particular absorción de agua, de las formulaciones, en particular de los polvos y granulados dispersables en agua, especialmente granulados,

Varadachari Hr.

puede conducir a problemas cuando se manejan y almacenan las composiciones plaguicidas, pero estos problemas no se presentan si se introduce pimetrozina en la forma de un solvato definido o en la forma de la modificación β anteriormente mencionada en el proceso de producción de la composición plaguicida, o se produce de una manera apropiada durante el proceso de producción anteriormente mencionado. Por ejemplo, estas formulaciones ya no se tienen que mantener en recipientes herméticos, y una vez que se han abierto los recipientes, no se tienen que sellar herméticamente de nuevo con el objeto de retener la calidad de los artículos.

En adición, la producción de las formulaciones de acuerdo con la invención, con un contenido de agua relativamente alto, o cuando se utiliza la modificación β de pimetrozina, es más simple que la producción de formulaciones esencialmente exentas de agua, o cuando se utiliza la modificación α , debido a que la producción en general es afectada de tal manera que se agrega agua en el paso de formulación, y subsecuentemente se tiene que remover de nuevo. El remover de una manera completa o casi completa el agua, involucra inconvenientes considerables, tales como un alto consumo de energía, tiempos de producción prolongados, mayor uso del equipo, etcétera.

Una formulación lista de pimetrozina con un contenido de agua de aproximadamente el 10 por ciento en peso bajo

condiciones normales, tiene solamente una tendencia muy insignificante a absorber humedad del aire, mientras que una formulación cuya proporción de agua se haya reducido durante la producción hasta menos del 5 por ciento, o que se haya
5 fabricado empezando utilizando ingredientes esencialmente exentos de agua, es muy higroscópica. El almacenamiento a largo plazo de las formulaciones que tienen un contenido de agua menor de aproximadamente el 5 por ciento en peso, requiere de empaque que esté completamente sellado contra el vapor de agua,
10 y se tiene que producir utilizando un esfuerzo correspondientemente mayor. Cuando se desecha, presenta problemas mayores que los recipientes convencionales que no son absolutamente a prueba de agua.

En adición, los empaques cuyo contenido no se puede
15 utilizar todo a la vez, en general no se vuelven a sellar de una manera suficientemente a prueba de agua. Por consiguiente, es inevitable que la formulación exenta de agua absorba agua.

Cuando una formulación exenta de agua absorbe agua, se reduce su calidad de una manera significativa dentro de un
20 período de semanas a meses. Esto significa que las cifras oficiales relacionadas con la proporción del ingrediente activo en la formulación ya no se pueden observar bajo algunas circunstancias. Por consiguiente, la absorción de agua por parte de la formulación exenta de agua puede conducir a
25 artículos no vendibles cuando sean almacenados por el

fabricante o el menudista, sin que se descomponga realmente el ingrediente activo.

5 Espontaneidad: La calidad del granulado dispersable en agua se determina hasta un grado sustancial por su propiedad para el usuario. De acuerdo con lo anterior, el usuario espera que el granulado se descomponga completamente en sus partículas primarias dentro de unos cuantos minutos de mezcla del licor de rociado. Cuando se formula pimetrozina, esta característica, conocida como espontaneidad, no se obtiene si se utiliza una
10 formulación que esté originalmente exenta de agua o que sea de un bajo contenido de agua, pero que haya absorbido agua nuevamente durante el almacenamiento. En contraste con las formulaciones esencialmente exentas de agua, después de almacenar durante un período de 7 días en el aparato de prueba
15 apropiado, las formulaciones de acuerdo con la invención muestran una descomposición completa de los granulados en las partículas primarias dentro de unos cuantos minutos.

Tabla 5: Comparación de la espontaneidad después de diferentes
20 **períodos (prueba realizada de una manera análoga a CIPAC MT 174); granulados de pimetrozina con un contenido de ingrediente activo del 50 por ciento en peso**

	% en peso de agua	Espontaneidad sin almacenamiento en %		Espontaneidad después de almacenamiento abierto durante 7 días a temperatura ambiente en %		
tiempo		0.5 min	1 min	% en peso de agua	0.5 min	1 min
granulado I	5.1	95	98	13.2	25	31
granulado II	10.3	96	98	13.7	93	98

Cuando se mide la espontaneidad, primero se produce el licor de rociado agitando la composición en un cilindro en la presencia de una cantidad especificada de agua. Después de 5 0.5 o de 1 minuto, se succiona el 90 por ciento del licor, y el resto se concentra por evaporación. El residuo obtenido se evalúa después del secado, y se calcula la cantidad del material originalmente utilizado que se suspende en el licor en %.

10 Sin tomar en cuenta el contenido de agua, los granulados tienen la composición indicada en el siguiente ejemplo F10, y se producen como se indica en el mismo.

Otras ventajas de las formulaciones reivindicadas de acuerdo con la invención son una mejor capacidad de suspensión 15 en el licor de rociado, y una mejor posibilidad de dispersión.

Se puede producir un solvato deseado antes de que se

combine la sustancia activa con los excipientes de formulación, o de una manera alternativa, durante el procedimiento de formulación, poniéndolo adecuadamente en contacto con la cantidad deseada de cierto solvente o con agua. Por
5 consiguiente, es posible utilizar diferentes procesos para la producción específica de estos solvatos o de composiciones plaguicidas que contengan estos solvatos. La pimetrozina exenta de agua y exenta de solvente, por ejemplo, se puede agitar o moler en una mezcladora, en una atmósfera que tenga un
10 contenido definido de agua o solvente, hasta que se obtenga la forma deseada. O, la pimetrozina con un alto contenido de agua o solvente, que resulte de un proceso de producción, o que se haya producido mezclando esencialmente pimetrozina exenta de solvente y exenta de agua específicamente con una mayor
15 cantidad de solvente o agua, se seca en una secadora hasta el contenido deseado de agente de solvatación. Estos métodos para producir solvatos, especialmente hidratos, o pimetrozina, por consiguiente, forman un objeto adicional de la presente invención.

20 Las formulaciones adecuadas para los compuestos de la fórmula (I) se describen, por ejemplo, en la Patente de los Estados Unidos de Norteamérica Número US-P-4931439. Todas se caracterizan porque no contienen pimetrozina en una forma solvatada.

25 Las formulaciones, es decir, los agentes, las

preparaciones, o las composiciones que contienen un ingrediente activo de la fórmula (I), y uno o más excipientes de formulación sólidos y/o líquidos, de la misma manera forman un objeto de la invención. Se producen, por ejemplo, de una manera
5 conocida por sí misma, mediante la mezcla íntima y/o la molienda del ingrediente activo de la fórmula (I) con los excipientes de formulación, tales como solventes o vehículos sólidos. Un nuevo método de preparación alternativo, que forma similarmente un objeto de la invención, consiste en agregar el
10 agente de solvatación durante el procedimiento de formulación, formando de esta manera el solvato durante el proceso de formulación. En una variante importante de este método, el agente de solvatación se puede agregar en exceso, y se puede remover nuevamente al final, por ejemplo, por evaporación, para
15 dar el valor deseado. En el caso de ciertas mezclas, este procedimiento puede simplificar de una manera significativa el proceso de producción. Las composiciones correspondientes producidas mediante este método similarmente forman un objeto de la invención.

20 Adicionalmente se pueden utilizar compuestos de actividad superficial (tensoactivos) para la preparación de las formulaciones. Los ejemplos de los solventes y vehículos sólidos se dan, por ejemplo, en la Patente de los Estados Unidos de Norteamérica Número US-P-4931439. Dependiendo del
25 tipo de ingrediente activo de la fórmula (I) que se vaya a

formular, los compuestos de actividad superficial adecuados son tensoactivos no iónicos, catiónicos, y/o aniónicos, y mezclas de tensoactivos que tengan buenas propiedades dispersantes y humectantes. Los ejemplos de los tensoactivos aniónicos, no iónicos, y catiónicos adecuados, se enlistan, por ejemplo, en la Patente de los Estados Unidos de Norteamérica Número US-P-4931439.

Las formulaciones insecticidas y acaricidas de acuerdo con la invención, como regla, contendrán del 0.1 al 99 por ciento en peso, especialmente del 1 al 95 por ciento en peso, de un compuesto de la fórmula (I), del 1 al 99.9 por ciento en peso, especialmente del 5 al 99.8 por ciento en peso, de un excipiente de formulación sólido o líquido, y del 0 al 25 por ciento en peso, especialmente el 0.1 al 25 por ciento en peso de un tensoactivo. Igualmente se prefieren las formulaciones insecticidas y acaricidas que contengan del 0.1 al 94 por ciento en peso, especialmente del 0.1 al 90 por ciento en peso, de pimetrozina, del 5 al 30 por ciento en peso de agente de solvatación, del 1 al 94.9 por ciento en peso, especialmente del 5 al 90 por ciento en peso, de un excipiente de formulación sólido o líquido, y del 0 al 30 por ciento en peso, especialmente del 0.1 al 25 por ciento en peso de un tensoactivo.

Las formulaciones plaguicidas, especialmente los granulados, que se prefieren en particular, son aquéllas que

contienen del 3 al 5 por ciento en peso, o aquellas que contienen del 30 al 50 por ciento en peso de pimetrozina. Igualmente se prefieren los polvos dispersables en agua, que contengan del 25 al 50 por ciento en peso de pimetrozina.

5 También se prefieren las formulaciones plaguicidas, en particular granulados, que contengan del 8 al 40 por ciento en peso, de preferencia del 8 al 20 por ciento en peso, especialmente del 8 al 14 por ciento en peso de agua. Igualmente se prefieren las formulaciones plaguicidas, en
10 particular granulados, que contengan del 40 al 60 por ciento en peso de pimetrozina, especialmente el 50 por ciento en peso de pimetrozina.

También se prefieren los polvos humectables que contengan del 6 al 20 por ciento en peso, especialmente del 8
15 al 12 por ciento en peso, de agua, y del 20 al 30 por ciento en peso de pimetrozina, especialmente el 25 por ciento en peso de pimetrozina.

Cuando se especifica la cantidad de contenido de agua, el hecho de que los excipientes de formulación mismo con
20 frecuencia tengan cierto contenido residual de agua, se debe tomar en consideración. Por esta razón, el contenido de agua de las formulaciones realmente aseverado es en general un poco más alto que aquél calculado a partir de la composición de los hidratos. En general, el contenido medido es del 1 al 5 por
25 ciento en peso más alto que los calculados. Anteriormente en la

presente y posteriormente en la presente, se entiende que una formulación de pimetrozina que está esencialmente exenta de agua o de un bajo contenido de agua, es una mezcla plaguicida que contiene cuando mucho el 6 por ciento en peso de agua, 5 basándose en la mezcla total.

Aunque se prefiere formular los productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente utilizará formulaciones diluidas. Las composiciones también pueden contener ingredientes adicionales, tales como estabilizantes, 10 por ejemplo, cuando sea apropiado, aceites vegetales epoxidados (aceite de coco epoxidado, aceite de semilla de colza, o aceite de frijol de soya), activadores, antiespumantes, normalmente aceite de silicona, conservadores, reguladores de viscosidad, aglutinantes, viscosantes, así como fertilizantes u otros 15 ingredientes activos.

Los compuestos de la fórmula (I) normalmente se aplican a las plantas o al lugar de las mismas en concentraciones de 0.001 a 1.0 kilogramos/hectárea, de preferencia de 0.1 a 0.6 kilogramos/hectárea. La concentración 20 requerida para lograr la acción deseada, se puede determinar mediante experimentación. Dependerá del tipo de acción, de la etapa de desarrollo de la planta cultivada y de la plaga, así como de la aplicación (lugar, tiempo, método), y como un resultado de estas variables, puede variar sobre un amplio 25 rango. Como con el tipo de composiciones, los métodos de

aplicación, tales como rociado, atomización, espolvoreo, humectación, dispersión, o riego, se seleccionan de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalecientes.

Las composiciones que contienen los compuestos de la fórmula (I), tienen excelentes propiedades insecticidas, haciéndolas adecuadas para aplicarse en cultivos de plantas cultivadas, especialmente en cereales, algodón, frijoles de soya, remolacha azucarera, caña de azúcar, plantaciones, colza, maíz, y arroz. También se entenderá que los cultivos significan aquellos cultivos que se han hecho tolerantes a plaguicidas mediante métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Las plagas, especialmente los insectos y los miembros de la orden *Acarina*, que se pueden controlar con las formulaciones de acuerdo con la invención, se describen, por ejemplo, en las Patentes de los Estados Unidos de Norteamérica Números US-P-931439 y US-P-46145.

La invención se ilustra mediante los siguientes ejemplos no limitantes.

20 Ejemplos de Formulación

% se refiere a porcentajes en peso.

<u>Ejemplo F1: Concentrados en emulsión</u>	a)	b)	c)
Metanolato de pimetrozina	2.5%	4.0%	0.5%
Dodecilbencensulfonato de calcio	5%	8%	6%

	Polietilenglicoléter de aceite de ricino (36 moles de óxido de etileno)	5%	-	-
	Tributilfenolpolietilenglicoléter (30 moles de óxido de etileno)	-	4%	4%
5	Acido láctico	80%	71%	-
	Acido fórmico	-	-	64.5%
	N-octilpirrolidona	7.5%	5%	20%

Se pueden preparar emulsiones de cualquier
 10 concentración deseada a partir de estos concentrados mediante su dilución con agua.

<u>Ejemplo F2: Soluciones</u>		a)	b)	c)
	Trihidrato de pimetrozina	30%	20%	10%
15	Acido fórmico	70%	-	-
	Acido acético	-	80%	-
	Acido láctico	-	-	90%

<u>Ejemplo F3: Soluciones</u>		a)	b)	c)
20	Metanolato de pimetrozina	30%	20%	10%
	Acido fórmico	70%	-	-
	Acido acético	-	80%	-
	Acido láctico	-	-	90%

Las soluciones son adecuadas para utilizarse en la
 25 forma de microgotas.

<u>Ejemplo F4: Granulados recubiertos</u>				
	a)	b)	c)	
Pimetrozina *CH ₃ OH	5%	3%	2.5%	
Acido silícico altamente dispersado	6%	5%	4%	
Polietilenglicol 300	5%	4%	3%	
5 Carbonato de calcio	84%	88%	90.5%	

El ingrediente se suspende en polietilenglicol 300, se rocía sobre el vehículo, y los granulados subsecuentemente se espolvorean con la sílice.

10

<u>Ejemplo F5: Polvos Secos</u>			a)	b)
	Dihidrato de pimetrozina		2%	5%
	Acido silícico altamente dispersado		1%	5%
	Talco		97%	-
15	Caolín		-	90%

Se obtienen polvos secos listos para usarse mediante la mezcla íntima de los vehículos con el ingrediente activo, y subsecuentemente se muelen.

20

<u>Ejemplo F6: Polvos Humectables</u>				
	a)	b)	c)	
	Dihidrato de pimetrozina	25%	50%	75%
	Ligninsulfonato de sodio	5%		8%
	Laurilsulfonato de sodio	3%	-	-
25	Di-isobutilnaftalensulfonato	-	6%	8%

de sodio.

Octilfenolpolietilenglicoléter	-	2%	-
--------------------------------	---	----	---

(7 a 8 moles de óxido de etileno).

Acido silícico altamente	5%	10%	9%
--------------------------	----	-----	----

5 dispersado.

Caolín	62%	27%	-
--------	-----	-----	---

Los compuestos se mezclan con los auxiliares, y esta mezcla se muele en un molino adecuado para dar polvos humectables, los cuales se pueden diluir con agua, para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

<u>Ejemplo F7: Granulado Humectable</u>				
	a)	b)	c)	
	Dihidrato de pimetrozina	30%	40%	85%
15	Ligninsulfonato de sodio	30%	30%	12.8%
	Dibutilnaftalensulfonato de sodio	5%	-	2.0%
	Polioxialquilato de bloque	5%	7.5%	-
	Vehículo orgánico polimérico	5%	-	-
	Antiespumante	0.1%	0.2%	0.2%
20	Caolín	24.9%	-	-
	Talco	-	22.3%	-

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los auxiliares, y la mezcla se humedece con agua. Esta mezcla se extruye, se granula, y luego se seca en una corriente de aire.

Ejemplo F8: Concentrado en Suspensión

	Dihidrato de pimetrozina	40%
	Propilenglicol	5%
	Nonilfenolpolietilenglicoléter	6%
5	(15 moles de óxido de etileno).	
	Trietanolamina de fosfato de	7%
	triestirilfenolpoliglicoléter.	
	Heteropolisacárido	1%
	1,2-benzisotiazol-3-ona	0.2%
10	Aceite de silicona en la forma de	0.8%
	una emulsión acuosa al 75%.	
	Agua	40%

El ingrediente activo finamente molido se mezcla
 15 íntimamente con los auxiliares. De esta manera, se obtiene un
 concentrado en suspensión a partir del cual se pueden preparar
 suspensiones de cualquier concentración deseada mediante su
 dilución con agua.

20 **Ejemplo F9: Preparación de un granulado dispersable en agua del
 compuesto de la fórmula (I):**

Las siguientes sustancias se mezclan y
 subsecuentemente se muelen utilizando un molino convencional:

- 60% pimetrozina anhidra.
- 25 5% dibutilnaftalensulfonato de sodio.

- 10% ligninsulfonato de sodio.
5% sulfato de sodio.
15% vehículo orgánico polimérico.
0.1% ácido perfluoroalquilfosfórico.
5 4.9% dióxido de silicio.

La mezcla subsecuentemente se mezcla con del 35 al 45 por ciento en peso de agua, y se granula. Después de secarse hasta una humedad residual del 8 al 12 por ciento en una
10 secadora continua comercial, el granulado obtenido se tamiza hasta un tamaño de grano definido. Se obtienen granulados, que contienen al compuesto de la fórmula (I) en una forma hidratada.

15 **Ejemplo F10: Preparación de un granulado dispersable en agua del compuesto de la fórmula (I):**

Se mezclan las siguientes sustancias.

- 50% pimetrozina anhidra.
5% dibutilnaftalensulfonato de sodio.
20 10% ligninsulfonato de sodio.
5% sulfato de sodio.
15% vehículo orgánico polimérico.
0.1% ácido perfluoroalquilfosfórico.
% restante dióxido de silicio.

La mezcla subsecuentemente se mezcla con del 50 al 70 por ciento en peso de agua, y se granula. Después de secarse hasta una humedad residual del 8 al 12 por ciento en una secadora continua comercial, el granulado obtenido se tamiza hasta un tamaño de grano definido. Se obtienen granulados, que contienen al compuesto de la fórmula (I) en una forma hidratada.

Ejemplos de preparación de solvatos de la fórmula (I), y de formulaciones que contienen estos solvatos:

Ejemplo P1: Preparación del compuesto de la fórmula (I), en donde r es 0, y s es 2 (dihidrato de pimetrozina):

La pimetrozina se almacena en un recipiente cerrado que tenga una atmósfera controlada del 89 por ciento de humedad relativa durante un período de 10 días. Luego se remueve el producto del recipiente, y se equilibra en una atmósfera de laboratorio. A una termo-escala, el producto obtenido muestra una pérdida de peso del 13.9 por ciento entre la temperatura ambiente y 125°C, que corresponde a dos moléculas de agua (pérdida teórica del 14.2 por ciento).

En el difractómetro de rayos X utilizando radiación CU (λ 1.54060Å) a temperatura ambiente, se encuentra el patrón reproducido en la tabla 1.

Ejemplo P2: Preparación del compuesto de la fórmula (I), en donde **r** es 0, y **s** es 2 (dihidrato de pimetrozina):

En una mezcladora, se rocía una cantidad definida de agua (16 por ciento, basándose en la pimetrozina exenta de 5 agua), uniformemente sobre el ingrediente activo con enfriamiento, y el polvo subsecuentemente se agita lentamente hasta que se enfríe a temperatura ambiente.

Ejemplo P3: Preparación del compuesto de la fórmula (I), en 10 donde **r** es 0, y **s** es 2 (dihidrato de pimetrozina):

En una mezcladora de acción rápida, se rocía uniformemente una cantidad definida de agua sobre una mezcla del ingrediente activo y los excipientes de la formulación, y después de un almacenamiento interino, el polvo se procesa 15 adicionalmente hasta la formulación final.

Ejemplo P4: Preparación del compuesto de la fórmula (I), en donde **r** es 0, y **s** es 2 (dihidrato de pimetrozina):

En un recipiente con agitador, se suspende 20 pimetrozina en agua en la presencia de los componentes de formulación restantes, y la mezcla subsecuentemente se rocía finamente en una corriente de aire, y se seca hasta una humedad residual del 6 al 15 por ciento.

25 **Ejemplo P5:** 0.5 gramos de pimetrozina se agitan durante 9

días a 25°C en 2.5 gramos de agua; luego se filtra la suspensión. Se obtiene el dihidrato, que muestra termogravimétricamente una pérdida de peso del 12 por ciento en peso.

5

Ejemplo P6: Preparación del compuesto de la fórmula (I), en donde **r** es 1, **s** es 0, y **L** es metanol (metanolato de pimetrozina):

Se agregan 0.488 gramos de pimetrozina exenta de agua
10 a 0°C, a 1.909 gramos de metanol exento de agua, y se agitan durante 7 días a 0°C. La suspensión se filtra a través de una frita sin aplicar vacío. Inmediatamente se mide una muestra de la torta del filtro en el difractómetro de rayos X. Se obtiene el patrón dado en la tabla 2. Un examen termogravimétrico entre
15 0°C y 100°C, muestra una pérdida de peso del 12.4 por ciento, que corresponde a una molécula de metanol (teoría: 12.8 por ciento en peso).

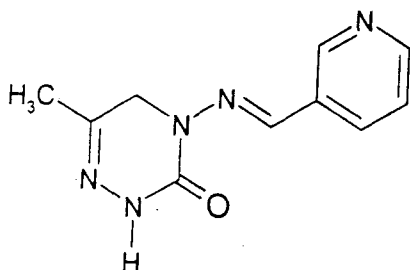
NOVEDAD DE LA INVENCION

Habiendo descrito la invención que antecede, se considera como una novedad, y por lo tanto, se reclama como
5 propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula:

10



• L_r • [H₂O]_s (I),

15

en donde:

r y **s**, independientemente uno del otro, significan cualquier valor entre 0.00 y 12.00; y L es metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, butanol terciario,
20 ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, etilenglicol, glicerol, acetato de metilo, acetato de etilo, lactato de etilo, butirolactona, carbonato de etileno, carbonato de propileno, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona, N-octil-2-
25 pirrolidona, N-decil-2-pirrolidona, acetona, butanona, metili-

sobutilcetona, metilpropilcetona, acetofenona, ciclohexanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metilterbutiléter, etanolamina, piridina, clorobenceno, tolueno, xileno, o tetrametilurea;

con la condición de que r y s no sean simultáneamente 0,

cada uno en forma libre o en forma de sal, y los tautómeros de los mismos, cada uno en forma libre o en forma de sal.

2. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde L significa metanol.

3. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde r es 0, y s es 2.

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.

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.

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.

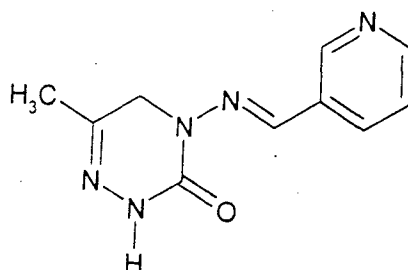
7. Un método para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1, en donde el compuesto no solvatado, plaguicidamente activo, se pone en contacto con el agente de solvatación.

8. Una composición plaguicida de acuerdo con la reivindicación 4, producida mediante el método descrito en la reivindicación 6.

9. El uso de una composición de la reivindicación 4, para el control de plagas.

RESUMEN DE LA INVENCION

Se describen compuestos de la fórmula



• L, • [H₂O]_s (I),

en donde:

r y *s*, independientemente uno del otro, significan cualquier valor entre 0.00 y 12.00; y L es metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, butanol terciario, ciclohexanol, alcohol tetrahydrofurfurílico, etilenglicol, glicerol, acetato de metilo, acetato de etilo, lactato de etilo, butirolactona, carbonato de etileno, carbonato de propileno, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona, N-octil-2-pirrolidona, N-decil-2-pirrolidona, acetona, butanona, metil-
sobutilcetona, metilpropilcetona, acetofenona, ciclohexanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahydrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metilterbutiléter, etanolamina, piridina, clorobenceno, tolueno, xileno, o tetrametilurea;

con la condición de que **r** y **s** no sean simultáneamente
0;

en cada caso, en forma libre o en forma de sal, y sus
tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal, un
5 método para la preparación y uso de estos compuestos, sus sales
y sus tautómeros; plaguicidas cuyo ingrediente activo se
selecciona a partir de estos compuestos y sus tautómeros, y un
método para la preparación de estos solvatos, y cuando sea
apropiado, sus sales, un método para la preparación de estas
10 composiciones, y su uso.

* * * * *

**EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD:

(51) INT. CL.: C 07

(22) FECHA DE
PRESENTACIÓN:

(71) SOLICITANTE: **NOVARTIS AG**
Domiciliada en Basilea, Suiza.

(30) PRIORIDAD: **SÍ**
(31) No. DE SOLICITUD: 905/99
1606/99

(72) INVENTORES: **STEPHAN GUTMANN** (Bad Säckingen,
Alemania) .

(32) FECHA DE **Mayo 12, 1999**
PRESENTACIÓN: **Septiembre 3, 1999**

(33) PAÍS: **SUIZA**

(74) APODERADO: **JIMENA ESCOBAR URIBE**

(54) 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.**

(57) RESUMEN:

La presente invención se refiere a novedosos solvatos de pimetrozina insecticidamente activos, a un método para producirlos, a composiciones que contienen estos compuestos, a un método para producir estas composiciones, a un método para controlar plagas con estas composiciones, especialmente insectos y miembros de la orden Acarina, particularmente en cultivos de plantas cultivadas

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN/TRÁMITE

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00033208 00000000 Folios: 41
Fecha (AMD): 2000-05-09 16:06:14
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Patente de Invención



Modelo de Utilidad



- | | |
|---|--------------------------|
| ☒ Nombre e identificación del solicitante — 1 | ☐ |
| ☒ Nombre e identificación del inventor — 1 | ☐ |
| ☒ Título o nombre de la invención — 1 | ☐ |
| ☒ Descripción — 3 | ☐ |
| ☒ Relvindicaciones — 34 | ☐ |
| ☒ Resumen — 1 | ☐ |
| ☒ Comprobante de pago — 2 | ☐ |

COMPLETA

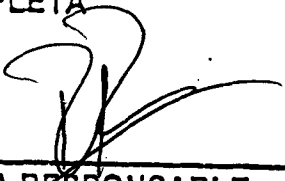
INCOMPLETA

Diseño Industrial ☐

- ☐ Nombre e identificación del solicitante
- ☐ Nombre e identificación del inventor o diseñador
- ☐ Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse
- ☐ Representación gráfica
- ☐ Comprobante de pago

COMPLETA

INCOMPLETA


FIRMA RESPONSABLE.

Fecha _____

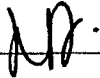
INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-33208 .

Fecha: 11 de Mayo del 2000 .

Se certifica que:

Desde fecha 16 de Abril de 1997 ,
del folio 90.643 al folio 90.650
del libro de Protocolo N^o 311 , obra el
poder N^o 17398 conferido por NOVARTIS AG
(NOVARTIS SA) (NOVARTIS INC)
domiciliado(a) en Basilea, Suiza .
al doctor Jimena Escobar Uribe y/o Ignacio
Escobar Uribe .
Representante en Santafé de Bogotá D.C. los
mismos .
Facultad para desistir y sustituir si .

Revisado  .



DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 2000-33208

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- | | | |
|--|--|--|
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94). |
| SI ☒ | NO ☐ | NO APLICABLE ☐ Presentó, en forma correcta, el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y el Decreto 298 del 17 de febrero de 1999). |
| SI ☒ | NO ☐ | EXTEMPORANEAMENTE ☐ Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París. |
| SI ☐ | NO ☒ | NO APLICABLE ☐ Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI ☐ | NO ☒ | NO APLICABLE ☐ Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI ☐ | NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

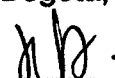
OBSERVACIONES JURÍDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

SI ☐ NO ☒ Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,

SI ☐ NO ☒ Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D.C., 11 de Mayo del 2000


EXAMINADOR JURIDICO.

PRIMER EXAMEN DE FORMARadicación no 0-33208Concepto Técnico no 1170 Clasificación Internacional de Patentes AOIN 43/707

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b).
- SI ☐ NO ☒ Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c).
- SI ☐ NO ☐ Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94).
- SI ☒ NO ☐ Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980).
- SI ☐ NO ☒ Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d).
- SI ☐ NO ☒ Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94.
- SI ☐ NO ☒ Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94.
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☐ NO ☒ **CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS**

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)Santa Fe de Bogotá, D.C., 21 - 07 - 00EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE N° 00-33208
CONCEPTO TÉCNICO N° 1170

IPC: A01N43/707

Las siguientes son las observaciones que se desprenden del primer examen de forma:

Se debe aclarar tanto en la descripción como en las reivindicaciones el significado técnico de los compuestos (I) "**en forma libre**", en el folio 8 la redacción es tan confusa que no se entiende la idea que se quiere expresar, por ejemplo, " los compuestos (I) en forma libre, deben entenderse incluyendo a las sales correspondientes, y las sales deben entenderse incluyendo a los compuestos libres ", por lo tanto se debe aclarar en que consiste un compuesto en forma libre y en el caso que sea la sal del compuesto también indicar si ella puede estar en forma libre, ya que puede ser que sea libre de agente de solvatación (L).

Tampoco se entiende como puede existir media molécula de agua cuando s es 0.5 ó 0.75 ó 1.5 y así sucesivamente.

La reivindicación 6 es muy confusa, se relaciona con un método para la preparación de composiciones plaguicidas sin embargo, no define ninguna preparación de la composición sino la solvatación del ingrediente activo, lo cual viene a ser lo mismo que se reclama en la reivindicación 7 como un método para la preparación de un compuesto de la fórmula (I) .

La reivindicación 8 no define ninguna composición, es de anotar que las reivindicaciones de composición o de producto no se caracterizan por el método por el cual se elaboraron.

De acuerdo a las observaciones realizar las correcciones necesarias y presentar **nuevo capítulo reivindicatorio completo**, de tal forma que sea claro y preciso.

Se sugiere que en el resumen del extracto se indiquen las reivindicaciones principales del compuesto con todos sus respectivos sustituyentes. Si el resumen del extracto sobrepasa el límite del número de palabras establecidas se debe pagar el valor correspondiente asignado por la oficina por cada palabra adicional que se quiera publicar.

Anexar arte final nítido tamaño 12x12 cm por duplicado para efecto de la publicación y uno de 6x6 cm.

Examinador Técnico de Patentes
202001

Santa Fe de Bogotá, 21 de julio de 2000

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 2000-33208

AUTO 1485

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérese al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

ARTICULO SEGUNDO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los 25 JUL 2000

EL JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 27 JUL 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI ☐ NO ☐

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA