



**CITUD**  
**ENTE D**  
**ENCION**

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
Folios: 48  
Radicación: 88867188 88888888  
Fecha (AMD): 2008-09-06 17:19:22  
Tramite: 882 PATENTES D I REGISTRO/ 411 PRESENTAC  
Dependencia: 2028 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EP 120 99 78

**DATOS DEL SOLICITANTE**

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

AVENTIS CROPSCIENCE S.A.

No. de Identificación

Representante Legal ( Persona Jurídica)

País de Domicilio

FRANCIA

Departamento o Estado

LYON

Dirección

55 Avenue René Cassin, 69009,

Ciudad

Teléfono

**(74) DATOS DEL APODERADO**

Nombre

CARLOS R. OLARTE

Dirección

CALLE 35 No. 7-25 Piso 4

Ciudad

SANTAFE DE BOGOTÁ

Teléfono

285-14-00/570-0010

**DATOS DEL INVENTOR**

(72) Nombre del Inventor (es)

JEAN-MICHEL GAULLIARD, CHRISTIAN SEGAUD

Identificación

Dirección

Ciudad

Teléfono

**DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION**

(54) Título de la Invención **COMPOSICIONES INSECTICIDAS CUYA MATERIA ACTIVA ES DE TIPO FENIL-PIRAZOL, Y PROCEDIMIENTO DE LUCHA CONTRA LOS INSECTOS.**

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

FR

(32) Fecha

Septiembre 7, 1999

(31) No. Solicitud

99 11312

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☒ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica

☒

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC (Adjunto poder Aventis)

☒

Recibo de la tasa respectiva

☒

Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras de 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 propietarios según formato

☒

Tarjeta archivo temático según formato

☒

Extracto para publicación según formato

☒

Arte final 12 x 12 y 6 x 6 cms

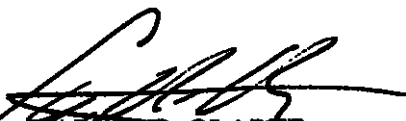
☐

Otros Documentos

☐

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

FIRMA



NOMBRE CARLOS R. OLARTE

CC. 79.782.747 de Bogotá

T.P.No. 74.295

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 45,636  
FECHA : JULIO 24 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
Radicacion : 00067168 00000000 Folios: 40  
Fecha (AND): 2000-09-06 17:19:22  
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC  
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE           | TIPO PAGO    | BANCO         | SUCURSAL | CUENTA      | No. PAGO | Vr. PAGO      |
|-----------------------|--------------|---------------|----------|-------------|----------|---------------|
| ALVARO CORREA ORDONEZ | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | BOGOTA   | 050-00110-6 | 2885674  | 27,860,000.00 |

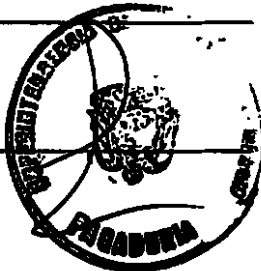
\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| 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

1000  
Colombia

3-07572256

RAISBECK LARA RODRIGUEZ & RUEDA

Members of the Firm

LE MINISTRE DES AFFAIRES ÉTRANGÈRES  
Constata que la présente certification de signature  
a été effectuée conformément à la loi française  
Pour le Ministre et par délégation



*Christophe MANESSE*

Christophe MANESSE

**BAKER & MCKENZIE**  
ATTORNEYS AT LAW  
APARTADO AEREO 3746  
TELEFONO 285 1480  
SANTAFE DE BOGOTÁ 2000  
COLOMBIA

MINISTRE  
DES AFFAIRES  
ÉTRANGÈRES  
ST  
PARIS CHA



**POWER OF ATTORNEY**

**PODER**

The undersigned

La abajo firmada

**AVENTIS CROPS SCIENCE S A**

**AVENTIS CROPS SCIENCE S A**

located in  
**55 Avenue René Cassin**  
**69009 Lyon**  
**France**

domiciliada en  
**55 Avenue René Cassin**  
**69009 Lyon**  
**France**

declares that it hereby grants to

declara por el presente otorgar a

**ALVARO CORREA ORDOÑEZ and/or**  
**CARLOS REINALDO OLARTE**  
**LUZ HELENA VILLAMIL and/or**

**ALVARO CORREA ORDOÑEZ y/o**  
**CARLOS REINALDO OLARTE**  
**LUZ HELENA VILLAMIL y/o**

a full and sufficient power of attorney to apply to the  
proper national officers and authorities for the issue of

poder especial amplio y bastante para recabar de las  
oficinas y autoridades nacionales que correspondan la  
obtención de

Letters Patent, mergers, changes of name,  
assignments, filing and prosecution of oppositions,  
changes of address

Patentes de invención, fusiones, cambios de  
nombre, traspasos, presentación y tramitación  
de oposiciones, cambios de dirección

to which end it empowers them to take all steps  
necessary before said authorities for the objects stated  
to file petitions prepare descriptions make protests  
declarations appeals and objections pay imposts  
apply for certifications receive documents and  
securities abandon applications and collect refunds  
To the said mandatories sufficient power is granted  
hereby to receive notifications for and on behalf of the  
Company to confer powers on those who are to  
represent the company judicially and extrajudicially to  
answer in court in the matter of all claims and demands  
that may be presented in connection with the patents  
and to do everything that may be required before  
administrative or judicial officers of any class giving  
them likewise power to substitute these presents and  
revoke such substitutions if necessary Additionally the  
Company hereby ratifies all acts taken to date on its  
behalf and in furtherance of this Power of Attorney

a cuyo efecto los faculta para dar ante dichas  
autoridades todos los pasos necesarios al objeto  
indicado elevar solicitudes formular descripciones  
protestas declaraciones apelaciones y reclamos  
oblar impuestos solicitar testimonios recibir  
documentos y valores desistir y percibir Se concede a  
los expresados mandatarios poder bastante para  
recibir notificaciones a nombre de la compañía otorgar  
poderes a quienes vayan a representar a la compañía  
judicial y extrajudicialmente responder en juicio a  
todas las reclamaciones o demandas que por motivo  
de las patentes se presentaren y hacer cuanto fuere  
necesario ante las autoridades administrativas o  
judiciales de cualquier orden dándoles asimismo  
facultad para sustituir el presente y en caso necesario  
revocar dichas sustituciones Adicionalmente la  
compañía por medio de la presente ratifica toda  
actuación tomada en representación suya y en relación  
con este poder

Done and subscribed in

Dado y firmado en

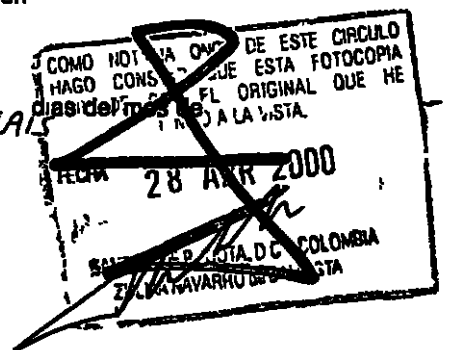
On the

19

Signature of Person

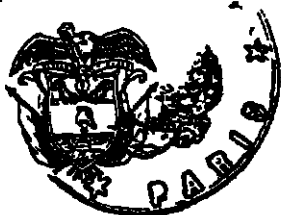


Je soussigné M<sup>e</sup> GAREL GALAIS  
Notaire à Chasselay (Rhône)  
Certifie sincère la signature de  
A BRACHOTTE  
qui a été apposée  
le 07/08/2000



CHARLES BRACHOTTE

**AUTHORIZED REPRESENTATIVE**



**CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA**  
**PARIS FRANCIA**

**No 1365**

**Paris, 4 de Abril de 2000**

**El suscrito Consul General de Colombia en Paris, vistos los documentos presentados por los interesados,**

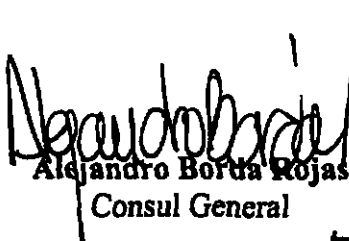
**CERTIFICA**

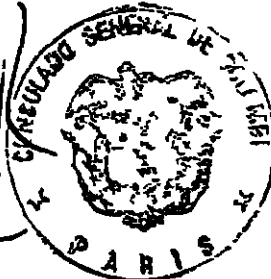
**Que el señor Christophe MANESSE, quien constató que la autenticación de la firma del signatario del poder precedente fue efectuada de conformidad con la ley francesa, ejercía en la fecha las funciones de Adjunto Administrativo de cancillería de la Dirección de los Franceses en el Exterior y de los Extranjeros en Francia del Ministerio de Asuntos Exteriores de Francia, y que su firma corresponde con la registrada en este Consulado,**

**Que la compañía AVENTIS CROPS SCIENCE S A es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de la República Francesa y que cumple con su objeto conforme a las mismas,**

**Que el señor Charles BRACHOTTE, quien confiere el poder precedente, está debidamente facultado para representar legalmente a dicha compañía en todo lo relacionado con asuntos de propiedad intelectual**

**El Cónsul General no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento**

  
**Alejandro Borda Rojas**  
**Consul General**

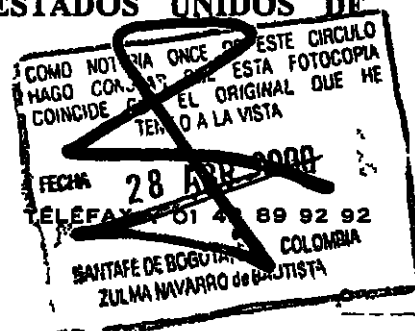


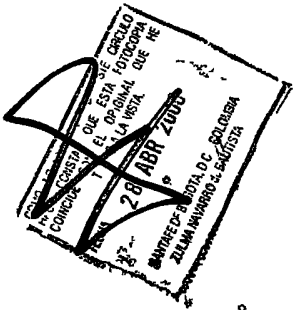
**Pagado Impuesto de Timbre por valor de US\$7,00 (SIETE DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA)**

**Pagados Derechos Consulares por valor de US\$15 (QUINCE DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA)**

**Total US\$22 (VEINTIDOS DOLARES DE LOS ESTADOS UNIDOS DE AMERICA)**

**12 RUE DE BERRI 75008 PARIS TÉL 01 53 93 91 91**





MINISTERIO DE RELACIONES  
EXTERIORES

250408  
ALEJANDRO BORDA  
Cuya firma aparece en el  
documento desempeña  
las funciones indicadas

NO SE ASUME  
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2000 ABR 17 A 10 34  
JEFE DE ALIZACIONES  
SANTIA DE ESGOIA DC

**PATENTE DE INVENCION**

INPI - Instituto Nacional de Propiedad Industrial

**CERTIFICADO DE UTILIDAD - CERTIFICADO DE ADICION**

**COPIA OFICIAL**

El Director General del Instituto Nacional de Propiedad Industrial certifica que el documento anexo es una copia certificada de una solicitud de título de propiedad industrial registrada en el Instituto.

Expedida en París, 1 de Agosto - 2000

Por el Director  
General del  
Instituto Nacional  
de propiedad  
Industrial - el Jefe  
de División -

Firma  
Martine Planche.

Sede : 26 bis, rue de Saint Petersburg- 75800 París, Cedex  
08 Teléfono 01 53 04 53 04 Fax: 01 42 93 59 30. Creado por  
la ley N. 51-444 del 19 de Abril de 1951.

INPI - Instituto Nacional de Propiedad Industrial

**Código de la Propiedad Intelectual**

**SOLICITUD DE ENTREGA**

**DE UN TITULO DE PROPIEDAD INDUSTRIAL**

Fecha de entrega de documentos: 7 de Septiembre, 1999

Número de registro nacional: 99 11312

Departamento de Registro : LY

Fecha de inscripción: 7 Septiembre 1999

1. Nombre y dirección del solicitante o de su representante a quien se debe dirigir toda la correspondencia:

AVENTIS CROPSCIENCE SA

-Patrick Genin, DPI

BP 9163

69263 Lyon, CEDEX 09

Número del poder permanente: 28.02.1991

Referencia del correspondiente: PH 99051

---

Teléfono del correspondiente; 33 4 72 85 26 41

2. Solicitud - Naturaleza del título de propiedad industrial

- a ☒ Patente de Invención
- b ☐ Certificado de Utilidad
- c ☐ Solicitud división
- d ☐ Transformación de una solicitud de patente europea

• Solicitud inicial

• Patente de Invención ☐ Certificado de utilidad  
Establecimiento del informe de Investigación

☐ Definido ☒ Inmediato

El solicitante persona natural requiere el pago  
escalonado de recibos

☐ Si ☐ No

Título de la invención: Máximo 200 caracteres:

COMPOSICIONES INSECTICIDAS CUYA MATERIA ACTIVA ES DE  
TIPO FENIL-PIRAZOL, Y PROCEDIMIENTO DE LUCHA CONTRA LOS  
INSECTOS DEL SUELO.

3. Solicitante: N. Siren. \_\_\_\_\_

Apellido y nombre (subrayar el patronímico) o  
denominación jurídica.

AVENTIS CROPS SCIENCE S.A

Forma Jurídica : S.A

Nacionalidad(es): Francesa

Dirección completa:  
55, Av. Rene Cassin  
69266 LYON Cedex 09

País:  
  
Francia

4. Inventores:

Los inventores son los solicitantes el único ( ) Si  
(x) No  
Si la respuesta es Negativa, diligenciar la designación  
aparte.

5. Reducción de impuestos de canones  
( ) Si ( ) No

6. Declaración de prioridad o solicitud de beneficio de la  
fecha de depósito de una solicitud anterior.  
País de Origen; Fecha de Inscripción; Número:  
Naturaleza de Solicitud

7. Divisiones: Anteriores a esta solicitud No. No.

8. Firma del solicitante o del representante. Nombre y  
cargo del firmante - N. de inscripción  
Patrick Genin - Firma ilegible -  
Ingeniero Responsable  
- Firma del funcionario de recepción: Sello D. GIRAUD  
Firma después del registro de la solicitud en la INPI-

PATENTE DE INVENCION , CERTIFICADO DE UTILIDAD

Designación del Inventor; No. Registro Nacional: 99  
11312

N/ Ref: PH 99051

Titulo de la Invención:

PROCEDIMIENTO DE LUCHA CONTRA INSECTOS DEL SUELO

El solicitante:

RHONE-POULENC AGRO.

Designan como inventores (apellido, nombres, dirección  
- país)

GAULLIARD Jean-Michel 101 Allée des Roses 69250  
MONTANEY FRANCE

SEGAUD Christian 3 Impasse La Fontaine 69740 -GENAS  
FRANCE

Nota:

A título excepcional el apellido del inventor puede estar  
seguido del de la sociedad a la que pertenece (compañía de  
pertenencia) cuando es diferente de la sociedad que  
registra o titular.

---

Fecha y firma de los solicitantes (o su apoderado)

Lyon, 30 de Septiembre 1999

GENIN Patrick

DOCUMENTO QUE RELACIONA LAS MODIFICACIONES

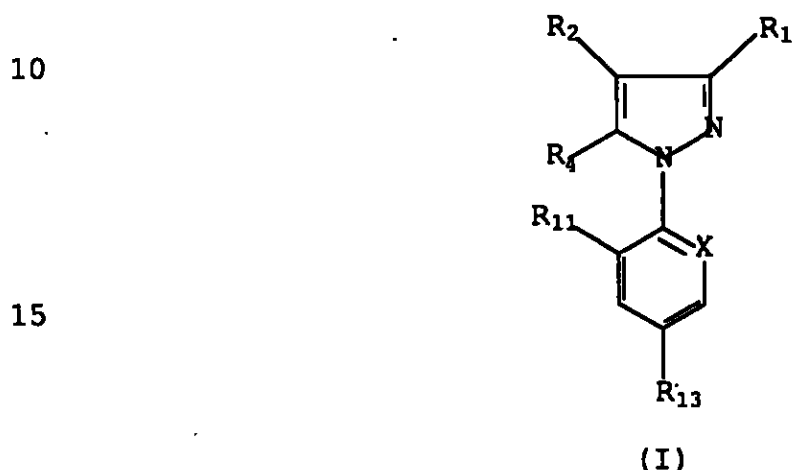
| PAGINAS DE LA DESCRIPCION O DE LAS REIVINDICACIONES O PLANCHAS DE DISEÑO |            |             | R.M. | Fecha de la Correspondencia | Sello fechador del corrector |
|--------------------------------------------------------------------------|------------|-------------|------|-----------------------------|------------------------------|
| Modificadas                                                              | Suprimidas | Adicionadas |      |                             |                              |
| 1                                                                        |            |             |      | 14 de Diciembre 1999        | 10 Enero 2000 V M            |
|                                                                          |            |             |      |                             |                              |

Un cambio en la redacción de la reivindicaciones de origen, salvo que este se derive de las disposiciones del Artículo R.612-36 de acuerdo con la Propiedad Industrial, señala por la mención "R.M." (reivindicaciones modificadas).

## REIVINDICACIONES

1. Composiciones insecticidas que contienen:

-a) entre 0,001 y 5%, con preferencia entre 0,05 y 1% y aun más ventajosamente entre 0,05 y 0,5%, de un compuesto de fórmula (I):



en la que:

20  $R_1$  es un átomo de halógeno, un grupo CN, un grupo metilo o un grupo  $\text{CH}_3\text{CO}$ ;

$R_2$  es  $\text{S(O)}_n\text{R}_3$ ;

$R_3$  es alquilo o haloalquilo;

$R_4$  representa un átomo de hidrógeno o de halógeno; o un radical  $\text{NR}_5\text{R}_6$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}_7$ ,  $\text{C(O)}\text{R}_7$  ó  $\text{C(O)}\text{O-R}_7$ , alquilo, haloalquilo u  $\text{OR}_8$  ó un radical  $-\text{N}=\text{C}(\text{R}_9)(\text{R}_{10})$ ;

$R_5$  y  $R_6$  representan, independientemente, un átomo de hidrógeno o un radical alquilo, haloalquilo,  $\text{C(O)}\text{alquilo}$ ,  $\text{S(O)}_r\text{CF}_3$ , ó  $R_5$  y  $R_6$  pueden formar juntos un radical alquileno divalente que puede estar interrumpido por uno o dos heteroátomos divalentes tales como oxígeno o azufre;

$R_7$  representa un radical alquilo o haloalquilo;

$R_8$  representa un radical alquilo, haloalquilo, o un átomo de hidrógeno;

35  $R_9$  representa un radical alquilo o un átomo de hidró-

geno;

$R_{10}$  representa un grupo fenilo o heteroarilo eventualmente sustituido por uno o varios átomos de halógeno o grupos tales como OH, -O-alquilo, -S-alquilo, ciano o alquilo;

5  $R_{11}$  y  $R_{12}$  representan, independientemente uno del otro, un átomo de hidrógeno o de halógeno;

$R_{13}$  representa un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo, haloalcoxi,  $S(O)_qCF_3$  ó  $SF_5$ ;

10 m, n, q, r representan, independientemente uno del otro, un número entero igual a 0, 1 ó 2;

X representa un átomo de nitrógeno trivalente o un radical C- $R_{12}$ , formando parte del ciclo aromático las otras tres valencias del átomo de carbono;

con la condición de que, cuando  $R_1$  es metilo, entonces  
15  $R_3$  es haloalquilo,  $R_4$  es  $NH_2$ ,  $R_{11}$  es Cl,  $R_{13}$  es  $CF_3$  y X es N;

-b) entre 0,05 y 10%, con preferencia entre 0,1 y 5%, de uno (o varios) agentes retenedores de humedad, preferentemente un agente de retención de humedad, de naturaleza orgánica; y

20 -c) entre 40 y 99%, con preferencia entre 50 y 98% (y más preferentemente entre 70 y 97%), de harina vegetal.

2. Composiciones insecticidas según la reivindicación 1, caracterizadas porque las harinas proceden de la molturación  
25 de granos de cereales como trigo, cebada, centeno, triticale, avena, o también arroz, sorgo, soja y maíz.

3. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizadas porque la harina es  
30 harina de maíz.

4. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizadas porque entre los agentes retenedores de humedad, de naturaleza orgánica, se  
35 pueden citar los derivados hidrófilos macromoleculares de

origen vegetal, y especialmente los derivados hidrófilos celulósicos, y más particularmente la celulosa.

5. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizadas porque la composición  
5 contiene igualmente 3 a 30%, con preferencia 4 a 20%, de azúcares.

6. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizadas porque los azúcares se  
10 eligen especialmente entre mono-, oligo-, o poli-órgano-sacáridos, especialmente entre sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa o también melaza o miel.

7. Composiciones insecticidas según una de las  
15 reivindicaciones 1 a 6, caracterizadas porque contienen igualmente un agente conservante que previene la degradación de las harinas, elegido entre benzoato de sodio, 1,2-benzo-isotiazolin-3-ona, ácido benzoico, ácido para-hidroxibenzoico y sus derivados ésteres y sales alcalinos o  
20 alcalino-térreos, de modo especial la sal de sodio, 2-fenil-fenol y sus sales alcalinas o alcalino-térreas, especialmente la sal de sodio, y para-nitro-fenol.

8. Composiciones insecticidas según una de las  
25 reivindicaciones 1 a 7, caracterizadas porque contienen otros aditivos tales como agentes colorantes o agentes atractivos para los insectos perjudiciales, o repulsivos para los pájaros o animales útiles o que han de protegerse, y/u otros aditivos de formulaciones, como agentes adhesivos, aglome-  
30 rantes, apetitosos, aglutinantes, gelificantes, de hinchamiento, antiadherentes y otros.

9. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizadas porque el compuesto de fórmula  
35 (I) es 5-amino-3-ciano-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fe-

nil]-4-[(trifluormetil)sulfinil]-1H-pirazol.

10. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizadas porque las formulaciones según la invención se encuentran en forma de granulados, estando el tamaño de estos granulados comprendido ventajosamente entre 0,1 mm y 3 cm, preferentemente entre 0,5 y 4 mm, y porque estos granulados son ventajosamente insolubles en agua.

10

11. Procedimiento de lucha contra los insectos, caracterizado porque se aplica sobre o en el interior del suelo (preferentemente en el interior del suelo) de la zona antes de ser cultivada, una cantidad eficaz de una composición según una de las reivindicaciones 1 a 10, en forma de granulados de tamaño comprendido entre 0,2 mm y 2 cm.

12. Procedimiento de protección de cultivos según la reivindicación 11, caracterizado porque se emplea un compuesto de fórmula (I).

13. Procedimiento según una de las reivindicaciones 11 ó 12, caracterizado porque se protegen los cultivos de cereales, con preferencia de maíz, remolacha, girasol, patata o colza.

14. Procedimiento según una de las reivindicaciones 11 a 13, caracterizado porque se utiliza una cantidad eficaz de una de las composiciones según la invención, para la lucha contra los insectos, especialmente los elatéricos.

15. Procedimiento según una de las reivindicaciones 12 a 14, caracterizado porque la cantidad eficaz de composición corresponde a una dosis de compuesto de fórmula (I)

comprendida entre 1 y 50 g/ha, preferentemente entre 3 y 40 g/ha.

16. Procedimiento de lucha contra los insectos que  
5 consiste en la aplicación sobre el suelo o en el interior del  
mismo, de una composición que aporta una dosis no letal por  
contacto pero letal por ingestión.

17. Procedimiento según la reivindicación 16 aplicable  
10 a los elatéridos.

15

20

25

30

35



# BREVET D'INVENTION

**CERTIFICAT D'UTILITÉ - CERTIFICAT D'ADDITION**

## COPIE OFFICIELLE

Le Directeur général de l'Institut national de la propriété industrielle certifie que le document ci-annexé est la copie certifiée conforme d'une demande de titre de propriété industrielle déposée à l'Institut.

Fait à Paris, le **01 AOUT 2000**

Pour le Directeur général de l'Institut  
national de la propriété industrielle  
Le Chef du Département des brevets

Martine PLANCHE

INSTITUT  
NATIONAL DE  
LA PROPRIÉTÉ  
INDUSTRIELLE

**SIEGE**

26 bis, rue de Saint Petersburg  
75800 PARIS Cédex 08  
Téléphone : 01 53 04 53 04  
Télécopie : 01 42 93 59 30

**REQUÊTE EN DÉLIVRANCE**

26 bis, rue de Saint Pétersbourg  
75800 Paris Cedex 08  
Téléphone : 01 53 04 53 04 Télécopie : 01 42 93 59 30

Confirmation d'un dépôt par télécopie ☐

Cet imprimé est à remplir à l'encre noire en lettres capitales

Réservé à l'INPI

DATE DE REMISE DES PIÈCES **7 SEP. 1999**  
N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL **9911312**  
DÉPARTEMENT DE DÉPÔT **4**  
DATE DE DÉPÔT **07 SEP. 1999**

1 NOM ET ADRESSE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE  
À QUI LA CORRESPONDANCE DOIT ÊTRE ADRESSÉE

**AVENTIS CROPS SCIENCE SA**  
**Patrick GENIN - DPI**  
**B.P. 9163**  
**69263 LYON CEDEX 09**

2 DEMANDE Nature du titre de propriété industrielle

☒ brevet d'invention ☐ demande divisionnaire  
☐ certificat d'utilité ☐ transformation d'une demande de brevet européen

☒ demande initiale  
☐ brevet d'invention

n° du pouvoir permanent 28.02.1991 références du correspondant PH 99051 téléphone 33 4 72852641

Établissement du rapport de recherche

☐ différé ☒ immédiat

La demande, personne physique, requiert le paiement échelonné de la redevance

☐ oui ☐ non

Titre de l'invention (200 caractères maximum)

**Compositions insecticides dont la matière active est de type phényl-  
pyrazole et procédé de lutte contre les insectes du sol.**

3 DEMANDEUR (S)

N° SIREN

code APE-NAF

Nom et prénoms (souligner le nom patronymique) ou dénomination

**AVENTIS CROPS SCIENCE SA**

Forme juridique

**S.A.**

Nationalité (s) **française**

Adresse (s) complète (s)

Pays

**55, AV. René Cassin**  
**69266 - LYON CEDEX 09.**

**France**

En cas d'huissier de paix, pourvoir sur papier libre ☐

INVENTEUR (S) Les inventeurs sont les demandeurs

☐ oui ☒ non Si la réponse est non, fournir une désignation séparée

5 RÉDUCTION DU Taux DES REDEVANCES

☐ requise pour la 1ère fois ☐ requise antérieurement au dépôt ; joindre copie de la décision d'admission

6 DÉCLARATION DE PRIORITÉ OU REQUÊTE DU BÉNÉFICE DE LA DATE DE DÉPÔT D'UNE DEMANDE ANTÉRIEURE

pays d'origine

numéro

date de dépôt

nature de la demande

7 DIVISIONS

antérieures à la présente demande

N°

date

N°

date

8 SIGNATURE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE

(nom et qualité du signataire)

**Patrick GENIN**

SIGNATURE DU PRÉPOSÉ À LA RÉCEPTION

**D. GENIN**

SIGNATURE APRÈS ENREGISTREMENT DE LA DEMANDE À L'INPI

**[Signature]**

**DÉSIGNATION DE L'INVENTEUR**  
(si le demandeur n'est pas l'inventeur ou l'unique inventeur)

**DEPARTEMENT DES BREVETS**

26bis, rue de Saint-Petersbourg  
75800 Paris Cédex 08  
Tél. : 01 53 04 53 04 - Télécopie : 01 42 93 59 30 PH 99051

**N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL**

**99 11312**

**TITRE DE L'INVENTION :**  
**PROCEDE DE LUTTE CONTRE LES INSECTES DU SOL**

**LE(S) SOUSSIGNÉ(S)**

**RHONE-POULENC AGRO**

**DÉSIGNE(NT) EN TANT QU'INVENTEUR(S)** (Indiquer nom, prénoms, adresse et souligner le nom patronymique) :

**GAULLIARD Jean-Michel** 101 Allée des Roses 69250 - MONTANEY FRANCE

**SEGAUD Christian** 3 Impasse La Fontaine 69740 - GENAS FRANCE

**NOTA :** A titre exceptionnel, le nom de l'inventeur peut être suivi de celui de la société à laquelle il appartient (société d'appartenance) lorsque celle-ci est différente de la société déposante ou titulaire.

Date et signature (s) du (des) demandeur (s) ou du mandataire

**LYON, le 30 SEPTEMBRE 1999**



**GENIN Patrick**

DOCUMENT COMPORTANT DES MODIFICATIONS

| PAGE(S) DE LA DESCRIPTION OU DES REVENDECATIONS<br>OU PLANCHE(S) DE DESSIN |              |            | R.M.* | DATE<br>DE LA<br>CORRESPONDANCE | TAMPON DATEUR<br>DU<br>CORRECTEUR |
|----------------------------------------------------------------------------|--------------|------------|-------|---------------------------------|-----------------------------------|
| Modifiée(s)                                                                | Supprimée(s) | Ajoutée(s) |       |                                 |                                   |
| 1                                                                          |              |            |       | 14-12-99                        | 10 JAN. 2000 - V M                |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |
|                                                                            |              |            |       |                                 |                                   |

Un changement apporté à la rédaction des revendications d'origine, sauf si celui-ci découle des dispositions de l'article R.612-36 du code de la Propriété Intellectuelle, est signalé par la mention «R.M.» (revendications modifiées).

### Procédé de lutte contre les insectes du sol.

La présente invention a pour objet de nouvelles compositions destinées à la lutte contre les insectes du sol en leur diverses formes de développement, et notamment des compositions utiles dans la lutte contre les taupins. L'invention porte également sur un procédé de lutte mettant en oeuvre lesdites compositions.

On connaît, notamment par les demandes de brevet EP 295117, WO 87/3781, 93/6089, 94/21606 des composés insecticides de type phényl-pyrazole utilisables dans la lutte contre les insectes. Les demandes de brevets EP 295117 et 836386 mentionnent également des compositions comprenant de 0,01% à 5% de telles matières actives.

Les taupins constituent une famille d'insectes particulièrement nuisibles pour certaines cultures, et plus particulièrement pour les cultures de maïs, betterave, tournesol, pommes de terre et colza. Leur caractère nuisible est d'autant plus marqué que les formes vers des taupins peuvent rester pendant de très longues périodes dans le sol, allant jusqu'à 5 ans.

On a bien proposé des appâts pour diverses sortes d'insectes, ainsi que des formules consommables par ingestion, mais ces formules ne sont pas nécessairement actives pour toutes les sortes d'insectes, et il reste le besoin de trouver des formes ou formulations insecticides particulièrement efficaces pour les applications les plus diverses, et notamment pour la lutte contre les taupins.

En outre, en ce qui concerne les insecticides appliqués sur ou dans le sol, il est désirable de trouver des conditions et formulations permettant d'obtenir une bonne efficacité à des doses aussi basses que possible.

Un but de l'invention est de remédier, en tout ou en partie, à ces difficultés.

Un autre but de l'invention est de proposer des compositions avantageuses et efficaces pour lutter contre les insectes non grégaires.

Un autre but de l'invention est de proposer des compositions avantageuses et efficaces pour lutter contre les insectes du sol notamment les taupins, et plus particulièrement les taupins à l'état de vers.

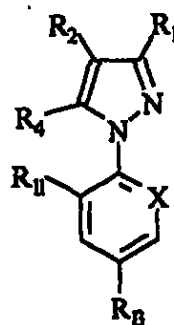
Un autre but de l'invention est de fournir des compositions comprenant au moins une matière active insecticide de type phényl-pyrazole et applicables commodément sur ou dans le sol.

Un autre but de l'invention est de proposer des compositions insecticides ayant de bonnes performances malgré des doses basses d'utilisation.

Il a maintenant été trouvé que ces buts pouvaient être atteints, en totalité ou en partie, au moyen des compositions et du procédé de lutte selon l'invention qui sont décrits en détail ci-après. On précise que les pourcentages indiqués dans le présent texte sont des pourcentages poids/poids, sauf indication contraire spécifique.

La présente invention a donc pour objet, en premier lieu, des compositions insecticides comprenant :

- a) entre 0,001 et 5 %, de préférence entre 0,05 et 1% et encore plus avantageusement entre 0,05 et 0,5 % d'un composé de formule (I) :



(I)

dans laquelle :

R<sub>1</sub> est un atome d'halogène ou un groupe CN ou un groupe méthyle ou un groupe CH<sub>3</sub>CO ;

R<sub>2</sub> est S(O)<sub>n</sub>R<sub>3</sub>;

R<sub>3</sub> est alkyl ou haloalkyl;

R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène ou d'halogène; ou un radical NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>, S(O)<sub>m</sub>R<sub>7</sub>, C(O)R<sub>7</sub> or C(O)O-R<sub>7</sub>, alkyl, haloalkyl ou OR<sub>8</sub> ou un radical -N=C(R<sub>9</sub>)(R<sub>10</sub>);

R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> représentent indépendamment l'atome d'hydrogène ou un radical alkyl, haloalkyl, C(O)alkyl, S(O)<sub>r</sub>CF<sub>3</sub>; ou R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> peuvent former ensemble un radical alkylene divalent qui peut être interrompu par un ou deux hétéroatomes divalents, tels que l'oxygène ou le soufre;

R<sub>7</sub> représente un radical alkyl ou haloalkyl;

R<sub>8</sub> représente un radical alkyl, haloalkyl ou un atome d'hydrogène;

$R_9$  représente un radical alkyl ou un atome d'hydrogène;

$R_{10}$  représente un groupe phenyl ou heteroaryl éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes tels que OH, -O-alkyl, -S-alkyl, cyano, ou alkyl;

$R_{11}$  et  $R_{12}$  représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou d'halogène;

$R_{13}$  représente un atome d'halogène ou un groupe haloalkyl, haloalkoxy,  $S(O)_qCF_3$  ou  $SF_5$ ;

m, n, q, r représentent, indépendamment l'un de l'autre, un nombre entier égal à 0, 1 ou 2;

X représente un atome d'azote trivalent ou un radical C- $R_{12}$ , les trois autres valences de l'atome de carbone faisant partie du cycle aromatique;

sous réserve que, lorsque  $R_1$  est méthyle, alors  $R_3$  est haloalkyl,  $R_4$  est  $NH_2$ ,  $R_{11}$  est Cl,  $R_{13}$  est  $CF_3$ , et X est N ;

- b) entre 0,05 et 10%, de préférence entre 0,1 et 5 % d'un (ou plusieurs) agent rétenteur d'humidité, de préférence un agent rétenteur d'humidité de nature organique ; et

- c) entre 40 et 99 %, de préférence entre 50 et 98 % (et plus préférentiellement entre 70 et 97 %) de farine végétale.

Les radicaux alkyle de la définition de la formule (I) comprennent généralement de 1 à 6 atomes de carbone. Le cycle formé par le radical alkylène divalent représentant  $R_5$  et  $R_6$  ainsi que par l'atome d'azote auxquels  $R_5$  et  $R_6$  sont rattachés, est généralement un cycle à 5, 6 ou 7 chaînons.

Le composé de formule (I) peut être préparé selon un des procédés décrits dans les demandes de brevet WO 87/3781, 93/6089, 94/21606, EP 295117 ou encore par un autre procédé compris dans les connaissances générales de l'homme du métier compétent en synthèse chimique. Ce composé est également désigné dans le présent texte par le terme de matière active.

Parmi les farines végétales utilisables, on peut citer les farines issues du broyage de grains de céréales comme le blé, l'orge, le seigle, le triticale, l'avoine, ou aussi le riz, le sorgho, le soja, le maïs, la farine préférée étant celle à base de maïs. Un mélange de ces farines végétales est également envisageable dans le cadre de la présente invention.

Parmi les agents rétenteurs d'humidité de nature organique, on peut citer les dérivés hydrophiles macromoléculaires d'origine végétale, et notamment les

dérivés hydrophiles cellulosiques, et plus particulièrement la cellulose mais aussi un ou plusieurs agents de désintégration. Il peut être avantageux d'utiliser ces composés en particulier lorsque l'on utilise dans les granulés des farines telles que les farines de blé dur. Des agents de désintégration incluent: l'amidon, le carboxyméthyl amidon de sodium, la cellulose telle que la cellulose microcristalline; des celluloses modifiées telles que la carboxyméthylcellulose de sodium; la bentonite, le silicate d'aluminium et de magnésium; le polynaphtalènesulfonate de sodium, le dodécylbenzènesulfonate de sodium, le dioctylsulfosuccinate de sodium, le sulfonate de lignine; un dérivé de la saccharide tel que le lactose, le fructose, le sucrose, le manitol, le dextrose; un dérivé réticulé de la polyvinylpyrrolidone. Lorsque l'on utilise un agent de désintégration, la composition selon l'invention peut contenir de 0,5 à 30% et, de préférence, de 1 à 20% en poids de la substance sèche, du ou des dits agents.

Selon une variante de la composition selon l'invention, la composition comprend également de 3 à 30 %, de préférence de 4 à 20% de sucres. Les sucres sont choisis notamment parmi les mono-, oligo- ou poly-organosaccharides, spécialement parmi le saccharose, le lactose, le fructose, le dextrose, le glucose ou encore la mélasse ou le miel.

Les compositions objet de l'invention peuvent également comprendre un agent conservateur prévenant la dégradation des farines, tel que le benzoate de sodium, la 1,2-benzisothiazoline-3-one, l'acide benzoïque, l'acide para hydroxybenzoïque et ses dérivés esters et sels alcalins ou alcalino-terreux, notamment le sel de sodium, le 2-phénylphénol et ses sels alcalins ou alcalino-terreux, notamment le sel de sodium, le paranitrophénol.

D'autres additifs peuvent également être inclus tels que des agents colorants ou des agents attractifs pour les nuisibles ou répulsifs pour les oiseaux ou animaux utiles ou à protéger.

D'autres additifs de formulations peuvent être utilisés comme des agents collants, agglomérants, appétants, agglutinants, gélifiants, gonflants, antiadhérants et autres.

Une classe préférée de composés de formule (I) comprend les composés tels que  $R_1$  est CN, et/ou  $R_3$  est haloalkyl, et/ou  $R_4$  est  $NH_2$ , et/ou  $R_{11}$  et  $R_{12}$  sont indépendamment l'un de l'autre un atome d'halogène, et/ou  $R_{13}$  est haloalkyl.

Selon une variante particulièrement avantageuse de l'invention, le composé de formule (I) mis en oeuvre dans l'invention est le 5-amino-3-cyano-1-

[2,6-dichloro-4-(trifluorométhyl)phényl]-4-[(trifluorométhyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazole, auquel il est fait référence dans les exemples sous le terme de "fipronil".

Les formulations selon l'invention sont généralement sous forme de granulés. La taille des granulés est avantageusement comprise entre 0,1 mm et 3 cm, de préférence entre 0,5 et 4 mm. Ces granulés sont avantageusement insolubles dans l'eau (dans le sens où ils résistent à la désintégration par l'eau).

Les compositions selon l'invention peuvent être préparées par simple mélange des divers constituants, de préférence par extrusion ou compression à froid ou à chaud selon toute technique de granulation ou pastillage connue en soit. Pour l'obtention de tels granulés, on se reportera aisément par exemple à la demande de brevet européen publiée sous le numéro EP 0575838 et/ou à d'autres techniques, par exemple d'extrusion, connues de l'homme du métier.

L'invention concerne également un procédé de protection des cultures contre les insectes, notamment les taupins, caractérisé en ce que l'on applique sur ou dans le sol (de préférence dans le sol) de la zone devant être cultivée une quantité efficace d'une composition sous forme de granulés de taille comprise entre 0,2 mm et 2 cm comprenant une matière active choisie dans le groupe constitué par les produits de formule I, l'imidacloprid, l'acetamiprid, le nitenpyram et le thiamethoxam. Les produits de formule I sont préférés.

L'invention concerne ainsi plus particulièrement un procédé de protection des cultures de céréales, de préférence de maïs, ou de betteraves ou de tournesol ou de pomme de terre ou de colza. L'application des formulations selon l'invention a lieu avantageusement avant le semis de la dite culture, ou simultanément à ce semis.

L'invention concerne également un procédé de lutte contre les insectes, notamment de taupins, caractérisé en ce que l'on applique sur ou dans le sol (de préférence dans le sol) où ils se trouvent ou sont susceptibles de se trouver une quantité efficace d'une des compositions selon l'invention.

Comme quantité efficace, on utilise souvent des quantités de composition correspondant à une dose de composé de formule (I) comprises entre 1 et 50 g/ha, de préférence entre 3 et 40 g/ha.

Une caractéristique particulière du procédé de lutte contre les insectes selon l'invention consiste en l'application, sur ou dans le sol, d'une composition apportant une dose non létale par contact mais létale par ingestion.

Autrement dit, dans le cas particulier des taupins, le procédé consiste à tuer les taupins par application d'une dose non létale par contact mais létale par ingestion. Une hypothèse de la bonne efficacité du procédé de traitement selon l'invention, permettant de diminuer fortement les doses d'application de composés de formule I notamment, est basée sur le fait que l'appât selon l'invention ayant entraîné la mort d'un taupin, ce dernier peut lui même servir d'appât pour d'autres taupins, qui ingèrent donc également un produit (taupin mort) contenant l'insecticide.

Comme insectes du sol contre lesquels l'invention est particulièrement efficace, on peut citer par exemple :

Les Coléoptères (wireworms (*Agriotes* spp.), false wireworms, white grubs) tels que par exemple :

*Agriotes lineatus* (taupin européen, Elateridae),

*Agriotes sordidus* (taupin européen, Elateridae),

*Agriotes obscurus* (taupin européen, Elateridae),

*Agriotes sputator* (taupin européen, Elateridae),

*Athous* spp. (Elateridae),

*Atomaria linearis* (cryptophagidae)

*Melolontha* spp. (vers blanc, scarabaeidae),

*Bothynoderes*,

*Limonius* spp. (taupin US),

*Melanotus* spp. (taupin US),

*Diabrotica* spp. (cornrootworms, chrysomelidae)

*Tanymecus pallidus* (beet leaf weevil, curculionidae).

Les Lépidoptères (Noctuelles) tels que :

*Autographa* spp., *Mamestra* spp., *Agrotis* spp. (Cutworms, vers gris),

*Euxoa* spp. (Cutworms, vers gris), *Spodoptera* spp. (*Spodoptera exigua*,

*Spodoptera littoralis*).

Les Diptères tels que *Tipula* spp.).

Les Myriapodes (Myriapoda) :

- *Diplopoda* = Millipedes,

- Centipede.

Parmi les taupins sol contre lesquels l'invention est particulièrement efficace, on peut citer *Agriotes* spp., *Athous* spp., *Limonius* spp.

Les granulés selon l'invention sont avantageusement insérés dans le sol à une profondeur comprise entre 1 et 5 cm.

Les compositions selon l'invention sont particulièrement avantageuses en ce qu'elles permettent l'utilisation de doses plus basses de produit actif que les compositions semblables connues.

Les exemples suivants illustrent l'invention, sans pour autant constituer une limitation de celle-ci. Dans ces exemples, le composé de formule (I) utilisé est le fipronil.

#### Exemple 1 :

Une surface de 0,1 ha est semée avec du maïs à raison de 8000 graines environ, non traitées. Cette surface est divisée en parcelles de 40 m<sup>2</sup>.

En même temps que le semis, on incorpore au sol, dans la raie de semis des granulés de 2 mm contenant une composition constituée de :

- 0,25% de fipronil,
- 93,5% de farine de maïs,
- 2% de cellulose,
- 4% de lactose,
- 0,2% de paranitrophénol,
- 0,05% de pigment bleu 15.3.

Les quantités de granulés ainsi épandues varient de 2,5 à 10 kg par hectare. Des parcelles non traitées sont conservées pour servir de témoin et vérifier l'importance des dégâts causés par les insectes. De même, des parcelles seront traitées avec un insecticide commercial réputé efficace et appelé référence. Chaque modalité est répétée quatre fois.

20 jours après semis environ, on compte les plants de maïs ayant levé.

Sur la localité de St Hilaire (30), 22 jours après le semis, on observe dans le sillon des 4 parcelles non traitées 19 plants pour 10 mètres de sillon. Dans les parcelles traitées selon l'invention avec la doses de Fipronil de 6 g par hectare on observe 49 plants par 10 mètres de sillon.

Avec la dose de Fipronil de 12,5 g par hectare on observe 48 à 50,5 plants par 10 mètres de sillon.

Avec la dose de Fipronil de 25 g par hectare on observe 45,5 à 51,3 plants par 10 mètres de sillon.

Avec la dose de Fipronil de 50 g par hectare on observe 49 plants par 10 mètres de sillon.

5 Pour obtenir le même résultat avec un granulé classique (support argile), il faut apporter 200 g de fipronil par hectare.

10 Le sol est creusé et gratté pour capturer et identifier les insectes responsables des dégâts, on observe pour le témoin non traité une présence importante de larves de taupins du genre Agriotes, en particulier Agriotes sordidus.

### Exemple 2 :

15 Une surface de 1 ha est semée avec du maïs à raison de 98100 graines environ, non traitées .Cette surface est divisée en parcelles de 27 m<sup>2</sup>.

En même temps que le semis, on incorpore au sol, dans la raie de semis des granulés de 2 mm contenant une composition constituée de :

20 0,25% de fipronil,  
93,5% de farine de maïs,  
2% de cellulose,  
4% de lactose,  
0,2% de paranitrophénol,  
0,05% de pigment bleu 15.3.

25 Les quantités de granulés ainsi épandues varient de 2,5 à 10 kg par hectare. Des parcelles non traitées sont conservées pour servir de témoin et vérifier l'importance des dégâts causés par les insectes. De même des parcelles seront traitées avec un insecticide commercial réputé efficace et appelé référence. Chaque modalité est répétée quatre fois.

50 jours après semis environ, on compte les plants de maïs ayant levé.

30 Sur la localité de Beaufort (62), 50 jours après le semis, on observe dans le sillon des 4 parcelles non traitées 30 plants pour 10 mètres de sillon. Dans les parcelles traitées selon l'invention avec la doses de Fipronil de 6 g par hectare on observe 40 plants par 10 mètres de sillon.

35 Avec la doses de Fipronil de 12,5 g par hectare on observe 43 à 46 plants par 10 mètres de sillon.

Avec la doses de Fipronil de 25 g par hectare on observe 44,5 à 50 plants par 10 mètres de sillon.

Avec la doses de Fipronil de 50 g par hectare on observe 49,8 plants par 10 mètres de sillon.

5 Pour obtenir le même résultat (52 plants pour 10 mètres ) avec un granulé classique (support argile) il faut apporter 200 g de fipronil par hectare.

Le sol est creusé et gratté pour capturer et identifier les insectes responsables des dégâts, on observe pour le témoin non traité une présence importante de larves de taupins du genre Agriotes, en particulier Agriotes lineatus.

10

Exemple 3 : Essais d'efficacité des granulés appâts selon l'invention sur culture de pomme de terre.

15 En même temps que le semis, on incorpore au sol, dans la raie de semis des granulés selon l'invention constitués de :

12,5 g/kg de fipronil (à partir d'une SC à 500g/l de fipronil),  
945,5 g/kg de farine a) de maïs (granulés A) ou b) de riz (granulés B),  
40 g/kg de lactose,  
2 g/kg de paranitrophénol.

20 On a comparé l'efficacité contre Agriotes (taupins) 90 jours après le semis des deux granulés A et B ci-dessus utilisés aux doses de 5 et 2,5 g de fipronil par hectare et du même fipronil utilisé par pulvérisation aux doses de 50 et 25 g/ha (à partir de Regent® 800WG)(composé C).

25 On observe alors les résultats suivants exprimés en nombre de trous par 10 tubercules (=N) :

| Produit     | A   | A | B   | B | C  | C  | témoin* |
|-------------|-----|---|-----|---|----|----|---------|
| Dose (g/ha) | 2,5 | 5 | 2,5 | 5 | 25 | 50 | -       |
| N           | 6   | 1 | 7   | 3 | 6  | 1  | 14      |

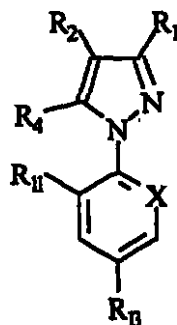
\* témoin non traité.

30 Ce résultat montre bien le bon contrôle des taupins obtenu par les granulés selon l'invention qui donnent le même résultat que le Regent® 800WG mais avec une dose diminuée d'un facteur 10.

# REVENDICATIONS

## 1. Compositions insecticides comprenant :

- a) entre 0,001 et 5 %, de préférence entre 0,05 et 1% et encore plus avantageusement entre 0,05 et 0,5 % d'un composé de formule (I) :



(I)

dans laquelle :

R<sub>1</sub> est un atome d'halogène ou un groupe CN ou un groupe méthyle ou un groupe CH<sub>3</sub>CO ;

R<sub>2</sub> est S(O)<sub>n</sub>R<sub>3</sub>;

R<sub>3</sub> est alkyl ou haloalkyl;

R<sub>4</sub> représente un atome d'hydrogène ou d'halogène; ou un radical NR<sub>5</sub>R<sub>6</sub>, S(O)<sub>m</sub>R<sub>7</sub>, C(O)R<sub>7</sub> or C(O)O-R<sub>7</sub>, alkyl, haloalkyl ou OR<sub>8</sub> ou un radical -N=C(R<sub>9</sub>)(R<sub>10</sub>);

R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> représentent indépendamment l'atome d'hydrogène ou un radical alkyl, haloalkyl, C(O)alkyl, S(O)<sub>r</sub>CF<sub>3</sub>; ou R<sub>5</sub> et R<sub>6</sub> peuvent former ensemble un radical alkylene divalent qui peut être interrompu par un ou deux hétéroatomes divalents, tels que l'oxygène ou le soufre;

R<sub>7</sub> représente un radical alkyl ou haloalkyl;

R<sub>8</sub> représente un radical alkyl, haloalkyl ou un atome d'hydrogène;

R<sub>9</sub> représente un radical alkyl ou un atome d'hydrogène;

R<sub>10</sub> représente un groupe phenyl ou heteroaryl éventuellement substitué par un ou plusieurs atomes d'halogène ou groupes tels que OH, -O-alkyl, -S-alkyl, cyano, ou alkyl;

R<sub>11</sub> et R<sub>12</sub> représentent, indépendamment l'un de l'autre, un atome d'hydrogène ou d'halogène;

R<sub>13</sub> représente un atome d'halogène ou un groupe haloalkyl, haloalkoxy, S(O)<sub>q</sub>CF<sub>3</sub> ou SF<sub>5</sub>;

m, n, q, r représentent, indépendamment l'un de l'autre, un nombre entier égal à 0,1 ou 2;

X représente un atome d'azote trivalent ou un radical C-R<sub>12</sub>, les trois autres valences de l'atome de carbone faisant partie du cycle aromatique;

5 sous réserve que, lorsque R<sub>1</sub> est méthyle, alors R<sub>3</sub> est haloalkyl, R<sub>4</sub> est NH<sub>2</sub>, R<sub>11</sub> est Cl, R<sub>13</sub> est CF<sub>3</sub>, et X est N ;

- b) entre 0,05 et 10%, de préférence entre 0,1 et 5 % d'un (ou plusieurs) agent rétenteur d'humidité, de préférence un agent rétenteur d'humidité de nature organique ; et

10 - c) entre 40 et 99 %, de préférence entre 50 et 98 % (et plus préférentiellement entre 70 et 97 %) de farine végétale.

2. Compositions insecticides selon la revendication 1 caractérisée en ce que les farines sont issues du broyage de grains de céréales comme le blé, l'orge, le seigle, le triticales, l'avoine, ou aussi le riz, le sorgho, le soja, le maïs.

3. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 2 caractérisée en ce que la farine est une farine de maïs.

20 4. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 3 caractérisée en ce que parmi les agents rétenteurs d'humidité de nature organique, on peut citer les dérivés hydrophiles macromoléculaires d'origine végétale, et notamment les dérivés hydrophiles cellulosiques, et plus particulièrement la cellulose.

25 5. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 4 caractérisée en ce que la composition comprend également de 3 à 30 %, de préférence de 4 à 20% de sucres.

30 6. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 4 caractérisée en ce que les sucres sont choisis notamment parmi les mono-, oligo- ou poly-organosaccharides, spécialement parmi le saccharose, le lactose, le fructose, le dextrose, le glucose ou encore la mélasse ou le miel.

7. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 6, caractérisée en ce qu'elles comprennent également un agent conservateur prévenant la dégradation des farines choisi parmi le benzoate de sodium, la 1,2-benzisothiazoline-3-one, l'acide benzoïque, l'acide para hydroxybenzoïque et ses dérivés esters et sels alcalins ou alcalino-terreux, notamment le sel de sodium, le 2-phénylphénol et ses sels alcalins ou alcalino-terreux, notamment le sel de sodium, le paranitrophénol.

8. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 7, caractérisée en ce qu'elles comprennent d'autres additifs tels que des agents colorants ou des agents attractifs pour les nuisibles ou répulsifs pour les oiseaux ou animaux utiles ou à protéger, et/ou d'autres additifs de formulations comme des agents collants, agglomérants, appétants, agglutinants, gélifiants, gonflants, antiadhérants et autres.

9. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 8, caractérisée en ce que le composé de formule (I) est le 5-amino-3-cyano-1-[2,6-dichloro-4-(trifluorométhyl)phényl]-4-[(trifluorométhyl)sulfinyl]-1H-pyrazole.

10. Compositions insecticides selon l'une des revendications 1 à 9, caractérisée en ce que les formulations selon l'invention sont sous forme de granulés, la taille de ces granulés étant avantageusement comprise entre 0,1 mm et 3 cm, de préférence entre 0,5 et 4 mm et en ce que ces granulés sont avantageusement insolubles dans l'eau.

11. Procédé de lutte contre les insectes, caractérisé en ce que l'on applique sur ou dans le sol (de préférence dans le sol) de la zone devant être cultivée une quantité efficace d'une composition selon l'une des revendications 1 à 10 sous forme de granulés de taille comprise entre 0,2 mm et 2 cm comprenant une matière active choisie dans le groupe constitué par les produits de formule I, l'imidacloprid, l'acetamiprid, le nitenpyram et le thiamethoxam.

12. Procédé de protection des cultures selon la revendication 11 caractérisé en ce que l'on emplit un composé de formule I.

13. Procédé selon l'une des revendications 11 ou 12 caractérisé en ce que l'on protège les cultures de céréales, de préférence de maïs, ou de betteraves ou de tournesol ou de pomme de terre ou de colza.

5 14. Procédé selon l'une des revendications 11 à 13 caractérisé en ce qu'une quantité efficace d'une des compositions selon l'invention est utilisée pour la lutte contre les insectes, notamment les taupins.

10 15. Procédé selon l'une des revendications 12 à 14 caractérisé en ce que la quantité efficace de composition correspond à une dose de composé de formule (I) comprise entre 1 et 50 g/ha, de préférence entre 3 et 40 g/ha.

15 16. Procédé de lutttes contre les insectes qui consiste en l'application, sur ou dans le sol, d'une composition apportant une dose non létale par contact mais létale par ingestion.

17. Procédé selon la revendication 16 applicable aux taupins.

---

**Compositions insecticides dont la matière active est de type phényl-pyrazole et procédé de lutte contre les insectes du sol.**

La présente invention a pour objet de nouvelles compositions destinées à la lutte contre les insectes du sol en leur diverses formes de développement, et notamment des compositions utiles dans la lutte contre les taupins. L'invention porte également sur un procédé de lutte mettant en oeuvre lesdites compositions.

On connaît, notamment par les demandes de brevet EP 295117, WO 87/3781, 93/6089, 94/21606 des composés insecticides de type phényl-pyrazole utilisables dans la lutte contre les insectes. Les demandes de brevets EP 295117 et 836386 mentionnent également des compositions comprenant de 0,01% à 5% de telles matières actives.

Les taupins constituent une famille d'insectes particulièrement nuisibles pour certaines cultures, et plus particulièrement pour les cultures de maïs, betterave, tournesol, pommes de terre et colza. Leur caractère nuisible est d'autant plus marqué que les formes vers des taupins peuvent rester pendant de très longues périodes dans le sol, allant jusqu'à 5 ans.

On a bien proposé des appâts pour diverses sortes d'insectes, ainsi que des formules consommables par ingestion, mais ces formules ne sont pas nécessairement actives pour toutes les sortes d'insectes, et il reste le besoin de trouver des formes ou formulations insecticides particulièrement efficaces pour les applications les plus diverses, et notamment pour la lutte contre les taupins.

En outre, en ce qui concerne les insecticides appliqués sur ou dans le sol, il est désirable de trouver des conditions et formulations permettant d'obtenir une bonne efficacité à des doses aussi basses que possible.

Un but de l'invention est de remédier, en tout ou en partie, à ces difficultés.

Un autre but de l'invention est de proposer des compositions avantageuses et efficaces pour lutter contre les insectes non grégaires.

Un autre but de l'invention est de proposer des compositions avantageuses et efficaces pour lutter contre les insectes du sol notamment les taupins, et plus particulièrement les taupins à l'état de vers.

Un autre but de l'invention est de fournir des compositions comprenant au moins une matière active insecticide de type phényl-pyrazole et applicables commodément sur ou dans le sol.

Composiciones insecticidas cuya materia activa es de tipo fenil-pirazol, y procedimiento de lucha contra los insectos del suelo.

5 La presente invención tiene por objeto nuevas composiciones destinadas a la lucha contra los insectos del suelo, en sus diversas formas de desarrollo, y especialmente composiciones útiles en la lucha contra los elatéridos. La invención se refiere igualmente a un procedimiento de lucha  
10 que utiliza las citadas composiciones.

Se conocen, especialmente por las solicitudes de patente EP-295117, WO-87/3781, 93/6089 y 94/21606, compuestos insecticidas de tipo fenil-pirazol utilizables en la lucha contra los insectos. Las solicitudes de patente EP-295117 y  
15 836386 mencionan igualmente composiciones que contienen 0,01% a 5% de tales materias activas.

Los elatéridos constituyen una familia de insectos particularmente perjudiciales para ciertos cultivos, y más particularmente para los cultivos de maíz, remolacha,  
20 girasol, patatas y colza. Su carácter perjudicial es muy marcado, ya que las formas de gusano de los elatéridos pueden permanecer en el suelo, durante periodos muy largos que llegan hasta 5 años.

Se han propuesto cebos para diversas clases de insectos, así como fórmulas que se consumen por ingestión, pero estas  
25 fórmulas no son necesariamente activas para todas las clases de insectos, y existe la necesidad de encontrar formas o formulaciones insecticida particularmente eficaces para las aplicaciones más diversas, y de modo especial para la lucha  
30 contra los elatéridos.

Además, en lo que se refiere a los insecticidas aplicados sobre el suelo o en el interior del mismo, es deseable encontrar condiciones y formulaciones que permitan obtener una buena eficacia a dosis tan bajas como sea  
35 posible.

Un objeto de la invención es remediar, en todo o en parte, estas dificultades.

Otro objeto de la invención es proponer composiciones ventajosas y eficaces para luchar contra los insectos no gregarios.

Otra finalidad de la invención es proponer composiciones ventajosas y eficaces para luchar contra los insectos del suelo, especialmente los elatéridos, y más particularmente los elatéridos en estado de gusanos.

Otro objeto de la invención es suministrar composiciones que contengan al menos una materia activa insecticida de tipo fenil-pirazol y aplicables cómodamente sobre el suelo o en el interior del mismo

Finalidad de la invención es también proponer composiciones insecticidas que posean buenas prestaciones, a pesar de las dosis bajas de utilización.

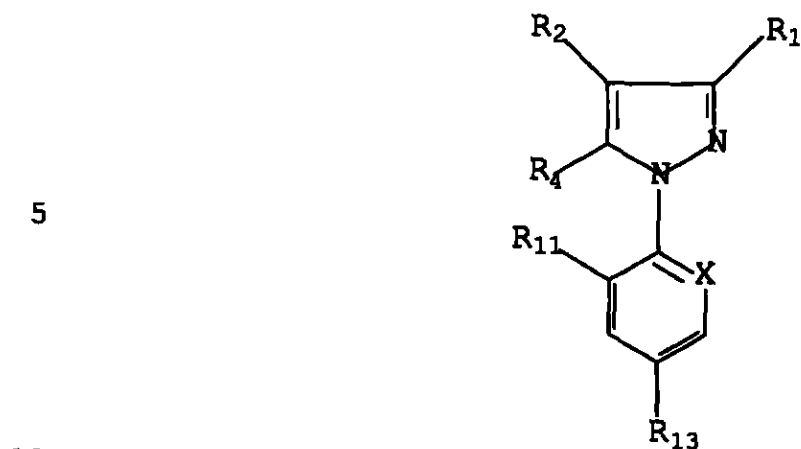
En la actualidad se ha comprobado que estos objetivos podían alcanzarse, en su totalidad o en parte, mediante las composiciones y el procedimiento de lucha según la invención, que se describen en detalle, a continuación. Se precisa que los porcentajes indicados en el presente texto sean porcentajes en peso/peso, salvo indicación específica en contra.

La presente invención tiene, pues, por objeto, en primer lugar, composiciones insecticidas que contienen:

-a) entre 0,001 y 5%, con preferencia entre 0,05 y 1%, y aun más ventajosamente, entre 0,05 y 0,5% de un compuesto de fórmula (I):

30

35



(I)

en la que :

$R_1$  es un átomo de halógeno, un grupo CN, un grupo metilo o un grupo  $\text{CH}_3\text{CO}$

15  $R_2$  es  $\text{S(O)}_n\text{R}_3$ ;

$R_3$  es alquilo o haloalquilo;

$R_4$  representa un átomo de hidrógeno o de halógeno; un radical  $\text{NR}_5\text{R}_6$ ,  $\text{S(O)}_m\text{R}_7$ ,  $\text{C(O)}\text{R}_7$  ó  $\text{C(O)}\text{O}-\text{R}_7$ , alquilo, haloalquilo  $\text{OR}_8$  ó un radical  $-\text{N}=\text{C}(\text{R}_9)(\text{R})_{10}$ ;

20  $R_5$  y  $R_6$  representan, independientemente, un átomo de hidrógeno o un radical alquilo, haloalquilo,  $\text{C(O)}\text{alquilo}$ ,  $\text{S(O)}_n\text{CF}_3$ ; ó  $R_5$  y  $R_6$  pueden formar juntos un radical alquileno divalente que puede estar interrumpido por uno o dos heteroátomos divalentes, tales como oxígeno o azufre;

25  $R_7$  representa un radical alquilo o haloalquilo;

$R_8$  representa un radical alquilo, haloalquilo o un átomo de hidrógeno;

$R_9$  representa un radical alquilo o un átomo de hidrógeno;

30  $R_{10}$  representa un grupo fenilo ó heteroarilo eventualmente sustituido por uno o varios átomos de halógeno o grupos tales como OH,  $-\text{O}-\text{alquilo}$ ,  $-\text{S}-\text{alquilo}$ , ciano ó alquilo;

35  $R_{11}$  y  $R_{12}$  representan, independientemente uno de otro, un átomo de hidrógeno o de halógeno;

$R_{13}$  representa un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo, haloalcoxi,  $S(O)_qCF_3$  ó  $SF_5$ ;

m, n, q, r representan, independientemente uno de otro, un número entero igual a 0, 1 ó 2;

5 X representa un átomo de nitrógeno trivalente o un radical  $C-R_{12}$ , y las otras tres valencias del átomo de carbono forman parte del ciclo aromático;

con la condición de que, cuando  $R_1$  es metilo, entonces  $R_3$  es haloalquilo,  $R_4$  es  $NH_2$ ,  $R_{11}$  es Cl,  $R_{13}$  es  $CF_3$  y X es N;

10 -b) entre 0,05 y 10%, con preferencia entre 0,1 y 5% de uno (o varios) agentes retenedores de humedad, preferentemente, un agente retenedor de humedad, de naturaleza orgánica; y

-c) entre 40 y 99%, con preferencia entre 50 y 98%  
15 (y más preferentemente entre 70 y 97%) de harina vegetal.

Los radicales alquilo de la definición de la fórmula (I) contienen generalmente 1 a 6 átomos de carbono. El ciclo formado por el radical alquileno divalente que representan  $R_5$  y  $R_6$ , así como por el átomo de nitrógeno a los que se  
20 encuentran unidos  $R_5$  y  $R_6$ , es generalmente un ciclo con 5, 6 ó 7 eslabones.

El compuesto de fórmula (I) puede prepararse según uno de los procedimientos descritos en las solicitudes de patente WO 87/3781, 93/6089, 94/21606, EP-295117 o también por otro  
25 procedimiento contenido en los conocimientos generales del especialista competente en síntesis química. Este compuesto se designa igualmente en el presente texto por la expresión materia activa.

Entre las harinas vegetales utilizables, se pueden citar  
30 las harinas procedentes de la molturación de granos de cereales como trigo, cebada, centeno, triticale, avena, o también arroz, sorgo, soja o maíz, siendo la harina preferida la preparada a base de maíz. Igualmente, puede considerarse apta una mezcla de estas harinas vegetales, en el marco de la  
35 presente invención.

Entre los agentes de naturaleza orgánica, retenedores de humedad, se pueden citar derivados hidrófilos macromoleculares de origen vegetal, y especialmente los derivados hidrófilos celulósicos, y más particularmente la celulosa, pero también uno o varios agentes de desintegración. Puede resultar ventajoso utilizar estos compuestos, en particular cuando se emplean en los granulados de harinas tales como las harinas de trigo duro. Los agentes de desintegración incluyen: almidón, carboximetil-almidón de sodio, celulosa tal como celulosa microcristalina; celulosas modificadas tales como carboximetil-celulosa de sodio; bentonita, silicato de aluminio y de magnesio; polinaftalén-sulfonato de sodio, dodecilbenceno-sulfonato de sodio, dioctil-sulfosuccinato de sodio, sulfonato de lignina; un derivado de azúcares tal como lactosa, fructosa, sacarosa, manitol, dextrosa; y un derivado reticulado de polivinilpirrolidona. Cuando se emplea un agente de desintegración, la composición según la invención puede contener 0,5 a 30% y, con preferencia, 1 a 20% en peso de sustancia seca, del o de los agentes citados.

De acuerdo con una variante de la composición según la invención, la composición contiene igualmente 3 a 30%, con preferencia 4 a 20%, de azúcares. Los azúcares se eligen especialmente entre los mono- o poli-órganosacáridos, de modo especial entre sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa o también melaza o miel.

Las composiciones objeto de la invención pueden igualmente contener un agente conservante que previene la degradación de las harinas, tal como benzoato de sodio, 1,2-benzoisotiazolin-3-ona, ácido benzoico, ácido para-hidroxibenzoico y sus derivados los ésteres y sales alcalinos o alcalino-térreos, especialmente la sal de sodio, 2-fenilfenol y sus sales alcalinas o alcalino-térreas, de modo especial la sal de sodio y el para-nitrofenol.

Pueden igualmente incluirse otros aditivos tales como

agentes colorantes o agentes atractivos para los insectos perjudiciales, o repulsivos para los pájaros o animales útiles que se van a proteger.

Pueden utilizarse otros aditivos de formulaciones como  
5 agentes adhesivos, aglomerantes, apetitosos, aglutinantes, gelificantes, que producen hinchamiento, antiadherentes y otros.

Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) está formada por compuestos tales que  $R_1$  es CN, y/o  $R_2$  es haloalquilo,  $R_4$  es  $NH_2$ ,  $R_{11}$  y  $R_{12}$  son, independientemente uno  
10 de otro, un átomo de halógeno, y/o  $R_{13}$  es haloalquilo.

Según una variante particularmente ventajosa de la invención, el compuesto de fórmula (I) utilizado en la invención es 5-amino-3-ciano-1-[2,6-dicloro-4-(trifluoro-  
15 metil)fenil] -4-[trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol, al cual se hace referencia en los ejemplos con el término "fipronil".

Las formulaciones según la invención se encuentran generalmente en forma de granulados. El tamaño de los granulados está ventajosamente comprendido entre 0,1 mm y 3  
20 cm, con preferencia entre 0,5 y 4 mm. Estos granulados son ventajosamente insolubles en agua (en el sentido en que resisten la degradación por el agua).

Las composiciones según la invención pueden prepararse por simple mezcladura de los diversos constituyentes,  
25 preferentemente por extrusión o compresión en frío o en caliente, según cualquier técnica conocida de granulación o preparación de pastillas. Para la obtención de tales granulados, nos referiremos fácilmente, por ejemplo, a la solicitud de patente europea publicada con el número RP-  
30 0575838 y/o a otras técnicas, por ejemplo de extrusión, conocidas por el especialista.

La invención se refiere igualmente a un procedimiento de protección de cultivos contra los insectos, especialmente los elatéridos, caracterizado porque se aplica sobre el suelo o  
35 en su interior (preferentemente en su interior) en la zona

que se debe cultivar, una cantidad eficaz de una composición en forma de granulados de tamaño comprendido entre 0,2 mm y 2 cm, que contiene una materia activa elegida en el grupo constituido por los productos de fórmula (I), imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram y thiamethoxam. Se prefieren los productos de fórmula (I).

La invención se refiere más particularmente a un procedimiento de protección de cultivos de cereales, con preferencia maíz o remolacha, girasol, patatas o colza. La aplicación de las formulaciones según la invención tiene lugar ventajosamente antes de la siembra del citado cultivo, o simultáneamente con esta siembra.

La invención se refiere igualmente a un procedimiento de lucha contra los insectos, especialmente los elatéridos, caracterizado porque se aplica sobre el suelo o en su interior (con preferencia en su interior) en el que se encuentran dichos insectos o son susceptibles de encontrarse, una cantidad eficaz de una de las composiciones según la invención.

Como cantidades eficaces, se utilizan frecuentemente cantidades de composición que corresponden a una dosis de compuesto de fórmula (I) comprendida entre 1 y 50 g/ha, preferentemente entre 3 y 40 g/ha.

Una característica particular del procedimiento de lucha contra los insectos, según la invención, consiste en la aplicación, sobre el suelo o en su interior, de una composición que aporta una dosis no letal por contacto, pero letal por ingestión.

Dicho de otro modo, en el caso particular de los elatéridos, el procedimiento consiste en matar estos elatéridos por aplicación de una dosis no letal por contacto, pero letal por ingestión. Una hipótesis de la buena eficacia del procedimiento de tratamiento según la invención, que permite disminuir fuertemente las dosis de aplicación de los compuestos de fórmula (I) especialmente, se basa en el hecho

de que si el cebo según la invención ha producido la muerte de un elatérico, éste último puede servir de cebo para otros elatéricos que ingieren, por tanto, igualmente un producto (elatérico muerto) que contiene el insecticida.

5 En el sentido del presente texto, las palabras insecticida e insecto deben interpretarse en su acepción corriente principal y no en su acepción estrictamente científica (zoológica). Esto es así de modo que para el término insecto, se entiende cualquier animal muy pequeño, 10 tales como los artrópodos (insectos en el sentido estricto y zoológico, arácnidos, miriápodos) y nemátodos.

Como insectos del suelo contra los cuales la invención es particularmente eficaz, se pueden citar por ejemplo:

**Coleópteros** (wireworms (*Agriotes* spp), false wireworms, 15 white grubs) tales como, por ejemplo:  
*Agriotes lineatus* (elatérico europeo, Elateridae),  
*Agriotes sordidus* (elatérico europeo, Elateridae),  
*Agriotes obscurus* (elatérico europeo, Elateridae),  
*Agriotes sputator* (elatérico europeo, Elateridae),  
20 *Athous* spp. (Elateridae),  
*Atomaria linearis* (cryptophagidae),  
*Melolontha* spp. (gusano blanco, scarabacidae),  
*Bothynoderes*,  
*Limonius* spp. (elatérico US),  
25 *Melanotus* spp. (Elatérico US)  
*Diabrotica* spp. (cornrootworms, crysomelidae)  
*Tanymecus pallidus* (beet leaf weevil, curculionidae)  
**Lepidópteros** (Noctuelles) tales como :  
*Autographa* spp., *Mamestra* spp., *Agrotis* spp. (Cutworms,  
30 gusano gris), *Euxoa* spp. (Cutworms, gusano gris), *Spodoptera* spp. (*Spodoptera exigua*, *Spodoptera littoralis*).  
**Dípteros** tales como *Tipula* spp.).  
**Miriápodos** (Myriapoda):  
-Diplopoda = Millipedes,  
35 -Centipede.

Entre los elatéridos del suelo contra los cuales es particularmente eficaz la invención, se pueden citar *Agriotes* spp., *Athous* spp., y *Limonius* spp.

Los granulados según la invención se insertan con  
5 ventaja en el suelo, a una profundidad comprendida entre 1 y 5 cm.

Las composiciones según la invención son particularmente ventajosas porque permiten la utilización de dosis más bajas de producto activo que las composiciones semejantes  
10 conocidas.

Los ejemplos que siguen ilustran la invención, sin constituir, en modo alguno, una limitación de la misma. En estos ejemplos, el compuesto de fórmula (I) utilizado es fipronil.  
15

#### Ejemplo 1:

20 Se sembró con maíz una superficie de 0,1 ha, a razón de aproximadamente 8.000 semillas, no tratadas. Esta superficie se dividió en parcelas de 40 m<sup>2</sup>.

Al mismo tiempo que la semilla, se incorporaron al suelo, en el surco de la semilla, granulados de 2 mm que  
25 contenían una composición constituida por:

- 0,25% de fipronil,
- 93,5% de harina de maíz,
- 2% de celulosa,
- 4% de lactosa,
- 30 0,2% de para-nitrofenol,
- 0,05% de pigmento azul 15.3,

Las cantidades de granulados así repartidas variaron de 2,5 a 10 kg por hectárea. Se conservaron parcelas no tratadas para servir de testigos y verificar la importancia de los  
35 daños producidos por los insectos. De igual modo, se trataron

parcelas con un insecticida comercial, reputado como eficaz, y denominado "referencia". Cada modalidad se repitió cuatro veces.

5      Aproximadamente 20 días después de la siembra, se contaron las plantas de maíz que habían brotado.

En la localidad de St Hilaire (30), 22 días después de la siembra, se observaron en el surco de las 4 parcelas no tratadas 19 plantas por cada 10 metros de surco. En las parcelas tratadas según la invención con la dosis de Fipronil  
10 de 6 g por hectárea, se observaron 49 plantas por cada 10 metros de surco.

Con la dosis de Fipronil de 12,5 g por hectárea se observaron 48 a 50,5 plantas por cada 10 metros de surco.

15      Con la dosis de Fipronil de 25 g por hectárea se observaron 45,5 a 51,3 plantas por cada 10 metros de surco.

Con la dosis de Fipronil de 50 g por hectárea se observaron 49 plantas por cada 10 metros de surco.

20      Para obtener el mismo resultado con un granulado clásico (arcilla como soporte), fue preciso aportar 200 g de fipronil por hectárea.

Se escarbó y rascó el suelo para capturar e identificar los insectos responsables de los daños, y se observó, para el testigo no tratado, una presencia importante de larvas de elatéridos del género Agriotes, en particular Agriotes  
25 sordidus.

#### Ejemplo 2:

30      Se sembró con maíz, a razón de aproximadamente 98.100 granos no tratados, una superficie de 1 ha. Esta superficie se dividió en parcelas de 27 m<sup>2</sup>.

Al mismo tiempo que la siembra, se incorporaron al suelo, en el surco de la semilla, granulados de 2 mm que contenían una composición constituida por:

35      0,25% de fipronil,

- 93,5% de harina de maíz,  
2% de celulosa,  
4% de lactosa,  
0,2% de para-nitrofenol,  
5 0,05% de pigmento azul 15,3.

Las cantidades de granulados así esparcidas variaron de 2,5 a 10 kg por hectárea. Se conservaron parcelas no tratadas para servir de testigos y verificar la importancia de los daños causados por los insectos. De igual modo, se trataron  
10 parcelas con un insecticida comercial, reputado por su eficacia, y denominado "referencia". Cada modalidad se repitió cuatro veces.

Aproximadamente 50 días después de la siembra, se contaron las plantas de maíz que habían brotado.

- 15 En la localidad de Beaufort (62), 50 días después de la siembra, se observaron en el surco de las cuatro parcelas no tratadas, 30 plantas por cada 10 metros de surco. En las parcelas tratadas según la invención, con la dosis de Fipronil de 6 g por hectárea, se observaron 40 plantas por cada 10  
20 metros de surco.

Con la dosis de Fipronil de 12,5 g por hectárea, se observaron 43 a 46 plantas por cada 10 metros de surco.

Con la dosis de Fipronil de 25 g por hectárea se observaron 44,5 a 50 plantas por cada 10 metros de surco.

- 25 Con la dosis de Fipronil de 50 g por hectárea se observaron 49,8 plantas por cada 10 metros de surco.

Para obtener el mismo resultado (52 plantas por cada 10 metros de surco) con un granulado clásico (soportado por arcilla) fue necesario aportar 200 g de Fipronil por  
30 hectárea.

El suelo se excavó y rascó para capturar e identificar los insectos responsables de los daños, y se observó, para el testigo no tratado, una presencia importante de larvas de elatéridos del género Agriotes, en particular Agriotes  
35 lineatus.

Ejemplo 3: Ensayos de eficacia de los granulados de cebo según la invención, sobre un cultivo de patata.

Al mismo tiempo que la siembra, se incorporaron al suelo, en el surco de la siembra, granulados según la invención constituidos por:

- 12,5 g/kg de fipronil (a partir de una SC con 500 g/l de fipronil),
- 945,5 g/kg de harina a) de maíz (granulados A) o b) de arroz (granulados B),
- 40 g/kg de lactosa,
- 2 g/kg de pera-nitrofenol.

Se comparó la eficacia contra Agriotes (elatéridos) 90 días después de la siembra de los dos granulados A y B anteriores, utilizados a dosis de 5 y 2,5 g de Fipronil por hectárea, y del mismo fipronil utilizado por pulverización a las dosis de 50 y 25 g por hectárea (a partir de Regent<sup>(R)</sup> 800WG) (compuesto C).

Se observaron entonces los resultados siguientes, expresados en número de perforaciones por cada 10 tubérculos (=N) :

| Product<br>o    | A   | A | B   | B | C   | C  | testigo* |
|-----------------|-----|---|-----|---|-----|----|----------|
| Dosis<br>(g/ha) | 2,5 | 5 | 2,5 | 5 | 2,5 | 50 | -        |
| N               | 6   | 1 | 7   | 3 | 6   | 1  | 14       |

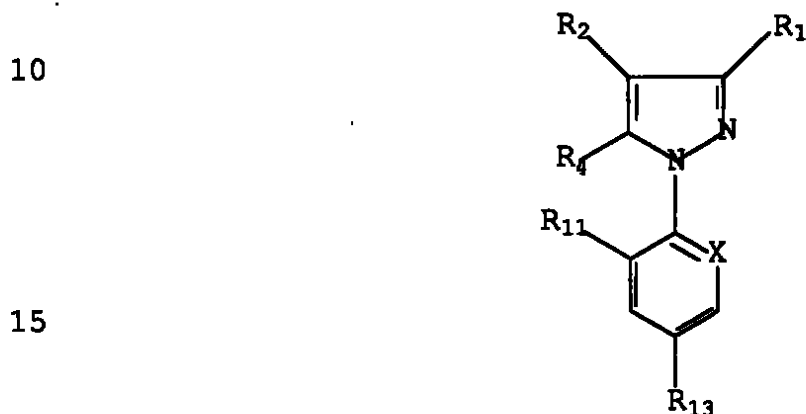
\* testigo no tratado

Este resultado muestra claramente el buen control de los elatéridos obtenido para los granulados según la invención, que dieron el mismo resultado que el Regent<sup>(R)</sup> 800WG, pero con una dosis disminuida en un factor 10.

## REIVINDICACIONES

### 1. Composiciones insecticidas que contienen:

- 5            -a) entre 0,001 y 5%, con preferencia entre 0,05 y 1% y aun más ventajosamente entre 0,05 y 0,5%, de un compuesto de fórmula (I):



(I)

en la que:

- 20             $R_1$  es un átomo de halógeno, un grupo CN, un grupo metilo o un grupo  $\text{CH}_3\text{CO}$ ;
- $R_2$  es  $\text{S}(\text{O})_n\text{R}_3$ ;
- $R_3$  es alquilo o haloalquilo;
- $R_4$  representa un átomo de hidrógeno o de halógeno; o un
- 25            radical  $\text{NR}_5\text{R}_6$ ,  $\text{S}(\text{O})_m\text{R}_7$ ,  $\text{C}(\text{O})\text{R}_7$  ó  $\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{R}_7$ , alquilo, haloalquilo u  $\text{OR}_8$  ó un radical  $-\text{N}=\text{C}(\text{R}_9)(\text{R}_{10})$ ;
- $R_5$  y  $R_6$  representan, independientemente, un átomo de hidrógeno o un radical alquilo, haloalquilo,  $\text{C}(\text{O})\text{alquilo}$ ,  $\text{S}(\text{O})_r\text{CF}_3$ , ó  $R_5$  y  $R_6$  pueden formar juntos un radical alquilenodivale
- 30            lente que puede estar interrumpido por uno o dos heteroátomos divalentes tales como oxígeno o azufre;
- $R_7$  representa un radical alquilo o haloalquilo;
- $R_8$  representa un radical alquilo, haloalquilo, o un átomo de hidrógeno;
- 35             $R_9$  representa un radical alquilo o un átomo de hidró-

geno;

$R_{10}$  representa un grupo fenilo o heteroarilo eventualmente sustituido por uno o varios átomos de halógeno o grupos tales como OH, -O-alquilo, -S-alquilo, ciano o alquilo;

5  $R_{11}$  y  $R_{12}$  representan, independientemente uno del otro, un átomo de hidrógeno o de halógeno;

$R_{13}$  representa un átomo de halógeno o un grupo haloalquilo, haloalcoxi,  $S(O)_qCF_3$  ó  $SF_5$ ;

10 m, n, q, r representan, independientemente uno del otro, un número entero igual a 0, 1 ó 2;

X representa un átomo de nitrógeno trivalente o un radical C- $R_{12}$ , formando parte del ciclo aromático las otras tres valencias del átomo de carbono;

con la condición de que, cuando  $R_1$  es metilo, entonces  
15  $R_3$  es haloalquilo,  $R_4$  es  $NH_2$ ,  $R_{11}$  es Cl,  $R_{13}$  es  $CF_3$  y X es N;

-b) entre 0,05 y 10%, con preferencia entre 0,1 y 5%, de uno (o varios) agentes retenedores de humedad, preferentemente un agente de retención de humedad, de naturaleza orgánica; y

20 -c) entre 40 y 99%, con preferencia entre 50 y 98% (y más preferentemente entre 70 y 97%), de harina vegetal.

2. Composiciones insecticidas según la reivindicación 1, caracterizadas porque las harinas proceden de la molturación  
25 de granos de cereales como trigo, cebada, centeno, triticale, avena, o también arroz, sorgo, soja y maíz.

3. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizadas porque la harina es  
30 harina de maíz.

4. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizadas porque entre los agentes retenedores de humedad, de naturaleza orgánica, se  
35 pueden citar los derivados hidrófilos macromoleculares de

origen vegetal, y especialmente los derivados hidrófilos celulósicos, y más particularmente la celulosa.

5 5. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizadas porque la composición contiene igualmente 3 a 30%, con preferencia 4 a 20%, de azúcares.

10 6. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizadas porque los azúcares se eligen especialmente entre mono-, oligo-, o poli-órgano-sacáridos, especialmente entre sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa o también melaza o miel.

15 7. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizadas porque contienen igualmente un agente conservante que previene la degradación de las harinas, elegido entre benzoato de sodio, 1,2-benzo-isotiazolin-3-ona, ácido benzoico, ácido para-hidroxibenzoico y sus derivados ésteres y sales alcalinos o 20 alcalino-térreos, de modo especial la sal de sodio, 2-fenil-fenol y sus sales alcalinas o alcalino-térreas, especialmente la sal de sodio, y para-nitro-fenol.

25 8. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizadas porque contienen otros aditivos tales como agentes colorantes o agentes atractivos para los insectos perjudiciales, o repulsivos para los pájaros o animales útiles o que han de protegerse, y/u otros aditivos de formulaciones, como agentes adhesivos, aglome- 30 rantes, apetitosos, aglutinantes, gelificantes, de hinchamiento, antiadherentes y otros.

35 9. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizadas porque el compuesto de fórmula (I) es 5-amino-3-ciano-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fe-

nil]-4-[(trifluormetil)sulfinil]-1H-pirazol.

10. Composiciones insecticidas según una de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizadas porque las formulaciones según la invención se encuentran en forma de granulados, estando el tamaño de estos granulados comprendido ventajosamente entre 0,1 mm y 3 cm, preferentemente entre 0,5 y 4 mm, y porque estos granulados son ventajosamente insolubles en agua.

10

11. Procedimiento de lucha contra los insectos, caracterizado porque se aplica sobre o en el interior del suelo (preferentemente en el interior del suelo) de la zona antes de ser cultivada, una cantidad eficaz de una composición según una de las reivindicaciones 1 a 10, en forma de granulados de tamaño comprendido entre 0,2 mm y 2 cm.

12. Procedimiento de protección de cultivos según la reivindicación 11, caracterizado porque se emplea un compuesto de fórmula (I).

13. Procedimiento según una de las reivindicaciones 11 ó 12, caracterizado porque se protegen los cultivos de cereales, con preferencia de maíz, remolacha, girasol, patata o colza.

14. Procedimiento según una de las reivindicaciones 11 a 13, caracterizado porque se utiliza una cantidad eficaz de una de las composiciones según la invención, para la lucha contra los insectos, especialmente los elatéricos.

15. Procedimiento según una de las reivindicaciones 12 a 14, caracterizado porque la cantidad eficaz de composición corresponde a una dosis de compuesto de fórmula (I)

424

comprendida entre 1 y 50 g/ha, preferentemente entre 3 y 40 g/ha.

16. Procedimiento de lucha contra los insectos que  
5 consiste en la aplicación sobre el suelo o en el interior del mismo, de una composición que aporta una dosis no letal por contacto pero letal por ingestión.

17. Procedimiento según la reivindicación 16 aplicable  
10 a los elatéricos.

15

20

25

30

35

## RESUMEN DESCRIPTIVO

Composiciones insecticidas que contienen:

- 5           -a) entre 0,001 y 5%, con preferencia entre 0,05 y 1%, de un compuesto de tipo 1-fenil-pirazol, especialmente 1-[2,6-Cl<sub>2</sub> 4-CF<sub>3</sub> fenil]3-CN 4-[SO-CF<sub>3</sub>] 5-NH<sub>2</sub> pirazol; y
- 10           -b) entre 0,05 y 10%, con preferencia entre 0,1 y 5%, de uno (o varios) agentes retenedores de humedad, preferentemente un agente retenedor de humedad, de naturaleza orgánica; y
- c) entre 40 y 99%, con preferencia entre 50 y 98% (y más preferentemente entre 70 y 97%), de harina vegetal.
- 15           Procedimiento de lucha contra los insectos, que utiliza esta composición, especialmente contra los elatéricos..

Folios 46 y 47 corresponden a tarjeta temático y prospectivos  
HSC

**EXTRACTO PARA PUBLICACION**  
**SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

|                                                                                                                                   |                                                          |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------|
| (21) No SOLICITUD                                                                                                                 | (51) INT CL                                              |
| (22) FECHA DE PRESENTACION                                                                                                        | (71) SOLICITANTE AVENTIS CROPS SCIENCE S A               |
| (30) PRIORIDAD                                                                                                                    |                                                          |
| (31) No DE SOLICITUD 99 11312                                                                                                     | (72) INVENTOR/ES JEAN-MICHEL GAULLIARD, CHRISTIAN SEGAUD |
| (32) FECHA DE PRESENTACION 07-09-99                                                                                               |                                                          |
| (33) PAIS FR                                                                                                                      | (74) APODERADO CARLOS R OLARTE                           |
| (54) TITULO COMPOSICIONES INSECTICIDAS CUYA MATERIA ACTIVA ES DE TIPO FENIL-PIRAZOL, Y PROCEDIMIENTO DE LUCHA CONTRA LOS INSECTOS |                                                          |

(57) RESUMEN

Compuestos insecticidas que contienen

a) entre 0,001 y 5%, con preferencia entre 0,05 y 1%, de un compuesto de tipo 1-fenil-pirazol, especialmente 1-[2,6-Cl<sub>2</sub> 4-CF<sub>3</sub> fenil]3-CN 4-[SO-CF<sub>3</sub>] 5-NH<sub>2</sub> pirazol, y

b) entre 0,05 y 10%, con preferencia entre 0,1 y 5%, de uno (o varios) agentes retenedores de humedad, preferentemente un agente retenedor de humedad, de naturaleza orgánica, y

c) entre 40y 99%, con preferencia entre 50 y 98% (y más preferentemente entre 70 y 97%), de harina vegetal

Procedimiento de lucha contra los insectos, que utiliza esta composición, especialmente contra los elatéridos

### REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

**PATENTE DE INVENCION** ☒

## MODELO DE UTILIDAD [ 1 ]

- |                                                                                               |    |     |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------|----|-----|
| • Nombre e identificación del Solicitante                                                     | 1  | [ ] |
| • Nombre e identificación del Inventor                                                        | 1  | [ ] |
| • Título o nombre de la invención                                                             | 1  | [ ] |
| • Descripción                                                                                 | 28 | [ ] |
| • Reivindicaciones                                                                            | 40 | [ ] |
| • Resumen                                                                                     | 45 | [ ] |
| • Comprobante de Pago                                                                         | 3  | [ ] |
| • Poder, cuando proceda                                                                       | 4  | [ ] |
| • Copia de la primera solicitud de patente, si reivindica prioridad, señalándola expresamente |    | [ ] |
| • Firma del solicitante o apoderado                                                           | 2  | [ ] |

**COMPLETA [ ]**

INCOMPLETA [ ]

## DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

- |                                                                      |   |     |
|----------------------------------------------------------------------|---|-----|
| • Nombre e identificación del peticionario                           | 4 | [ ] |
| • Nombre e identificación del inventor o diseñador                   | 3 | [ ] |
| • Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse | 4 | [ ] |
| • Representación gráfica                                             | 3 | [ ] |
| • Comprobante de pago                                                |   | [ ] |
| • Poder, cuando proceda                                              |   | [ ] |
| • Firma del solicitante o apoderado                                  |   | [ ] |

**COMPLETA [ ]**

INCOMPLETA [ ]

**Firma Responsabile**

**Fecha** \_\_\_\_\_

**Carrera 13 No 27-00 Piso 5 y 10**  
**Conmutador 334 12 21-2-3-4**  
**Fax. 281 31 25 e-mail [info@sc.gov.co](mailto:info@sc.gov.co)**  
**Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia**

## DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

### PRIMER EXAMEN DE FORMA

**EXPEDIENTE 00-67188**

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 [ X ] | NO APLICABLE [ ] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art 14-a)                                                                                              |
| SI [ X ] | 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 [ x ] | 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 la Resolución 02 del 4 de Enero del 2000)    |
| SI [ X ] | NO [ ]   | EXTEMPORANEAMENTE [ ] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París                                                         |
| SI [ x ] | 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 [ x ] | 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 SIC) |

SI [ ] NO [ X ] **CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS**

**OBSERVACIONES** Con el fin de aceptar el poder presentado con la solicitud, el solicitante debe allegar la traducción del mismo, hecha por un traductor oficial, junto con el aval del mismo hecha por el Ministerio de Relaciones Exteriores, de conformidad con el artículo 260 del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, debe presentarse la sustitución del poder, otorgada por quien aparece como apoderado principal (artículo 66 del Código de Procedimiento Civil)

En consecuencia, se conceptua que esta solicitud

SI [ ] NO [ x ] Se ajusta a los aspectos **FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,

SI [ ] NO [ x ] Se recomienda **PUBLICAR** el extracto correspondiente

Santafé de Bogotá, D C , 8 de septiembre del 2000

**EXAMINADOR JURIDICO**

202022

1º EXAMEN DE FORMA

Radicacion no 0067188

Concepto Tecnico no 1493 Clasificacion Internacional de Patentes A01N 43/48, 43/56

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art 21 de la Decision 344 se determino que esta solicitud de **Patente de Invención**

- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificacion 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 invencion en forma correcta (Art 13-e)
- SI ☒ NO ☐ Contiene el titulo o nombre de la invención en forma correcta (Art 13-b)
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripcion clara y completa de la invencion (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 mas reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la proteccion mediante la patente (Art 13-d)
- SI ☐ NO ☒ Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del articulo 4 del Dto 117 /94
- SI ☐ NO ☒ Contiene el arte final del dibujo caracteristico de acuerdo con el literal c) del articulo 4 y el articulo 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)

Bogota, D C, sep 14/2000

EXAMINADOR TECNICO  
Código 202026

**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**  
**Primer Examen de Forma**

CONCEPTO TECNICO N° 1493

EXPEDIENTE N° 0067188

A01N 43/48, 43/56

Se recomienda corregir el extracto para publicación de manera que los *espacios en blanco no induzcan a error*

Falta el arte final de la fórmula estructural tamaño 12x12 cm, por duplicado para efectos de publicación y 6x6 cm para la tarjeta del archivo temático

Bogotá , D C ,Septiembre 14 del 2000

EXAMINADOR TECNICO  
Código 202026

110

3  
81

## DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 00-67188

AUTO 3211

### 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 Bogotá D C , a los

03 OCT. 2000

**EL JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,**

**ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL**

**NOTIFICADO POR ESTADO**

Bogotá D C , 05 OCT 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha

**VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO**

**SOLICITO PRORROGA TERMINO SI \_\_\_\_ NO \_\_\_\_**

**VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA**

202022