



Industria y Comercio

S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

Division de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21 EXPEDIENTE No

06-43845

54 TÍTULO

NICOTINOILCARBAMATOS SUBSTITUIDOS COMO PESTICIDAS

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

A01N 43/40,

71 SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO

MONHEIM REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74 APODERADO

EMILIO FERRERO

C C 438 019 de Usaquén

22 BOGOTÁ, D C ,



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 08-043845-00000-00000 Fec: 2008-05-09 17:36:30
op. 2020 NUECREACIONES
Tiro: 11 PATENTEYII Ene 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios: 67

ón

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

- 1

☒ Patente de Invención.
☒ Capítulo I.
- ☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo II.

2 SOLICITANTE (71)	Nombre: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT sociedad constituida y existente bajo las leyes de la República Federal de Alemania. Dirección: Alfred-Nobel-Str. 50 Monhelm 40789 República Federal de Alemania Domicilio: Monhelm República Federal de Alemania	IDENTIFICACIÓN C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número _____	
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 36 11 Fax: 211 86 50 E-mail: clientes@camyp.com Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACIÓN C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número <u>438.019</u> T.P <u>31.929</u>	
4 INVENTOR (ES) (72)	1. Masahito ITO 4-3-27, Kamikashiwada, Ushiku-shi, Ibaraki 300-1232, Japón 3. Koichi ARAKI 2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi, Ibaraki 300-1216, Japón 5. Katsuhiko SHIBUYA 6-14-4, Midori, Minamikawachi-machi, Kawachi-gun, Tochigi 329-0433, Japón 2. Tetsuya MURATA 7-16-24-202, Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0807, Japón 4. Yulchi OTSU 1-5-7, Ekiminami-cho, Oyama-shi, Tochigi 323-0822, Japón 6. Norihiko NAKAKURA 3-2-7, Gion, Minamikawachi-machi, Kawachi-gun, Tochigi 329-0434, Japón		
5 PCT (86) Solicitud Internacional No. <u>PCT/EP2004/012276</u> Publicación Internacional No. <u>WO 2005/047255 A1</u>	Fecha: <u>29 de octubre de 2004</u> Fecha: <u>26 de mayo de 2005</u>		
6 Título (54) <u>NICOTINOILCARBAMATOS SUBSTITUIDOS COMO PESTICIDAS</u>			
7 Clasificación Internacional (51) <u>C07D 213/82</u>	<u>A01N 43/40</u>		
8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>JP</u> <u>JP</u>	(32) Fecha <u>13 de noviembre de 2003</u> <u>18 de junio de 2004</u>	(31) Número de Solicitud <u>2003-383977</u> <u>2004-181700</u>

9

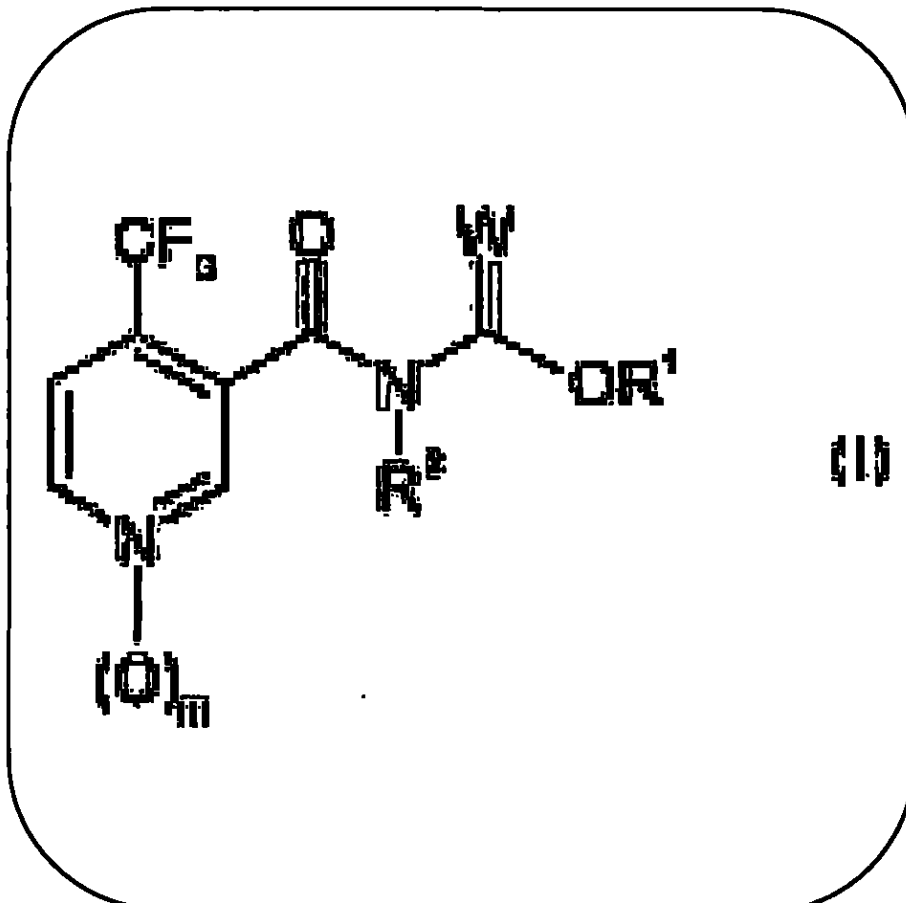
Comprobante de pago No.: 06-32.843Fecha: 3 de mayo de 2006

10

Anexos:

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00.
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS

11

FIGURA CARACTERÍSTICA

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA : *Emilio Ferrero*

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

FCC

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/047255 A1**

Descripción:

Páginas 21 en el idioma original

Páginas 29 en español

Reivindicaciones: Número (s) 8

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
3. ☒ **Extracto de publicación.**

NO SE PRESENTARON MODIFICACIONES EN LA FASE INTERNACIONAL

Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of-Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-
ATTORNEY

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned
Bayer CropScience AG

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4° N° 72 35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambas, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4° N° 72 35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn, or of the first or second alternates in their turn, or both of them, second, shall be such that the representation can be taken again in the sequence, by the principal, the first or second alternate, or both of them, second, and the mere fact or its exercise will suffice to take over the representation by the first, second or third alternate in their turn, shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above named attorneys at law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons,

administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento; en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblem, domain names, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

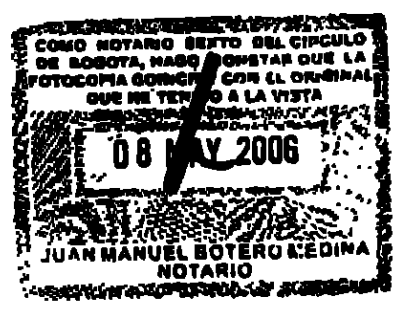
Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003
en/in Leverkusen
por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Handwritten signatures: "H. Bader" and "R. Jesse"



2 X

AUTENTICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

El suscrito Notario Certifica: Que la firma que antecede de
Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

es auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo

de Secretarias

de la compañía Bayer CropScience AG

sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a
las leyes de Alemania

que la dirección de dicha compañía es Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Alemania

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los
documentos respectivos y de todo ello da fe.

Dado y firmado en Leverkusen

El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature
of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

is authentic, that the signatory currently acts in the position of

secretaries

of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of
Germany

that the address is Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Germany

and that the signatory has the power to grant this document.

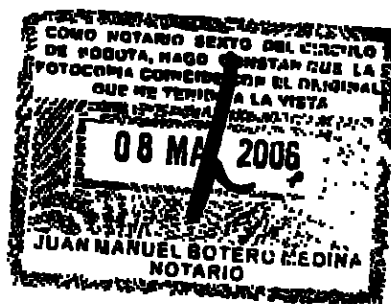
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



8

URNr. 242/2003

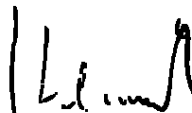
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

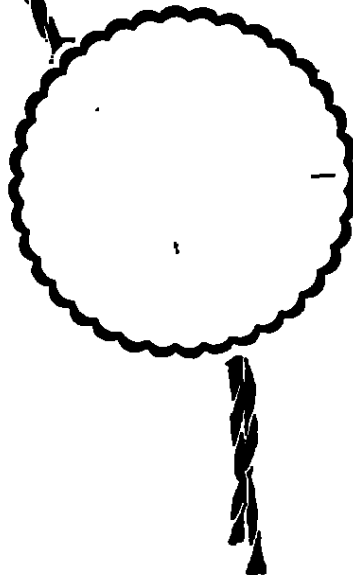
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht in das Handelsregister des
Amtsgerichts Langenfeld - HRB 3990 -, daß die genannten Herren
berechtigt sind, die Bayer CropScience Aktiengesellschaft in
Monheim am Rhein als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 12. Februar 2003


Notar



(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Diese öffentliche Urkunde

Dirk Heiderhoff

Notars Dirk Heiderhoff

in Leverkusen

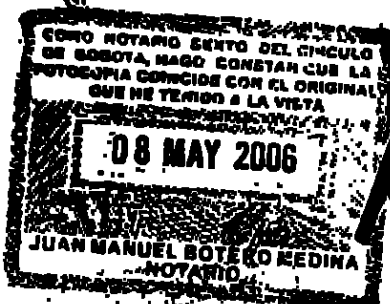
17. FEB. 2003

6. am

8. under Nr. 482/03

10. Unterschrift:

...lain Calisto



Feb 5 190

Eu 13.

528

ଅଧ୍ୟାୟ ୧୫

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 10.09/02 realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia y registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

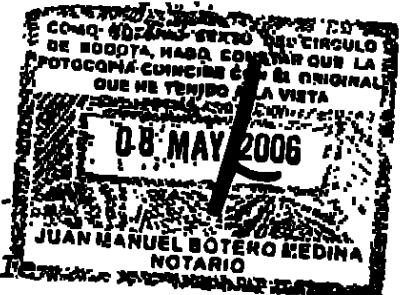
A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 de enero de 2003 y otorga derechos de representación y poder a los Doctores EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, tpa. 23555 y GERMÁN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4° No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003
en Leverkusen
por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD) en donde se certifican la firma anterior del Doctor Axel Bader y del Doctor Ralf-Rüdiger Jesse como

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

Secretari a de Bayer CropScience AG, una sociedad actualmente existente y rganizada de acuerdo a las leyes de Alemania y con direcci3n en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania. Dado y firmado en Leverkusen el 12 de febrero del 2003.

Firma Ilegible
Notario P3blico

Sello

Se anexa autenticaci3n notarial en alem3n de las firmas anteriores.

Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el de febrero de 2003 bajo el n3mero 482/03.

RECEIVED
JAN 15 2003
DEPT. OF JUSTICE
IMMIGRATION & NATURALIZATION SERVICE
WASHINGTON, DC 20535

Es traducci3n fiel y completa de la cual se deja copia en esta ficina para su confrontaci3n.

DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAOL - INGLES - INGLES - ESPAOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

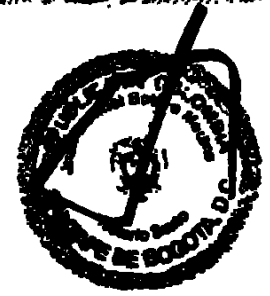
COMO NOTARIO SENTO EN EL CIRCULO
DE FOTOGRAFIA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCIDE CON EL ORIGINAL
QUE ME TENGO A LA VISTA
08 MAY 2006
JUAN MANUEL SOTERO MEDINA
NOTARIO

EN SE ANHE
 REPUBLICA DEL ECTO
 2003 MAR 18 P 12:24
 JEFE DE LEGACION
 BOGOTA D.C.

COMO NOVENO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
 BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIORES FIR-
 MA(S) PUESTA(S) POR Vergara
 IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s) _____
 ES(SON) AUTENTICA(S)
 SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE
 RELACIONES EXTERIORES

208992
 J. Vergara
 ESTA FIRMA APARECE EN EL
 DOCUMENTO DESEMPESADA
 LAS FUNCIONES INDICADAS



COMO NOVENO SEXTO DEL CIRCULO
 BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
 COPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
 QUE NO FUE A LA META
 08 MAY 2006
 JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
 NOTARIO

TRADUCCION OFICIAL No. 9450

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

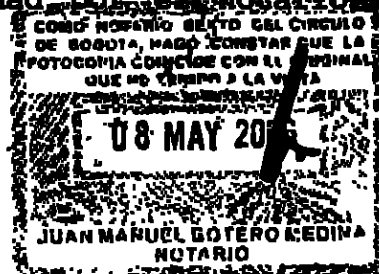
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 8317; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 12 de febrero 2003 en Leverkusen, Alemania, por los señores Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse.

Autenticación en español e inglés de las firmas antecedentes y certificación de existencia de la sociedad por el notario de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



1112 ORIGINAL DE FERRER
IN-DE-OFICIAL
[Signature]
de-1

Protocolo notarial 242/2003

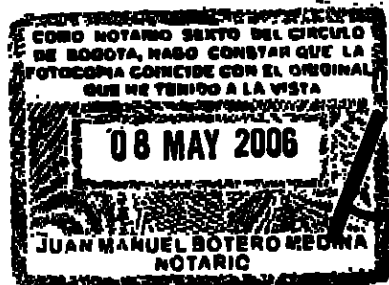
Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas ante mí por los señores

1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,

a quienes conozco en persona.

Certifico, por haber tenido la lista el registro de comerci del Juzgado Municipal de Langenfeld -HRB 3990- que los mencionados señores están facultados, en su calidad de apoderados, para representar individualmente a la firma Bayer CropScience Aktiengesellschaft, domiciliada en Monheim am Rhein.

Leverkusen, 12 de febrero 2003
(Hilo y oblea notarial)
Fdo.: firma ilegible, Notario



Costas

Art. 141, 154 Kost0

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-

ANEXO AL NÚMERO 1 OFICIAL
F. Botero
Regist. ...

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	<u>EUROS 5,28</u>
Total	EUROS 38,28
Fdo.: Heiderhoff, notario	

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Dirk Heiderhoff, notario
Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6. El 17 de febrero 2003

7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

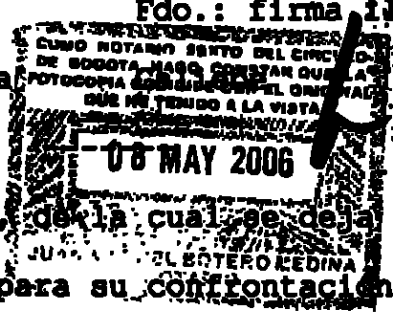
9. Sello

10. Firma

El Presidente del

Fdo.: firma ilegible

Tribunal Regional de Colonia



ES TRADUCCIÓN FIEL COMPLETA, de la cual se deja copia en l s
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 14 de marzo 2003.

Handwritten signature: Diego Guzmán Acevedo

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

Andrés de la
LUTIA FERRAZ VILLALBA EN EL
GOBIERNO DESAMPARA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL ESTADO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFES DE SECCION
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAY CONSTANCIA DE LAS ANTERIORES FIR-
MAS PUESTAS POR *Guillermo José*
de la Torre
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s) _____
ES(SON) AUTENTICAS;
SANTA FE DE BOGOTA, 18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAY CONSTANCIA QUE LA
FOTOCOPIA CONFORME CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
05 MAY 2006
JUAN VA. DEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



19

(43) International Publication Date
26 May 2005 (26.05.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/047255 A1

not Sk

(51) International Patent Classification⁷: C07D 213/82,
213/89, C07F 7/08, C07D 405/12, 409/12, 401/12, A01N
43/40

Norilko (JP/JP); 3-2-7, Gion, Minamikawachi-machi,
Kawachi-gun, Tochigi 329-0434 (JP).

(21) International Application Number:
PCT/EP2004/012276

(74) Common Representative: BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(22) International Filing Date: 29 October 2004 (29.10.2004)

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, GR, GU, HT, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM;
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Date:
2003-383977 13 November 2003 (13.11.2003) JP
2004-181700 18 June 2004 (18.06.2004) JP

(71) Applicant (for all designated States except US):
BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
[DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): ITO, Masahito
[JP/JP]; 4-3-27, Kamikashiwada, Ushiku-shi, Ibaraki
300-1232 (JP). MURATA, Tetsuya [JP/JP]; 7-16-24-202,
Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0807 (JP). ARAKI, Koichi
[JP/JP]; 2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi, Ibaraki 300-1216
(JP). OTSU, Yutchi [JP/JP]; 1-5-7, Ekiminami-cho,
Oyama-shi, Tochigi 323-0822 (JP). SHIBUYA, Kat-
suhiko [JP/JP]; 6-14-4, Midori, Minamikawachi-machi,
Kawachi-gun, Tochigi 329-0433 (JP). NAKAKURA,

Published:

— with international search report

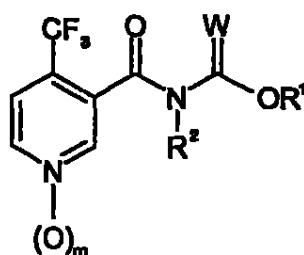
For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.



WO 2005/047255 A1

BCS 03 7009

(54) Title: SUBSTITUTED NICOTINOYL CARBAMATES AS PESTICIDES



(I)

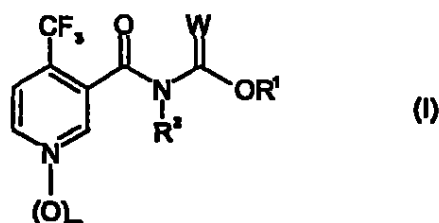
(57) Abstract: Novel nicotinoyl carbamates represented by the general formula (I) wherein W, R¹, R², W and m are as defined in the specification, their use as pesti-
cides, and processes for their preparation are described.

SUBSTITUTED NICOTINOYL CARBAMATES AS PESTICIDES

The invention relates to novel nicotinoyl carbamates, to their use as pesticides, preferably as insecticides and to processes for their preparation.

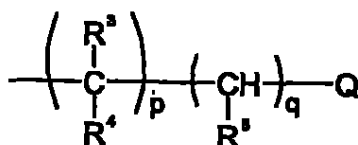
JP 321903/1994 and JP 101648/1998 describe amide type compounds or their salts and their use as agents for controlling harmful organisms.

The invention, accordingly, provides novel nicotinoyl carbamates of the general formula (I)



in which

- m represents 0 or 1,
- 10 W represents O or S,
- R² represents hydrogen, alkyl, alkenyl, aralkyl, cyanomethyl, alkoxycarbonylalkyl, aralkyloxycarbonyl, acyl, alkoxyalkyl or phenyl; and
- R¹ represents



15 wherein

- R³ represents hydrogen or alkyl,
- R⁴ represents hydrogen, alkyl, haloalkyl, phenyl or alkoxycarbonyl,
- R⁵ represents hydrogen or alkyl,
- p represents 0 or 1,

q represents 0 or 1, and

Q represents aryl that may be optionally substituted; 5- or 6-membered heterocyclic group that contains at least one hetero atom selected from the group consisting of N, O and S and may be optionally substituted; phenyl-substituted cycloalkyl; condensed bicyclic hydro-
5 carbon group; trimethylsilyl; alkenyl or alkynyl.

The compounds of the formula (I), according to the present invention, have strong insecticidal activities and show good compatibility to various crops.

According to the present invention the compounds of the formula (I) surprisingly show very excellent insecticidal action compared with the similar compounds to the compounds of the formula (I),
10 described in the prior art (e.g. JP 321903/1994 and JP 101648/1998).

In the present specification, the following definitions shall apply if no specific other definition is given:

"Halogen" represents fluoro, chloro, bromo or iodo; and preferably represents fluoro, chloro or bromo.

15 "Alkyl" represents a straight-chain or branched-chain C_{1-12} alkyl, for example, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, n-pentyl, n-hexyl, n-heptyl, n-octyl, n-nonyl, n-decyl, n-undecyl, n-dodecyl, etc. and preferably represents C_{1-6} alkyl.

Each alkyl part of "haloalkyl", "alkoxycarbonyl", "alkoxycarbonylalkyl" and "alkoxyalkyl" there can be mentioned the same as described in the above-mentioned "alkyl".

20 "Alkenyl" represents a straight-chain or branched-chain C_{2-6} alkenyl, for example, vinyl, allyl, 1-propenyl, isopropenyl, 2-butenyl, 2-pentenyl, 2-hexenyl, etc. and preferably represents C_{2-4} alkenyl.

"Alkynyl" represents a straight-chain or branched-chain C_{2-6} alkynyl, for example, ethenyl, propargyl, 1-propynyl, isopropenyl, 1- (2- or 3) butynyl, 1- (2- or 3) pentenyl, 1- (2- or 3) hexenyl, etc. and preferably represents C_{2-4} alkynyl.

25 "Aryl" represents C_{6-10} aromatic hydrocarbon cyclic group, for example, phenyl, naphthyl, etc. and preferably represents phenyl.

"Aralkyl" represents, for example, benzyl, α -methylbenzyl, 2-phenylethyl, α,α -dimethylbenzyl, etc. and preferably represents benzyl.

"Heterocyclic group" represents a saturated or unsaturated 5-6-membered heterocyclic group containing at least one, preferably 1-3 hetero atoms selected from N, O and S and represents, for example, furyl, thienyl, pyrrolyl, pyrrolidinyl, tetrahydrofuryl, tetrahydrothienyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, isoxazolyl, oxazolyl, isothiazolyl, thiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, 5 piperidinyl, pyrazinyl, pyranyl, tetrahydropyranyl, tetrahydrothiopyranyl, thiopyranyl, etc.

"Condensed bicyclic hydrocarbon group" represents a condensed bicyclic C₉₋₁₀ hydrocarbon group, for example, indenyl, indanyl, tetrahydronaphthyl, etc. and preferably represents indanyl or tetrahydronaphthyl.

"Aralkyl" part of "aralkyloxycarbonyl" represents the same group as described in the above-mentioned definition of "aralkyl". 10

"Cycloalkyl" represents C₃₋₈cycloalkyl, for example, cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cycloheptyl or cyclooctyl, preferably represents C₅₋₇cycloalkyl, and particularly cyclohexyl is preferable.

Preferred substituents or preferred ranges of the radicals present in the formulae (I) and the corresponding intermediate compounds are defined below. 15

W preferably represents O or S.

R³ preferably represents hydrogen or C₁₋₄alkyl.

R⁴ preferably represents hydrogen, C₁₋₄alkyl, halo-C₁₋₄alkyl, phenyl or C₂₋₄alkoxycarbonyl.

R⁵ preferably represents hydrogen or C₁₋₄alkyl.

20 p preferably represents 0 or 1.

q preferably represents 0 or 1.

Q preferably represents aryl that may be optionally substituted with at least one group selected from the group consisting of C₁₋₄alkoxy, C₁₋₄alkylthio, halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, C₂₋₄alkenyl, nitro, halo-C₁₋₄alkyl; phenoxy; phenyl that may be optionally substituted; 5-6-membered heterocyclic group containing N, O or S, 5- or 6-membered heterocyclic group that contains at least one hetero atom selected from the group consisting of N, O and S and may be optionally substituted with halo-C₁₋₃alkyl, C₁₋₄alkoxy-carbonyl or oxo; 4-phenylcyclohexyl; condensed bicyclic C₉₋₁₀ hydrocarbon group; trimethylsilyl; C₂₋₆alkenyl; C₂₋₆alkynyl. 25

- R^2 preferably represents hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{2-6} alkenyl, benzyl, cyanomethyl, C_{1-4} alkoxy-carbonyl- C_{1-4} alkyl, benzyloxycarbonyl, C_{1-4} alkylcarbonyl, C_{1-4} alkoxy- C_{1-2} alkyl or phenyl.
- m preferably represents 0 or 1.
- W particularly preferably represents O or S.
- 5 R^3 particularly preferably represents hydrogen or methyl.
- R^4 particularly preferably represents hydrogen, methyl, trichloromethyl, trifluoromethyl, phenyl or methoxycarbonyl.
- R^5 particularly preferably represents hydrogen or methyl.
- p particularly preferably represents 0 or 1.
- 10 q particularly preferably represents 0 or 1.
- Q particularly preferably represents phenyl which is optionally substituted with one or more groups selected from the group consisting of methoxy, methylthio, fluoro, chloro, bromo, iodo, cyano, methyl, vinyl, nitro, trifluoromethyl, phenoxy, phenyl, chloro-substituted phenyl, tolyl and
- 15 thienyl, furyl, thienyl, trifluoromethylpyrazolyl, pyridyl, trifluoromethylpyridyl, tetrahydropyranyl, tetrahydrothiopyranyl, piperidinyl, 1-(tert-butoxycarbonyl)-4-piperidinyl, pyrrolidinyl/tetrahydrofuryl, 1,1-dioxo-tetrahydrothiopyranyl, 4-phenylcyclohexyl, indanyl, tetrahydronaphthyl, trimethylsilyl, C_{2-4} alkenyl C_{2-4} alkynyl.
- R^2 particularly preferably represents hydrogen, C_{1-4} alkyl, C_{2-4} alkenyl, benzyl, cyanomethyl, 20 C_{1-2} alkoxy-carbonylmethyl, benzyloxycarbonyl, acetyl, C_{1-2} alkoxymethyl or phenyl.
- m particularly preferably represents 0.
- W very particularly preferably represents O.
- R^2 very particularly preferably represents hydrogen.
- R^3 very particularly preferably represents hydrogen.
- 25 R^4 very particularly preferably represents hydrogen.

The abovementioned general or preferred radical definitions apply both to the end products of the formula (I) and also, correspondingly, to the starting materials or intermediates required in each case for the preparation. These radical definitions can be combined with one another at will, i.e. including combinations between the given preferred ranges.

- 5 Preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) which contain a combination of the meanings mentioned above as being preferred.

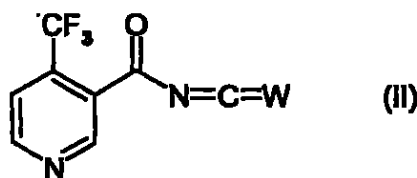
Particular preference according to the invention is given to compounds of the formula (I) which contain a combination of the meanings listed above as being particularly preferred.

- 10 Very particular preference according to the invention is given to the compounds of the formula (I) which contain a combination of the meanings listed above as being very particularly preferred.

- The compounds of the formula (I) can be obtained by any of the following preparation processes a), b), c), d) or e). Particularly the compounds of the formula (I), in which R² represents hydrogen and m represents 0, can be synthesized by the preparation processes a), b) or c), and the compounds of the formula (I), in which R² represents another group than hydrogen and m represents 0, can be synthesized by the preparation process d), and further the compounds of the formula (I), in which m represents 1, can be synthesized by the preparation process e).
- 15

Preparation process (a): in case R² = hydrogen, m = 0:

Compounds of the formula



20

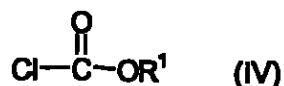
wherein W has the same definition as aforementioned, are reacted with compounds of the formula



wherein R¹ has the same definition as aforementioned, in the presence of inert solvents.

Preparation process (b): in case W = 0, R² = hydrogen, m = 0:

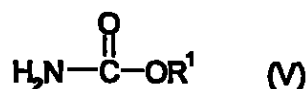
- 25 4-trifluoromethylnicotinamide is reacted with compounds of the formula



wherein R^1 has the same definition as aforementioned, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base.

Preparation process (c): in case $\text{W} = \text{O}$, $\text{R}^2 = \text{hydrogen}$, $m = 0$:

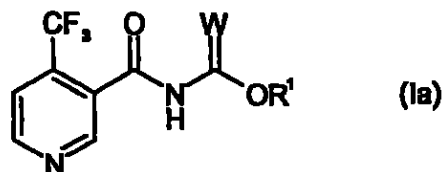
- 5 4-trifluoromethylnicotinoyl chloride is reacted with compounds of the formula



wherein R^1 has the same definition as aforementioned, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base.

Preparation process (d): in case $\text{R}^2 =$ as defined above, except hydrogen, $m = 0$:

- 10 Compounds of the formula



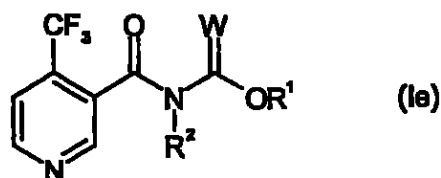
wherein W and R^1 have the same definition as aforementioned, are reacted with compounds of the formula



- 15 wherein R^2 is as defined above, except hydrogen and Hal represents halogen, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base.

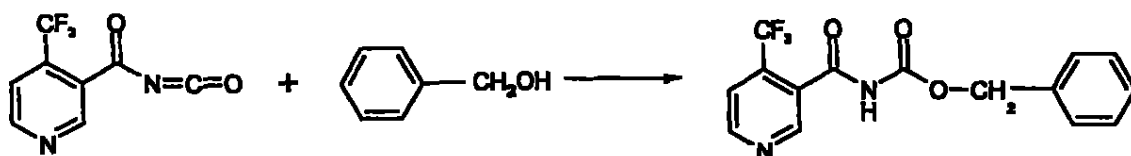
Preparation process (e): in case $m = 1$:

Compounds of the formula

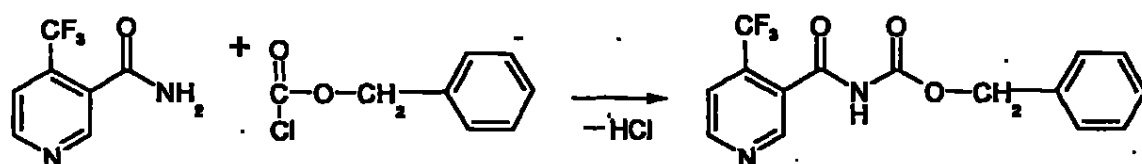


wherein W, R¹ and R² have the same definition as aforementioned, are oxidized in the presence of inert solvents.

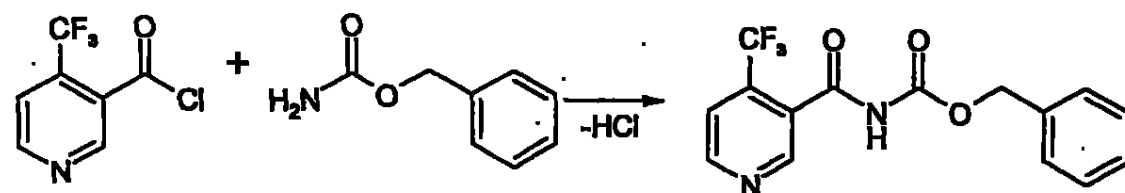
The preparation process a) to prepare compounds of the formula (I) can be illustrated by the following reaction scheme in case, for example, that 4-trifluoromethylpicotinoyl isocyanate and benzyl alcohol are used as starting materials.



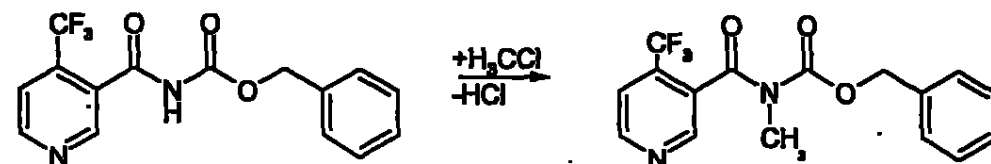
The preparation process b) to prepare compounds of the formula (I) can be illustrated by the following reaction scheme in case, for example, that 4-trifluoromethylpicotinamide and benzyl chloroformate are used as starting materials.



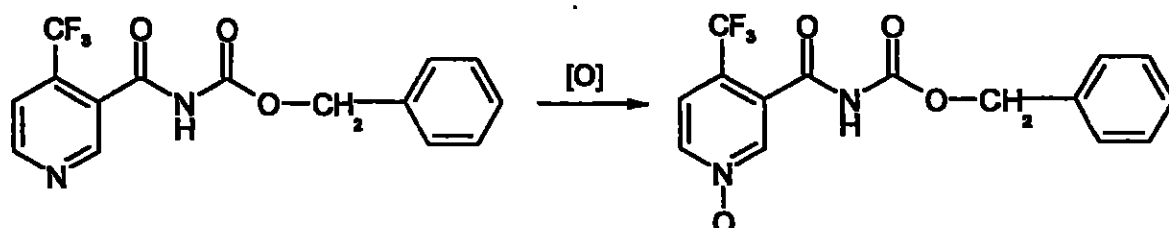
The preparation process c) to prepare compounds of the formula (I) can be illustrated by the following reaction scheme in case, for example, that 4-trifluoromethylpicotinoyl chloride and benzyl carbamate are used as starting materials.



The preparation process d) to prepare compounds of the formula (I) can be illustrated by the following reaction scheme in case, for example, that benzyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate and methyl chloride are used as starting materials.



The preparation process e) to prepare compounds of the formula (I) can be illustrated by the following reaction scheme in case, for example, that benzyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate is used as starting material and m-chloroperbenzoic acid, as oxidizing agent



The compounds of the formula (II) in the preparation process a) can be easily obtained according to the process described in, for example, J. Med. Chem., p.1630 (1991), J. Chem. Soc., p.153 (1958).

The alcohols of formula (III) are well known in the field of organic chemistry; as their representative examples the following compounds may be mentioned: benzyl alcohol, α -methylbenzyl alcohol, phenol, 2-phenyl-isopropanol, trimethylsilylmethanol, 2-(trimethylsilyl)ethanol, 3-furylmethanol, 2-furylmethanol, 2-thienylmethanol, 2-methoxybenzyl alcohol, 3-methoxybenzyl alcohol, 4-methoxybenzyl alcohol, 4-vinylbenzyl alcohol, 4-methylthiobenzyl alcohol, 2-chlorobenzyl alcohol, 3-chlorobenzyl alcohol, 4-chlorobenzyl alcohol, 2-pyridylmethyl alcohol, 3-pyridylmethyl alcohol, 4-pyridylmethyl alcohol, 3-cyanobenzyl alcohol, trimethylsilylmethanol, 4-methylbenzyl alcohol, 2,4-dichlorobenzyl alcohol, 2,6-dichlorobenzyl alcohol, 2-bromobenzyl alcohol, 3-bromobenzyl alcohol, 4-bromobenzyl alcohol, 2-nitrobenzyl alcohol, 3-nitrobenzyl alcohol, 1-phenyl-2,2,2-trifluoroethanol, diphenylmethanol, 2-trifluoromethylbenzyl alcohol, 3-trifluoromethylbenzyl alcohol, 4-trifluoromethylbenzyl alcohol, 2-fluorobenzyl alcohol, 3-fluorobenzyl alcohol, 4-fluorobenzyl alcohol, 4-nitrobenzyl alcohol, α -methoxycarbonylbenzyl alcohol, 3-iodobenzyl alcohol, 5-trifluoromethyl-2-pyridylmethanol, 3-phenoxybenzyl alcohol, 4-phenoxybenzyl alcohol, 2-methylbenzyl alcohol, 3-methylbenzyl alcohol, 2,4-dimethylbenzyl alcohol, 4-biphenylmethanol, 1-naphthylmethanol, 2-naphthylmethanol, 2,2-dimethyl-3-phenylpropanol, 1-phenyl-2,2,2-trichloroethanol, 2-phenethyl alcohol, 2-phenylpropanol, 1-indanyl alcohol, 2-indanyl alcohol, 1-(1,2,3,4-tetrahydronaphthyl) alcohol, 2-(1,2,3,4-tetrahydronaphthyl) alcohol, 4-tetrahydropyranyl alcohol, 4-tetrahydrothiopyranyl alcohol, 4-piperidinyl alcohol, 2-pyrrolidinyl alcohol, 3-pyrrolidinyl alcohol, 2-tetrahydrofurfuryl alcohol, 4-phenyl-cyclohexyl alcohol, 4-(2-thienyl)benzyl alcohol, 4-(4-chlorophenyl)benzyl alcohol, etc.

Among the above-mentioned alcohols, for example, 4-tetrahydrothiopyranyl alcohol, 2-(1,2,3,4-tetrahydronaphthyl) alcohol, 4-phenoxybenzyl alcohol can be easily obtained, for example, by reducing their corresponding known ketones using sodium borohydride.

4-Trifluoronicotinamide is a known compound. (c.f. JP 321903/1994.)

The chloroformic acid esters of formula (IV) are well known in the field of organic chemistry and can be easily obtained generally by reacting phosgene with the corresponding alcohols in the presence of a tertiary amine.

- 5 4-Trifluoromethylnicotinoyl chloride can be easily obtained, for example, by a reaction of known 4-trifluoromethylnicotinic acid and thionyl chloride.

The carbamic acid esters of formula (V) are well known in the field of organic chemistry and can be obtained by known processes.

- 10 The compounds of the formula (Ia) in the preparation process d) are the compounds of the formula (I) of the present invention, in case that R^2 represents hydrogen, obtained by the preparation processes a), b) (in case $W = 0$) or c) (in case $W = 0$).

The halides of formula (VI) are well known in the field of organic chemistry; as their representative examples there can be mentioned the following: chloromethyl ethyl ether, acetyl chloride, benzyl chloroformate, ethyl bromoacetate, benzyl bromide, allyl bromide, ethyl iodide, etc.

- 15 The compounds of the formula (Ie) in the preparation process e) are the compounds of the formula (I) of the present invention, in case that $m = 0$.

As a representative example of the oxidizing agent used for oxidation there can be mentioned *m*-chloroperbenzoic acid.

- 20 The aforementioned preparation process a) can be conducted, for example, according to the process described in J. Chem. Soc., p.1091 (1957) and *ibid.* p. 4458 (1956).

- 25 The reaction of the preparation process a) can be conducted using an adequate diluent singly or mixed. As examples of the diluent used in that case there can be mentioned aliphatic, alicyclic and aromatic hydrocarbons (may be optionally chlorinated), for example, pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, ligroine, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, 1,2-dichloroethane, chlorobenzene, dichlorobenzene, etc.; ethers, for example, ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), diethylene glycol dimethyl ether (DGM), etc.; nitriles, for example, acetonitrile, propionitrile, acrylonitrile, etc.; acid amides, for example, dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide (DMA), *N*-methylpyrrolidone, 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone, hexamethyl phosphoric triamide (HMPA), etc.
- 30

The reaction of the preparation process a) can be conducted in a substantially wide range of temperature. However, it can be conducted in a range of generally about 0 – about 100°C, preferably about 0 – about 50°C. Although said reaction is conducted desirably under normal pressure, it can be operated optionally also under elevated pressure or under reduced pressure.

- 5 In conducting the preparation process a), the aimed compounds can be obtained, for example, by reacting 1 mole amount to a little excess amount of the compounds of the formula (III) to 1 mole of compounds of the formula (II) in a diluent, for example, 1,2-dichloroethane.

The aforementioned preparation processes b), c), d) and e) can be conducted under the similar reaction conditions by using a diluent mentioned in the above-mentioned preparation process a) except dimethylformamide,

The preparation process b) can be conducted, for example, according to the process described in J. Med. Chem., p. 2504 (1991). The preparation process c) can be conducted, for example, according to the process described in J. Chem. Soc., p. 451 (1964). The preparation process d) can be conducted, for example, according to the process described in Heterocycles, p. 373 (1987). The preparation process e) can be conducted, for example, according to the process described in J. Med. Chem., p. 2925 (1995).

The preparation processes b), c) and d) can be conducted also in the presence of a base. As a suitable base may be mentioned: carbonates of alkali metals, for example, potassium carbonate; tertiary amines, N,N-dialkylanilines and pyridines, for example, triethylamine, 1,1,4,4-tetramethylethylenediamine (TMEDA), N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-dimethylaminopyridine (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octane (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-ene (DBU), etc.

The compounds of the formula (I) show strong insecticidal action. The compounds of the present invention can, therefore, be used as insecticidal agents. And the active compounds of the present invention exhibit exact controlling effect against harmful insects without phytotoxicity against cultured plants. The compounds of the present invention can be used for controlling a wide variety of pests, for example, harmful sucking insects, biting insects and other plant-parasitic pests, stored grain pests, hygienic pests, etc. and applied for their extermination.

As examples of such pests there can be mentioned the following pests:

- 30 As insects, there can be mentioned coleoptera pests, for example, *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*,

Anomala rufocuprea, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Manochamus alternatus*, *Lissorhoptus oryzophilus*, *Lyctus brunus*;

Lepidoptera pests, for example,

- 5 *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens*, *Phyllocnistis citrella*;

Hemiptera pests, for example,

- 10 *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicae*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Rhopalosiphum pseudobrassicae*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Cimex lectularius*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Psylla* spp. *Bemisia argentifolii*;

Orthoptera pests, for example,

Blattella germanica, *Periplaneta americana*, *Gryllotalpa africana*, *Locusta migratoria migratorioides*;

Homoptera pests, for example,

- 15 *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*;

Diptera pests, for example,

Musca domestica, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus*, etc.

Thysanoptera pests, for example, *Thrips palmi* Karny, *Frankliniella occidentalis*.

- 20 Moreover, in the field of veterinary medicine, the compounds of the present invention can be effectively used against various harmful animal-parasitic pests (endoparasites and ectoparasites), for example, insects and helminthes. As examples of such animal-parasitic pests there can be mentioned the following pests:

As insects there can be mentioned, for example,

- 25 *Gastrophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalides canis*, etc.

In the present invention substances having insecticidal action against pests, which include all of them, are in some cases called as insecticides

The active compounds of the formula (I) can be made into customary formulation forms, when they are used as insecticides. As formulation forms there can be mentioned, for example, solutions, emulsifiable concentrates, wettable powders, water dispersible granules, suspensions, powders, foaming agents, pastes, tablets, granules, aerosols, active compound-impregnated natural and synthetic substances, microcapsules, seed coating agents, formulations used with burning equipment (as burning equipment, for example, fumigation and smoking cartridges, cans, coils, etc.), ULV [cold mist, warm mist], etc.

These formulations can be prepared according to per se known methods, for example, by mixing the active compounds with extenders, namely liquid diluents; liquefied gas diluents; solid diluents or carriers, and optionally by using surface-active agents, namely emulsifiers and/or dispersants and/or foam-forming agents.

In case that water is used as extender, for example, organic solvents can also be used as auxiliary solvents.

As liquid diluents or carriers there can be mentioned, for example, aromatic hydrocarbons (for example, xylene, toluene, alkyl-naphthalene, etc.), chlorinated aromatic or chlorinated aliphatic hydrocarbons (for example, chlorobenzenes, ethylene chlorides, methylene chloride, etc.), aliphatic hydrocarbons [for example, cyclohexane etc. or paraffins (for example, mineral oil fractions etc.)], alcohols (for example, butanol, glycols and their ethers, esters, etc.), ketones (for example, acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, cyclohexanone, etc.), strongly polar solvents (for example, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, etc.), and water.

Liquefied gas diluents or carriers are substances that are gases at normal temperature and pressure and there can be mentioned, for example, aerosol propellants such as butane, propane, nitrogen gas, carbon dioxide, halogenated hydrocarbons.

As solid diluents there can be mentioned, for example, ground natural minerals (for example, kaolin, clay, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite, diatomaceous earth, etc.), ground synthetic minerals (for example, highly dispersed silicic acid, alumina, silicates, etc.), etc.

As solid carriers for granules there can be mentioned, for example, crushed and fractionated rocks (for example, calcite, marble, pumice, sepiolite, dolomite, etc.) synthetic granules of inorganic and organic meals, particles of organic materials (for example, saw dust, coconut shells, maize cobs, tobacco stalks, etc.) etc.

As emulsifiers and/or foam-forming agents there can be mentioned, for example, nonionic and anionic emulsifiers [for example, polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty acid

alcohol ethers (for example, alkylaryl polyglycol ethers), alkylsulfonates, alkylsulfates, arylsulfonates, etc.], albumin hydrolysis products, etc.

Dispersants include, for example, lignin sulfite waste liquor, methyl cellulose, etc.

5 Tackifiers can also be used in formulations (powders, granules, emulsifiable concentrates). As said tackifiers there can be mentioned, for example, carboxymethyl cellulose, natural and synthetic polymers (for example, gum Arabic, polyvinyl alcohol, polyvinyl acetate, etc.) etc.

Colorants can also be used. As said colorants there can be mentioned, for example, inorganic pigments (for example, iron oxide, titanium oxide, Prussian Blue, etc.), organic dyestuffs such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs or metal phthalocyanine dyestuffs, and further traces nutrients
10 such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

Said formulations can contain the aforementioned active components of the amount in the range of generally 0.1-95 % by weight, preferably 0.5-90 % by weight.

The active compounds of the formula (I) of the present invention can exist also as a mixed agent with other active compounds, for example, insecticides, poisonous baits, bactericides, miticides,
15 nematocides, fungicides, growth regulators, herbicides, etc. in the form of their commercially useful formulations and in the application forms prepared from such formulations. Here, as the above-mentioned insecticides, there can be mentioned, for example, organophosphorous agents, carbamate agents, carboxylate type chemicals, chlorinated hydrocarbon type chemicals, insecticidal substances produced by microbes, etc.

20 Further, the active compounds of the formula (I) can exist also as a mixed agent with a synergist and as such formulations and application forms commercially useful ones can be mentioned. Said synergist itself must not be active, but is a compound that enhances the action of the active compound.

The content of the active compounds of the formula (I) in a commercially useful application form
25 can be varied in a wide range.

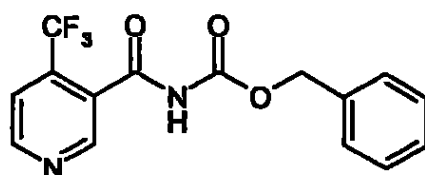
The concentration of the active compounds of the formula (I) at the time of application can be, for example, in the range of 0.0000001-100 % by weight, preferably in the range of 0.00001-1 % by weight.

The compounds of the formula (I) can be used by usual methods suitable to the application forms.

In case of application against hygienic pests and stored grain pests the active compounds of the present invention have a good stability against alkali on calcific substances and further show an excellent residual effectiveness in wood and soil.

Then the present invention will be described more specifically by examples. The present invention, however, should not be restricted only to them in any way.

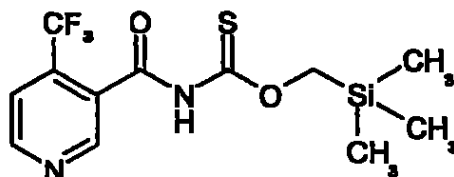
Synthesis Example 1



After oxalyl chloride (0.14 ml) was added to a suspension of 4-trifluoromethyl-nicotinamide (0.2 g) in 1,2-dichloroethane (10 ml) at room temperature, the mixture was refluxed for 2 hours. The solvent was distilled off under reduced pressure and the residue was dissolved in methylene chloride. Benzyl alcohol (0.11 g) was added to the solution and the mixture was stirred at room temperature for 2 hours. The solvent was distilled off under reduced pressure and the residue was separated and purified by silica gel column chromatography (hexane: ethyl acetate = 3:1) to obtain benzyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate (0.24 g).

¹H-NMR: 8.85 (1H, d), 8.72 (1H, s), 7.94 (1H, brs), 7.56 (1H, d), 7.4-7.2 (5H, m), 5.11 (2H, s)

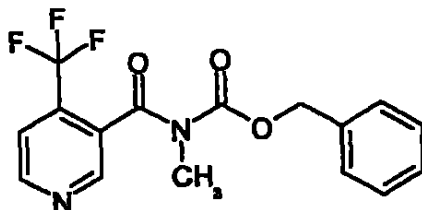
Synthesis Example 2



To a methylene chloride solution of 4-trifluoromethyl-nicotinic acid (1g) and catalytic amount of N,N-dimethylformamide, oxalyl chloride (0.5 ml) was added and the mixture was stirred at room temperature for 1 hour. The solvent was distilled off under reduced pressure and the residue was dissolved in toluene. Potassium carbonate (0.5 g) and tetrabutylammonium thiocyanate (1.89 g) were added to the solution and the mixture was stirred for 30 minutes. Then trimethylsilylmethanol (0.66 g) was added thereto and the mixture was stirred at room temperature for 1 hour. After diluting the reaction mixture with ethyl acetate, it was washed with water, 1N hydrochloric acid and saturated aqueous solution of sodium chloride and the organic layer was dried with magne-

22
sium sulfate. The solvent was distilled off under reduced pressure and the residue was separated and purified by silica gel column chromatography (hexane: ethyl acetate = 5:1) to obtain trimethylsilylmethyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)thiocarbamate (0.77 g). mp: 105-107°C

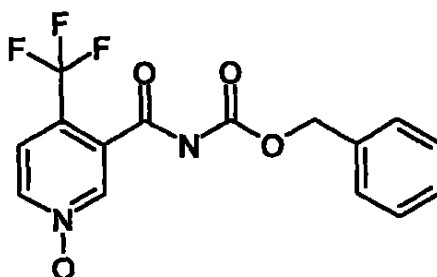
Synthesis Example 3



5

60 % Sodium hydride (36 mg) was suspended in N,N-dimethylformamide and N,N-dimethylformamide solution of benzyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate (0.4 g) was slowly added thereto. After stirring the mixture at room temperature for 30 minutes, methyl iodide (0.35 g) was added thereto and the mixture was stirred at room temperature for 1 hour. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, washed with saturated aqueous solution of sodium chloride and the organic layer was dried with magnesium sulfate. The solvent was distilled off under reduced pressure and the residue was separated and purified by silica gel column chromatography (hexane: ethyl acetate = 6:1) to obtain benzyl N-methyl-N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate (0.33 g). n_D^{20} : 1.5185

15 Synthesis Example 4



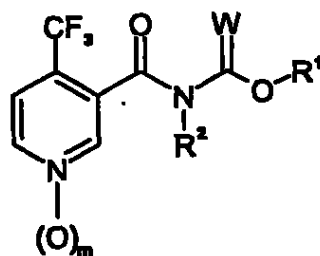
m-Chloroperbenzoic acid (0.27 g) was slowly added to a methylene chloride solution of benzyl N-(4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate (0.3 g). After stirring at room temperature for 12 hours, the reaction solution was washed with saturated aqueous solution of sodium hydrogen carbonate and saturated aqueous solution of sodium chloride, and the organic layer was dried with magnesium sulfate. The solvent was distilled off under reduced pressure and the obtained crystals were recrystallized from toluene to obtain benzyl (1-oxy-4-trifluoromethyl-3-pyridylcarbonyl)carbamate (0.18 g). mp: 204-205°C

20

The compounds of the formula (I) of the present invention obtained by the similar processes to the above-mentioned Synthesis Examples are shown in the following Table 1, together with the compounds shown in the above-mentioned Synthesis Examples.

In the Table, Ph represents phenyl, Me represents methyl, Et represents ethyl, tert-Bu represents tert-butyl, Fu represents furyl, Th represents thienyl, Py represents pyridyl, Nap represents naphthyl, Pyz represents pyrazolyl, Pip represents piperidinyl, Pyr represents pyrrolidinyl and c-Hex represents cyclohexyl.

Table 1



Cpd No.	W	R ²	R ¹	m	mp. °C/ n _D ²⁰ /NMR
1	O	H	CH ₃ Ph	0	a
2	O	H	Ph	0	b
3	O	H	CH(CH ₃)Ph	0	116-118
4	O	H	C(CH ₃) ₂ Ph	0	140-141
5	O	H	CH ₂ CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	107-108
6	O	H	CH ₂ (3-Fu)	0	105-106
7	O	H	CH ₂ (2-Fu)	0	85-87
8	O	H	CH ₂ (2-Th)	0	116-117
9	O	H	CH ₂ (3-Th)	0	90-92
10	O	H	CH ₂ (2-MeO-Ph)	0	101-104
11	O	H	CH ₂ (3-MeO-Ph)	0	122-124
12	O	H	CH ₂ (4-MeS-Ph)	0	101-103
13	O	H	CH ₂ (4-MeO-Ph)	0	118-119
14	O	H	CH ₂ (2-Cl-Ph)	0	133-135
15	O	H	CH ₂ (3-Cl-Ph)	0	92-97
16	O	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	0	113-114
17	O	H	CH ₂ (2-Py)	0	15240
18	O	H	CH ₂ (3-Py)	0	156-157

Cpd No.	W	R ²	R ¹	m	mp. °C/ n _D ²⁰ /NMR
19	O	H	CH ₂ (4-Py)	0	91-106
20	O	H	CH ₂ (3-CN-Ph)	0	121-122
21	O	CH ₂ CN	CH ₂ Ph	0	90-93
22	O	CH ₃	CH ₂ Ph	0	1.5185
23	O	CH ₂ CH ₃	CH ₂ Ph	0	1.5190
24	O	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ Ph	0	1.5185
25	O	CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	0	1.5490
26	O	CH ₂ CO ₂ Bt	CH ₂ Ph	0	1.5063
27	O	CO ₂ CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	0	1.5445
28	O	H	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	97-99
29	O	H	CH ₂ (4-Me-Ph)	0	c
30	O	H	CH ₂ (2,4-diCl-Ph)	0	158-160
31	O	H	CH ₂ (2,6-diCl-Ph)	0	154-156
32	O	H	CH ₂ (2-Br-Ph)	0	d
33	O	H	CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	0	e
34	O	H	CH ₂ (3-NO ₂ -Ph)	0	121-122
35	O	H	CH(CF ₃)Ph	0	84-91
36	O	H	CH(Ph)Ph	0	121-122
37	O	H	CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	0	127-130
38	O	H	CH ₂ (3-CF ₃ -Ph)	0	96
39	O	H	CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	0	132-133
40	O	H	CH ₂ (2-F-Ph)	0	97-100
41	O	H	CH ₂ (3-F-Ph)	0	114-115
42	O	H	CH ₂ (4-F-Ph)	0	130-133
43	O	H	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	0	f
44	O	H	CH(CO ₂ Me)Ph	0	55-61
45	O	H	CH ₂ (3-I-Ph)	0	g
46	O	H	CH ₂ (2-(5-CF ₃ -Py))	0	h
47	O	COCH ₃	CH ₂ Ph	0	i
48	O	CH ₂ OBt	CH ₂ Ph	0	1.5085
49	O	H	CH ₂ (3-Ph-O-Ph)	0	88-91
50	O	H	CH ₂ (2-Me-Ph)	0	129-130
51	O	H	CH ₂ (3-Me-Ph)	0	113-114

Cpd No.	W	R ²	R ¹	m	mp. °C/ n _D ²⁰ /NMR
52	O	H	CH ₂ (2,4-diMe-Ph)	0	120-121
53	O	H	CH ₂ (2,4,6-triMe-Ph)	0	179-180
54	O	H	CH ₂ (4-Ph-Ph)	0	124-125
55	O	H	CH ₂ (1-Nap)	0	147-148
56	O	H	CH ₂ (2-Nap)	0	115-117
57	O	H	CH(C(CH ₃) ₃)Ph	0	165-166
58	O	H	CH(CCl ₃)Ph	0	j
59	O	H	CH ₂ CH ₂ Ph	0	85-86
60	O	H	CH ₂ CH(CH ₃)Ph	0	109-111
61	O	H	CH ₂ (4-tert-Bu-Ph)	0	153-155
62	O	H	1-indanyl	0	144-146
63	O	H	2-indanyl	0	148-151
64	O	H	1-(1,2,3,4-tetrahydro-Nap)	0	142-145
65	O	H	2-(1,2,3,4-tetrahydro-Nap)	0	163-171
66	O	H	4-tetrahydropyranyl	0	1.4801
67	O	H	4-tetrahydrothiopyranyl	0	1.4974
68	O	H	4-Pip	0	k
69	O	H	CH ₂ (3-tetrahydro-Fu)	0	82-89
70	O	H	CH ₂ (2-tetrahydro-Fu)	0	1.4909
71	O	H	CH ₂ (2-tetrahydropyranyl)	0	1.4890
72	O	H	3-tetrahydro-Fu	0	103-111
73	O	H	CH ₂ (1-(3-CF ₃ -Pyz))	0	110-113
74	O	H	CH ₂ (2-Ph-Ph)	0	140-142
75	O	H	CH ₂ (3-Ph-Ph)	0	82-88
76	O	H	CH ₂ (4-(3'-MeO-Ph)-Ph)	0	161-163
77	O	H	CH ₂ (4-(2'-Me-Ph)-Ph)	0	119-121
78	O	H	Ph	0	
79	O	H	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	
80	O	H	CH ₂ Ph	0	
81	O	H	CH ₂ Ph	1	204-205
82	O	H	CH ₂ (3-Br-Ph)	0	100-103
83	O	H	CH ₂ (4-Br-Ph)	0	115-119
84	O	H	4-(1,1-dioxo-tetrahydro-	0	

Cpd No.	W	R ²	R ¹	m	mp. °C/ n _D ²⁰ /NMR
			thiopyranyl)		
85	O	H	2-Pyr	0	
86	O	H	3-Pyr	0	
87	O	H	CH ₂ (4-Ph-O-Ph)	0	1.5549
88	S	H	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	105-107
89	O	H	CH ₂ (4-vinyl-Ph)		91-93
90	O	H	4-Ph-C-Hex	0	l
91	O	H	CH ₂ (4-(2-Th)-Ph)	0	142-143
92	O	H	CH ₂ (4-(4-Cl-Ph)-Ph)	0	165-168
93	O	H	4-(1-tert-Bu-OCO)Pip	0	98-110
94	O	H	CH ₂ -C≡CH	0	m
95	O	H	CH(CH ₃)-C≡CH	0	n
96	O	H	C(CH ₃) ₂ -C≡CH	0	o
97	O	H	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-C≡CH	0	p
98	O	H	CH ₂ -C≡CCH ₃	0	q
99	O	H	CH ₂ -C≡CCH ₂ CH ₃	0	r
100	O	CH ₂ Ph	CH ₂ CH=CH ₂	0	s
101	O	H	CH ₂ CH=CH ₂	0	t

Fu = Furanyl, Th = Thienyl, Ph = Phenyl, Py = Pyridyl, Pyr = Pyrrolyl

¹H-NMR values mentioned as a-l in the above-mentioned Table 1 are as follows (chemical shift δ in ppm):

a	8.85(1H,d), 8.72(1H,s), 7.94(1H,brs), 7.56(1H,d), 7.4-7.2(5H,m), 5.11(2H,s)
b	8.87(1H,d), 8.80(1H,s), 8.38(1H,brs), 7.59(1H,d), 7.4-7.2(3H,m), 7.1-7.0(2H,m)
c	8.83(1H,d), 8.70(1H,s), 8.25(1H,brs), 7.55(1H,d), 7.3-7.2(4H,m), 5.06(2H,s), 2.36(3H,s)
d	8.84(1H,d), 8.74(1H,s), 7.96(1H,brs), 7.6-7.5(2H,m), 7.4-7.2(4H,m), 5.21(2H,s)
e	8.87(1H,d), 8.76(1H,s), 8.42(1H,brs), 8.13(1H,d), 7.7-7.5(4H,m), 5.57(2H,s)
f	8.88(1H,d), 8.74(1H,s), 8.23(2H,d), 8.14(1H,brs), 7.60(1H,d), 7.47(2H,d), 5.23(2H,s)
g	8.87(1H,d), 8.73(1H,s), 8.08(1H,brs), 7.7-7.5(3H,m), 7.3-7.2(1H,m), 7.10(1H,t), 5.04(2H,s)
h	9.11(1H,brs), 8.9-8.8(2H,m), 8.76(1H,s), 8.0-7.9(1H,m), 7.58(1H,d), 7.44(1H,d), 5.31(2H,s)
i	8.82(1H,d), 8.78(1H,s), 7.50(1H,d), 7.4-7.3(3H,m), 7.2-7.1(2H,m), 5.16(2H,s)
j	9.11(1H,Br), 8.90(1H,d), 8.75(1H,s), 7.60(1H,d), 7.5-7.3(5H,m), 6.20(1H,s)
k	8.87(1H,d), 8.73(1H,s), 7.59(1H,d), 4.9-4.7(1H,m), 3.5-2.6(5H,m), 2.0-1.8(2H,m), 1.7-1.5(2H,m)

l	9.0-8.7(2H,m), 8.0-7.8(1H,m), 7.6-7.5(1H,m), 7.4-7.1(5H,m), 5.1-4.6(1H,m), 2.6-1.4(10H,m)
m	8.89 (1H, d), 8.75 (1H, s), 8.22 (1H, s), 7.61 (1H, d), 4.71 (2H, d), 2.53 (1H, t)
n	8.89 (1H, d), 8.75 (1H, s), 8.09 (1H, s), 7.60 (1H, d), 5.31 (1H, ddd), 2.51 (1H, q), 1.49 (3H, dd)
o	8.87 (1H, d), 8.74 (1H, s), 7.86 (1H, s), 7.59 (1H, d), 2.55 (1H, s), 1.63 (6H, s)
p	8.87 (1H, d), 8.74 (1H, s), 7.80 (1H, s), 7.59 (1H, t), 2.56 (1H, s), 1.86 (2H, ddd), 1.62 (3H, s), 0.99 (3H, t)
q	8.89 (1H, dd), 8.74 (1H, s), 8.05 (1H, s), 7.60 (1H, d), 4.68 (2H, q), 1.85 (3H, t)
r	8.88 (1H, d), 8.74 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.60 (1H, d), 4.68 (2H, t), 2.21 (2H, tt), 1.13 (3H, t)
s	8.88 (1H, d), 8.74 (1H, s), 8.19 (1H, s), 7.60 (1H, d), 5.84 (1H, tt), 5.35-5.26 (2H, m), 4.59 (2H, dt)
t	8.79 (1H, dd), 8.57 (1H, s), 7.54 (1H, d), 7.43-7.28 (5H, m), 5.61-5.50 (1H, m), 5.17-5.08 (4H, m), 4.45 (2H, dt)

Biological Test Example 1:

Test against *Myzus persicae** resistant to organophosphorous agents and carbamates

Preparation of test solution: Solvent: Dimethylformamide 7 parts by weight; Emulsifier: Poly-oxyethylene alkyl phenyl ether 3 part by weight

In order to make an appropriate formulation of an active compound 1 part by weight of the active compound was dissolved in the above-mentioned amount of solvent containing the above-mentioned amount of emulsifier and the solution was diluted with water to a prescribed concentration.

Test method: About 30 bred *Myzus persicae** resistant to organophosphorous agents and carbamates were inoculated per 1 seedling of eggplant planted in a vinyl pot of 6cm diameter. One day after the inoculation, a sufficient amount of a diluted aqueous solution of a prescribed concentration of an active compound prepared as mentioned above, was sprayed by using a spray gun. After spraying it was placed in a green house of 28°C and the rate of death was calculated 7 days after the spraying. Test was repeated twice.

Results: The compounds No. 1, 3, 5, 6, 8, 9, 14, 18, 23, 29, 33, 35, 38, 40, 44, 54, 55, 59, 62, 70, 73, 84 offered to the test as specific examples showed 100% of rate of death at 100ppm concentration of the effective component.

Formulation Example 1 (Granule)

To a mixture of 10 parts of the compound of the present invention (No. 1), 30 parts of bentonite (montmorillonite), 58 parts of talc and 2 parts of ligninsulfonate salt, 25 parts of water are added, well kneaded, made into granules of 10-40 mesh by an extrusion granulator and dried at 40-50°C to obtain granules.

5 **Formulation Example 2 (Granules)**

95 Parts of clay mineral particles having particle diameter distribution in the range of 0.2-2mm are put in a rotary mixer. While rotating it, 5 parts of the compound of the present invention (No. 1) are sprayed together with a liquid diluent, wetted uniformly and dried at 40-50°C to obtain granules.

) 10 **Formulation Example 3 (Emulsifiable concentrate)**

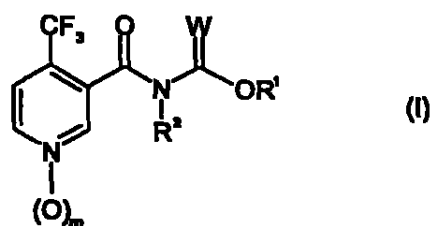
30 Parts of the compound of the present invention (No. 1), 55 parts of xylene, 8 parts of polyoxyethylene alkyl phenyl ether and 7 parts of calcium alkylbenzenesulfonate are mixed and stirred to obtain an emulsifiable concentrate.

Formulation Example 4 (Wettable powder)

- 15 15 Parts of the compound of the present invention (No. 1), 80 parts of a mixture of white carbon (hydrous amorphous silicon oxide fine powder) and powder clay (1:5), 2 parts of sodium alkylbenzenesulfonate and 3 parts of sodium alkylnaphthalenesulfonate-formalin-condensate are crushed and mixed to make a wettable powder.

) **Formulation Example 5 (Water dispersible granule)**

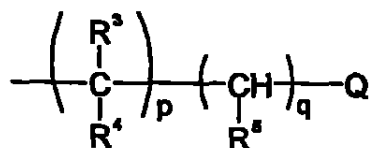
- 20 20 Parts of the compound of the present invention (No. 1), 30 parts of sodium ligninsulfonate, 15 parts of bentonite and 35 parts of calcined diatomaceous earth powder are well mixed, added with water, extruded with 0.3mm screen and dried to obtain water dispersible granules.

CLAIMS**1. Compounds of formula (I)**

in which

5 m represents 0 or 1,

W represents O or S,

R² represents hydrogen, alkyl, alkenyl, aralkyl, cyanomethyl, alkoxy-carbonylalkyl, aralkyloxy-carbonyl, acyl, alkoxyalkyl or phenyl, andR¹ represents

10

wherein

R³ represents hydrogen or alkyl,R⁴ represents hydrogen, alkyl, haloalkyl, phenyl or alkoxy-carbonyl,R⁵ represents hydrogen or alkyl,

15 p represents 0 or 1,

q represents 0 or 1, and

Q represents aryl that may be optionally substituted; 5- or 6-membered heterocyclic group that contains at least one hetero atom selected from the group consisting of N, O and S and may be optionally substituted; phenyl-substituted cycloalkyl; condensed bicyclic hydrocarbon group; trimethylsilyl; alkanyl or alkynyl.

20

2. Compounds of formula (I) as defined in Claim 1 wherein

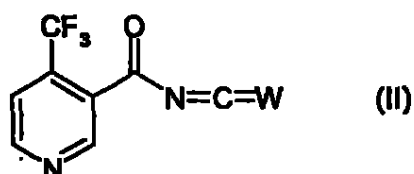
- W represents O or S,
- R³ represents hydrogen or C₁₋₄alkyl,
- R⁴ represents hydrogen, C₁₋₄alkyl, halo-C₁₋₄alkyl, phenyl or C₂₋₄alkoxycarbonyl,
- R⁵ represents hydrogen or C₁₋₄alkyl,
- 5 p represents 0 or 1,
- q represents 0 or 1,
- Q represents aryl which is optionally substituted with one or more groups selected from the group consisting of C₁₋₄alkoxy, C₁₋₄alkylthio, halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, C₂₋₄alkenyl, nitro, halo-C₁₋₄alkyl; phenoxy; phenyl that may be optionally substituted; 5-6-membered hetero-
- 10 cyclic group containing N, O or S, 5- or 6-membered heterocyclic group that contains at least one hetero atom selected from the group consisting of N, O and S and may be optionally substituted with halo-C₁₋₂alkyl, C₁₋₄alkoxy-carbonyl or oxo; 4-phenylcyclohexyl; condensed bicyclic C₉₋₁₀ hydrocarbon group; trimethylsilyl; C₂₋₆alkenyl; C₂₋₆alkynyl,
- R² represents hydrogen, C₁₋₆alkyl, C₂₋₆alkenyl, benzyl, cyanomethyl, C₁₋₄alkoxy-carbonyl-C₁₋
- 15 ₄alkyl, benzyloxycarbonyl, C₁₋₄alkylcarbonyl, C₁₋₄alkoxy-C₁₋₂alkyl or phenyl.,
- m represents 0 or 1.
3. Compounds as defined in Claims 1 or 2 wherein
- W represents O or S,
- 20 R³ represents hydrogen or methyl,
- R⁴ represents hydrogen, methyl, trichloromethyl, trifluoromethyl, phenyl or methoxycarbonyl,
- R⁵ represents hydrogen or methyl,
- p represents 0 or 1,
- q represents 0 or 1,
- 25 Q represents phenyl which is optionally substituted with one or more groups selected from the group consisting of methoxy, methylthio, fluoro, chloro, bromo, iodo, cyano, methyl, vinyl, nitro, trifluoromethyl, phenoxy, phenyl, chloro-substituted phenyl, tolyl or
- thienyl, furyl, thienyl, trifluoromethylpyrazolyl, pyridyl, trifluoromethylpyridyl, tetrahy-
- dropyranyl, tetrahydrothiopyranyl, piperidinyl, 1-(tert-butoxycarbonyl)-4-piperidinyl, pyr-
- 30 rolidinyltetrahydrofuryl, 1,1-dioxo-tetrahydrothiopyranyl, 4-phenylcyclohexyl, indanyl, tetrahydronaphthyl, trimethylsilyl, C₂₋₄alkenyl C₂₋₄alkynyl,

R^2 represents hydrogen, C_{1-4} alkyl, C_{2-4} alkenyl, benzyl, cyanomethyl, C_{1-3} alkoxy-carbonylmethyl, benzyloxycarbonyl, acetyl, C_{1-3} alkoxymethyl or phenyl,
 m particularly preferably represents 0.

4. Process for the preparation of the compounds of the formula (I) set forth in claim 1, characterized in that

a) in case R^2 represents hydrogen and m represents 0:

Compounds of the formula



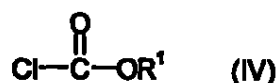
wherein W has the same definition as aforementioned, are reacted with compounds of the formula



wherein R^1 has the same definition as aforementioned, in the presence of one or more inert solvents,

or, b) in case W represents oxygen 0 and R^2 represents hydrogen and m = 0 (zero)

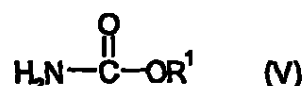
4-trifluoromethylnicotinamide is reacted with compounds of the formula



wherein R^1 has the same definition as aforementioned, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base,

or, c) in case W represents oxygen 0 and R^2 represents hydrogen and m = 0 (zero)

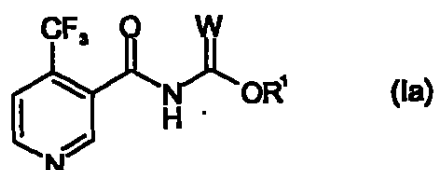
4-trifluoromethylnicotinoyl chloride is reacted with compounds of the formula



wherein R^1 has the same definition as aforementioned, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base,

or, d) in case R^2 represents defined above except hydrogen and m represents 0 (zero)

Compounds of the formula



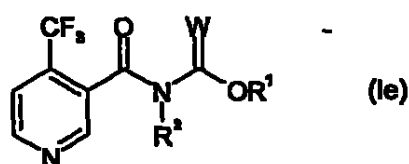
wherein W and R¹ have the same definition as aforementioned, are reacted with compounds of the formula



wherein R² represents a group defined to the aforementioned R² other than hydrogen and Hal represents halogen, in the presence of inert solvents, and if appropriate, in the presence of a base,

or, e) in case m represents 1

10 Compounds of the formula



wherein W, R¹ and R² have the same definition as aforementioned, are oxidized in the presence of inert solvents.

- 15 5. Insecticidal compositions characterized in that they contain at least one compound of the formula (I) according to any of claims 1, 2 or 3.
6. A method of controlling pests characterized in that compounds of formula (I) according to any of claims 1, 2 or 3 are allowed to act on pests and / or their habitat.
- 20 7. Use of compounds of formula (I) according to any of claims 1, 2 or 3 for controlling pests.
8. A process for the preparation of pesticidal compositions characterized in that compounds of the formula (I) are mixed with extenders and / or surface active agents.
- 25

NICOTINOILCARBAMATOS SUBSTITUIDOS COMO PESTICIDAS.**Campo de la invención**

La invención se refiere a nuevos nicotinoilcarbamatos, a su empleo como pesticidas, preferentemente como insecticidas y procedimientos para su preparación.

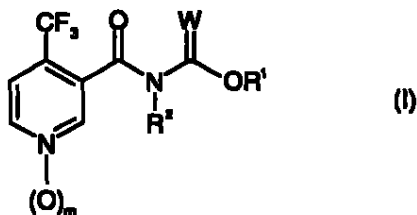
5

Antecedentes de la invención

Las publicaciones JP 321903/1994 y JP 101648/1998 describen compuestos de tipo amida o sus sales y su empleo como agentes para el control de organismos dañinos.

Descripción detallada de la invención

Así pues, la invención, proporciona nuevos nicotinoilcarbamatos de la fórmula
10 general (I)



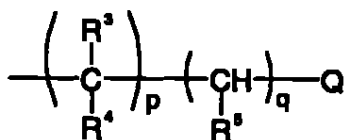
en la que

m significa 0 o 1,

W significa O o S,

15 R² significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, aralquilo, cianometilo, alcóxicarbonilalquilo, aralquiloalcóxicarbonilo, acilo, alcóxialquilo o fenilo, y

R¹ significa



donde

20 R³ significa hidrógeno o alquilo,

R⁴ significa hidrógeno, alquilo, halógenoalquilo, fenilo o alcóxicarbonilo,

- 2 -

R⁵ significa hidrógeno o alquilo,

p significa 0 o 1,

q significa 0 o 1, y

Q significa arilo, que puede estar substituido, en caso dado; un grupo heterocíclico
5 con 5 o 6 miembros, que contiene, al menos, un heteroátomo elegido del grupo formado por N, O y S y puede estar substituido, en caso dado; cicloalquilo substituido por fenilo; un grupo hidrocarbonado bicíclico, condensado; trimetilsililo; alquenilo o alquinilo.

Los compuestos de la fórmula (I), según la presente invención, tienen una
10 potente actividad insecticida y muestran una buena compatibilidad con diversos cultivos.

Sorprendentemente, los compuestos de la fórmula (I), según la presente invención, muestran una acción insecticida muy excelente en comparación con la de los compuestos similares a los compuestos de la fórmula (I), descritos en el arte previo (véanse, por ejemplo, las publicaciones JP 321903/1994 y JP 101648/1998).

15 En la presente descripción, se aplicarán las definiciones siguientes, en tanto en cuanto no se den otras definiciones específicas:

"Halógeno" significa flúor, cloro, bromo o yodo, y, preferentemente, significa flúor, cloro o bromo.

"Alquilo" significa alquilo con 1 a 12 átomos de carbono de cadena lineal o de
20 cadena ramificada, por ejemplo, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.- butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo, etc. y, preferentemente, significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono.

Cada parte alquilo de "halógenoalquilo", "alcoxicarbonilo",
"alcoxicarbonilalquilo" y "alcoxialquilo" puede considerarse igual que la que se ha
25 descrito precedentemente para "alquilo".

- 3 -

“Alquenilo” significa alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada, por ejemplo vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 2-butenilo, 2-pentenilo, 2-hexenilo, etc. y, preferentemente, significa alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono.

- 5 “Alquinilo” significa alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada, por ejemplo, etenilo, propargilo, 1-propinilo, isopropenilo, 1- (2- o 3-)butenilo, 1- (2- o 3-)pentenilo, 1- (2- o 3-)hexenilo, etc. y, preferentemente, significa alquinilo con 2 a 4 átomos de carbono.

- 10 “Ariilo” significa un grupo hidrocarbonado cíclico, aromático, con 6 a 10 átomos de carbono, por ejemplo, fenilo, naftilo, etc. y, preferentemente, significa fenilo.

“Aralquilo” significa, por ejemplo, bencilo, α -metilbencilo, 2-feniletilo, α,α -dimetilbencilo, etc. y, preferentemente, significa bencilo.

- 15 “Grupo heterocíclico” significa un grupo heterocíclico con 5 hasta 6 miembros, saturado o insaturado, que contiene, al menos, preferentemente, de 1 a 3 heteroátomos elegidos del grupo formado por N, O y S y significa, por ejemplo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirrolidinilo, tetrahidrofurilo, tetrahidrotienilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, isoxazolilo, oxazolilo, isotiazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piperidinilo, pirazinilo, piranilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotiopiranilo, tiopiranilo, etc.

- 20 “Grupo hidrocarbonado bicíclico, condensado” significa un grupo hidrocarbonado con 9 a 10 átomos de carbono, bicíclico, condensado, por ejemplo, indenilo, indanilo, tetrahidronaftilo, etc. y, preferentemente, significa indanilo o tetrahidronaftilo.

“Aralquilo” significa, como parte de “aralquilocarbonilo” el mismo grupo que ha sido descrito en la definición, precedentemente indicado para “aralquilo”.

- 25 “Cicloalquilo” significa cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo,

- 4 -

preferentemente significa cicloalquilo con 5 a 7 átomos de carbono, y, de forma particularmente preferente, significa ciclohexilo.

A continuación se han definido los sustituyentes preferentes o los intervalos preferentes de los radicales presentes en la fórmula (I) y en los correspondientes
5 compuestos intermedios.

Preferentemente,

W significa O o S.

Preferentemente,

R³ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

10 Preferentemente,

R⁴ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o alcóxicarbonilo con 2 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁵ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

15 Preferentemente,

p significa 0 o 1.

Preferentemente,

q significa 0 o 1.

Preferentemente,

20 Q significa arilo que puede estar substituido, en caso dado, por, al menos, un grupo elegido del grupo formado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, nitro, halógeno- alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; fenoxi; fenilo que puede estar substituido, en caso dado; un grupo
25 heterocíclico con 5 hasta 6 miembros, que contiene N, O o S, un grupo heterocíclico con 5 hasta 6 miembros, que contiene, al menos, un heteroátomo

- 5 -

elegido del grupo formado por N, O y S y que puede estar substituido, en caso
 dado, por halógeno-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono, por alcoxi-carbonilo
 con 1 a 4 átomos de carbono o por oxo; 4-fenilciclohexilo; un grupo
 hidrocarbonado con 9 a 10 átomos de carbono bicíclico, condensado;
 5 trimetilsililo; alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono; alquinilo con 2 a 6 átomos
 de carbono.

Preferentemente,

R² significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6
 átomos de carbono, bencilo, cianometilo, alcoxicarbonilo con 1 a 4 átomos de
 10 carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, benciloxicarbonilo, alquilcarbonilo
 con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a
 2 átomos de carbono o fenilo.

Preferentemente,

m significa 0 o 1.

15 De forma particularmente preferente,

W significa O o S.

De forma particularmente preferente,

R³ significa hidrógeno o metilo.

De forma particularmente preferente,

20 R⁴ significa hidrógeno, metilo, triclorometilo, trifluórometilo, fenilo o
 metoxicarbonilo.

De forma particularmente preferente,

R⁵ significa hidrógeno o metilo.

De forma particularmente preferente,

25 p significa 0 o 1.

De forma particularmente preferente,

- 6 -

- q significa 0 o 1.
De forma particularmente preferente,
- Q significa fenilo, que está substituido, en caso dado, por uno o varios grupos elegidos entre el grupo formado por metoxi, metiltio, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, vinilo, nitro, trifluórmétilo, fenoxi, fenilo, fenilo substituido por cloro, toliilo y tienilo, furilo, tienilo, trifluórmétilpirazolilo, piridilo, trifluórmétilpiridilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotiopiranilo, piperidinilo, 1-(terc.-butoxicarbonil)-4-piperidinilo, pirrolidiniltetrahidrofurilo, 1,1-dioxo-tetrahidrotiopiranilo, 4-fenilciclohexilo, indanilo, tetrahidronaftilo, trimetilsililo, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 4 átomos de carbono.
De forma particularmente preferente,
- 10 R² significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, bencilo, cianometilo, alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono-carbonilmetilo, benciloxycarbonilo, acetilo, alcoximetilo con 1 a 2 átomos de carbono o fenilo.
De forma particularmente preferente,
- m significa 0.
De forma muy particularmente preferente,
- 20 W significa O.
De forma muy particularmente preferente,
- R² significa hidrógeno.
De forma muy particularmente preferente,
- R³ significa hidrógeno.
- 25 De forma muy particularmente preferente,
- R⁴ significa hidrógeno.

- 7 -

Las definiciones de los radicales, mencionadas precedentemente, de manera general o de manera preferente, son aplicables tanto a los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, a los productos de partida o a los productos intermedios, necesarios, en cada caso, para la obtención. Estas definiciones de los radicales pueden combinarse, arbitrariamente, entre sí, por ejemplo incluso en combinaciones entre los intervalos citados de manera preferente.

Según la invención, serán preferentes los compuestos de la fórmula (I), que contengan una combinación de los significados indicados precedentemente como preferentes.

10 Según la invención, serán particularmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), que contengan una combinación de los significados indicados precedentemente como particularmente preferentes.

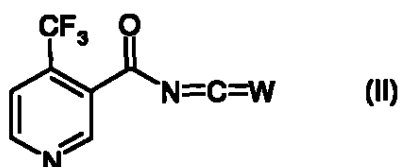
Según la invención, serán muy particularmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), que contengan una combinación de los significados indicados precedentemente como muy particularmente preferentes.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden obtenerse mediante uno de los siguientes procedimientos de obtención a), b), c), d) o e). Particularmente, los compuestos de la fórmula (I), en la que R^2 significa hidrógeno y m significa 0, pueden sintetizarse mediante los procedimientos de obtención a), b) o c), y los compuestos de la fórmula (I), en la que R^2 significa otro grupo diferente de hidrógeno y m significa 0, pueden sintetizarse mediante el procedimiento de obtención d), y, además, los compuestos de la fórmula (I), en la que m significa 1, pueden sintetizarse mediante el procedimiento de obtención e).

Procedimiento de obtención (a): en el caso en que $R^2 = \text{hidrógeno}$, $m = 0$:

25 Los compuestos de la fórmula

- 8 -



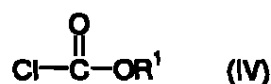
en la que W tiene el mismo significado precedentemente indicado, se hacen reaccionar con compuestos de la fórmula



- 5 en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes.

Procedimiento de obtención (b): en el caso en que $\text{W} = \text{O}$, $\text{R}^2 = \text{hidrógeno}$, $m = 0$:

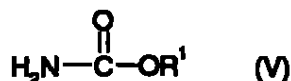
La 4-trifluórmethylnicotinamida se hace reaccionar con compuestos de la fórmula



- 10 en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes y, si es conveniente, en presencia de una base.

Procedimiento de obtención (c): en el caso en que $\text{W} = \text{O}$, $\text{R}^2 = \text{hidrógeno}$, $m = 0$:

El cloruro de 4-trifluórmethylnicotinoilo se hace reaccionar con compuestos de la fórmula



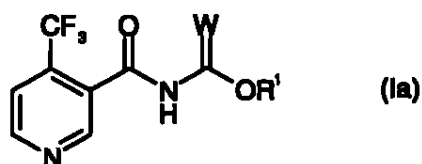
15

en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes y, si es conveniente, en presencia de una base.

Procedimiento de obtención (d): en el caso en que $\text{R}^2 =$ como se ha definido precedentemente, excepto hidrógeno, $m = 0$:

- 20 Los compuestos de la fórmula

- 9 -



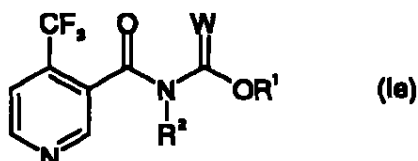
en la que W y R¹ tienen el mismo significado precedentemente indicado, se hacen reaccionar con compuestos de la fórmula



- 5 en la que R^{2'} tiene el significado precedentemente indicado, excepto hidrógeno y Hal significa halógeno, en presencia de disolventes inertes y, si es conveniente, en presencia de una base.

Procedimiento de obtención (e): en el caso en que m = 1:

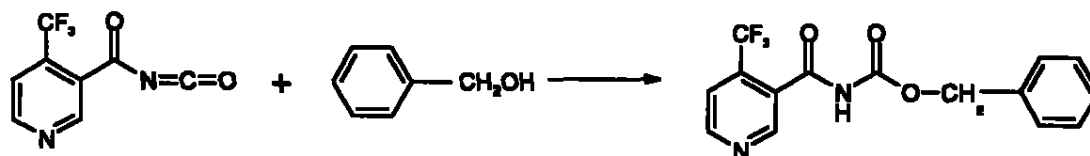
Los compuestos de la fórmula



10

en la que W, R¹ y R² tienen el mismo significado precedentemente indicado, se oxidan en presencia de disolventes inertes.

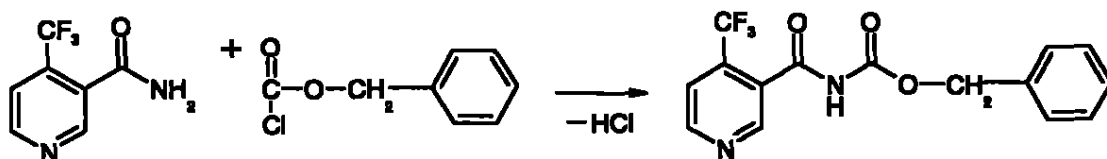
- El procedimiento de obtención a), para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), puede ser ilustrado por el siguiente esquema de reacción, si se emplean, por ejemplo, el isocianato de el 4-trifluormetilnicotinoilo y el alcohol bencilico como productos de partida.



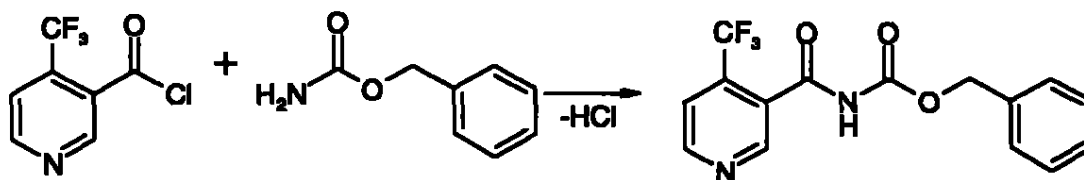
- El procedimiento de obtención b), para la obtención de compuestos de la fórmula (I), puede ser ilustrado por el siguiente esquema de reacción, si se emplean, por ejemplo, la 4-trifluormetilnicotinamida y el cloroformiato de bencilo como productos de partida.

20

- 10 -



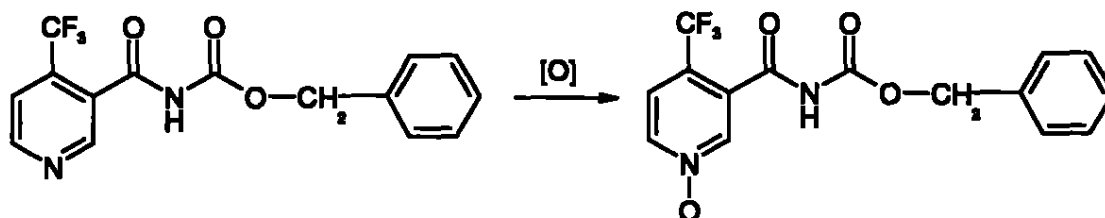
El procedimiento de obtención c), para la obtención de compuestos de la fórmula (I), puede ser ilustrado por el siguiente esquema de reacción, si se emplean, por ejemplo, el cloruro de 4-trifluórmetyl nicotinoilo y el carbamato de bencilo como productos de partida.



El procedimiento de obtención d), para la obtención de compuestos de la fórmula (I), puede ser ilustrado por el siguiente esquema de reacción, si se emplea, por ejemplo, el N-(4-trifluórmetyl-3-piridilcarbonilo)carbamato de bencilo y el cloruro de metilo como productos de partida.



El procedimiento de obtención e), para la obtención de compuestos de la fórmula (I), puede ser ilustrado por el siguiente esquema de reacción, si se emplea, por ejemplo, el N-(4-trifluórmetyl-3-piridilcarbonilo)carbamato de bencilo como producto de partida y el ácido m-cloroperbenzoico como agente oxidante.



Los compuestos de la fórmula (II), en el procedimiento de obtención a), pueden

obtenerse fácilmente de acuerdo con el procedimiento descrito, por ejemplo, en la publicación J. Med. Chem., p. 1630 (1991), J. Chem. Soc., p. 153 (1958).

Los alcoholes de la fórmula (III) son perfectamente conocidos en el campo de la química orgánica; como ejemplos representativos de los mismos pueden citarse los

5 compuestos siguientes: alcohol bencílico, alcohol α -metilbencílico, fenol, 2-fenil-isopropanol, trimetilsililmetanol, 2-(trimetilsilil)etanol, 3-furilmetanol, 2-furilmetanol, 2-tienilmetanol, alcohol 2-metoxibencílico, alcohol 3-metoxibencílico, alcohol 4-metoxibencílico, alcohol 4-vinilbencílico, alcohol 4-metiltiobencílico, alcohol 2-clorobencílico, alcohol 3-clorobencílico, alcohol 4-clorobencílico, alcohol 2-

10 piridilmetílico, alcohol 3-piridilmetílico, alcohol 4-piridilmetílico, alcohol 3-cianobencílico, trimetilsililmetanol, alcohol 4-metilbencílico, alcohol 2,4-diclorobencílico, alcohol 2,6-diclorobencílico, alcohol 2-bromobencílico, alcohol 3-bromobencílico, alcohol 4-bromobencílico, alcohol 2-nitrobencílico, alcohol 3-nitrobencílico, 1-fenil-2,2,2-trifluoretanol, difenilmetanol, alcohol 2-

15 trifluormetilbencílico, alcohol 3-trifluormetilbencílico, alcohol 4-trifluormetilbencílico, alcohol 2-fluorbencílico, alcohol 3-fluorbencílico, alcohol 4-fluorbencílico, alcohol 4-nitrobencílico, alcohol α -metoxycarbonilbencílico, alcohol 3-yodobencílico, 5-trifluormetil-2-piridilmetanol, alcohol 3-fenoxibencílico, alcohol 4-fenoxibencílico, alcohol 2-metilbencílico, alcohol 3-metilbencílico, alcohol 2,4-dimetilbencílico, 4-

20 bifenililmetanol, 1-naftilmetanol, 2-naftilmetanol, 2,2-dimetil-3-fenilpropanol, 1-fenil-2,2,2-tricloroetanol, alcohol 2-fenetílico, 2-fenilpropanol, alcohol 1-indanílico, alcohol 2-indanílico, alcohol 1-(1,2,3,4-tetrahidronaftílico), alcohol 2-(1,2,3,4-tetrahidronaftílico), alcohol 4-tetrahidropiranílico, alcohol 4-tetrahidrotiopiranílico, alcohol 4-piperidinílico, alcohol 2-pirrolidinílico, alcohol 3-pirrolidinílico, alcohol 2-

25 tetrahidrofurfurílico, alcohol 4-fenil-ciclohexílico, alcohol 4-(2-tienil)bencílico, alcohol 4-(4-clorofenil)bencílico, etc.

Entre los alcoholes precedentemente mencionados, pueden obtenerse fácilmente, por ejemplo, el alcohol 4-tetrahidropirranílico, el alcohol 2-(1,2,3,4-tetrahidronaftílico), el alcohol 4-fenoxibencílico, por ejemplo, mediante reducción de sus cetonas conocidas correspondientes, empleándose borohidruro de sodio.

5 La 4-trifluornicotinamida es un compuesto conocido (véase la publicación JP 321903/1994).

Los ésteres del ácido clorofórmico, de la fórmula (IV), son perfectamente conocidos en el campo de la química orgánica y pueden ser obtenidos fácilmente, en general, mediante la reacción de fosgeno con los alcoholes correspondientes, en
10 presencia de una amina terciaria.

El cloruro de 4-trifluormetilnicotinoilo puede ser obtenido fácilmente, por ejemplo, mediante reacción del ácido 4-trifluormetilnicotínico, conocido, y cloruro de tionilo.

Los ésteres del ácido carbámico, de la fórmula (V), son perfectamente conocidos
15 en el campo de la química orgánica y pueden obtenerse mediante procedimientos conocidos.

Los compuestos de la fórmula (Ia), en el procedimiento de obtención d) son los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención, en el caso en que R^2 signifique hidrógeno, obtenidos mediante los procedimientos de obtención a), b) (en el caso en que
20 $W = 0$) o c) (en el caso en que $W = 0$).

Los halogenuros, de la fórmula (VI), son perfectamente conocidos en el campo de la química orgánica, y pueden mencionarse, como sus ejemplos representativos, los siguientes: clorometil etil éter, cloruro de acetilo, cloroformiato de bencilo, bromoacetato de etilo, bromuro de bencilo, bromuro de alilo, yoduro de etilo, etc.

25 Los compuestos de la fórmula (Ie), en el procedimiento de obtención e), son los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención, en el caso en que $m = 0$.

Como ejemplo representativo del agente oxidante, empleado para la oxidación, puede mencionarse el ácido m-cloroperbenzoico.

El procedimiento de obtención a), precedentemente mencionado, puede llevarse a cabo, por ejemplo, según el procedimiento descrito en la publicación J. Chem. Soc.,
5 p.1091 (1957) e ibid. p. 4458 (1956).

La reacción del procedimiento de obtención a) puede llevarse a cabo empleándose un diluyente adecuado solo o en mezcla. Como ejemplos de diluyentes empleados en este caso, pueden mencionarse los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (que pueden clorados, en caso dado), por ejemplo el pentano, el hexano, el
10 ciclohexano, el éter de petróleo, la ligroína, el benceno, el tolueno, el xileno, el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano, el clorobenceno, el diclorobenceno, etc.; los éteres, por ejemplo, el etil éter, el metil etil éter, el isopropil éter, el butil éter, el dioxano, el dimetoxietano (DME), el tetrahidrofurano (THF), el dietilen glicol dimetil éter (DGM), etc.; los nitrilos, por
15 ejemplo, el acetonitrilo, el propionitrilo, el acrilonitrilo, etc.; las amidas, por ejemplo, la dimetilformamida (DMF), la dimetilacetamida (DMA), la N-metilpirrolidona, la 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, la hexametilfósforotriamida (HMPA), etc.

La reacción del procedimiento de obtención a) puede llevarse a cabo en un amplio intervalo de temperaturas. Sin embargo, puede llevarse a cabo, en general, en un
20 intervalo comprendido entre aproximadamente 0 y aproximadamente 100°C, preferentemente entre aproximadamente 0 y aproximadamente 50°C. Aún cuando es deseable llevar a cabo dicha reacción bajo presión normal, ésta puede llevarse a cabo, de manera opcional, también bajo presión elevada o bajo presión reducida.

En la realización del procedimiento de obtención a), los compuestos deseados
25 pueden obtenerse, por ejemplo, mediante reacción de una cantidad de 1 mol, hasta una

cantidad ligeramente en exceso de los compuestos de la fórmula (III), con 1 mol de los compuestos de la fórmula (II) en un diluyente, por ejemplo, el 1,2-dicloroetano.

Los procedimientos de obtención, precedentemente mencionados, b), c), d) y e) pueden llevarse a cabo bajo condiciones de reacción similares, mediante el empleo de un diluyente ya citado, en el procedimiento de obtención a), precedentemente mencionado, con excepción de la dimetilformamida.

El procedimiento de obtención b) puede llevarse a cabo, por ejemplo, según el procedimiento descrito en la publicación J. Med. Chem., p. 2504 (1991). El procedimiento de obtención c) puede llevarse a cabo, por ejemplo, según el procedimiento descrito en la publicación J. Chem. Soc., p. 451 (1964). El procedimiento de obtención d) puede llevarse a cabo, por ejemplo, según el procedimiento descrito en la publicación Heterocycles, p. 373 (1987). El procedimiento de obtención e) puede llevarse a cabo, por ejemplo, según la publicación J. Med. Chem., p. 2925 (1995).

Los procedimientos de obtención b), c) y d) pueden llevarse a cabo, además, en presencia de una base. Como bases adecuadas pueden citarse: los carbonatos de metales alcalinos, por ejemplo, el carbonato de potasio; las aminas terciarias, las N,N-dialquilanilinas y las piridinas, por ejemplo, la trietilamina, la 1,1,4,4-tetrametiletilendiamina (TMEDA), la N,N-dimetilanilina, la N,N-diethylanilina, la piridina, la 4-dimetilaminopiridina (DMAP), el 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), etc.

Los compuestos de la fórmula (I) muestran una potente acción insecticida. Por lo tanto, los compuestos de la presente invención pueden emplearse como agentes insecticidas. Y los compuestos activos de la presente invención presentan un efecto de control exacto contra los insectos dañinos, sin fitotoxicidad para las plantas de cultivo.

Los compuestos de la presente invención pueden emplearse para el control de una amplia variedad de plagas, por ejemplo, insectos chupadores dañinos, insectos

mordedores y otras pestes parasitantes de las plantas, pestes de granos almacenados, pestes de la higiene, etc. y pueden aplicarse para su destrucción.

Como ejemplos de tales pestes, pueden mencionarse las pestes siguientes:

Como insectos, pueden mencionarse las pestes de Coleoptera, por ejemplo,

- 5 *Callosobruchus Chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Manochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lictus bruneus*;

pestes de Lepidoptera, por ejemplo,

- 10 *Limantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Prausta nubilalis*, *Ephestia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens*, *Phyllocnistis citrella*;

pestes de Hemiptera, por ejemplo,

- 15 *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicae*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Rhopalosiphum pseudobrassicae*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Cimex lectularius*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Psylla* spp., *Bemisia argentifolii*;

pestes de Orthoptera, por ejemplo,

- 20 *Blatella germanica*, *Periplaneta americana*, *Gryllotalpa africana*, *Locusta migratoria migratorioides*;

pestes de Homoptera, por ejemplo,

Reticulitermes speratus, *Coptotermes formosanus*;

pestes de Diptera, por ejemplo,

- 25 *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus*, etc.

pestes de Thysanoptera, por ejemplo, Thrips palmi Karny, Frankliniella occidentalis.

Además, los compuestos de la presente invención pueden emplearse de manera efectiva en el campo de la medicina veterinaria contra diversas plagas parásitas dañinas para los animales (endoparásitos y ectoparásitos), por ejemplo, insectos y
5 helmintos. Como ejemplos de tales plagas parásitas de los animales pueden mencionarse las plagas siguientes:

Como insectos pueden mencionarse, por ejemplo:

Gastrophilus spp., Stomoxys spp., Trichodectes spp., Rhodnius spp., Ctenocephalides canis, etc.

10 En la presente invención, se denominan insecticidas, en algunos casos, a las sustancias que presentan una acción insecticida contra las plagas, incluyéndose todas ellas.

Los compuestos activos de la fórmula (I) pueden obtenerse en formas de formulación usuales, cuando sean usados como insecticidas. Como formas de
15 formulación pueden mencionarse, por ejemplo, soluciones, concentrados emulsionables, polvos humectables, granulados dispersables en agua, suspensiones, polvos, agentes espumantes, pastas, tabletas, granulados, aerosoles, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con el compuesto, microcápsulas, agentes para el recubrimiento de las semillas, formulaciones empleadas con equipo de fumigación (como equipo de
20 combustión, por ejemplo, cartuchos, botes, serpentinas etc, para la fumigación y la producción de humo, latas, rollos, etc.), ULV [niebla fría, niebla caliente], etc.

Estas formulaciones pueden prepararse según procedimientos per se ya conocidos, por ejemplo mediante mezcla de los compuestos activos con extendedores, concretamente con diluyentes líquidos; diluyentes gaseosos licuados; diluyentes sólidos
25 o materiales excipientes y, de forma opcional, mediante el empleo de agentes

tensioactivos, concretamente emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma.

Cuando se utilice el agua como extendedor, podrán emplearse, por ejemplo, también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

- 5 Como diluyentes líquidos o materiales excipientes pueden mencionarse, por ejemplo, los hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno, alquilnaftalinas, etc.), los hidrocarburos aromáticos clorados o los hidrocarburos alifáticos clorados (por ejemplo, los clorobencenos, los cloruros de etileno, el cloruro de metileno, etc.), los hidrocarburos alifáticos [por ejemplo, el ciclohexano, etc. o las parafinas (por ejemplo, 10 las fracciones de aceite mineral, etc.)], los alcoholes (por ejemplo, el butanol, los glicoles y sus éteres, sus ésteres, etc.), las cetonas (por ejemplo, la acetona, la metil etil cetona, la metil isobutil cetona, la ciclohexanona, etc.), los disolventes fuertemente polares (por ejemplo, la dimetilformamida, el dimetil sulfóxido, etc.), y agua.

- Los diluyentes o los materiales excipientes gaseosos, licuados, son sustancias 15 que son gaseosas a temperatura y presión normal y pueden mencionarse, por ejemplo, los propulsores para los aerosoles tales como el butano, el propano, el nitrógeno gaseoso, el dióxido de carbono, los hidrocarburos halogenados.

- Como diluyentes sólidos pueden mencionarse, por ejemplo, minerales naturales molturados (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, 20 tierra de diatomeas, etc.), minerales sintéticos molturados (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersado, alúmina, silicatos, etc.).

- Como materiales excipientes sólidos pueden mencionarse, por ejemplo, minerales quebrados y fraccionados (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, etc.), granulados sintéticos de harinas inorgánicos y orgánicos, 25 partículas de materiales orgánicos (por ejemplo, serrines, cáscaras de nuez de coco, mazorcas de maíz, tallos de tabaco, etc.), etc.

Como emulsionantes y/o agentes generadores de espuma pueden mencionarse, por ejemplo, emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo, los ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, los éteres polioxietilenados de alcoholes grasos (por ejemplo, los alquilaril poliglicol éteres), los sulfonatos de alquilo, los sulfatos de alquilo, los sulfonatos de arilo, etc.], productos de hidrólisis de la albumina, etc.

Los dispersantes incluyen, por ejemplo, las lejías sulfíticas de lignina, la metilcelulosa, etc.

En las formulaciones pueden emplearse, igualmente, adhesivos (polvos, granulados, concentrados emulsionables). Como tales adhesivos, pueden mencionarse, por ejemplo, la carboximetilcelulosa, los polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo, la goma arábiga, el alcohol polivinílico, el acetato de polivinilo, etc.), etc.

Del mismo modo, pueden emplearse colorantes. Como tales colorantes pueden mencionarse, por ejemplo, los pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia, etc.), los colorantes orgánicos tales como los colorantes de alizarina, los colorantes azoicos o los colorantes de ftalocianina, metálicos, así como nutrientes en trazas tales como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno y de cinc.

Tales formulaciones pueden contener los componentes activos, precedentemente indicados, en una cantidad comprendida, en general, en el intervalo desde el 0,1 hasta el 95 % en peso, preferentemente desde el 0,5 hasta el 90 % en peso.

Los compuestos activos de la fórmula (I) de la presente invención pueden presentarse, además, como agentes en mezcla con otros compuestos activos, por ejemplo, insecticidas, cebos venenosos, bactericidas, miticidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas, etc., en forma de sus formulaciones usuales en el comercio y en las formas de aplicación preparadas a partir de tales formulaciones. En este caso pueden citarse, como los insecticidas precedentemente indicados, por ejemplo,

- 19 -

los agentes organofosforados, los agentes de carbamato, los productos químicos de tipo carboxilato, los productos químicos de tipo hidrocarburo clorado, sustancias insecticidas producidas por microbios, etc.

Además, los compuestos activos de la fórmula (I) pueden presentarse, también,
5 como agentes en mezcla con un sinérgico y como tales pueden citarse las formulaciones y las formas de aplicación usuales en el comercio. Dicho sinérgicos no tienen que ser activo por si mismos, sino que es un compuesto que mejora la acción del compuesto activo.

El contenido de compuestos activos de la fórmula (I) en una forma de aplicación,
10 usual en el comercio, puede variar dentro de amplios límites.

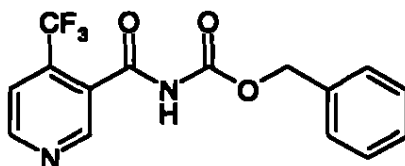
La concentración de los compuestos activos de la fórmula (I) en el momento de la aplicación puede estar comprendida, por ejemplo, en un intervalo desde el 0,0000001 hasta el 100 % en peso, preferentemente en el intervalo desde un 0,00001 hasta un 1 % en peso.

15 Los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse mediante procedimientos usuales, apropiados para las formas de aplicación.

Cuando se apliquen contra las plagas de la higiene y contra las plagas de granos almacenados, los compuestos activos de la presente invención tienen una buena estabilidad contra los álcalis sobre sustancias calcificadas y, además, muestran una muy
20 excelente efectividad residual en la madera y en el suelo.

La presente invención se describirá con mayor detalle por medio de ejemplos. Sin embargo, la presente invención no queda limitada por éstos de ninguna manera.

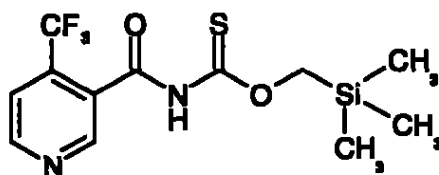
Ejemplo de síntesis 1



- 20 -

- Tras adición de cloruro de oxalilo (0,14 ml) a una suspensión de 4-trifluórmethyl-nicotinamida (0,2 g) en 1,2-dicloroetano (10 ml), a temperatura ambiente, se sometió la mezcla a destilación bajo durante 2 horas. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y el residuo se disolvió en cloruro de metileno. Se añadió a la solución
- 5 alcohol bencillico (0,11 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y el residuo se separó y se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (hexano : acetato de etilo = 3:1) para obtener el carbamato de N-(4-trifluórmethyl-3-piridilcarbonyl)carbamato de bencilo (0,24 g).
- 10 ¹H-NMR: 8,85 (1H, d), 8,72 (1H, s), 7,94 (1H, ancho), 7,56 (1H, d), 7,4-7,2 (5H, m), 5,11 (2H, s)

Ejemplo de síntesis 2

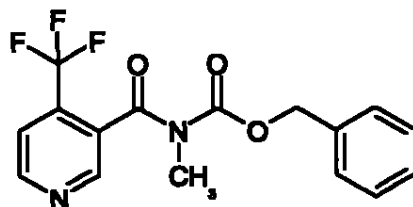


- Se añadió cloruro de oxalilo (0,5 ml) a una solución en cloruro de metileno del
- 15 ácido 4-trifluórmethyl-nicotínico (1 g) y una cantidad catalítica de N,N-dimetilformamida, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y el residuo se disolvió en tolueno. Se añadieron a la solución carbonato de potasio (0,5 g) y tiocianato de tetrabutilamonio (1,89 g) y la mezcla se agitó durante 30 minutos. A continuación se añadió trimetilsililmetanol (0,66
- 20 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Tras la dilución de la mezcla de la reacción con acetato de etilo, ésta se lavó con agua, con ácido clorhídrico 1N y con solución acuosa saturada de cloruro de sodio y la fase orgánica se secó con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y el residuo se separó y se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice

- 21 -

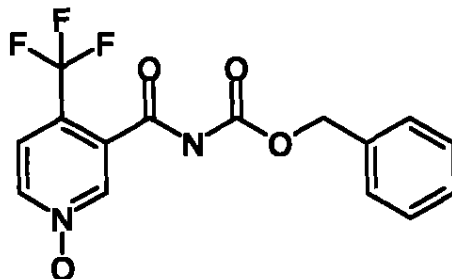
(hexano : acetato de etilo = 5:1) para obtener el N-(4-trifluórmetil-3-piridilcarbonil)tiocarbamato de trimetilsilanilmetilo (0,77 g). pf: 105-107°C.

Ejemplo de síntesis 3



- 5 Se suspendió hidruro de sodio al 60 % (36 mg) en N,N-dimetilformamida y, se le añadió, lentamente, una solución en N,N-dimetilformamida de N-(4-trifluórmetil-3-piridilcarbonil)carbamato de bencilo (0,4 g). Tras la agitación de la mezcla, a temperatura ambiente, durante 30 minutos, se añadió yoduro de metilo (0,35 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de la reacción se
- 10 diluyó con acetato de etilo, se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio y la fase orgánica se secó con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y el residuo se separó y se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (hexano : acetato de etilo = 6:1) para obtener el N-metil-N-(4-trifluórmetil-3-piridilcarbonil)carbamato de bencilo (0,33 g).
- 15 n_D^{20} : 1,5185.

Ejemplo de síntesis 4



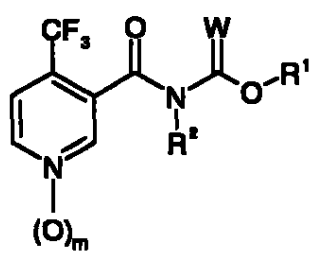
Se añadió, lentamente, ácido m-cloroperbenzoico (0,27 g) a una solución en cloruro de metileno de N-(4-trifluórmetil-3-piridilcarbonil)carbamato de bencilo (0,3 g).

Tras agitación a temperatura ambiente durante 12 horas, la solución de la reacción se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y con una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, y la fase orgánica se secó con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó por destilación bajo presión reducida y los cristales obtenidos se
5 recristalizaron en partir de tolueno para obtener el (1-oxi-4-trifluormetil-3-piridilcarbonyl)carbamato de bencilo (0,18 g). pf: 204-205°C.

En la tabla 1 se han mostrado los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención, obtenidos mediante procedimientos similares a los de los ejemplos de síntesis, precedentemente mencionados, junto con los compuestos mostrados en los
10 ejemplos de síntesis precedentemente mencionados.

En la tabla, Ph significa fenilo, Me significa metilo, Et significa etilo, terc.-Bu significa terc.-butilo, Fu significa furilo, Th significa tienilo, Py significa piridilo, Nap significa naftilo, Pyz significa pirazolilo, Pip significa piperidinilo, Pyrrol significa pirrolidinilo y c-Hex significa ciclohexilo.

15 Tabla 1



Comp. No.	W	R ²	R ¹	m	pf.°C/m _D ²⁰ / NMR
1	O	H	CH ₂ Ph	0	a
2	O	H	Ph	0	b
3	O	H	CH(CH ₃)Ph	0	116-118
4	O	H	C(CH ₃) ₂ Ph	0	140-141
5	O	H	CH ₂ CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	107-108

Comp. No.	W	R ²	R ¹	m	pf.°C/ μ _D ²⁰ / NMR
6	O	H	CH ₂ (3-Fu)	0	105-106
7	O	H	CH ₂ (2-Fu)	0	85-87
8	O	H	CH ₂ (2-Th)	0	116-117
9	O	H	CH ₂ (3-Th)	0	90-92
10	O	H	CH ₂ (2-MeO-Ph)	0	101-104
11	O	H	CH ₂ (3-MeO-Ph)	0	122-124
12	O	H	CH ₂ (4-MeS-Ph)	0	101-103
13	O	H	CH ₂ (4-MeO-Ph)	0	118-119
14	O	H	CH ₂ (2-Cl-Ph)	0	133-135
15	O	H	CH ₂ (3-Cl-Ph)	0	92-97
16	O	H	CH ₂ (4-Cl-Ph)	0	113-114
17	O	H	CH ₂ (2-Py)	0	1,5240
18	O	H	CH ₂ (3-Py)	0	156-157
19	O	H	CH ₂ (4-Py)	0	91-106
20	O	H	CH ₂ (3-CN-Ph)	0	121-122
21	O	CH ₂ CN	CH ₂ Ph	0	90-93
22	O	CH ₃	CH ₂ Ph	0	1,5185
23	O	CH ₂ CH ₃	CH ₂ Ph	0	1,5190
24	O	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ Ph	0	1,5185
25	O	CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	0	1,5490
26	O	CH ₂ CO ₂ Et	CH ₂ Ph	0	1,5063
27	O	CO ₂ CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	0	1,5445
28	O	H	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	0	97-99
29	O	H	CH ₂ (4-Me-Ph)	0	c
30	O	H	CH ₂ (2,4-diCl-Ph)	0	158-160
31	O	H	CH ₂ (2,6-diCl-Ph)	0	154-156
32	O	H	CH ₂ (2-Br-Ph)	0	d
33	O	H	CH ₂ (2-NO ₂ -Ph)	0	e

Comp. No.	W	R ²	R ¹	m	pf. ^o C/ μ _D ²⁰ / NMR
34	O	H	CH ₂ (3-NO ₂ -Ph)	0	121-122
35	O	H	CH(CF ₃)Ph	0	84-91
36	O	H	CH(Ph)Ph	0	121-122
37	O	H	CH ₂ (2-CF ₃ -Ph)	0	127-130
38	O	H	CH ₂ (3-CF ₃ -Ph)	0	96
39	O	H	CH ₂ (4-CF ₃ -Ph)	0	132-133
40	O	H	CH ₂ (2-F-Ph)	0	97-100
41	O	H	CH ₂ (3-F-Ph)	0	114-115
42	O	H	CH ₂ (4-F-Ph)	0	130-133
43	O	H	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	0	f
44	O	H	CH(CO ₂ Me)Ph	0	55-61
45	O	H	CH ₂ (3-I-Ph)	0	g
46	O	H	CH ₂ (2-(5-CF ₃ -Py))	0	h
47	O	COCH ₃	CH ₂ Ph	0	i
48	O	CH ₂ OEt	CH ₂ Ph	0	1,5085
49	O	H	CH ₂ (3-Ph-O-Ph)	0	88-91
50	O	H	CH ₂ (2-Me-Ph)	0	129-130
51	O	H	CH ₂ (3-Me-Ph)	0	113-114
52	O	H	CH ₂ (2,4-diMe-Ph)	0	120-121
53	O	H	CH ₂ (2,4,6-triMe-Ph)	0	179-180
54	O	H	CH ₂ (4-Ph-Ph)	0	124-125
55	O	H	CH ₂ (1-Nap)	0	147-148
56	O	H	CH ₂ (2-Nap)	0	115-117
57	O	H	CH(C(CH ₃) ₃)Ph	0	165-166
58	O	H	CH(CCl ₃)Ph	0	j
59	O	H	CH ₂ CH ₂ Ph	0	85-86
60	O	H	CH ₂ CH(CH ₃)Ph	0	109-111
61	O	H	CH ₂ (4-terc.-Bu-Ph)	0	153-155

Comp. No.	W	R ²	R ¹	m	pf. ^a C/n _D ²⁰ / NMR
62	O	H	1-indanilo	0	144-146
63	O	H	2-indanilo	0	148-151
64	O	H	1-(1,2,3,4-tetrahidro-Nap)	0	142-145
65	O	H	2-(1,2,3,4-tetrahidro-Nap)	0	163-171
66	O	H	4-tetrahidropiranilo	0	1,4801
67	O	H	4-tetrahidrotiopiranilo	0	1,4974
68	O	H	4-Pip	0	k
69	O	H	CH ₂ (3-tetrahidro-Fu)	0	82-89
70	O	H	CH ₂ (2-tetrahidro-Fu)	0	1,4909
71	O	H	CH ₂ (2-tetrahidropiranilo)	0	1,4890
72	O	H	3-tetrahidro-Fu	0	103-111
73	O	H	CH ₂ (1-(3-CF ₃ -Pyz))	0	110-113
74	O	H	CH ₂ (2-Ph-Ph)	0	140-142
75	O	H	CH ₂ (3-Ph-Ph)	0	82-88
76	O	H	CH ₂ (4-(3'-MeO-Ph)-Ph)	0	161-163
77	O	H	CH ₂ (4-(2'-Me-Ph)-Ph)	0	119-121
78	O	H	Ph	0	
79	O	H	CH ₃ Si(CH ₃) ₃	0	
80	O	H	CH ₃ Ph	0	
81	O	H	CH ₃ Ph	1	204-205
82	O	H	CH ₃ (3-Br-Ph)	0	100-103
83	O	H	CH ₂ (4-Br-Ph)	0	115-119
84	O	H	4-(1,1-dioxo-tetrahidro-tiopiranilo)	0	
85	O	H	2-Pirr	0	
86	O	H	3-Pirr	0	
87	O	H	CH ₂ (4-Ph-O-Ph)	0	1,5549
88	S	H	CH ₃ Si(CH ₃) ₃	0	105-107
89	O	H	CH ₂ (4-vinilo-Ph)		91-93

Comp. No.	W	R ¹	R ¹	m	pf. ^o C/n _D ²⁰ / NMR
90	O	H	4-Ph-C-Hex	0	l
91	O	H	CH ₂ (4-(2-Th)-Ph)	0	142-143
92	O	H	CH ₂ (4-(4-Cl-Ph)-Ph)	0	165-168
93	O	H	4-(1-terc.-Bu-OCO)Pip	0	98-110
94	O	H	CH ₂ -C≡CH	0	m
95	O	H	CH(CH ₃)-C≡CH	0	n
96	O	H	C(CH ₃) ₂ -C≡CH	0	o
97	O	H	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)-C≡CH	0	p
98	O	H	CH ₂ C=CCH ₃	0	q
99	O	H	CH ₂ C=CCH ₂ CH ₃	0	r
100	O	CH ₂ Ph	CH ₂ CH=CH ₂	0	s
101	O	H	CH ₂ CH=CH ₂	0	t

Fu = furanilo, Th = tienilo, PH = fenilo, Py = piridilo, Pyr = pirrolilo

Los valores ¹H-NMR mencionados como a-t en la tabla 1, precedentemente indicada, son como siguen (desplazamiento químico δ en ppm):

a	8,85(1H,d), 8,72(1H,s), 7,94(1H,ancho), 7,56(1H,d), 7,4-7,2(5H,m), 5,11(2H,s)
b	8,87(1H,d), 8,80(1H,s), 8,38(1H,ancho), 7,59(1H,d), 7,4-7,2(3H,m), 7,1-7,0(2H,m)
c	8,83(1H,d), 8,70(1H,s), 8,25(1H,ancho), 7,55(1H,d), 7,3-7,2(4H,m), 5,06(2H,s), 2,36(3H,s)
d	8,84(1H,d), 8,74(1H,s), 7,96(1H,ancho), 7,6-7,5(2H,m), 7,4-7,2(4H,m), 5,21(2H,s)
e	8,87(1H,d), 8,76(1H,s), 8,42(1H,ancho), 8,13(1H,d), 7,7-7,5(4H,m), 5,57(2H,s)
f	8,88(1H,d), 8,74(1H,s), 8,23(2H,d), 8,14(1H,ancho), 7,60(1H,d), 7,47(2H,d), 5,23(2H,s)

- 27 -

g	8,87(1H,d), 8,73(1H,s), 8,08(1H,ancho), 7,7-7,5(3H,m), 7,3-7,2(1H,m), 7,10(1H,t), 5,04(2H,s)
h	9,11(1H,ancho), 8,9-8,8(2H,m), 8,76(1H,s), 8,0-7,9(1H,m), 7,58(1H,d), 7,44(1H,d), 5,31(2H,s)
i	8,82(1H,d), 8,78(1H,s), 7,50(1H,d), 7,4-7,3(3H,m), 7,2-7,1(2H,m), 5,16(2H,s)
j	9,11(1H,Ancho), 8,90(1H,d), 8,75(1H,s), 7,60(1H,d), 7,5-7,3(5H,m), 6,20(1H,s)
k	8,87(1H,d), 8,73(1H,s), 7,59(1H,d), 4,9-4,7(1H,m), 3,5-2,6(5H,m), 2,0-1,8(2H,m), 1,7-1,5(2H,m)
l	9,0-8,7(2H,m), 8,0-7,8(1H,m), 7,6-7,5(1H,m), 7,4-7,1(5H,m), 5,1-4,6(1H,m), 2,6-1,4(10H,m)
m	8,89 (1H, d), 8,75 (1H, s), 8,22 (1H, s), 7,61 (1H, d), 4,71 (2H, d), 2,53 (1H, t)
n	8,89 (1H, d), 8,75 (1H, s), 8,09 (1H, s), 7,60 (1H, d), 5,31 (1H, ddd), 2,51 (1H, q), 1,49 (3H, dd)
o	8,87 (1H, d), 8,74 (1H, s), 7,86 (1H, s), 7,59 (1H, d), 2,55 (1H, s), 1,63 (6H, s)
p	8,87 (1H, d), 8,74 (1H, s), 7,80 (1H, s), 7,59 (1H, t), 2,56 (1H, s), 1,86 (2H, ddd), 1,62 (3H, s), 0,99 (3H, t)
q	8,89 (1H, dd), 8,74 (1H, s), 8,05 (1H, s), 7,60 (1H, d), 4,66 (2H, q), 1,85 (3H, t)
r	8,88 (1H, d), 8,74 (1H, s), 8,03 (1H, s), 7,60 (1H, d), 4,68 (2H, t), 2,21 (2H, tt), 1,13 (3H, t)
s	8,88 (1H, d), 8,74 (1H, s), 8,19 (1H, s), 7,60 (1H, d), 5,84 (1H, tt), 5,35-5,26 (2H, m), 4,59 (2H, dt)
t	8,79 (1H, dd), 8,57 (1H, s), 7,54 (1H, d), 7,43-7,28 (5H, m), 5,61-5,50 (1H, m), 5,17-5,08 (4H, m), 4,45 (2H, dt)

Ejemplo de ensayo biológico 1:

Ensayo contra *Myzus persicae** resistente a los agentes de organofosforados y a los carbamatos

Preparación de la solución de ensayo: disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida; emulsionante: 3 partes en peso de polioxietilen alquil fenil éter.

- 5 Con el fin de preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se disolvió 1 parte en peso del compuesto activo en la cantidad precedentemente mencionada de disolvente que contenía la cantidad precedentemente mencionada de emulsionante y la solución se diluyó con agua hasta una concentración establecida.

- Procedimiento del ensayo: aproximadamente 30 pulgones de *Myzus persicae**
10 resistentes a los agentes organofosforados y a los carbamatos se inocularon, respectivamente, en 1 planta de semillero de berenjena, plantadas en tiestos de vinilo de 6 cm de diámetro. Al cabo de un día, desde la inoculación, se pulverizó una cantidad suficiente de una solución acuosa diluida de una concentración dada de un compuesto activo, preparada como se ha mencionado precedentemente, mediante el empleo de una
15 pistola pulverizadora. Tras la pulverización, se colocó en un invernadero a 28°C y se calculó la proporción de muertes al cabo de 7 días desde la pulverización. En ensayo se repitió dos veces.

- Resultados: los compuestos No. 1, 3, 5, 6, 8, 9, 14, 18, 23, 29, 33, 35, 38, 40, 44, 54, 55, 59, 62, 70, 73, 84 empleados en el ensayo, como ejemplos específicos, mostraron un
20 proporción del 100% de muertes a la concentración de 100 ppm de producto activo.

Ejemplo de formulación 1 (granulado)

- Se añadieron 25 partes de agua a una mezcla formada por 10 partes del compuestos de la presente invención (No. 1), 30 partes de bentonita (montmorillonita), 58 partes de talco y 2 partes de sal de ligninasulfonato, se amasaron bien, para formar
25 granulados de 10 a 40 mesh mediante un granulador por extrusión y secado a 40 hasta 50°C, para obtener granulados.

Ejemplo de formulación 2 (granulados)

Se colocan en un mezclador rotativo 95 partes de partículas de arcilla mineral, que tienen una distribución del diámetro de las partículas en el intervalo desde 0,2 hasta 2 mm. Durante la rotación, se pulverizan 5 partes del compuesto de la presente invención (No. 1) junto con un diluyente líquido, se humedecen de manera uniforme y se secan a 40 hasta 50°C para obtener granulados.

Ejemplo de formulación 3 (concentrado emulsionable)

Se mezclan 30 partes del compuesto de la presente invención (No. 1), 55 partes de xileno, 8 partes de polioxietileno alquil fenil éter y 7 partes de alquilbencenosulfonato de calcio y se agitan para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 4 (polvo humectable)

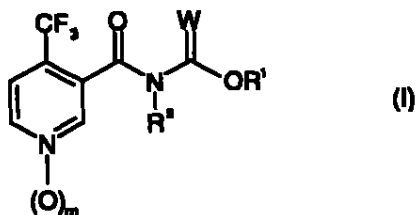
Se trituran 15 partes del compuestos de la presente invención (No. 1), 80 partes de una mezcla de carbón blanco (polvo fino de óxido de silicona amorfo hidratado) y polvo de arcilla (1:5), 2 partes de alquilbencenosulfonato de sodio y 3 partes de condensado de alquilbencenosulfonato de sodio-formalina y se mezclan para obtener un polvo humectable.

Ejemplo de formulación 5 (granulado dispersable en agua)

Se mezclan bien 20 partes del compuestos de la presente invención (No. 1), 30 partes de ligninasulfonato de sodio, 15 partes de bentonita y 35 partes de polvo calcinado de tierra de diatomeas, se les añade agua, se extruyen con un tamiz de 0,3 mm y se secan para obtener granulados dispersables en agua.

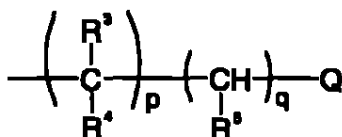
REIVINDICACIONES

1.- Compuestos de fórmula (I)



en la que

- 5 m significa 0 o 1,
 W significa O o S,
 R² significa hidrógeno, alquilo, alquenilo, aralquilo, cianometilo,
 alcoxycarbonilalquilo, aralquilocarbonilo, acilo, alcoxialquilo o fenilo, y
 R¹ significa



10

donde

- R³ significa hidrógeno o alquilo,
 R⁴ significa hidrógeno, alquilo, halógenoalquilo, fenilo o alcoxycarbonilo,
 R⁵ significa hidrógeno o alquilo,
 15 p significa 0 o 1,
 q significa 0 o 1, y
 Q significa arilo, que puede estar substituido, en caso dado; un grupo heterocíclico
 con 5 o 6 miembros que contiene, al menos, un heteroátomo elegido del grupo
 formado por N, O y S y que puede estar substituido, en caso dado; cicloalquilo
 20 substituido por fenilo; un grupo hidrocarbonado bicíclico, condensado;
 trimetilsililo; alqueno o alquino.

2.- Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en los que

- W significa O o S,
- R³ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- R⁴ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, fenilo o alcóxicarbonilo con 2 a 4 átomos de carbono,
- 5 R⁵ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- p significa 0 o 1,
- q significa 0 o 1,
- Q significa arilo, que puede estar substituido, en caso dado, por uno o varios grupos elegidos entre el grupo formado por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, nitro, halógeno- alquilo con 1 a 4 átomos de carbono; fenoxi; fenilo que puede estar substituido, en caso dado; un grupo heterocíclico con 5 hasta 6 miembros, que contiene N, O o S, un grupo heterocíclico con 5 hasta 6 miembros, que contiene, al menos, un heteroátomo elegido del grupo formado por N, O y S y que puede estar substituido, en caso dado, por halógeno-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono; alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-carbonilo u oxo; 4-fenilciclohexilo; un grupo hidrocarbonado con 9 a 10 átomos de carbono bicíclico, condensado; trimetilsililo; alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono; alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono,
- 10 R² significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, bencilo, cianometilo, alcóxicarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, benciloxicarbonilo, alquilcarbonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átomos de carbono o fenilo,
- 15 m significa 0 o 1.
- 20
- 25

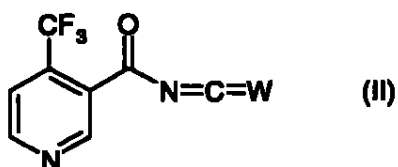
3.- Compuestos según las reivindicaciones 1 o 2 en los que

- W significa O o S,
- R³ significa hidrógeno o metilo,
- R⁴ significa hidrógeno, metilo, triclorometilo, trifluórmétilo, fenilo o metoxicarbonilo,
- 5 R⁵ significa hidrógeno o metilo,
- p significa 0 o 1,
- q significa 0 o 1,
- Q significa fenilo, que está substituido, en caso dado, por uno o varios grupos elegidos entre el grupo formado por metoxi, metiltio, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, vinilo, nitro, trifluórmétilo, fenoxi, fenilo, fenilo substituido por cloro, tolilo o
- 10 tienilo, furilo, tienilo, trifluórmétilpirazolilo, piridilo, trifluórmétilpiridilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotiopiranilo, piperidinilo, 1-(terc.-butoxicarbonil)-4-piperidinilo, pirrolidiniltetrahidrofurilo, 1,1-dioxo-tetrahidrotiopiranilo, 4-fenilciclohexilo, indanilo, tetrahidronaftilo, trimetilsililo, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 4 átomos de carbono,
- 15 R² significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 átomos de carbono, bencilo, cianometilo, alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono-carbonilmetilo, benciloxicarbonilo, acetilo, alcoximetilo con 1 a 2 átomos de carbono o fenilo,
- 20 m significa 0.

4.- Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizado porque

- 25 a) en el caso en que R² signifique hidrógeno y m signifique 0:
se hacen reaccionar los compuestos de la fórmula

- 33 -



en la que W tiene el mismo significado precedentemente indicado, con compuestos de la fórmula



5 en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de uno o más disolventes inertes,

o, b) en el caso en que W signifique oxígeno 0 y R^2 signifique hidrógeno y m signifique 0 (cero)

se hace reaccionar la 4-trifluórmelnicotinamida con compuestos de la fórmula

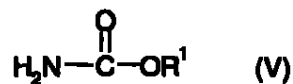


10

en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base,

o, c) en el caso en que W signifique oxígeno 0 y R^2 signifique hidrógeno y m signifique 0 (cero):

15 se hace reaccionar el cloruro de 4-trifluórmelnicotinoilo con compuestos de la fórmula

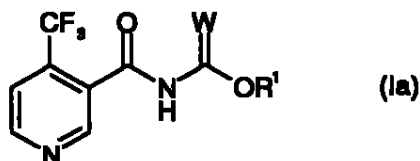


en la que R^1 tiene el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes y, en caso dado, en presencia de una base,

20 o, d) en el caso en que R^2 tenga el significado precedentemente indicado, excepto hidrógeno, y m signifique 0 (cero):

se hacen los compuestos de la fórmula

- 34 -



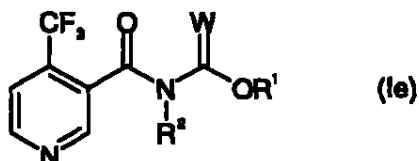
en la que W y R¹ tienen el mismo significado precedentemente indicado, con compuestos de la fórmula



- 5 en la que R^{2'} significa un grupo como se ha definido precedentemente en R², diferente de hidrógeno, y Hal significa halógeno, en presencia de disolventes inertes y, si es conveniente, en presencia de una base,

o, e) en el caso en que m signifique 1:

se oxidan los compuestos de la fórmula



10

en la que W, R¹ y R² tienen el mismo significado precedentemente indicado, en presencia de disolventes inertes.

5.- Composiciones insecticidas caracterizadas porque contienen, al menos, un compuesto de la fórmula (I), según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 3.

- 15 6.- Un procedimiento para el control de las plagas, caracterizado porque se dejan actuar sobre las plagas y/o sobre su medio ambiente los compuestos de la fórmula (I), según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 3.

7.- Empleo de los compuestos de la fórmula (I), según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 3, para el control de las plagas.

- 35 -

8.- Un procedimiento para la preparación de composiciones pesticidas, caracterizado porque se mezclan los compuestos de la fórmula (I) con extendedores y/o con agentes tensioactivos.

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC 7 C07D213/82 C07D213/89 C07F7/08 C07D405/12 C07D409/12 C07D401/12 A01N43/40		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 7 C07D C07F A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, PAJ		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,Y	WO 03/097604 A1 (BAYER CROPSCIENCE GMBH; ARAKI, KOICHI; MURATA, TETSUYA; GUNJIMA, KOSHI) 27 November 2003 (2003-11-27) claims table 9	1-8
P,Y	WO 03/097605 A1 (BAYER CROPSCIENCE GMBH; ARAKI, KOICHI; MURATA, TETSUYA; GUNJIMA, KOSHI) 27 November 2003 (2003-11-27) claims table 3	1-8
X	EP 0 580 374 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 26 January 1994 (1994-01-26) claims examples 17,34,108	1-8
-/-		
☒ Further documents are listed in the continuation of box C. ☒ Patent family members are listed in annex.		
* Special categories of cited documents: *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art *A* document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 2 February 2005		Date of mailing of the international search report 10/02/2005
Name and mailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+31-70) 340-3016		Authorized officer Kollmannsberger, M

C-(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1998, no. 09, 31 July 1998 (1998-07-31) & JP 10 101648 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA LTD), 21 April 1998 (1998-04-21) cited in the application the whole document	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No
EP2004/012276

6A

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03097604	A1	27-11-2003	NONE
WO 03097605	A1	27-11-2003	NONE
EP 0580374	A	26-01-1994	AT 132489 T 15-01-1996
		AU 4210693 A 03-02-1994	
		BR 9302960 A 16-02-1994	
		CA 2100011 A1 24-01-1994	
		CN 1081670 A ,C 09-02-1994	
		CZ 9301502 A3 16-02-1994	
		DE 69301205 D1 15-02-1996	
		DE 69301205 T2 05-09-1996	
		DK 580374 T3 20-05-1996	
		EG 20154 A 31-07-1997	
		EP 0580374 A1 26-01-1994	
		ES 2085118 T3 16-05-1996	
		GR 3018953 T3 31-05-1996	
		HK 1001896 A1 17-07-1998	
		HU 68334 A2 28-06-1995	
		IL 106340 A 12-03-1999	
		JP 2994182 B2 27-12-1999	
		JP 6321903 A 22-11-1994	
		MX 9304425 A1 28-02-1994	
		PL 299769 A1 05-04-1994	
		RU 2083562 C1 10-07-1997	
		SK 75093 A3 08-06-1994	
		US 5360806 A 01-11-1994	
		ZA 9305042 A 05-04-1994	
JP 10101648	A	21-04-1998	NONE

Extracto de pub folio 65

FORMAT DE DIGITALIZACI N
RELACI N DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Sede Social: Calle 100 No. 100-100, Zona Industrial, San José, Costa Rica

65

Expediente No		06043845	No de Folio
Item		No de unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	1	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones: *Anta Final*

66

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 08-049845-00000-0000 Fac: 2008-05-08 17:38:30
op. 2020 NUECREACIONES
Tm: 11 PATENTEYII Eno 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios: 87

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 32,843
FECHA : MAYO 3 DE 2006

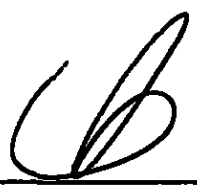
***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	34928387	03/05/2006	36,423,500.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
		TOTAL :	\$ 463,000.00

SOM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Polo 13549-841-060-8



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rég. 08-013845-00000-0000 Fac. 2008-05-09 17:30:30
Dep. 2020 NUECREACIONES
Tm. 11 PATENTEYU Ene 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Fotos 67

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION () MODELO DE UTILIDAD ()	()	()
Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud	()	()
Descripción de la invención	()	()
Dibujos de ser estos pertinentes	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()	()	()

DISEÑO INDUSTRIAL ()

Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud	()	()
Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño	()	()
Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()	()	()

ESQUEMA DE TRAZADO ()

Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud	()	()
Representación gráfica del Esquema Trazado	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()	()	()

El responsable

El

Edna Naranjo
9-05-06

69
60

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

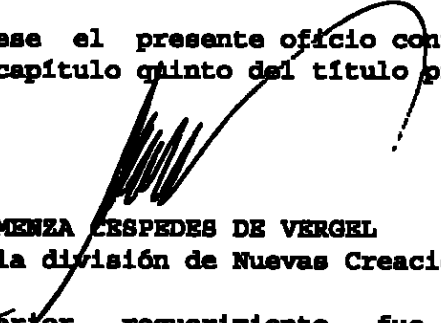
REFERENCIA	Radicación No.	6 43845
	Solicitud internacional	EP2004/012276
	Fecha inicio fase nacional	13/06/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	Nº 00 06729

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

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


ALIX CARMENZA CRESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 23 JUN. 2006
adpall