

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. - COLOMBIA

212 244
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-129099--00004-0000

Fecha: 2008-04-11 15:08:39 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra 11 PATENTEYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act 538 PETICION Folios: 2

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. 06.129.099

Solicitud del examen de patentabilidad correspondiente a la Patente PCT
Entrada en Fase Nacional, para:

"DERIVADOS DE PIPERIDINA Y SUS USOS COMO INSECTICIDAS,
ACARICIDAS, MOLUSQUICIDAS O NEMATOMICIDAS"

Solicitante: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

SOLICITUD EXAMEN DE PATENTABILIDAD

(CAPITULO I)

Yo, **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pié de mi firma, obrando en mi calidad de apoderada de la sociedad solicitante, atentamente me permito solicitar a Ud. que se realice el examen de patentabilidad de la invención arriba citada, para lo cual anexo el comprobante de pago No. 08-29.325 de Abril 10 de 2008, correspondiente a la tasa establecida para dicha solicitud.

En consecuencia, atentamente solicito a Ud. se anexe este memorial junto con el comprobante de pago al expediente correspondiente a esta solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, y se continúe con su tramitación.

Señor Jefe,

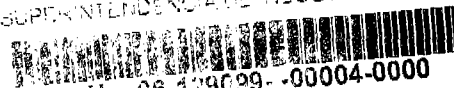

Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. 39.779.654 de Usaquén
T.P.A. No. 70.819 del C. S. J.
Calle 94 A No. 7 A-09 - Bogotá, D.C.
Teléfono (PBX): 610 7420

Bogotá,
MCA/gcb/P1442

11 ABR. 2008

215
213

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-129029-00004-0000

Act. 538 PETICION Dep. 2020 NUECREACIONE
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 29,325
CHA : ABRIL 10 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	316105	10/04/2008	1,698,000.00

***** CONCEPTO *****

RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	420,000.00
	TOTAL :	\$ 420,000.00

SDM: CUATROCIENTOS VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

21

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

RADICACIÓN EXPEDIENTE No. 06-129099

EL EXTRACTO DE LA PRESENTE SOLICITUD DE **PATENTE DE INVENCION**

FUE PUBLICADO EN LA GACETA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL No **582** DE

FECHA **30 DE NOVIEMBRE DE 2007** EL TÉRMINO HÁBIL SEÑALADO POR LA

LEY EXPIRA EL **27 DE FEBRERO DE 2008**

NOTA: Dentro del plazo de los seis (6) meses siguientes a partir de la fecha de publicación en la gaceta de Propiedad Industrial, deberá solicitar y cancelar el examen de patentabilidad so pena de que la solicitud caiga en abandono, de acuerdo con lo establecido en el Artículo 44 de la Decisión 486/2000.

SE PRESENTARON OPOSICIONES POR PARTE DE TERCEROS.

SI _____

NO X

SISTEMA DE TRÁMITES-CONSULTA DE TRÁMITES*

Martes 30 de Noviembre de 2010

Datos del Trámite (PENDIENTE)

Radicación: Año: 2006 Número: 128099 Cnt: Cons Rad: 6 * Segu Event: 0

Tipo Trámite: 11 PCI-PATENTE DE INVENCIÓN CAPÍTULOS I Y II

Tipo Evento: 378. FASE NACIONAL INCLUIDO CAPÍTULO I

Tipo Actuación: 467. SOLICITUD PROPIOSA SOLICITANTE

Dependencia Origen:

Dependencia Destino: 2020. DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

Solicitante/Destinatario: CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA Tipo: Contante

Identificación: CC . CÉDULA DE CIUDADANÍA Número: 39778554-0

Dirección: Calle 84 A No 74- 09 BOGOTÁ D.C. COLOMBIA

Tipo de Radicación: EN . ENTRADA

Fecha de Radicación: Día: 21 Mes: Septiembre Año: 2010 Hora: 12:49:13

Folio: 2

Entrega: VENTANILLA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
SISTEMA DE TRAMITES-CONSULTA DE RECIBOS

Martes 30 de Noviembre de 2010

Recibos de pago del Expediente Año : 6 Número: 129099 Cnt Cons Rad: 6

Salir									
Número de Recibo	Fecha	Remite	Concepto	Tipo	Número	Cuenta	Cantidad	Valor	Estado
10	7/9/2010	17/09/2010	PRORROGA DE TERMINOS O PLAZO ADICIONAL	CONSIGNACION	323910122	062754387	1	83009.0	U

217
216

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C., 2010-06-18

Abogada

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Solicitante: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

ASUNTO

Radicación 06-129099

Trámite 011

Evento 378

Actuación 430

Oficio

Folios 003

08202

Patente de Invención ☒

Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒

Cap. I ☒

Cap. II ☐

No. de solicitud internacional

PCT/IB2005/002002

Fecha de presentación internacional

2005-06-22

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: folios 26 a 184 (como se radicó inicialmente)

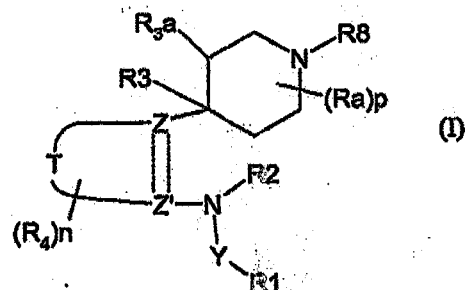
Reivindicaciones (1 a 12): folios 185 a 194 (como se radicó inicialmente)

Prioridad: Gran Bretaña, 0414438.2 de 2004-06-28

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Derivados de piperidina y sus usos como insecticidas, acaricidas, molusquicidas o nematocidas (véase folio 211).

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en: un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende en aplicar a una plaga, al locus de una plaga, o a una planta propensos a padecer el ataque de una plaga una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de fórmula I



217

Los significados de Y, Z, Z', R1, R2, R3, R_{3a}, Ra, R₄, R8, n y p se encuentran en los folios 185 a 187.

También se reivindica un compuesto de fórmula I', que coincide con la fórmula I pero sus símbolos tienen el significado indicado en el folio 192 y compuestos de las fórmulas IIa y IIb Véanse folios 193 y 194.

La invención se catalogó como A01N43/40, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. De la solicitud de Patente

Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

Los métodos usualmente se caracterizan por una serie de pasos lógicos para alcanzar un objetivo. Un método como el reivindicado en la solicitud en estudio que consiste en la aplicación de un compuesto es una aplicación; es decir, un uso. Los usos no son patentables en Colombia, por lo tanto, las reivindicaciones de método de la solicitud en estudio no son patentables.

Los términos alquilo, alcoxicarbonilo, arilo, heteroarilo, alquinilo y muchos otros no designan compuestos sino clases enteras de compuestos que pueden constituir millones de posibilidades que, obviamente, no están sustentadas en la descripción. Por tomar un ejemplo, los alquilo pueden abarcar compuestos de hasta más de 40 átomos de carbono, con cadenas lineales o ramificadas, etc. Si además se agrega que pueden estar sustituidos, la cantidad de posibilidades crece de manera indefinida porque no se sabe con qué están sustituidos. Y esto sucede con cada una de las clases de compuestos citadas. Por lo tanto, el objeto de la solicitud está totalmente indefinido y resulta completamente especulativo, además de no tener un sustento entero en la descripción.

En las reivindicaciones independientes 1, 10 y 11 no se definió el significado del símbolo T. Por lo tanto no se ha definido el objeto que se pretende proteger.

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Los compuestos de fórmula I', IIa y IIb no guardan relación con los métodos de las reivindicaciones 1 a 9, ya que estos métodos no involucran los compuestos de fórmula I', IIa y IIb. Por lo tanto, no es claro cuál es el concepto común inventivo. Aparte de esto, el solicitante afirma en la descripción que sólo algunos de los compuestos son novedosos, por lo tanto, en ese caso tampoco habría unidad de invención a posteriori entre el método y los compuestos de las fórmulas I', IIa y IIb.

Por otra parte, si al menos uno de los compuestos de fórmulas I', IIa y IIb no era novedoso, tampoco habría unidad de invención entre los innumerables compuestos que se cubren bajo las dichas fórmulas.

5. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso (artículos 14 y 21 D 486)

Como ya se indicó en el presente concepto, un método cuyo único paso es una aplicación no es más que una aplicación, o sea un uso. Los usos no son patentables según la legislación vigente en Colombia.

210

6. Determinación del Estado de la Técnica

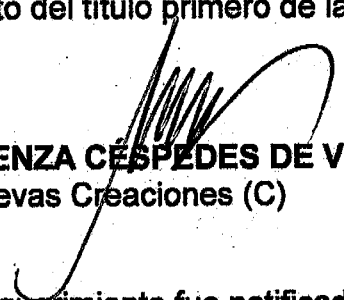
La fecha tomada en cuenta para determinar el estado de la técnica es 2004-06-28, la cual corresponde a la fecha de la prioridad reivindicada.

Debido a la total falta de definición del objeto a proteger, a que puede haber lugar a más de una invención (por lo menos cuatro) sin que conformen un único concepto inventivo, no es procedente realizar la búsqueda de antecedentes, como tampoco es procedente llevar a cabo un examen de patentabilidad por las mismas razones y porque esta oficina no puede asignar un valor arbitrario al símbolo T que no fue definido en las reivindicaciones.

7. Notificación

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de 60 días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Directora Nuevas Creaciones (C)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 25 JUN 2010

CONCEPTO TÉCNICO No. 2210	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202043
-------------------------------------	--

CASTELLANOS & CO LTDA
ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. - COLOMBIA

Señora

JEFE DE LA DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Desarrollo Económico

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 06-129099- -00007-0000

Fecha: 2010-11-02 14:35:41 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act 444 RESPUESTAREQUE Folios: 18

Ref.: Expediente No. 06.129.099

Solicitud de Patente de Invención para:

**"DERIVADOS DE PIPERIDINA Y SUS USOS COMO INSECTICIDAS, ACARICIDAS,
MOLUSQUICIDAS O NEMATICIDAS"**

Solicitante: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

Yo, Margarita Castellanos Abondano, identificada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio No. 8202 notificado por fijación en lista del 25 de junio de 2010, estando dentro del término de prórroga, en los siguientes términos:

Claridad de la solicitud

En atención a las observaciones del señor examinador, presento un nuevo pliego reivindicatorio debidamente sustentado por la divulgación inicial, en donde se eliminaron métodos y se definen los términos objetados por claridad. Más específicamente se incorporaron las siguientes modificaciones a las reivindicaciones:

"Heteroarilo" ha sido definido como:

"un sistema anular aromático que contiene por lo menos un heteroátomo y está formado por un anillo simple o por dos o más anillos fusionados, donde los anillos simples

221
220

contienen hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se eligen entre nitrógeno, oxígeno y azufre". Base para esta modificación se provee en la página 5, líneas 16 – 20 del texto PCT (página 7, 2º párrafo memoria descriptiva).

"Ariilo" ha sido definido como:

"fenilo, naftalenilo, antracenilo, indenilo o fenantrenilo". Base para esta modificación se provee en la página 5, líneas 13 – 15 del texto PCT (página 7, 2º párrafo memoria descriptiva)..

"Heterociclilo" ha sido definido como:

"es un anillo no aromático que contiene hasta 10 átomos incluyendo uno o más heteroátomos seleccionados de O, S y N". Base para esta modificación es provista en la página 6, líneas 1 – 3 del texto PCT (páginas 7 a 8 memoria descriptiva).

"Alquilo" ha sido definido como:

"un grupo alquilo C1-C6". Base para esta modificación es provista en la página 4, líneas 1 – 3 del texto PCT (página 7, 2º párrafo memoria descriptiva).

La definición de "cianoalquilo" para R4 en la reivindicación 1 ha sido modificada a "C1-8 cianoalquilo". Base para esta modificación es provista en la página 13, líneas 3 – 4 del texto PCT (página 18, tercer párrafo memoria descriptiva).

Con el fin de dar claridad a las nuevas reivindicaciones, las anteriores definiciones han sido incluidas al final de la reivindicación 1. En las reivindicaciones posteriores se hace referencia a estas definiciones de la reivindicación 1.

Así entonces, con el nuevo pliego de 9 reivindicaciones, se deben tener por superadas las objeciones hechas a la claridad de la solicitud y a la unidad de invención toda vez que en las nuevas reivindicaciones se definen los compuestos de tal manera que la persona medianamente versada en la materia pueda entender y llevar a la práctica la invención y se eliminaron las reivindicaciones de método objetadas por no tener un concepto inventivo común con las de compuestos. Dada la claridad y unidad de invención de la solicitud es posible realizar una búsqueda del estado de la técnica relativo a la invención y adelantar el examen de patentabilidad.

222
221

Por otra parte, el solicitante desea presentar datos de ensayos adicionales como referente para el señor examinador en el estudio de patentabilidad de ésta solicitud de patente. En el anexo que presento se compilan los resultados de los ensayos en donde se aprecia que todos los compuestos en las tablas A a F tienen una buena actividad. Adicionalmente, el solicitante pone de presente que ésta invención constituye un invento pionero que abre un campo de investigación insecticida totalmente nuevo y que, en consecuencia, el alcance de las reivindicaciones está totalmente de acuerdo con la contribución realizada al arte y con el alcance de los ejemplos (teniendo en cuenta una generalización razonable).

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 14, 21, 25 y 30 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se continúe el trámite de la presente solicitud.

Anexos

Capítulo reivindicatorio

Formato de modificaciones

Recibo de pago por modificaciones

Resultados de ensayos biológicos

Señora Jefe,


Margarita Castellanos Abondano
C.C. No. 39.779.654 de Usaquén
T.P.A. No. 70.819 de C.S.J.
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.
Tel.: 7560770

Bogotá D.C. 02 NOV. 2010
PATENTES/P1442/MEMORIAL FONDO

223
222



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Espacio reservado para el adhesivo de radicación

FORMULARIO ÚNICO DE CORRECCIONES Y MODIFICACIONES

①

SOLICITUD DE:



Corrección de Error Material



Modificación a una solicitud

②

SOLICITANTE

Nombre: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

Dirección: **Schwarzwaldallee 215, CH-4058
Basilea - SUIZA**

Nacionalidad o Domicilio: **Basilea - SUIZA**

Lugar de Constitución: **Basilea - SUIZA**

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual

Número

③

**REPRESENTANTE
O APODERADO**

Nombre: **MARGARITA CASTELLANOS A.**

Dirección: **CALLE 94A No. 7A-09**

Teléfono: **756 07 70** Fax: **755 01 58**

E-mail: **info@castellanosyco.com**

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual

Número

39'779.654

TPA

70.819

④

Número de Expediente:

06.129.099

⑤

Descripción de la corrección o modificación solicitada:

Presento nuevo pliego reivindicatorio para el examen de patentabilidad de la presente solicitud.

⑥

Comprobante de pago No.

10- 90,763

Fecha

26/10/2010

⑦

Anexos:



Comprobante de pago de la tasa.



Poderes si fuere el caso, junto con la sustitución de los mismos a mi favor.



Documento que acredita la existencia y representación legal de las partes, cuando sean personas jurídicas



Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE **MARGARITA CASTELLANOS A.**

FIRMA

Margarita Castellanos A.

CC 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 CSJ

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página - MCA/zca-P1442

02 NOV. 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 90,763
FECHA : OCTUBRE 26 DE 2010

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	7463201	26/10/2010	16,774,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	114,000.00
		TOTAL :	\$ 114,000.00

SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

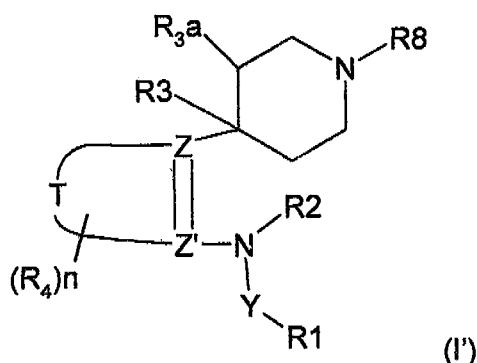
RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

225
224

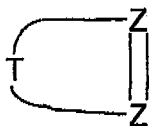
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula I'



donde Y es un enlace simple, C=O o C=S;

el anillo



es un anillo benceno, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, pirrol, imidazol, quinolina, isoquinolina, tiofeno, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol;

donde R¹ es hidrógeno, alquilo C₁₋₆, cianoalquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, cicloalquil(C₃₋₇)alquilo(C₁₋₄), alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆), heteroarilalquilo C₁₋₆ (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alquil(C₁₋₆)sulfinilo, alquiltio C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, alquil(C₁₋₆)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), arilalquilo C₁₋₆ (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alquil(C₁₋₆)sulfinilo, alquiltio C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, alquil(C₁₋₆)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alquil(C₁₋₆)carbonilaminoalquilo(C₁₋₆), arilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alquil(C₁₋₆)sulfinilo, alquiltio C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, alquil(C₁₋₆)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos

226
25

posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alquil(C₁₋₆)sulfinilo, alquiltio C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, alquil(C₁₋₆)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, fenoxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), heterocicliloxi (opcionalmente sustituido con halo, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), ciano, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, cicloalquenilo C₅₋₇, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), alquiltio C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆ o NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi(C₁₋₄)carbonilo), fenilalquilo C₁₋₆ (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilalquilo C₁₋₆ (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alquil(C₁₋₆)sulfinilo, alquiltio C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, alquil(C₁₋₆)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₄)carbonilalquil(C₁₋₆)carbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil(C₁₋₆)amino o

227
226

fenilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquil amino));

R² es hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

R³ es hidrógeno, hidroxilo, halógeno, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

R^{3a} es H o R³ y R^{3a} juntos forman un enlace;

cada R⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, cianoalquilo, alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆), cicloalquil(C₃₋₇)alquilo(C₁₋₆), cicloalquenil(C₅₋₆)alquilo(C₁₋₆), alqueniloxi(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₆), alquiniloxi(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₆), ariloxialquilo C₁₋₆, carboxialquilo C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquenil(C₂₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquinil(C₂₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alqueniloxi(C₃₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquiniloxi(C₃₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), ariloxicarbonilalquilo C₁₋₆, alquiltio(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆), alquil(C₁₋₆)sulfinilalquilo(C₁₋₆), alquil(C₁₋₆)sulfonilalquilo(C₁₋₆), aminocarbonilalquilo C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquilo(C₁₋₆), dialquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquilo(C₁₋₆), fenilalquilo C₁₋₄ (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo C₁₋₄ (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), heterociclilalquilo C₁₋₄ (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), alquenilo C₂₋₆, aminocarbonilalquenilo C₂₋₆, alquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquenilo(C₂₋₆), dialquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquenilo(C₂₋₆), fenilalquenilo C₂₋₄, (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), alquinilo C₂₋₆, trimetilsililalquinilo C₂₋₆, aminocarbonilalquinilo C₂₋₆, alquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquinilo(C₂₋₆), dialquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquinilo(C₂₋₆), alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, cicloalquilo C₃₋₇, halocicloalquilo C₃₋₇, cianocicloalquilo C₃₋₇, alquil(C₁₋₃)cicloalquilo(C₃₋₇), alquil(C₁₋₃)halocicloalquilo(C₃₋₇), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), heterociclilo (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), o dos grupos adyacentes R⁴ junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete

228
127

miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), alquiltio C₁₋₆ o R¹⁹R²⁰N donde R¹⁹ y R²⁰ son, independientemente, hidrógeno, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇, alqueno C₃₋₆, alquino C₃₋₆, haloalquilo C₂₋₆, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo o R¹⁹ y R²⁰ junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo C₁₋₆; n es 0, 1, 2 o 3.

R⁶ es -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵ donde z es 1 o 2, R⁵¹ y R⁵² son cada uno independientemente H o alquilo C₁₋₂, R⁵³ y R⁵⁴ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C₁₋₄ o haloalquilo C₁₋₄ y R⁵⁵ es fenilo sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino;

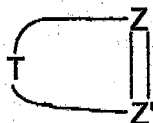
donde heteroarilo es un sistema de anillo aromático que contiene por lo menos un heteroátomo y consiste de un anillo o dos o más anillos fusionados, donde los anillos simples pueden contener hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre;

arilo es seleccionado de fenilo, naftalenilo, antracenilo, indenilo o fenantrenilo;

heterociclilo es un anillo no aromático que contiene hasta 10 átomos incluyendo uno o más heteroátomos seleccionados de O, S y N; y a menos que se especifique de otra manera alquilo es un grupo alquilo C₁₋₆;

o sales o N-óxidos de los mismos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 donde el anillo



es un anillo benceno, piridina, pirimidina, pirazina, tiofeno o pirazol.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o con la reivindicación 2 donde Y es un enlace simple o C=O.

4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R¹ es alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)alquilo C₁₋₆, heteroarilalquilo C₁₋₃ (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilalquilo(C₁₋₃) (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁₋₆, haloalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆ o haloalcoxi C₁₋₆), alquiltio C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆ o NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆, alcoxi(C₁₋₆)alquilo C₁₋₆, alquil(C₂₋₆)carbonilo, fenilcarbonilo, (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenilalquilo C₁₋₃ (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄, CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C₁₋₆)sulfonilo, alcoxi(C₁₋₆)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de

cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilalquilo C_{1-3} (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , alquil(C_{1-6})sulfonilo, alquil(C_{1-6})sulfinilo, alquiltio C_{1-6} , alcoxi(C_{1-6})carbonilo, alquil(C_{1-6})carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno); donde heteroarilo, arilo, heterociclilo y a menos que se defina de otro modo alquilo son como se ha definido en la reivindicación 1.

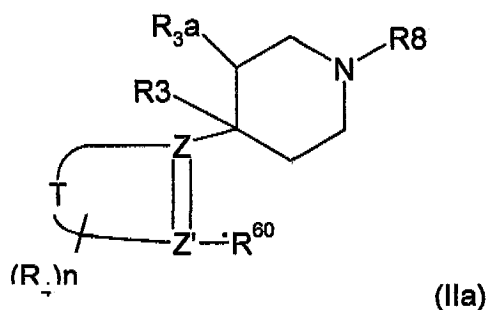
5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R^2 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o haloalquilo C_{1-4} .

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde cada R^4 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , cianoalquilo C_{1-6} , alcoxi(C_{1-6})alquilo C_{1-6} , alquinilo C_{2-6} , trimetilsililalquinilo C_{2-6} , alcoxi(C_{1-6})carbonilo, cicloalquilo C_{3-7} , alquil(C_{1-3})cicloalquilo C_{3-7} , fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterociclilo (opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C_{1-3} , haloalquilo C_{1-3} , alcoxi C_{1-3} o haloalcoxi C_{1-3}), dialquil(C_{1-6})amino, o dos grupos adyacentes R^4 junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 o 3; donde heteroarilo, arilo, heterociclilo y a menos que se defina de otro modo alquilo son como se ha definido en la reivindicación 1.

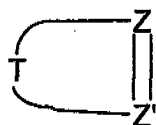
7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R^3 es hidrógeno.

231
230

8. Un compuesto de Fórmula (IIa)

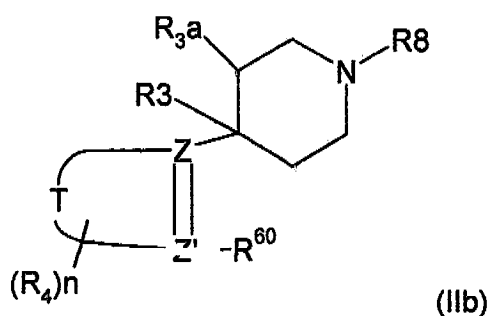


donde el anillo

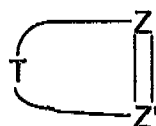


y R^3 , R^{3a} , R^4 , R^8 , y n son como se definió para la Fórmula I' en la reivindicación 1 y R^{60} es NH_2 , NO_2 o halógeno; o

un compuesto de Fórmula (IIb)



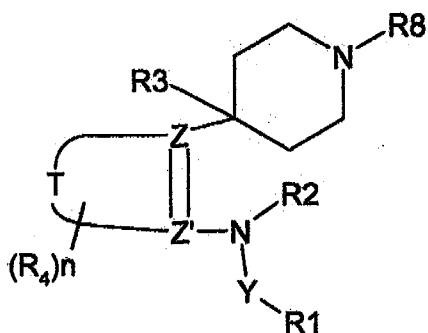
donde el anillo



y R^4 , R^{60} y n son como se definió para la Fórmula IIa, R^3 y R^{3a} son ambos H o juntos forman un enlace y R^8 es metilo, bencilo o COO -alquilo C_{1-6} siempre y cuando el compuesto no sea tert-butilo 4-(2-aminofenil)piperidin-1-carboxilato o 2,4-diamino-5-(1-bencil-4-piperidinil)-pirimidina.

9. Una composición insecticida y acaricida que comprende una cantidad efectiva como insecticida y acaricida de un compuesto de Fórmula I' como se definió en la reivindicación 1.

232
231



Ejemplos Biológicos

La tabla siguiente ilustra otros ejemplos de la invención.

Estos ejemplos ilustran las propiedades plaguicidas/insecticidas de los compuestos de fórmula (I). Los ensayos se realizaron de la siguiente manera:

Plutella xylostella (polilla de espalda de diamante):

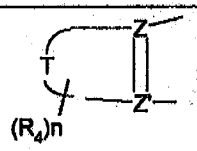
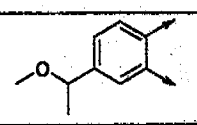
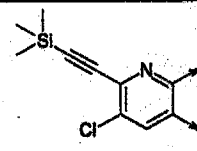
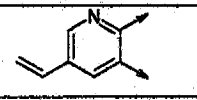
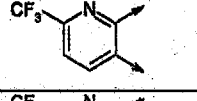
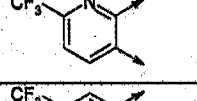
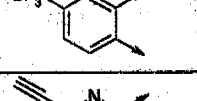
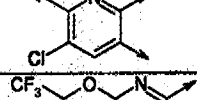
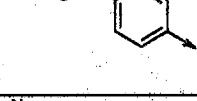
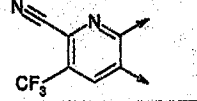
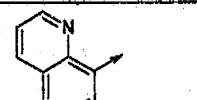
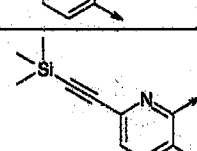
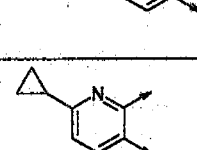
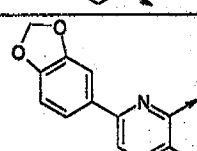
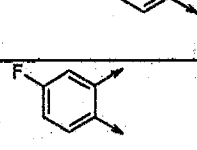
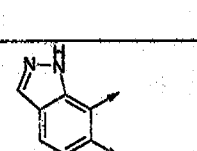
Una placa de 24 pocillos de microtitulación (MTP) con dieta artificial fue tratada por pipeteo con soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en el pozo 18 ppm). Después del secado, la MTP fue infestada con larvas L2 (7-12 por pocillo). Después de un período de incubación de 6 días, las muestras fueron analizadas por mortalidad de larvas y regulación del crecimiento.

Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Plutella xylostella*:

Tabla A

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
1		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.4	553/555
2		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.33	510
3		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.4	558
4		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.45	599/601/603/604
5		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.42	507/509

233
232

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
6		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.36	524
7		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.6	599/601
8		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.3	493/495
9		C=O	2,5-dicloro-isonicotinoilo	H	F	4-Cl-cinamilo	1.5	588
10		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	CH3	H	4-Br-cinamilo	1.36	595/597
11		C=O	CF ₃ CH ₂	H	H	4-Cl-cinamilo	1.33	505
12		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.37	525
13		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.4	565
14		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	bis-(4-Cl-cinamilo) HCl salt	1.64	712/714
15		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.37	517/519/5 21/522
16		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.53	563/565
17		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	*NR	*NR
18		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.41	587/589
19		C=O	(2-cloro-thiazol-5-yl)-metilamino	H	H	4-Cl-cinamilo	1.44	519
20		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.22	506

234
23

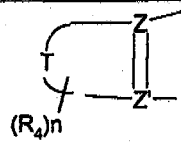
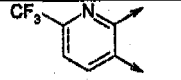
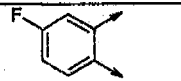
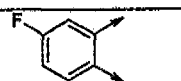
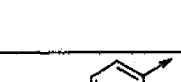
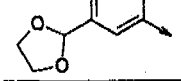
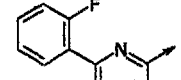
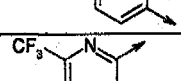
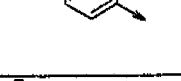
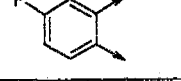
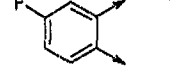
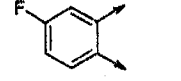
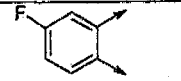
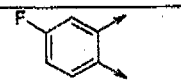
* NR = no se registran datos

Heliothis virescens (gusano del tabaco):

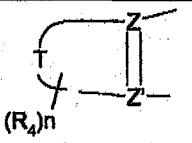
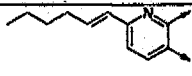
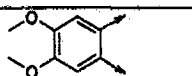
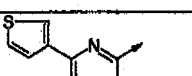
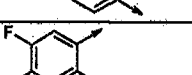
Los huevos (0-24 h de edad) fueron colocados en la placa de 24 pocillos de microtitulación con dieta artificial y tratados por pipeteo con soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en el pozo 18 ppm). Después de un período de incubación de 4 días, las muestras fueron analizadas por mortalidad de huevos, mortalidad de larvas y regulación del crecimiento.

Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Heliothis virescens*:

Tabla B

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
1		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-fluoro-cinamilo	*NR	*NR
2		C=O	2-metoxymetilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.6	431.2
3		C=O	3,4-dimetoxybenzilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.68	523.2
4		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	*NR	*NR
5		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.31	561.2
6		C=O	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo	H	H	4-trifluoro-metil-cinamilo	1.44	620.2
7		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	CH ₃	4-cloro-cinamilo	1.26	498
8		C=O	(E)-pent-3-enilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.65	427.2
9		C=O	(E)-2-metil-pent-3-enilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.63	427.2
10		C=O	tetrahidrofuran-2-ilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.56	443.2
11		C=O	2-tiofen-2-ilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.68	469.2
12		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.27	571.2
13		C=O	2-chloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.46	551.2

225
234

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
14		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.46	549.2
15		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	*NR	*NR
16		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.41	549/551
17		enlace	H	H	H	4-cloro-cinamilo	1.27	381

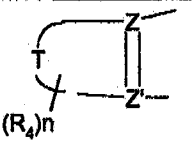
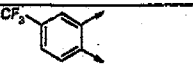
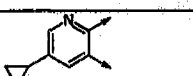
* NR = no se registran datos

Spodoptera littoralis (gusano de hoja de algodón egipcio)

Discos de hoja de algodón fueron colocados en agar en una placa de 24 pocillos de microtitulación y rociados con soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después del secado, los discos de hoja estaban infestados de 5 larvas L1. Las muestras fueron analizadas por mortalidad, comportamiento alimentario y regulación del crecimiento 3 días después del tratamiento (DAT).

Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Spodoptera littoralis*:

Tabla C

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
1		enlace	H	H	H	4-cloro-cinamilo	1.35	395
2		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.34	507/509

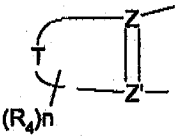
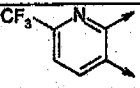
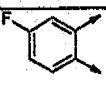
Diabrotica balteata (gusano de la raíz del maíz):

Una placa de 24 pocillos de microtitulación (MTP) con dieta artificial fue tratada por pipeteo con soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en el pozo 18 ppm). Después del secado, la MTP fue infestada con

236
235

larvas (L2) (6 a 10 por pozo). Después de un período de incubación de 5 días, las muestras fueron analizadas por mortalidad de larvas, y regulación de crecimiento. Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Diabrotica balteata*:

Tabla D

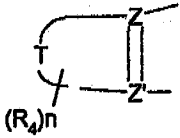
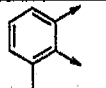
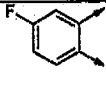
Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS	MH+
1		C=O	2,3-difluoro fenyl	H	H	4-trifluoro metil-cinamilo	1.34	570.2
2		C=O	etilamino	H	H	4-cloro-cinamilo	1.36	416

Aedes aegypti (mosquito de la fiebre amarilla):

10-15 larvas de *Aedes* (L2), junto con una mezcla de la nutrición se colocaron en placas de 96 pocillos de microtitulación. Las soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 2 ppm se pipetearon en los pozos. 2 días más tarde, los insectos fueron revisados por mortalidad e inhibición del crecimiento.

Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Aedes aegypti*:

Tabla E

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS	MH+
1		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.54	480
2		C=O	2-metoxyetil	H	H	4-cloro-cinamilo	1.52	431.2

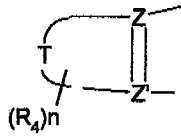
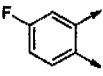
Tetranychus urticae (ácaro araña de dos manchas):

Discos de hojas de haba ("bean") en agar en placas de 24 pocillos de microtitulación fueron rociados con soluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después del secado, los discos de hoja estaban infestados por poblaciones de ácaros de diversas edades. 8 días después, los discos se revisaron por mortalidad de huevos, mortalidad de larvas, y mortalidad de adultos.

Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Tetranychus urticae*:

237
236

Tabla F

Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS	MH+
1		C=O	2-cloro-5-trifluorometil-6-metil-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.66	678

238
237

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020

Bogotá, D.C., 2011-01-31

Abogada

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

Solicitante: SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

ASUNTO

Radicación 06-129099

Trámite 011

Evento 378

Actuación 430

Oficio

Folios 004

002288

Patente de Invención ☒

Patente de Modelo de Utilidad ☐

Vía Nacional ☐

Vía PCT (fase nacional) ☒

Cap. I ☒

Cap. II ☐

No. de solicitud internacional

PCT/IB2005/002002

Fecha de presentación internacional

2005-06-22

Como resultado del examen de fondo, realizado con fundamento en el artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

Descripción: folios 26 a 184 (como se radicó inicialmente)

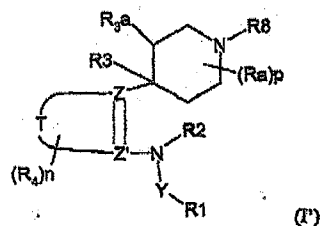
Reivindicaciones (1 a 9): folios 225 a 231 (como se modificó mediante oficio de 2010-11-02)

Prioridad: Gran Bretaña, 0414438.2 de 2004-06-28

2. Objeto de la invención

Título de la solicitud: Derivados de piperidina y sus usos como insecticidas, acaricidas, molusquicidas o nematocidas (véase folio 211).

El objeto de la presente solicitud de patente de invención consiste en: un compuesto de fórmula I'



Los significados de Y, Z, Z', R1, R2, R3, R3a, Ra, R4, R8 y n se encuentran en los folios 225 a 228.

También se reivindicaron compuestos de fórmulas (IIa) y (IIb), que aparecen en el folio 231. La invención se catalogó como A01N43/40, según la Clasificación Internacional de Patentes (IPC).

3. De la solicitud de Patente

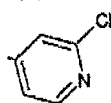
Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

El objeto de la materia está completamente indefinido ya que la única parte fija de la fórmula (I') es el grupo piperidina ya que el resto de sustituyentes, especialmente el anillo

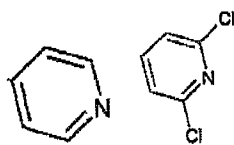


puede tener hasta 19 significados diferentes. En los datos allegados no se ensayaron más de 7 posibilidades de las reivindicadas y cada uno de dichos anillos es muy diferente como para suponer que todos tendrán actividad. Los sustituyentes R1 y R4 tienen hasta 11 sustituciones sucesivas de sistemas aromáticos con hasta 7 miembros cada uno, sustituidos con otros radicales o grupos, que forman millones de compuestos que no tienen sustento en la descripción y que no definen de manera concisa el objeto de la solicitud.

A pesar de que la solicitante limitó un poco los significados de los términos alquilo, alcoxicarbonilo, arilo, heteroarilo, alquinilo y demás, estos siguen sin el entero soporte en la descripción y se entiende por entero soporte en la descripción cuando en ésta se encuentran ejemplos de síntesis y de actividad de al menos cada uno de los compuestos en donde cada uno de los sustituyentes adopta el significado de uno de su clase. Es decir, se esperaba que puedan verse en la descripción ejemplos de síntesis y de actividad de compuestos donde R1 tenga el significado de cada clase indicada en la primera reivindicación. Por ejemplo de síntesis se entiende aquí que se proporcionen los datos físicos o fisicoquímicos característicos del compuesto sintetizado. Esto mismo se espera para cada uno de los sustituyentes Y, Z, Z', R2, R3, R3a, Ra, R4, R8 cuando n asume los significados indicados. En la tabla I de la descripción se citan 1127 compuestos en los cuales R1 tiene un único significado correspondiente a



En la descripción se anuncian 71 tablas más en donde supuestamente deben aparecer miles de compuestos en los que R1 asume significados como



, otras piridinas sustituidas, , etc., pero ningún caso cuando R1 es hidrógeno, cianoalquilo, cicloalquil-alquilo, haloalcoxi, etc. Mucho menos se encuentran casos donde las posiciones adyacentes en sistema heteroarilo puedan estar ciclizadas para formar ciclos. No se encuentra ni una sola evidencia de que se haya sintetizado y mucho menos que se haya ensayado la actividad pesticida de compuestos en los que R1 tenga un sistema heteroarilo, arilo con sustituciones que a su vez formen anillos o ciclos de ninguna especie.

En últimas, no es suficiente con que la descripción contenga unas tablas en las que aparezcan los significados de los sustituyentes, sino que cada una de las clases de sustituyentes se represente en la síntesis de al menos un compuesto por clase. Así mismo, se espera que cada uno de estos compuestos representativos haya sido ensayado en su actividad como insecticida, acaricida, molusquicida o nematocida.

Algo similar ocurre con los significados de R4, para los que en ninguna parte de la descripción se encuentra ningún ejemplo, ni de síntesis ni de actividad, en donde los sustituyentes R4 formen entre sí algún tipo de ciclo. Además, muchas de las clases de compuestos que puede ser R4 no se encuentran en las tablas y tampoco se encuentran evidencias de su síntesis o su actividad.

No fue posible encontrar en la descripción referencia alguna para el significado de R4 como algún heteroarilo que tenga dos o más anillos fusionados con hasta cuatro heteroátomos.

Tampoco se encontró evidencia alguna en la descripción sobre la actividad pesticida de las sales o N-óxidos de los compuestos reivindicados.

En los significados de los sustituyentes sigue apareciendo las palabras arilo, heterociclilo, arilcarbonilo y otras que puede implicar miles de posibilidades que no definen de ninguna manera concisa el objeto de la solicitud.

Los significados de R4, R1 y los 19 posibles significados del ciclo mencionado dan una cantidad de varias decenas de millones de compuestos que no tienen sustento en la descripción.

Por lo tanto no se ha definido el objeto que se pretende proteger. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente

4. Unidad de invención (artículo 25 D 486)

Los posibles significados de los sustituyentes en el compuesto de fórmula I' pueden ser tan variados que, por ejemplo, R1 puede ser un heteroarilalquilo sustituido (1) en donde dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo forman un anillo de hasta 7 miembros sustituido (2) con arilalquilo sustituido (3) donde dos posiciones adyacentes en el sistema arilo forman un anillo de hasta 7 miembros, sustituido (4) a su vez por un arilo (que no se ha definido) que está a su vez sustituido (5) y donde, a su vez, dos posiciones adyacentes pueden formar un anillo de hasta 7 miembros el cual también está sustituido (6) con heteroarilo que a su vez está sustituido (7) y donde dos posiciones adyacentes forman un anillo de hasta 7 miembros que también está sustituido (8) con fenoxi, el cual también está sustituido, o por heterociclilo sustituido o por fenil alquilo que también puede estar sustituido (9) a su vez y donde dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas y formar un anillo de hasta 7 miembros que también puede estar sustituido (10) a su vez con arilcarbonilo, donde dos posiciones adyacentes forman un anillo de hasta 7 miembros, él mismo sustituido (11) con arilo o heteroarilo. Como puede leerse puede haber al menos 12 sustituciones de sustituciones sucesivas; es decir, al menos once sistemas de anillos aromáticos sustituidos sucesivamente. Es decir que la piperidina es absolutamente insignificante frente a un sistema de 11 sustituciones sucesivas para un solo sustituyente R1. Algo similar ocurre con R4. Esto combinado con los 19 posibles significados del ciclo



da un número inimaginable de posibilidades que no guardan absolutamente unidad de invención. Además, lo único común que tienen los millones de compuestos de la fórmula I' es la piperidina que no tiene nada de novedoso ni de inventivo.

Por otra parte, si al menos uno de los compuestos de fórmulas I' no era novedoso, como lo afirma la solicitante en la descripción, tampoco habría unidad de invención *a posteriori* entre los innumerables compuestos que se cubren bajo las dichas fórmulas.

En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente

5. Determinación del Estado de la Técnica

La fecha tomada en cuenta para determinar el estado de la técnica es 2004-06-28, la cual corresponde a la fecha de la prioridad reivindicada.

241
240

Debido a la total falta de definición del objeto a proteger, a que puede haber lugar a más de una invención (por lo menos cuatro) sin que conformen un único concepto inventivo, no es procedente realizar la búsqueda de antecedentes, como tampoco es procedente llevar a cabo un examen de patentabilidad por las mismas razones y porque esta oficina no puede asignar un valor arbitrario al símbolo T que no fue definido en las reivindicaciones.

6. Notificación

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de 60 días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.



JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ
Director Nuevas Creaciones (E)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 11 FEB. 2011

CONCEPTO TÉCNICO No. 373	EXAMINADOR TÉCNICO Código No. 202043
------------------------------------	--