

CASTELLANOS & CO LTDA
A B O G A D O S
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

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).

"Arilo" 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.

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

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

IDENTIFICACIÓN

C.C.



NIT



C.E.



Otro



Cual

Teléfono:

Fax:

E-mail:

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

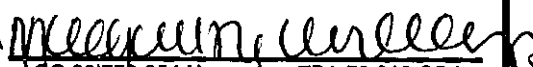


Nuevo capítulo reivindicatorio

⑧

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS A.

FIRMA


OC 39'779.654 Usaquén - TPA 70.819 CSJ

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 PGD	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 LEMAS COMERCIALES
		TOTAL :	\$ 114,000.00

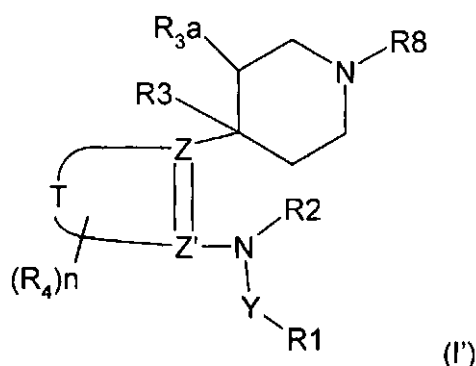
SON: CIENTO CATORCE MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

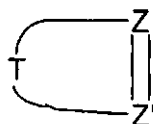
REIVINDICACIONES

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

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 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), alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , fenoxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), heterocicliloxi (opcionalmente sustituido con halo, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), ciano, alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-6} , cicloalquenilo C_{5-7} , heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), alquiltio C_{1-6} , haloalquiltio C_{1-6} o NR¹³R¹⁴ donde R¹³ y R¹⁴ son independientemente hidrógeno, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi(C_{1-6})alquilo(C_{1-6}), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi(C_{1-4})carbonilo), fenilalquilo C_{1-6} (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C_{1-6})sulfonilo, alcoxi(C_{1-6})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 C_{1-6} (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, 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) o heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6} , alcoxi(C_{1-4})carbonilalquil(C_{1-6})carbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO₂, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil(C_{1-6})amino o

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 C₁₋₈, haloalquilo C₁₋₈, alcoxi C₁₋₈, 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), alquinioloxi(C₃₋₆)alquilo(C₁₋₆), ariloxialquilo C₁₋₆, carboxialquilo C₁₋₆, alquil(C₁₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquenil(C₂₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquini(C₂₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alcoxi(C₁₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alqueniloxi(C₃₋₆)carbonilalquilo(C₁₋₆), alquinioloxi(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), alquini(C₂₋₆), trimetilsililalquini(C₂₋₆), aminocarbonilalquini(C₂₋₆), alquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquini(C₂₋₆), dialquil(C₁₋₆)aminocarbonilalquini(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

miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), alquiltio C_{1-8} o $R^{19}R^{20}N$ donde R^{19} y R^{20} son, independientemente, hidrógeno, alquilo C_{1-8} , cicloalquilo C_{3-7} , alqueno C_{3-6} , alquino C_{3-6} , haloalquilo C_{2-6} , alcoxi(C_{1-6})carbonilo o R^{19} y R^{20} 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 C_{1-6} ; n es 0, 1, 2 o 3.

R^8 es $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ donde z es 1 o 2, R^{51} y R^{52} son cada uno independientemente H o alquilo C_{1-2} , R^{53} y R^{54} son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C_{1-4} o haloalquilo C_{1-4} y R^{55} es fenilo 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 o heteroarilo 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;

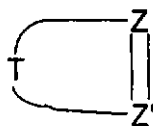
donde heteroarilo es un sistema de anillo aromático que contiene por lo menos un heteroátomo y consiste de un anillo o dos o más anillos fusionados, donde los anillos simples pueden contener hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre;

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 C_{1-6} ;

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 R^1 es alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi(C_{1-6})alquilo C_{1-6} , 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, alcoxi(C_{1-6})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(C_{1-3}) (donde el grupo arilo puede estar 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, dialquilamino, alquil(C_{1-6})sulfonilo, alcoxi(C_{1-6})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 C_{1-4} , alcoxi C_{1-4} , haloalquilo C_{1-4} , haloalcoxi C_{1-4} , CN, NO_2 , arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C_{1-6})sulfonilo, alcoxi(C_{1-6})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 C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , alquil(C_{1-6})sulfonilo, alcoxi(C_{1-6})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 C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , alquenilo C_{2-6} , heterociclilo (opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} o haloalcoxi C_{1-6}), alquiltio C_{1-6} , haloalquiltio C_{1-6} o $NR^{13}R^{14}$ donde R^{13} y R^{14} son independientemente hidrógeno, alquilo C_{1-6} o haloalquilo C_{1-6} , alcoxi(C_{1-6})alquilo C_{1-6} , alquil(C_{2-6})carbonilo, fenilcarbonilo, (donde el grupo fenilo está 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), fenilalquilo C_{1-3} (donde el grupo fenilo está 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, dialquilamino, alquil(C_{1-6})sulfonilo, alcoxi(C_{1-6})carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de

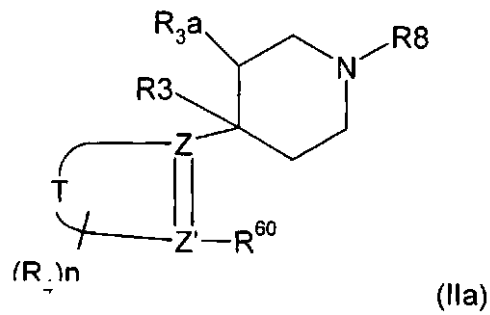
cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilalquilo C_{1-3} (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C_{1-6} , haloalquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-6} , alquil(C_{1-6})sulfonilo, 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} .

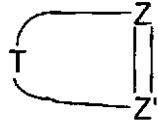
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde cada R^4 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_{1-8} , haloalquilo C_{1-8} , cianoalquilo C_{1-8} , alcoxi(C_{1-6})alquilo C_{1-6} , alquinilo C_{2-6} , trimetilsililalquinilo C_{2-6} , alcoxi(C_{1-6})carbonilo, 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_{1-8} , 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_{1-8})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.

8. Un compuesto de Fórmula (IIa)

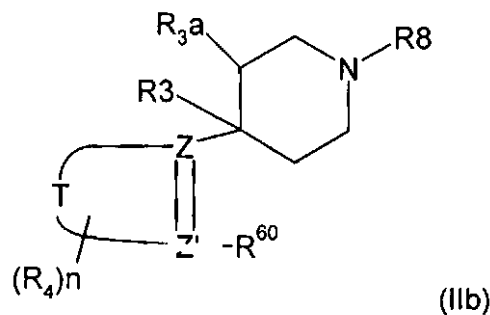


donde el anillo

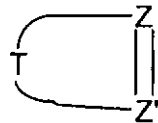


y R^3 , R^{3a} , R^4 , R^8 , y n son como se definió para la Fórmula I' en la reivindicación 1 y R^{60} es NH_2 , NO_2 o halógeno; o

un compuesto de Fórmula (IIb)

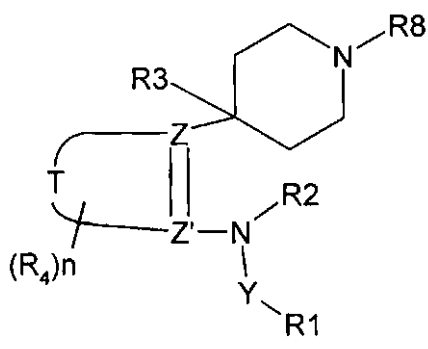


donde el anillo



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.



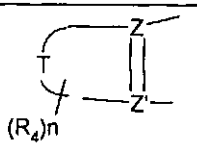
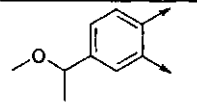
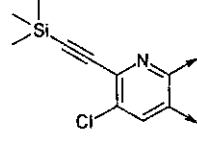
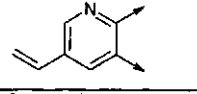
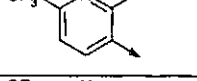
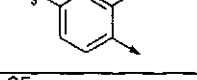
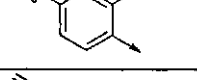
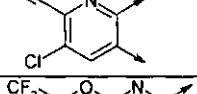
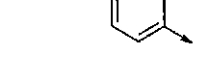
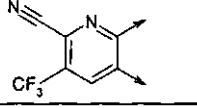
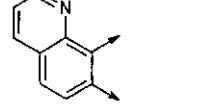
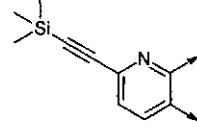
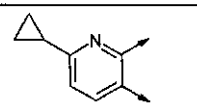
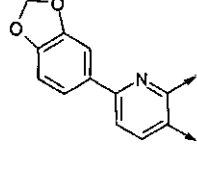
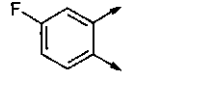
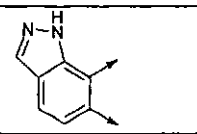
Ejemplos Biológicos

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-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.33	510
3		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.4	558
4		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.45	599/601/603/604
5		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-Cl-cinamilo	1.42	507/509

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	517/519/521/522
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

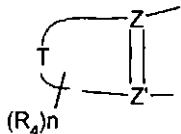
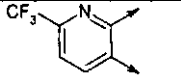
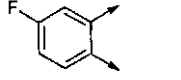
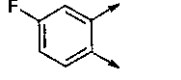
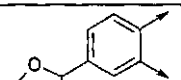
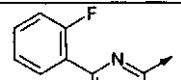
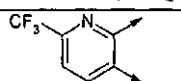
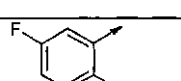
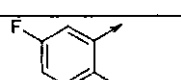
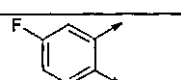
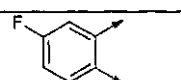
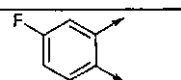
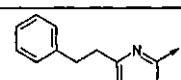
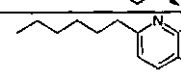
* NR = no se registran datos

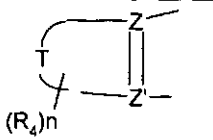
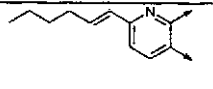
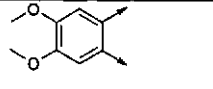
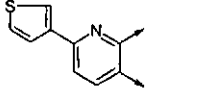
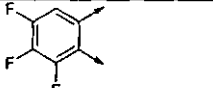
Heliothis virescens (gusano del tabaco):

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-dimethoxybenzilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.68	523.2
4		C=O	2-chloro-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-trifluorometil-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

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

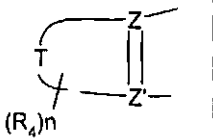
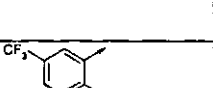
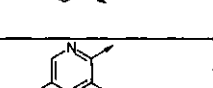
* NR = no se registran datos

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

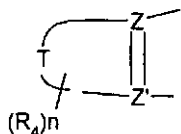
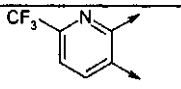
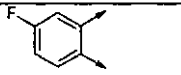
Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS (min)	MH+
1		enlace	H	H	H	4-cloro-cinamilo	1.35	395
2		C=O	2-cloro-isonicotinoilo	H	H	4-cloro-cinamilo	1.34	507/509

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

larvas (L2) (6 a 10 por pozo). Después de un periodo 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

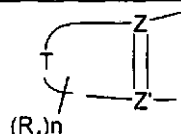
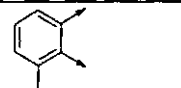
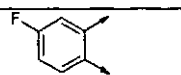
Comp No		Y	R1	R2	R3	R8	Tiempo de retención de LCMS	MH+
1		C=O	2,3-difluoro phenyl	H	H	4-trifluoro metil-cinamilo	1.34	570.2
2		C=O	etilamino	H	H	4-cloro-cinamilo	1.36	416

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*:

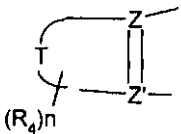
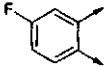
Tabla E

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-metoxietil	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*:

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