Organizacion CSA Ltda

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 00-17174

54. **TÍTULO** Composiciones Insecticidas Sinergicas Que Comprenden Un Antagonista Del Canal De Sodio Neuronal y Un Arilpirrol

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** AOIN 47/28, 43/36

71. **SOLICITANTE** American Cyanamid Company

DOMICILIO Madison, Estado De New Jersey Estados Unidos De America.

74. **APODERADO** Jose Antonio Noreda
T.P. # 10.184
Codigo 231

22. **BOGOTÁ, D. C.,** 09 Mar, 2000

13

202037

(FORMA P-10)

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. **EXPEDIENTE No.** 00-17174

54. **TITULO** COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS

Ver titulo nuevo en folio 46

51. **CLASIFICACION INTERNACIONAL** A01N47/28, 43/36

71. **SOLICITANTE** AMERICAN CYANAMID COMPANY

DOMICILIO MADISON, ESTADO DE NEW JERSEY, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA.

74. **APODERADO** JOSE ANTONIO LLOREDA

T.P.#10.784
CODIGO 231

22. **SANTAFE DE BOGOTA, D.C.** 09 MAR. 2000

13

(FORMA P 10)

ndustria y Comercio
UPERINTENDENCIA

S 00 17174

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00017174 00000000 Folios: 30
Fecha (AMD): 2000-03-29 12:32:35
Tramite : 001 PATENTES I - RESIDENTE 411 PRESENTAD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

mbres y Apellidos o Razón Social	**AMERICAN CYANAMID COMPANY**, Sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes del Estado de Maine , Estados Unidos de América.
No. de Identificación	
Representante Legal (Persona Jurídica)	**JOSE ANTONIO LLOREDA**
País de Domicilio	**ESTADOS UNIDOS DE AMERICA**
Departamento o Estado	MAINE
ección	Five Giralda Farms, Madison, New Jersey, 07940-0874, Estados Unidos de América.
Ciudad	NEW JERSEY Teléfono 00919736605000

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre	JOSE ANTONIO LLOREDA
Dirección y Domicilio	Calle 72 No. 5-83 Piso 6, Santafé de Bogotá, Colombia
Ciudad	BOGOTA Teléfono 326 42 70

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es)	Treacy Michael Frank, Borysewicz Raymond Frank, y Rensner Paul Erich.
Identificación	
cción	53 Sequoia Drive Newtown,Pennsylvania 18940; 12 Albemarle Road Hamilton Square, New Jersey 08690 y 1267 Woodthrush Court Yardley, Pennsylvania 19067, Todos residentes en : Estados Unidos de América.
Ciudad	Pennsylvania, New Jersey. Teléfono 00919736605000

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención " **COMPOSICIONES INSETICIDAS SINERGICAS.**"

PRIORIDAD REIVINDICADA SI [X] NO [ ] **TIPO DE PRIORIDAD** **ANDINA** [ ] **UNIONISTA** [XX]

(33) País	US	(32) Fecha	12-03-99	(31)No. Solicitud	60/124.228
	US		07-10-99		60/158.202

Para Publicar a los [ ] **6 meses** [ ] **12 meses** [ ] **18 meses a partir de la fecha de la presente Solicitud**

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL A 01 N

(1)

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención provee una composición insecticida sinérgica que comprende como ingredientes activos esenciales un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol.

También se proveen métodos para el control sinérgico de insectos protección para los cultivos.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica	
Los poderes debidamente otorgados, o mensión de su protocolización ante la S.I.C. 16.333	X
Recibo de la tasa respectiva **$608.000,00**	X
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia dela primera solicitud	
Traducción oficial	
Si se reivindica prioridad Unionista:	
Copia certificada de la primera solicitud:	
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción Simple	
Capítulo descriptivo	X
Dibujos, planos necesarios	
Capítulo reivindicatorio	X
Tarjeta archivo propietarios según formato	X
Tarjeta archivo temático según formato	X
Extracto para publicación según formato	X
Arte final 12 x 12 cms. Y 6x6 cms	
Otros Documentos	
Nota: Anexo información sobre la fuente normativa de reciprocidad y petición Reconocimiento Personería	X

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

FIRMA

NOMBRE JOSE ANTONIO LLOREDA C.C. 17.159.681 de Bogotá TP No. 10.784

2

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO Folios: 3?
Radicacion : 0001717 00000000
Fecha (AMD): 2000-03-29 12:56:35
Tramite : 002 PRIMERAS A [illegible] REGISTRO/ AL PRESENTAR
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 14,721
FECHA : MARZO 1 DE 2000

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
LLOREDA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	958158	5,164,900.00

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

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

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

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

ANEXO

Atentamente manifiesto a usted que la fuente normativa de la reciprocidad de la cual se deriva el derecho del solicitante para reivindicar prioridad en el presente caso, se encuentra:

a) En el Artículo 2 del Anexo 1C, Aspectos de los Derechos de Propiedad Intelectual relacionados con el Comercio, del Acuerdo por el cual se establece la "Organización Mundial de Comercio (OMC)" suscrito en Marruecos el 15 de abril de 1994. Este acuerdo fue aprobado por el Congreso de Colombia mediante Ley 170 de 1994 y por la Corte Constitucional Colombiana mediante Sentencia C-137-95 de 28 de marzo de 1995, y entró en vigencia en nuestro país el 30 de abril de 1995, 30 días después de su ratificación.

   Dicho Artículo establece que en lo que respecta a las partes II, III y IV del Acuerdo (referidas a la existencia, alcance y ejercicio de los derechos de propiedad intelectual, entre otros) los Miembros cumplirán los artículos 1 a 12 y el Artículo 19 del Convenio de París --el Artículo que establece la prioridad de las patentes de invención es el Artículo 4--

b) En el Artículo 4 del mencionado Anexo 1C, Aspectos de los Derechos de Propiedad Intelectual relacionados con el Comercio, del Acuerdo por el cual se establece la Organización Mundial de Comercio (OMC), el cual consagra el "Trato de la nación más favorecida" para los países Miembros del mismo.

c) En el Artículo 4 del Convenio de París, del cual ya era parte Colombia en el momento en que se presentó la solicitud **cuyas prioridades ahora reivindico**, con lo cual se cumple la reciprocidad exigida en el Artículo 12 de la Decisión 344 del Acuerdo de Cartagena para con solicitudes provenientes de los Países Miembros del Acuerdo de Cartagena.

ANEXO

El documento que acredita la calidad REPRESENTANTES LEGALES en Bogotá de los doctores JOSE LLOREDA CAMACHO y/o ALFONSO LLOREDA CAMACHO y/o JOSE ANTONIO LLOREDA para TODOS LOS ASUNTOS RELACIONADOS CON LA PROPIEDAD INDUSTRIAL de la sociedad peticionaria, que faculta a cada uno de dichos abogados para actuar individualmente, se encuentra protocolizado ante esa División bajo el No. **16.333.** En consecuencia, ruego a usted reconocer la personería de cada uno de dichos Representantes Legales para actuar dentro del presente expediente, a fin de que cualquiera de ellos pueda intervenir en cualquier tiempo respecto de la solicitud en él contenida.

JOSE ANTONIO LLOREDA
T.P. No. 10.784
CODIGO 231

RESUMEN OBJETO Y FINALIDAD DE LA INVENCION

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS

La presente invención provee una composición insecticida sinérgica que comprende como ingredientes activos esenciales un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol.

También se proveen métodos para el control sinérgico de insectos y protección para los cultivos.

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS

ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

Si bien se han desarrollado agentes y composiciones insecticidas para controlar las plagas de insectos tales como plagas higiénicas o plagas de agrohorticultura, y en la práctica se han usado como agente simple o mixto, todavía se están buscando composiciones para el control de insectos que sean ecológicamente seguras y económicamente eficientes. Las composiciones insecticidas que permiten obtener regímenes de dosis eficaces reducidas, aumento de la seguridad ambiental y menor incidencia de resistencia de los insectos, son sumamente deseables. Puede adoptarse la aplicación rotacional de agentes para el control de insectos que tienen diferentes modos de acción lo cual constituye una buena práctica de manipulación de las plagas, pero sin embargo esta realización no necesariamente proporciona un control de insectos satisfactorio. Las combinaciones de agentes para el control de insectos han sido estudiadas pero sin embargo no siempre se ha obtenido una marcada acción sinérgica. La obtención de una composición insecticida que demuestre que no hay resistencia cruzada para los agentes insecticidas existentes, ningún problema de toxicidad y poco impacto negativo sobre el ambiente es extremadamente difícil.

Por lo tanto es un objeto de esta invención proveer una composición insecticida sinérgica que demuestre un alto efecto controlador con concomitante reducción del costo de producción de los cultivos y reducción de la carga ambiental.

AF
204420

Es otro objeto de esa invención proveer métodos para el control sinérgico de insectos y para mejorar la protección de los cultivos.

COMPENDIO DE LA INVENCION

La presente invención provee una composición insecticida sinérgica que comprende como ingredientes activos esenciales una cantidad sinérgicamente eficaz de una combinación de un antagonista de canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol.

La presente invención provee además un método para el control sinérgico de insectos, que comprende poner en contacto dicho insecto con una cantidad sinérgicamente eficaz de una combinación de un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol.

La presente invención provee además un método para mejorar la protección de plantas contra la infestación y ataque de los insectos.

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCIÓN

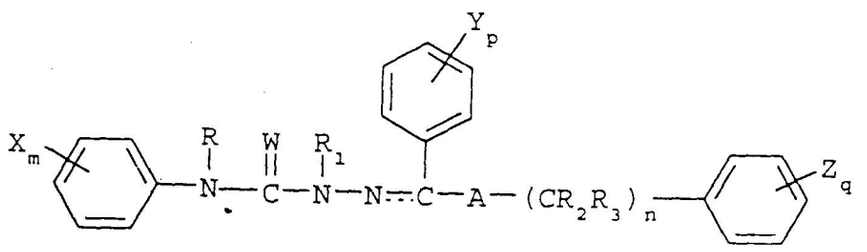
Cuando dos o más substancias en combinación demuestran inesperadamente elevada actividad biológica, por ejemplo, actividad insecticida, podemos referirnos al fenómeno resultante como sinergismo. El mecanismo del sinergismo no es totalmente comprendido, y muy posiblemente puede diferir con diferentes combinaciones. Sin embargo, el término "sinergismo" tal como se emplea en esta solicitud designa una acción cooperativa que radica en una combinación de dos o más componentes biológicamente activos en los cuales la actividad combinada de los dos o más componentes excede la suma de la actividad de cada componente por separado.

Sorprendentemente, se ha hallado ahora que una composición que comprende una combinación de un antagonista de canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol proveen mejor control de los insectos usando menores niveles de los agentes activos combinados, que el que podría lograrse cuando el

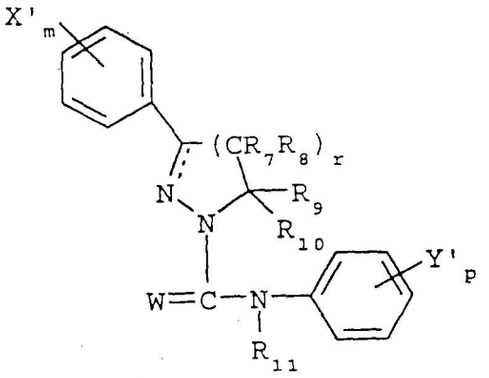
antagonista del canal de sodio neuronal o el insecticida de arilpirrol se aplican por separado.

Tal como se emplea en esta solicitud, el término antagonista de canal de sodio neuronal designa un compuesto que es capaz de evitar la capacidad de la célula neuronal para transferir iones de sodio a través de la membrana de la célula. Una célula neuronal afectada en esta forma, es por consiguiente incapaz de excitarse lo cual da como resultado parálisis, y finalmente mortalidad, en el huésped que constituye el objetivo. Pueden encontrarse descripciones de los antagonistas del canal de sodio neuronal y su modo de acción en Pesticide Biochemistry and Physiology, 60: 177-185 de Archives of Insect Biochemistry and Physiology, 37:91-103, incorporándose ambas aquí como referencia.

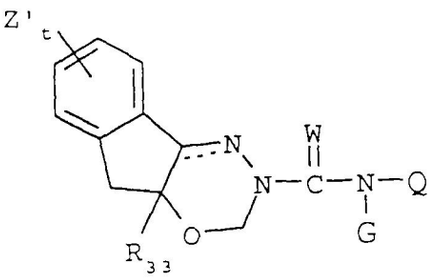
Los antagonistas del canal de sodio neuronal incluyen compuestos tales como los descritos en la patente norteamericana No. 5.543.573; patente norteamericana No. 5.708.170; patente norteamericana No. 5.324.837 y patente norteamericana No. 5.462.938, entre otras publicaciones. Ejemplos de los compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal que son útiles en la composición de esta invención son aquellos compuestos que tienen la fórmula estructural:



(I)



(II)



(III)

en la cual A es CR_4R_5 ó NR_6;

W es O ó S;

X,Y, Z, X', Y' y Z' son cada uno independientemente H; halógeno: OH; CN; NO_2; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3, haloalcoxi C_1-C_3, cicloalquilo C_3-C_6, alqueniloxi C_2-C_6, o sulfoniloxi;

alcoxi C_1-C_6, opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno. alcoxi C_1-C_3, o cicloalquilo C_3-C_6;

alcoxicarbonilo C_1-C_6, cicloalquilcarboniloxi C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de

halógeno, alquilo C_1-C_4, o alcoxi C_1-C_4; aminocarboniloxi opcionalmente substituído con grupos alquilo C_1-C_3;

alcoxicarboniloxi C_1-C_6; alquilsulfoniloxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

m, p y q son cada uno independientemente un número entero elegido de 1, 2, 3 4 ó 5;

n es un número entero elegido de 0, 1 ó 2;

r es un número entero elegido de 1 ó 2;

t es número entero elegido de 1, 2, 3 ó 4;

R, R_1, R_2, R_3, R_4 y R_5 son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_4;

R_6 es H, alquilo C_1-C_6; haloalquilo C_1-C_6; alcoxialquilo C_1-C_6; alcoxi $_1$-C_6; haloalcoxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6, alcoxicarbonilo C_1-C_6, alquiltio C_1-C_6, o haloalquiltioC_1-C_6,

R_7 y R_8 son cada uno independientemente H; halógeno, alquilo C_1-C_6; alquilcarboniloxi C_1-C_6; o fenilo opcionalmente substituido con uno o más de los grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_2-C_6, alcoxi C_1-C_6; o haloalcoxi C_1-C_6;

R_9 y R_{10} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_4;

R_{11} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, alquilcarbonilo C_1-C_4; alcoxicarbonilo C_1-C_6 o haloalcoxicarbonilo C_1-C_6 ;

R_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_6;

G es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_6, CN, $NO_2S(O)_uR_{14}$, COR_{15}, CO_2R_{16}, fenilo o cicloalquilo C_3-C_6; alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6 CN, NO_2; $S(O)_uR_{17}$; COR_{18}; CO_2R_{19}; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN, haloalquilo C_1-C_3, o haloalcoxi C_1-C_3;

cicloalquilo C_3-C_6 o feniltio;

Q es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN SCN, NO_2, $S(O)_uR_{20}$, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxialquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6, o $NR_{21}R_{22}$;

u es un número entero de 0, 1 ó 2;

R_{14}, R_{15}, R_{16}, R_{17}, R_{18}, R_{19}, R_{21} y R_{22} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_6;

R_{17} y R_{20} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6, o haloalquilo C_1-C_6,

R_{33} es CO_2R_{34};

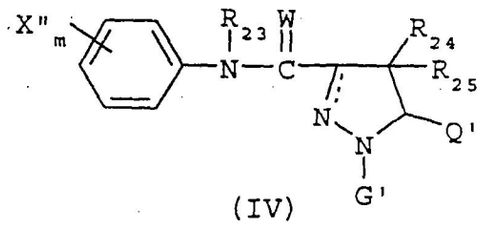
R_{34} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, fenilo o halofenilo; y la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace o un enlace simple (es decir C-N ó C=N); o un estereoisómero del mismo.

Los antagonistas del canal de sodio neuronal apropiados para ser usados en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula I, II ó III en los cuales la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace.

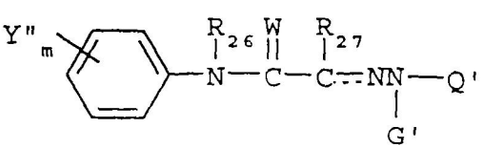
Los antagonistas del canal de sodio neuronal preferidos que son apropiados para ser usados en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula I ó de fórmula III en los cuales la configuración de la línea de puntos representa un doble enlace.

Son antagonistas del canal de sodio neuronal particularmente preferidos que son útiles en la composición de la invención, aquellos compuestos de fórmula I ó de fórmula III en los cuales W es O; X es trifluormetoxi y está en posición 4; Y es trifluormetilo y está en posición 3; Z es CN y está en posición 4; A es CH_2; n es 0; m, p y q son cada uno 1; R y R_1 son cada uno H; Z' es Cl; R_{33} y G son cada uno CO_2CH; Q es p-(trifluormetoxi)fenilo; y la configuración de la línea de puntos C ... N representa un doble enlace; o un estereoisómero del mismo.

Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal incluyen aquellos descritos en la patente norteamericana 5.116.850 y la patente norteamericana 5.305.573, entre otras publicaciones. Ejemplos de otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal apropiados para ser usados en la composición de la invención son aquellos compuestos que tienen la fórmula estructural:



(IV)



(V)

en la cual W es O ó S;

X' e Y' son cada una independientemente H; halógeno; CN; SCN, alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, NO_2, CN, alcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, fenilo, halofenilo, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, o alcoxicarbonilo C_1-C_4;

alquenilo C_2-C_4; haloalquenilo C_2-C_4; alquinilo C_2-C_4; haloalquinilo C_2-C_4; cicloalquilo C_3-C_6; halocicloalquilo C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, halo, alcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o haloalquilsulfonilo C_1-C_4; o $NR_{28}R_{29}$;

m es un número entero de 1, 2, 3, 4 ó 5;

G' es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

un anillo heteroaromático de 5 miembros que contienen uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 5 miembros a través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X"; o

un anillo heteroaromático de seis miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 6 miembros a

través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

Q' es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, alcoxi C_1-C_3, alcoxicarbonilo C_1-C_6, o fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o alquilsulfinilo C_1-C_4;

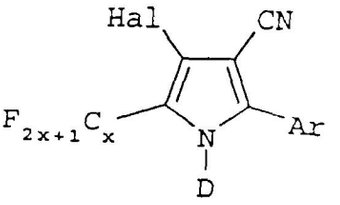
alquenilo C_2-C_6; alquinilo C_2-C_6; o fenilo opcionalmente substituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de X";

R_{24}, R_{24}, R_{25}, R_{26}, R_{27}, R_{28}, y R_{29} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_4; y la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace o un enlace simple (es decir C-N o C=N); o un estereoisómero del mismo.

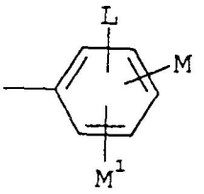
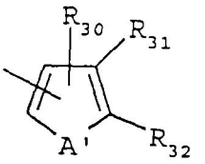
Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal preferidos de la invención son aquellos compuestos de fórmula IV ó V en los cuales la configuración de línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace.

Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal que se usan en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula IV o V en los cuales W es O; X" e Y" son cada uno independientemente H; G es fenilo opcionalmente substituído con uno o más átomos de halógeno; Q' es halofenilo o alquilo C_1-C_4, opcionalmente substituído con un grupo fenilo o halofenilo; y la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace.

Los insecticidas de arilpirrol incluyen aquellos descritos en la patente norteamericana 5.010.098; en la patente norteamericana 5.492.925 y en la patente norteamericana 5.284.863. Ejemplos de insecticidas de arilpirrol apropiados para ser usados en la composición de la invención son aquellos arilpirroles que tienen la fórmula estructural



(VI)

en la cual Ar es  o  ;

Hal es Cl o Br;

x es un número entero de 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;

D es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, OH, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_5, alquilcarboniloxi C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquenilcarboniloxi C_2-C_6, fenilcarboniloxi, halofenilcarboniloxi, fenoxi, halofenoxi, fenilo, halofenilo o alquilfenilo C_1-C_3,

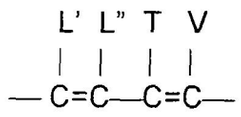
alquenilo C_2-C_6, haloalquenilo C_2-C_6; CN; alquinilo C_2-C_6; haloalquinilo C_2-C_6; di-(alquilo C_1-C_4)aminocarbonilo; o polimetileniminocarbonilo C_3-C_6;

L es H o halógeno;

M y M' son cada uno independientemente H, halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, alquilcarbonilo C_1-C_4, haloalquilcarbonilo C_1-C_4, $NR_{35}R_{36}$ o cuando M y M^1 están unidos a átomos de carbono adyacentes, pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual MM^1 representa $-OCH_2O-OCF_2O-$ ó $-CH=CH-CH=CH-$;

A' es O o S;

R_{30}, R_{31} y R_{32} son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, NO_2, CHO o R_{31} y R_{32} pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual $R_{31}R_{32}$ representan



donde L', L", T y V son cada una independientemente H, halógeno, CN o NO_2 con la condición de que no más de dos de L', L", T y V sean NO_2; y

R_{35} y R_{36} son cada una independientemente H o alquilo C_1-C_4.

Los arilpirroles preferidos apropiados para ser usados como ingrediente activo esencial en la composición de la invención son aquellos arilpirroles de fórmula VI en los cuales D es H o etoximetilo; Ar es fenilo substituído con uno o más grupos halógeno o halometilo; y n es 1.

Son realizaciones preferidas de la invención son aquellas que tienen un compuesto antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I o fórmula III y un compuesto arilpirrol de fórmula VI como ingredientes activos.

Son realizaciones más preferidas de la invención aquellas que comprenden un compuesto de fórmula I o fórmula III en los cuales W es O; X es trifluormetoxi y está en posición 4; Y es trifluormetilo y está en posición 3; Z es CN y está en posición 4; A es CH_3; n es 0; m y, p y q son cada uno independientemente 1; R y R_1 son cada uno independientemente H; Z' es Cl; R_{33} y G son cada uno independientemente CO_2CH_3; Q es p-(trifluormetoxi)fenilo; y la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace y un arilpirrol de fórmula VI en el cual D es H o etoximetilo; Ar es fenilo substituído con uno o más grupos halógeno o halometilo; y x es 1.

Son realizaciones particularmente preferidas de la invención aquellas que tienen como ingrediente activo un compuesto de fórmula I o III en el cual W es O; X es trifluormetoxi y está en posición 4; Y es trifluormetilo y está en posición 3; Z es CN y está en posición 4; A es CH_3; n es 0; m, p y q son cada una 1; R y R_1 son cada una H; Z' es Cl; R_{33} y G son cada una CO_2CH_3; y Q es p-(trifluormetoxi)fenilo, y la configuración de la línea de puntos C ... N representa un doble y un arilpirrol de fórmula VI en el cual D es H o etoximetilo; Ar es p-clorofenilo o 3,5-diclorofenilo; y x es 1.

En la memoria y reivindicaciones el término haloalquilo designa un grupo alquilo C_XH_{2X+1} que tiene 1 a 2X+1 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. De manera similar, los términos haloalquenilo, haloalquinilo, haloalcoxi, halofenilo y similares designan substitución mono a perhalógeno donde los halógenos pueden ser iguales o diferentes. Halógeno se refiere a Cl, Br, I o F.

Cada uno de los compuestos de fórmula I, II, III, IV y V abarcan centros asimétricos que pueden estar representados en la forma estereoisomérica R o la forma estereoisomérica S. La presente invención incluye también la forma R y la forma S en cualquier relación. Para los compuestos de fórmula III, se prefiere la forma S.

Ventajosamente, el compuesto antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I, II, III, IV ó V o una mezcla de los mismos puede formularse con insecticida de arilpirrol. Dicha formulación puede dispersarse luego en un diluyente sólido o líquido para su aplicación al insecto, a su provisión de alimento, al habitat o lugar de cría, en forma de un rocío diluído, un polvillo sólido o un concentrado en polvo. Pueden agregarse formulaciones habituales, así como también ingredientes activos adicionales agrícolamente activos dentro del ámbito de la invención.

Los ingredientes activos de la composición de la invención pueden formularse también por separado en forma de un polvo humectable, un concentrado emulsionable, un concentrado en suspensión acuosa o fluible líquida, o cualquiera de las formulaciones convencionales usadas como agentes de control de insectos y en el campo, en mezcla para tanque con agua o con otro líquido que resulte económico de aplicar en forma de una mezcla líquida para pulverización. Las composiciones formuladas por separado pueden aplicarse también secuencialmente.

En la práctica real, la composición de la invención se aplica al follaje de las plantas o al tallo de las plantas o al habitat de los insectos como rocío diluído preparado a partir de cualquiera de las formulaciones precedentes. En la práctica se ha hallado que los ingredientes activos de la composición de la invención son sumamente sinérgicos cuando están presentes en una relación de compuesto antagonista del canal de sodio neuronal a insecticida de arilpirrol de aproximadamente 1:10 a 1:50.

Las composiciones de la invención son composiciones insecticidas superiores y son especialmente útiles para proteger plantas de cultivo y cosechadas incluyendo: cultivos de leguminosas tales como soja, habichuelas verdes, guisantes, alubias y similares así como también algodón, plantas forrajeras, cultivos de coles, vegetales de hoja, tabaco, lúpulo, tomates, patatas, flores ornamentales tales como crisantemos, cultivos de viña tales como uvas calabaza, zapallo o melón y árboles frutales tales como cerezos, durazneros, manzanos o cítricos, contra los estragos causados por los insectos.

La composición insecticida sinérgica de la invención es muy activa contra una amplia variedad de insectos, lepidópteros y coleópteros tales como *Helicoverpa zea* (gusano del algodón), *Heliothis virescens* (gusano del brote del

tabaco), *Leptinotarsea decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Diabrotica spp.* (gusano de la raíz del maíz) y similares.

Además, la composición de la invención puede ser útil en la prevención y control de plagas que afectan la salud pública tales como moscas, mosquitos, cucarachas, hormigas, termitas o similares.

Estas y otras ventajas de la invención serán ser más evidentes a partir de los ejemplos que se dan a continuación. Estos ejemplos se proveen simplemente como ilustración de la invención y no están destinados a considerarse limitativos de la misma.

EJEMPLO 1

Evaluación Del Efecto Insecticida Sinérgico De Una Combinación De Un Antagonista Del Canal De Sodio Neuronal Además De Un Insecticida De Aril Pirrol

En esta evaluación las larvas de *Heliothis zea* (gusano del algodón), *Heliothis virescens* (gusano del tabaco) y *Heliothis virescens* resistentes a los piretroides, se obtuvieron a partir de colonias de laboratorio. *H. virescens* resistente a los piretroides deriva de la cepa PEG [Campannola & Plapp, Proceedings of Beltwide Cotton Conference (1988)]

Se sumergieron hojas de algodón en 1:1 v/v de soluciones del compuesto de ensayo en acetona/ agua o en soluciones de una combinación de los compuestos de ensayo por un período de aproximadamente 3 segundos. Después de la inmersión, las hojas se dejaron secar al aire durante 2-3 horas. Se usaron bandejas plásticas de bioensayo que contenían múltiples receptáculos de frente abierto (4,0 x 4,0 x 2,5 cm) como arenas de ensayo. Porciones cortadas de

una hoja tratada, una mecha dental de algodón humedecida y una sola larva de tercera etapa de desarrollo se colocaron dentro de cada receptáculo, cubierto con una hoja adhesiva de plástico transparente ventilada y se mantuvieron bajo luz fluorescente constante a aproximadamente 27 °C durante un período de tiempo predeterminado. La mortalidad/ morbilidad larval se evaluó a los 5 días después del tratamiento. Todos los tratamientos se repitieron 4 - 5 veces en un diseño en bloque completo al azar con 16 - 32 larvas por tratamiento. Se aplicó un análisis logarítmico a todos los datos obtenidos. Los resultados se resumen en las Tablas I, II y III siguientes.

Tabla I

Evaluación del Control Sinérgico del gusano del Algodón

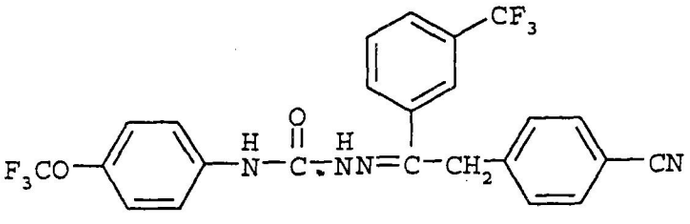
Tratamiento	Dosis (ppm)	% de Mortalidad Larval	Relación de Toxicidad [3,4]
A[1]	0,816	0	-
B[2]	0,0816	9	-
A + B	0,816 + 0,0816	50	5,6
A	1,0	9,4	-
B	0,1	19,8	-
A + B	1,0 + 0,1	62,5	2,1

[1] A = fórmula VIa de arilpirrol

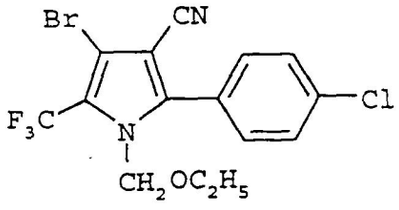
[2] B = fórmula Ia de antagonista de canal de sodio neuronal

[3] Relación de Toxicidad = $\frac{\text{\% de mortalidad (A + B)}}{\text{\% de mortalidad A + \% mortalidad B}}$

[4] Relación de Toxicidad > 1 = sinérgico



(Ia)



(VIa)

Tabla II

Evaluación del Control Sinérgico del gusano del Tabaco

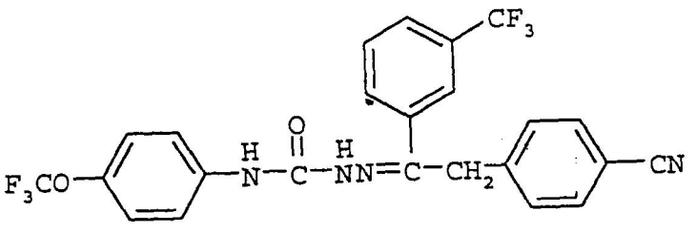
Tratamiento	Dosis (ppm)	% de Mortalidad Larval	Relación de Toxicidad [3,4]
A[1]	0,974	3	-
B[2]	0,0974	25	-
A + B	0,974 + 0,0974	50	1,8
A	1,0	10	-
B	0,1	30	-
A + B	1,0 + 0,1	51,3	1,28

[1] A = fórmula VIa de arilpirrol

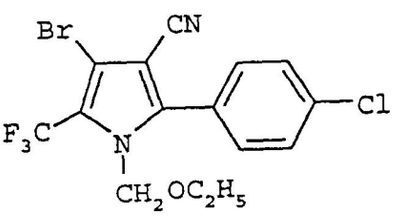
[2] B = fórmula Ia de antagonista de canal de sodio neuronal

[3] Relación de Toxicidad = $\frac{\%\text{ de mortalidad (A + B)}}{\%\text{ de mortalidad A + \% mortalidad B}}$

[4] Relación de Toxicidad > 1 = sinérgico



(Ia)



(VIa)

Tabla III

Evaluación del Control Sinérgico del gusano del Tabaco Resistente a los Piretroides

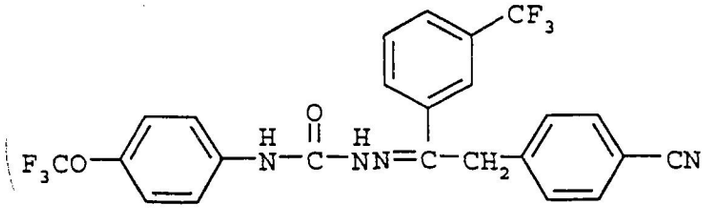
Tratamiento	Dosis (ppm)	% de Mortalidad Larval	Relación de Toxicidad [3,4]
A[1]	0,997	0	-
B[2]	0,0816	29	-
A + B	0,816 + 0,0816	50	1,7
A	2,093	7	-
B	0,0419	8	-
A + B	2,093 + 0,0419	50	3,3
A	1,0	6,2	-
B	0,1	25,0	-
A + B	1,0 + 0,1	56,3	1,8
A	3,0	34,4	-
B	0,06	14,1	-
A + B	3,0 + 0,06	81,2	1,67

[1] A = fórmula VIa de arilpirrol

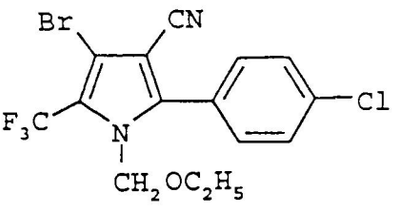
[2] B = fórmula Ia del antagonista de canal de sodio neuronal

[3] Relación de Toxicidad = $\frac{\%\text{ de mortalidad (A + B)}}{\%\text{ de mortalidad A + \% mortalidad B}}$

[4] Relación de Toxicidad > 1 = sinérgico



(Ia)

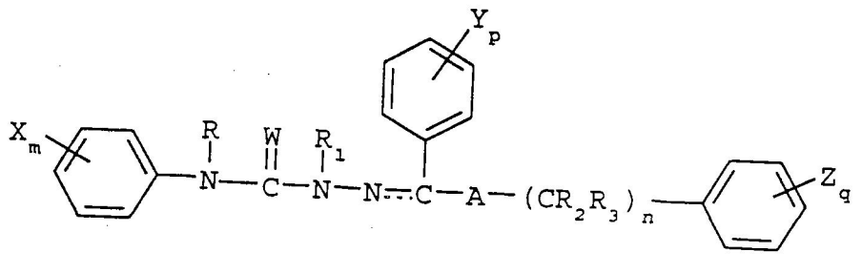


(VIa)

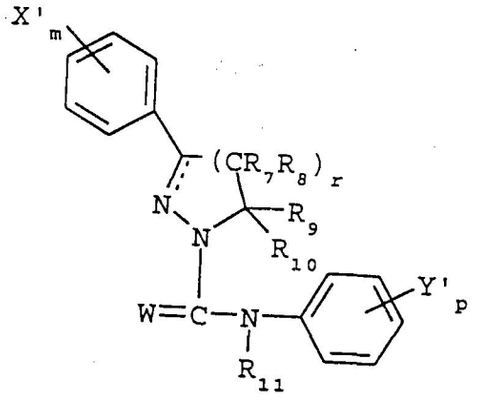
REIVINDICACIONES

Habiendo así especialmente descrito y determinado la naturaleza de la presente invención y la forma como la misma ha de ser llevada a la práctica. se declara reivindicar como de propiedad y derecho exclusivo:

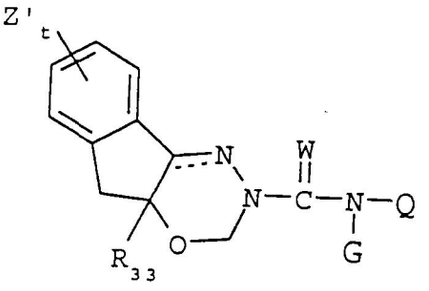
1.Una composición insecticida sinérgica que comprende una cantidad sinérgicamente eficaz de un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol en el cual el compuesto antagonista del canal de sodio tiene la estructura de fórmula:



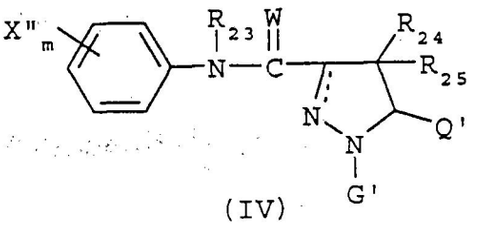
(I)



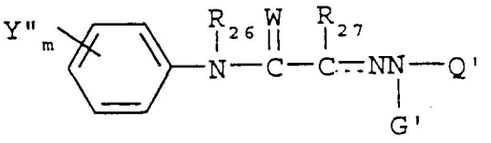
(II)



(III)



(IV)



(V)

en la cual A es CR_4R_5 ó NR_6;

W es O ó S;

X,Y, Z, X', Y' y Z' son cada uno independientemente H; halógeno: OH; CN; NO_2; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3, haloalcoxi C_1-C_3, cicloalquilo C_3-C_6, alqueniloxi C_2-C_6, o sulfoniloxi;

alcoxi C_1-C_6, opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno. alcoxi C_1-C_3, o cicloalquilo C_3-C_6;

alcoxicarbonilo C_1-C_6, cicloalquilcarboniloxi C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de

halógeno, alquilo C_1-C_4, o alcoxi C_1-C_4; aminocarboniloxi opcionalmente substituído con uno o más grupos alquilo C_1-C_3;

alcoxicarboniloxi C_1-C_6; alquilsulfoniloxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

m, p y q son cada uno independientemente un número entero elegido de 1, 2, 3, 4 ó 5;

n es un número entero elegido de 0, 1 ó 2;

r es un número entero elegido de 1 ó 2;

t es número entero elegido de 1, 2, 3 ó 4;

R, R_1, R_2, R_3, R_4 y R_5 son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_4;

R_6 es H, alquilo C_1-C_6; haloalquilo C_1-C_6; alcoxialquilo C_1-C_6; alcoxi C_1-C_6; haloalcoxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6, alcoxicarbonilo C_1-C_6, alquiltio C_1-C_6, o haloalquiltio C_1-C_6,

R_7 y R_8 son cada uno independientemente H; halógeno, alquilo C_1-C_6; alquilcarboniloxi C_1-C_6; o fenilo opcionalmente substituído con uno o más de los grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_2-C_6, alcoxi C_1-C_6; o haloalcoxi C_1-C_6;

R_9 y R_{10} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_4;

R_{11} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, alquilcarbonilo C_1-C_4; alcoxicarbonilo C_1-C_6 o haloalcoxicarbonilo C_1-C_6 ;

R_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_6;

G es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_6, CN, $NO_2S(O)_uR_{14}$, COR_{15}, CO_2R_{16}, fenilo o cicloalquilo C_3-C_6; alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6 CN, NO_2; $S(O)_uR_{17}$; COR_{18}; CO_2R_{19}; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN, haloalquilo C_1-C_3, o haloalcoxi C_1-C_3;

cicloalquilo C_3-C_6 o feniltio;

Q es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN SCN, NO_2, $S(O)_uR_{20}$, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxialquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6, o $NR_{21}R_{22}$;

u es un número entero de 0, 1 ó 2;

R_{14}, R_{15}, R_{16}, R_{17}, R_{18}, R_{19}, R_{21} y R_{22} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_6;

R_{17} y R_{20} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6, o haloalquilo C_1-C_6,

R_{33} es CO_2R_{34}

R_{34} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, fenilo o halofenilo;

X' e Y' son cada una independientemente H; halógeno; CN; SCN, alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, NO_2, CN, alcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, fenilo, halofenilo, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, o alcoxicarbonilo C_1-C_4;

alquenilo C_2-C_4; haloalquenilo C_2-C_4; alquinilo C_2-C_4; haloalquinilo C_2-C_4; cicloalquilo C_3-C_6; halocicloalquilo C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o haloalquilsulfonilo C_1-C_4; o $NR_{28}R_{29}$;

G' es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

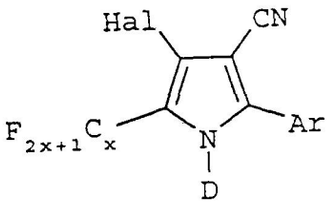
un anillo heteroaromático de 5 miembros que contienen uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 5 miembros a través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X"; o

un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 6 miembros a través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

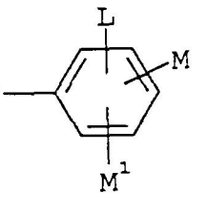
Q' es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, alcoxi C_1-C_3, alcoxicarbonilo C_1-C_6, o fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o alquilsulfinilo C_1-C_4;

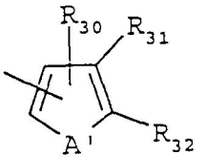
alquenilo C_2-C_6; alquinilo C_2-C_6; o fenilo opcionalmente substituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de X";

R_{24}, R_{24}, R_{25}, R_{26}, R_{27}, R_{28}, y R_{29} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_4; ; y la configuración de la línea de puntos C ... N representa un doble enlace o un enlace simple (es decir C-N o C=N); o un estereoisómero del mismo, y donde el insecticida de arilpirrol es un compuesto de fórmula VI



(VI)

en la cual Ar es 

o 

;

Hal es Cl o Br;

x es un número entero de 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;

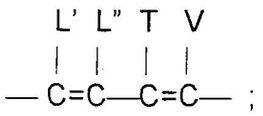
D es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, OH, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_5, alquilcarboniloxi C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquenilcarboniloxi C_2-C_6, fenilcarboniloxi, halofenilcarboniloxi, fenoxi, halofenoxi, fenilo, halofenilo o alquilfenilo C_1-C_3, alquenilo C_2-C_6, haloalquenilo C_2-C_6; CN; alquinilo C_2-C_6; haloalquinilo C_2-C_6; di-(alquilo C_1-C_4)aminocarbonilo; o polimetileniminocarbonilo C_3-C_6;

L es H o halógeno;

M y M' son cada uno independientemtne H. halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, alquilcarbonilo C_1-C_4, haloalquilcarbonilo C_1-C_4, $NR_{35}R_{36}$ o cuando M y M^1 están unidos a átomos de carbono adyacentes, pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual MM^1 representa $-OCH_2O-OCF_2O-$ ó $-CH=CH-CH=CH-$;

A' es O o S;

R_{30}, R_{31} y R_{32} pueden tomarse conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual R_{31}-R_{32} pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual $R_{31}R_{32}$ representan



L', L", T y V son cada una independientemente H, halógeno, CN o NO_2 con la condición de que no más de dos de L', L", T y V sean NO_2; y

R_{35} y R_{36} son cada una independientemente H o alquilo C_1-C_4.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1 en la cual la relación del antagonista del canal de sodio neuronal al insecticida de arilpirrol es de aproximadamente 1:10 a 1:50.

3. La composición de acuerdo con la reivindicación 2 en la cual dicho antagonista del canal de sodio neuronal y dicho insecticida de arilpirrol están dispersados en un diluyente inerte sólido o líquido.

4. La composición de acuerdo con la reivindicación 1 que tiene un compuesto de fórmula I o de fórmula III en el cual la configuración de la línea de puntos C⋯N representa un doble enlace.

5. La composición de acuerdo con la reivindicación 4 en la cual W es O; X es trifluormetoxi y está en posición 4; Y es trifluormetilo y está en posición 3; Z es CN y está en posición 4; A es CH_2; n es 0; m, p y q son cada una independientemente 1; R y R_1 son cada una independientemente H; Z es Cl; R_{33} y G son cada uno independientemente CO_2CH_3; y Q es p-(trilfuormetoxi)fenilo.

6. La composición de acuerdo con la reivindicación 1 que tiene un insecticida de arilpirrol de fórmuila VI en la cual D es H o etoximetilo; Ar es fenilo substituído con uno o dos grupos halógeno o halometilo; y x es 1.

7. Un método para el control sinérgico de insectos que comprende poner en contacto dicho insecto con una cantidad sinérgicamente eficaz de una combinación de un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol tal como se describió en la reivindicaicón 1.

8. El método de acuerdo con la reivindicación 7 en el cual el antagonista del canal de sodio neuronal está presente en una relación con el insecticida de arilpirrol de aproximadamente 1:10 a 1:50 y tiene un compuesto antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I o de fórmula III donde la configuración de la línea de puntos C ⋯ N representa un doble enlace y W es O; X es trifluormetoxi y está en posición 4; Y es trifluormetilo y está en posición 3; Z es CN y está en posición 4; A es CH_2; n es 0; m, p y q son cada uno independientemente 1; R y R_1 son cada uno independientemente H; Z' es Cl; R_{33} y G son cada uno independientemente CO_2CH_3; y Q es p-(trifluormetoxi)fenilo.

9. El método de acuerdo con la reivindicación 7 que tiene un insecticida de arilpirrol de la fórmula VI en la cual D es H o etoximetilo; Ar es fenilo substituído con uno o dos grupos halógeno o halometilo; y x es 1.

10. Un método para proteger una planta contra la infestación y ataque de insectos que comprende aplicar al follaje o al tallo de dicha planta una cantidad sinérgicamente eficaz de una composición de acuerdo con la reivindicación 1.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN

(21) No. SOLICITUD:

(51) INT. CL.:

(22) FECHA DE PRESENTACIÓN: 09-03-00

(71) SOLICITANTE: **AMERICAN CYANAMID COMPANY**

(30) PRIORIDAD:

(31) No. DE SOLICITUD: 60/124.228 Y 60/158.202

(72) INVENTOR/ES: Treacy Michael Frank, Borysewicz Raymond Frank y Rensner Paul Erich

(32) FECHA DE PRESENTACIÓN: 12-03-99 Y 07-10-99

(33) PAÍS: US y US

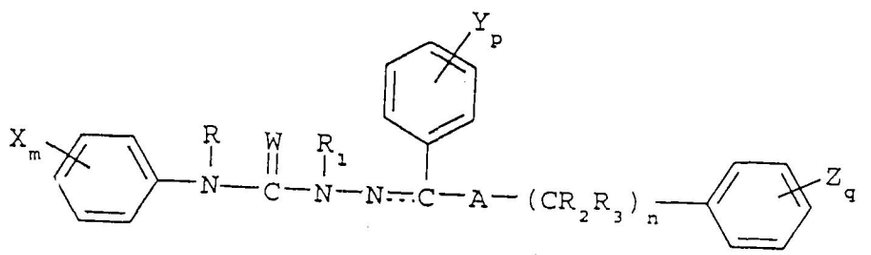
(74) APODERADO: JOSE ANTONIO LLOREDA

(54) TÍTULO: " **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS .** "

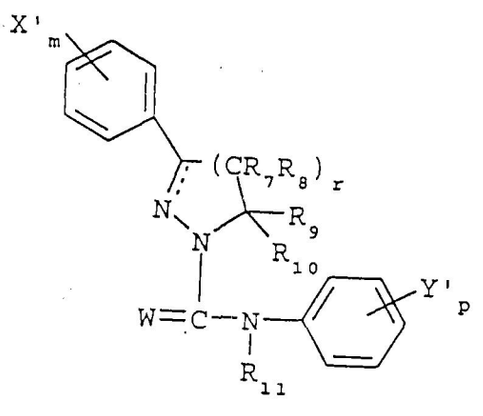
(57) RESUMEN:

Reivindicación número 1.-

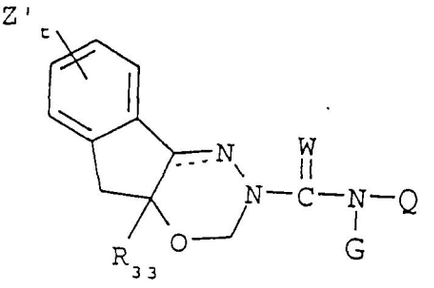
Una composición insecticida sinérgica que comprende una cantidad sinérgicamente eficaz de un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida de arilpirrol en el cual el compuesto antagonista del canal de sodio tiene la estructura de fórmula:



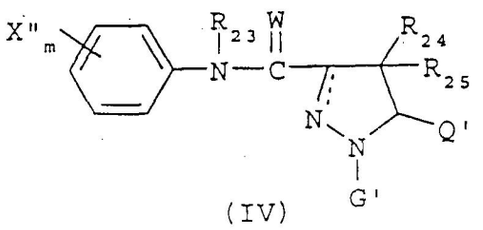
(I)



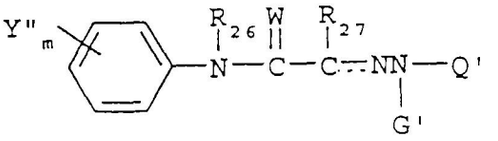
(II)



(III)



(IV)



(V)

en la cual A es CR_4R_5 ó NR_6;

W es O ó S;

X,Y, Z, X', Y' y Z' son cada uno independientemente H; halógeno: OH; CN; NO_2; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3, haloalcoxi C_1-C_3, cicloalquilo C_3-C_6, alqueniloxi C_2-C_6, o sulfoniloxi;

alcoxi C_1-C_6, opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno. alcoxi C_1-C_3, o cicloalquilo C_3-C_6;

alcoxicarbonilo C_1-C_6, cicloalquilcarboniloxi C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de

halógeno, alquilo C_1-C_4, o alcoxi C_1-C_4; aminocarboniloxi opcionalmente substituído con uno o más grupos alquilo C_1-C_3;

alcoxicarboniloxi C_1-C_6; alquilsulfoniloxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

m, p y q son cada uno independientemente un número entero elegido de 1, 2, 3, 4 ó 5;

n es un número entero elegido de 0, 1 ó 2;

r es un número entero elegido de 1 ó 2;

t es número entero elegido de 1, 2, 3 ó 4;

R, R_1, R_2, R_3, R_4 y R_5 son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_4;

R_6 es H, alquilo C_1-C_6; haloalquilo C_1-C_6; alcoxialquilo C_1-C_6; alcoxi C_1-C_6; haloalcoxi C_1-C_6; alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6, alcoxicarbonilo C_1-C_6, alquiltio C_1-C_6, o haloalquiltio C_1-C_6,

R_7 y R_8 son cada uno independientemente H; halógeno, alquilo C_1-C_6; alquilcarboniloxi C_1-C_6; o fenilo opcionalmente substituído con uno o más de los grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_2-C_6, alcoxi C_1-C_6; o haloalcoxi C_1-C_6;

R_9 y R_{10} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_4;

R_{11} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, alquilcarbonilo C_1-C_4; alcoxicarbonilo C_1-C_6 o haloalcoxicarbonilo C_1-C_6 ;

R_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H, o alquilo C_1-C_6;

G es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_6, CN, $NO_2S(O)_uR_{14}$, COR_{15}, CO_2R_{16}, fenilo o cicloalquilo C_3-C_6; alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6 CN, NO_2; $S(O)_uR_{17}$; COR_{18}; CO_2R_{19}; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN, haloalquilo C_1-C_3, o haloalcoxi C_1-C_3;

cicloalquilo C_3-C_6 o feniltio;

Q es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos de halógeno, CN SCN, NO_2, $S(O)_uR_{20}$, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxialquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_6, haloalcoxi C_1-C_6, o $NR_{21}R_{22}$;

u es un número entero de 0, 1 ó 2;

R_{14}, R_{15}, R_{16}, R_{17}, R_{18}, R_{19}, R_{21} y R_{22} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_6;

R_{17} y R_{20} son cada uno independientemente alquilo C_1-C_6, o haloalquilo C_1-C_6,

R_{33} es CO_2R_{34}

R_{34} es H, alquilo C_1-C_6, haloalquilo C_1-C_6, fenilo o halofenilo;

X' e Y' son cada una independientemente H; halógeno; CN; SCN, alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, NO_2, CN, alcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, fenilo, halofenilo, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, o alcoxicarbonilo C_1-C_4;

alquenilo C_2-C_4; haloalquenilo C_2-C_4; alquinilo C_2-C_4; haloalquinilo C_2-C_4; cicloalquilo C_3-C_6; halocicloalquilo C_3-C_6; fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o haloalquilsulfonilo C_1-C_4; o $NR_{28}R_{29}$;

G' es fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

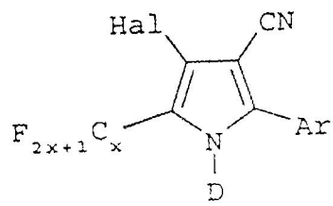
un anillo heteroaromático de 5 miembros que contienen uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 5 miembros a través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X"; o

un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, estando unido dicho anillo heteroaromático de 6 miembros a través de carbono y estando opcionalmente substituído con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X";

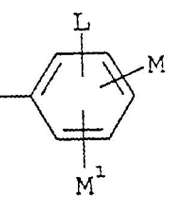
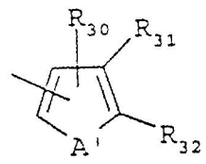
Q' es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, alcoxi C_1-C_3, alcoxicarbonilo C_1-C_6, o fenilo opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, o alquilsulfinilo C_1-C_4;

alquenilo C_2-C_6; alquinilo C_2-C_6; o fenilo opcionalmente substituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de X";

R_{24}, R_{24}, R_{25}, R_{26}, R_{27}, R_{28}, y R_{29} son cada uno independientemente H ó alquilo C_1-C_4; ; y la configuración de la línea de puntos C ... N representa un doble enlace o un enlace simple (es decir C-N o C=N); o un estereoisómero del mismo, y donde el insecticida de arilpirrol es un compuesto de fórmula VI



(VI)

en la cual Ar es  o  ;

Hal es Cl o Br;

x es un número entero de 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;

D es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente substituído con uno o más grupos halógeno, CN, OH, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_5, alquilcarboniloxi C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquenilcarboniloxi C_2-C_6, fenilcarboniloxi, halofenilcarboniloxi, fenoxi, halofenoxi, fenilo, halofenilo o alquilfenilo C_1-C_3,

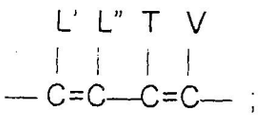
alquenilo C_2-C_6, haloalquenilo C_2-C_6; CN; alquinilo C_2-C_6; haloalquinilo C_2-C_6; di-(alquilo C_1-C_4)aminocarbonilo; o polimetileniminocarbonilo C_3-C_6;

L es H o halógeno;

M y M' son cada uno independientemtne H. halógeno, CN, NO_2, alquilo C_1-C_4, haloalquilo C_1-C_4, alcoxi C_1-C_4, haloalcoxi C_1-C_4, alquiltio C_1-C_4, haloalquiltio C_1-C_4, alquilsulfonilo C_1-C_4, haloalquilsulfonilo C_1-C_4, alquilcarbonilo C_1-C_4, haloalquilcarbonilo C_1-C_4, $NR_{35}R_{36}$ o cuando M y M^1 están unidos a átomos de carbono adyacentes, pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual MM^1 representa $-OCH_2O-OCF_2O-$ ó $-CH=CH-CH=CH-$;

A' es O o S;

R_{30}, R_{31} y R_{32} pueden tomarse conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual R_{31}-R_{32} pueden ser tomados conjuntamente con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo en el cual $R_{31}R_{32}$ representan



L', L", T y V son cada una independientemente H, halógeno, CN o NO_2 con la condición de que no más de dos de L', L", T y V sean NO_2; y

R_{35} y R_{36} son cada una independientemente H o alquilo C_1-C_4.

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00017174 00000000 Folios: 39
Fecha (AMD): 2000-03-07 12:32:35
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 11 PRESENTAC
Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

38

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

40

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCIÓN [X] **MODELO DE UTILIDAD [ ]**

- Nombre e identificación del Solicitante [A]
- Nombre e identificación del Inventor [ ]
- Título o nombre de la Invención [ ]
- Descripción [ ]
- Reivindicaciones [ ]
- Resumen [ ]
- Comprobante de Pago [ ]

COMPLETA [X] INCOMPLETA [ ]

DISEÑO INDUSTRIAL [ ]

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

COMPLETA [ ] INCOMPLETA [ ]

Firma Responsable

Fecha:_____.

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

39

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-017174

Fecha: 10 de marzo del 2000.

Se certifica que:

Desde fecha 7 de diciembre de 1995, del folio 83.720 al folio 83.726 del libro de Protocolo N° 288, obra el poder N° 16.333 conferido por AMERICAN CYANAMID COMPANY

domiciliado(a) en Madison, New Jersey. E.U.A.

al doctor JOSE LLOREDA CAMACHO y/o ALFONSO LLOREDA CAMACHO y/o JOSE ANTONIO LLOREDA.

Representante en Santafé de Bogotá D.C. Los mismos.

Facultad para desistir si.

Revisado.

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

40

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

430
2000/03/10

EXPEDIENTE 00-017174

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

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a).

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94).

SI [x] **NO [ ]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000).

SI [x] **NO [ ]** **EXTEMPORANEAMENTE [ ]** Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris.

SI [ ] **NO [x]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.

SI [ ] **NO [x]** **NO APLICABLE [ ]** Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).

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

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

OBSERVACIONES JURIDICAS: Debe presentar comprobante de pago por concepto de excedente de palabras, a partir de la 150, en el extracto para publicación (artículo primero de la Resolución 02 del 2000).

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

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

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

Santafé de Bogotá, D.C.,10 de marzo del 2000.

EXAMINADOR JURIDICO: Código 202002

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia

41

Folio 43

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES

Primer **EXAMEN DE FORMA**

430.
2000/03/17

RADICACIÓN Nº 00-17174

CONCEPTO TÉCNICO Nº 454 **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES** A01N47/28, 43/36

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

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

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 17-III-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

12

CONCEPTO TÉCNICO No. 454
EXPEDIENTE No. 00-17174 A01N47/28, 43/36

372
2000/03/17

El título debe estar acorde con la descripción y las reivindicaciones por lo tanto debe complementarse indicando que las composiciones sinérgicas insecticidas contienen un antagonista de canal de sodio neuronal y un arilpirrol.

En la reivindicación 1, folio 27 se dan nuevamente los significados de X' y Y' lo cual es confuso porque corresponden a significados diferentes, así mismo se debe corregir en el folio 28 la repetición del radical R_{24}.

La expresión "aproximadamente" es ambigua y le resta precisión a las reivindicaciones.

De acuerdo a lo anterior se deben hacer las correcciones respectivas presentando NUEVO CAPÍTULO REIVINDICATORIO COMPLETO de forma que sea claro.

Anexar nuevas tarjetas de archivo temático y de propietario y el extracto para publicación. Si el resumen del extracto sobrepasa el límite del número de palabras establecidas se debe pagar el valor correspondiente asignado por la oficina por cada palabra adicional que se quiera publicar.

Falta arte final de la fórmula estructural tamaño 12x12 cm por duplicado para efecto de la publicación y uno de 6x6 cm.

202001
Examinador Técnico de Patentes

Santa Fe de Bogotá, D.C. 17 de marzo de 2000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

45
43

EXPEDIENTE 00-017174

AUTO 0689

430.
2000|031

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor Jose Antonio LLoreda, como apoderado del solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido

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

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

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE
Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los 21 MAR 2000

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 23 MAR 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI____ NO____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA

Carrera 13 N° 27-00 Pisos 5° y 10°
Conmutador 334 1221-2-3-4
Fax 281 3125
Santafé de Bogotá, D.C. - Colombia