

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-017310- -00016-0000
Fec: 2007-02-06 16:42:31 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra: 2 PATENTES
Eve: 1 REGDEPOSITO
Act 329 CTOINFORMACION Folios: 95

Señor

SUPERINTENDENTE DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Re: P1.- WYETH HOLDINGS CORPORATION.- Solicitud de Patente de Invención para "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE AMIDINOHIDRAZONA". Clase A.01N.-Expediente número 00-017.310.-

1. Me refiero al auto dictado por ese Despacho notificado por fijación en lista de 28 de Septiembre de 2006 y a mi memorial de plazo de 20 de Diciembre del mismo año.

2. Antes de referirme a las objeciones realizadas por el señor Examinador en su Concepto Técnico No. **1485**, me permito manifestar que es deseo del solicitante realizar las siguientes modificaciones al capítulo reivindicatorio de la solicitud en estudio

(i) Debidamente autorizado por el solicitante, y de conformidad con el Artículo 36 de la Decisión Andina 486, el Artículo 7 del Decreto 2591 de 13 de Diciembre de 2000 y Artículo 11 de la Resolución No. 00210 de 15 de Enero de 2001, **se ha dividido la presente solicitud de patente en nueve solicitudes**, a saber:

(1) Una solicitud original compuesta por 3 reivindicaciones que encuentran su sustento en la descripción y en el capítulo reivindicatorio originalmente presentado a ese Despacho con la presente solicitud No. **00-017-310**, específicamente en las reivindicaciones 1, 3 y 6; en las cuales se han realizado leves modificaciones, con el fin de superar las objeciones realizadas por el señor Examinador en el Concepto Técnico citado anteriormente. Tales modificaciones son las siguientes:

a) Se ha procedido a restringir la configuración de la línea de puntos del enlace carbono-nitrógeno para que represente únicamente doble enlace, es decir C=N, siendo posible encontrar para modificación mencionada, pleno sustento en la descripción y en el capítulo reivindicatorio, específicamente en la página 7 de

descripción y en la reivindicación 2 del capítulo reivindicatorio originalmente presentado. De esta manera, se está restringiendo de manera significativa la cantidad de compuestos posibles, pues la configuración de línea punteada pasa de representar un **enlace sencillo o un enlace doble** a representar **solamente un enlace doble**. Me permito aclarar que esta **modificación aplica para la reivindicación 1 de todas las solicitudes divisionales que se presentan**.

Adicionalmente, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) e hidrametilnón; es decir, para esta nueva reivindicación ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I, sino solo la familia de las amidinohidrazonas y específicamente el compuesto hidrametilnón, el cual se encontraba en la reivindicación original 6.

- b) La nueva reivindicación 2 corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.
- c) La nueva reivindicación 3 reclama: "Una composición de cebo que contiene de 0.01 a 20% en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió en la reivindicación 1, en combinación con hidrametilnón (5,5-dimetilperhidropirimidin-2-ona 4-trifluorometil- α -(4-trifluorometilstilil)cinamilidenohidrazona)".

Con respecto a la introducción de la cantidad del antagonista del canal de sodio neuronal en la composición, el sustento puede encontrarse en la página 12 de la descripción.

Con lo anterior, es claro que las modificaciones realizadas se encuentran dirigidas a **restringir de manera significativa** el alcance de la presente solicitud al definir de manera más precisa los componentes involucrados y sus proporciones en la composición.

De esta manera, el capítulo reivindicatorio de la solicitud **00-017.310** original, se encuentra ahora dirigido a proteger una composición insecticida que comprende un **antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con un compuesto de amidinohidrazona, a saber, hidrametilnón**.

Teniendo en cuenta lo anterior, me permito manifestar que el título de ésta solicitud se ha modificado pasando a ser: "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE **AMIDINOHIDRAZONA**" con el fin de permitir una mayor relación entre el título de la solicitud y la materia para la cual se dirige la protección de la misma.

Finalmente, me permito manifestar que las reivindicaciones 2, 5 y 7 – 10 del capítulo reivindicatorio originalmente presentado, han sido eliminadas.

(2) Una primera solicitud fraccionada No. **00-017.310A** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que encuentran sustento en la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la primera solicitud divisional corresponde a las reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono – nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más compuestos piretroide o de tipo piretroide específicos, a saber, cipermetrina, cialotrina, ciflutrina, permetrina, etofenprox, silafluofén; estos dos últimos han sido referidos en la solicitud **00-017.310** como pertenecientes al subgrupo de los compuestos de tipo piretroide. Sin embargo, puede verificarse que éstos compuestos según la literatura científica, son considerados como piretroides. Para corroborar lo anterior, me permito anexar copia de las páginas 3696 y 3694 del libro "Römpp Chemie Lexikon" en su versión original y la versión traducida del alemán, en el cual puede observarse que el compuesto etofenprox aparece clasificado como un compuesto piretroide, en vista de la relación estructural existente con dicha familia, lo cual permite agrupar los compuestos mencionados en un solo grupo.

- b) La reivindicación 2 de la primera solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la

dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la primera solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger una **composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno más compuestos piretroides o de tipo piretroide específicos**, y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

- (3) Una segunda solicitud fraccionada No. **00-017.310B** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que están plenamente sustentadas por la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 5 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la segunda solicitud divisional corresponde a la reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir C=N.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y nucleopolihedrovirus recombinante capaz de expresar una neurotoxina de insecto, a saber: HzNPVAaIT, Helicoverpa Nucleopolihedrovirus que expresa la toxina del insecto *Androctonus australis*.

- b) La reivindicación 2 de la segunda solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la segunda solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger **una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con un nucleopolihedrovirus recombinante capaz de expresar una neurotoxina de insecto**, que es HzNPVaIT y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

(4) Una tercera solicitud fraccionada No. **00-017.310C** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que tienen sustento en la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la tercera solicitud divisional corresponde a la reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más compuestos de organofosfato, seleccionados del grupo que comprende profenofos, acefato, sulprofos, malatión, diazinón, metil paratión y terbufós.

- b) La reivindicación 2 de la tercera solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la tercera solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger **una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos de organofosfato específicos** y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

(5) Una cuarta solicitud fraccionada No. **00-017.310D** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que están plenamente sustentadas por la descripción y las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la cuarta solicitud divisional corresponde a la reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de

puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más carbamatos, a saber: metomil, tiodicarb y fenotiocarb.

- b) La reivindicación 2 de la cuarta solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la cuarta solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger **una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos de carbamato específicos**, y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

- (6) Una quinta solicitud fraccionada No. **00-017.310E** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que están plenamente sustentadas en la descripción y las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la quinta solicitud divisional corresponde a las reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más compuestos de lactona macrocíclica, a saber espinosad, avermectina, emamectina, milbemectina, nemadectina y moxidectina.

- b) La reivindicación 2 de la quinta solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la quinta solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger **una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos de lactona macrocíclica definidos** y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

- (7) Una sexta solicitud fraccionada No. **00-017.310F** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que encuentran su sustento en la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la sexta solicitud divisional corresponde a las reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir C=N.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más compuestos antagonistas de GABA, a saber: fipronil y endosulfón

- b) La reivindicación 2 de la sexta solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la sexta solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger **una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos antagonistas de GABA específicos** y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

- (8) Una séptima solicitud fraccionada No. **00-017.310G** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que encuentran su sustento en la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales

se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la séptima solicitud divisional corresponde a las reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más compuestos de ligando receptor de acetilcolina, a saber: imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram y tiametoxam.

- b) La reivindicación 2 de la séptima solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la séptima solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger una **composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos de ligando receptor de acetilcolina específicos** y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

- (9) Una octava solicitud fraccionada No. **00-017.310H** que presenta un nuevo capítulo reivindicatorio constituido por 2 reivindicaciones que encuentran su sustento en la descripción y en las reivindicaciones 1, 3 y 4 originalmente presentadas con la solicitud **00-017.310** en las cuales se han realizado leves modificaciones, las cuales se enseñan a continuación:

- a) La reivindicación 1 de la octava solicitud divisional corresponde a las reivindicaciones originales 1 y 4, en la cual tal como se mencionó anteriormente, se ha restringido la configuración de la línea de puntos del enlace carbono - nitrógeno para que represente únicamente un doble enlace, es decir $C=N$.

Además, la composición insecticida reclamada comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) y uno o más

compuestos de formamidina a saber: amitraz, clordimeform y clorfenamidina.

- b) La reivindicación 2 de la octava solicitud divisional corresponde a la reivindicación original 3 para la cual se ha modificado la dependencia; es decir, pasa de depender de la reivindicación 2 a depender de la reivindicación 1.

De esta manera, la octava solicitud fraccionada se encuentra dirigida a proteger una **composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) en combinación con uno o más compuestos de formamidina específicos** y ya no se tienen en cuenta los demás subgrupos pertenecientes al Grupo I.

Por último, me permito manifestar que **ninguna de las modificaciones realizadas anteriormente amplía de manera alguna el alcance de la presente invención** toda vez que limita a la combinación del antagonista del canal de sodio neuronal con una familia de compuestos, y desde el inicio del capítulo reivindicatorio de cada solicitud divisional (es decir, en la reivindicación 1) se limita dicha familia de compuestos a unos compuestos específicos. Por otro lado, me permito resaltar que tal como se ha establecido, todas las modificaciones están plenamente sustentadas en el capítulo reivindicatorio y la descripción de la solicitud **00-017.310** originalmente presentada.

3. **Objeción por Claridad de la Solicitud:**

El señor Examinador en su concepto Técnico No. **1485** objeta la claridad de la solicitud argumentando lo siguiente:

- "No se acepta la división de la solicitud... la reivindicación 1 continúa siendo muy general por cuanto no se delimita el alcance de la invención puesto que abarca diez grupos de compuestos que corresponden a funciones químicas diferentes y donde no se especifican los compuestos".
- "Tampoco está suficientemente sustentado en el capítulo descriptivo que toda esa amplia gama de mezclas posibles de acuerdo a lo reivindicado presenten efecto sinérgico, solo se muestran unos ejemplos que no resultan suficientemente representativos de acuerdo al gran número de mezclas posibles".

- "Con respecto a la fórmula estructural no es claro la forma como se indica que "la configuración de la línea punteada C==N representa un enlace doble o un enlace simple" pero en la fórmula no aparece dicho enlace representado así, lo que allí se muestra es un enlace formado por una línea continua y una punteada... no es congruente la forma de representarlo en la estructura con lo que se indica dentro de la reivindicación No. 1 y con lo indicado en la reivindicación No. 3"
- "Las reivindicaciones de método para el control de insectos... son muy generales y no definen una forma de realización específica"

Como respuesta a estos argumentos, me permito dirigir la atención del Señor Examinador a los siguientes hechos, que permitirán demostrar que teniendo en cuenta las modificaciones realizadas a la solicitud presentada, se superan las objeciones del señor Examinador:

- En cuanto a la objeción basada en la alegada generalidad de la reivindicación 1, me permito manifestar que teniendo en cuenta la división realizada a la solicitud, **de ninguna manera** puede seguirse hablando de una reivindicación general toda vez que la composición insecticida que se reclama en cada uno de los capítulos reivindicatorios, ya no comprende un antagonista del canal de sodio neuronal y diez familias de compuestos; por el contrario, ahora comprende el antagonista del canal de sodio neuronal y **una sola** familia de compuestos de la cual **se han seleccionado unos compuestos específicos**. De esta manera, es evidente que se supera la objeción de claridad a este respecto.
- En cuanto a la demostración del efecto sinérgico, me permito dirigir la atención del señor Examinador al hecho de que en mi memorial de fecha 27 de Julio de 2006, presenté para las solicitudes divisionales denominadas como A, C, F y G anexos a la descripción del sustento experimental que demuestra el sinergismo existente para la respectiva mezcla reclamada, los cuales se anexan nuevamente en este memorial. Adicionalmente, en la página 11 de mi memorial de fecha 27 de Julio de 2006, se estableció que en los ejemplos 2 y 3 de la descripción de la solicitud presentada, los cuales se encuentran en las páginas 16 a 20 de dicha solicitud, se demuestra el efecto insecticida sinérgico presentado por la combinación del antagonista de sodio neuronal de fórmula Ia, con hidrametilnón (compuesto de amidinohidrazona, ejemplo que demuestra el efecto sinérgico de la composición reclamada correspondiente a la solicitud original) y con HzNPV-AaIT (un nucleopolihedrovirus recombinante capaz de expresar una toxina de insecto, ejemplo que demuestra el efecto

sinérgico de la composición reclamada correspondiente a la solicitud divisional B).

Ahora bien, me permito manifestar que para demostrar el efecto sinérgico presentado por la mezcla del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula Ia con espinosad (compuesto de lactona macrocíclica, comprendido en la solicitud divisional E) y con amitraz (compuesto de formamidina, comprendido en la solicitud divisional H), me permito anexar a dichas solicitudes fraccionadas datos experimentales que permiten evidenciar la existencia de dicho efecto. De esta manera, se supera la objeción realizada por el señor Examinador en relación con el sustento de la existencia de un efecto sinérgico.

- En relación con la objeción del señor Examinador por una alegada inconsistencia en la representación estructural y el texto de la reivindicación para el enlace Carbono-Nitrógeno, me permito manifestar que tal como se menciono anteriormente, se modificaron los capítulos reivindicatorios de manera tal que desde el inicio de cada capítulo (es decir, desde la reivindicación 1) se ha definido que dicha línea punteada en la estructura esté definida como un enlace doble, y se ha reemplazado la representación $C=N$, con una representación acorde con la estructura presentada. De esta manera, se supera la objeción de claridad realizada por el señor Examinador a este respecto.
- Por último, con respecto a la objeción acerca de las reivindicaciones de método, teniendo en cuenta que fueron eliminadas del capítulo reivindicatorio de las solicitudes divisionales, se supera esta objeción.

De esta manera, entonces las modificaciones realizadas a la solicitud presentada permiten superar las objeciones de claridad realizadas por el señor Examinador.

4. Objeción por Unidad de Invención de la Solicitud:

De acuerdo con el Concepto Técnico No. **1485**, el señor Examinador afirma: "la invención no comprende un grupo de invenciones relacionadas entre sí de manera que se integre un único concepto inventivo" y sustenta dicha afirmación con el siguiente argumento: "no obstante se haya restringido la composición con respecto a los antagonistas el canal de sodio a los compuestos de fórmula I, los compuestos del grupo I con los cuales se combinan corresponden a grupos con funciones diferentes".

Sobre este particular, me permito manifestar que en este caso el capítulo reivindicatorio de cada solicitud divisional no se ha restringido solamente en cuanto al

antagonista del canal de sodio neuronal; sino que adicionalmente se ha establecido que dicho antagonista solo se combina con una familia de compuestos e incluso se ha limitado **de manera considerable** el alcance de la invención al definir que de esa familia de compuestos perteneciente al grupo I, solo unos pocos compuestos específicos pueden estar comprendidos en la composición. De esta manera, es posible entonces hablar de una sola invención presente en cada solicitud y **debe reconocerse la existencia de unidad de Invención para las invenciones en mención.**

5. Adicionalmente, el señor Examinador en su concepto Técnico No. **1485** establece que "Se ha solicitado en dos oportunidades al interesado y se le ha aclarado y orientado al respecto de cómo ajustar su solicitud de manera que sea clara y guarde unidad de invención y no ha sido posible que responda adecuadamente para continuar con el trámite".

A este respecto, me permito manifestar que contrario a lo que afirma el señor Examinador, en **ningún momento** el solicitante ha procedido de manera contraria a las sugerencias realizadas por el señor Examinador. De hecho, en cada memorial de respuesta a los Conceptos técnicos notificados por ese Despacho se han acatado las instrucciones y sugerencias del señor Examinador:

- En primer lugar, como respuesta a la objeción del señor Examinador relacionada con el amplio número de posibilidades de mezclas existentes debido a la diversidad de antagonistas del canal de sodio neuronal reclamados, se procedió a restringir el grupo de los antagonistas del canal de sodio neuronal posibles a apenas **un antagonista del canal del sodio neuronal**, específicamente el de fórmula I; es decir se pasó de tener 5 posibilidades para la formula de dicho antagonista a solamente una fórmula posible. De esta manera, la composición insecticida comprendía el antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I y uno o más compuestos de **cualquiera de las 10 familias del Grupo I.**
- Posteriormente, como respuesta a la objeción del señor Examinador relacionada con la diversidad de familias de compuestos pertenecientes al grupo I con los cuales se mezcla el antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I, se dividió la solicitud para que cada una de las solicitudes divisionales estuviera dirigida a proteger una composición insecticida que comprendía el antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I y uno o más compuestos de **apenas una de las familias pertenecientes al Grupo I.**
- En esta ocasión se está limitando aún mucho más el alcance de la invención **de acuerdo con las sugerencias del señor Examinador** pues la

composición insecticida reclamada ahora apenas contiene el antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I y apenas **unos compuestos específicos perfectamente definidos**, pertenecientes a una de las familias del grupo I.

Es importante resaltar, que no hay un sustento jurídico dentro de la normatividad que regula la Propiedad Industrial, específicamente las patentes, para rechazar una solicitud divisional porque no cumple con los requisitos de patentabilidad, en este caso con el de claridad. El artículo 36 de la Decisión 486 permite dividir la solicitud en dos o más fraccionarias en cualquier momento del trámite, pero en ningún momento hace mención a que inmediatamente se presenta una solicitud divisional se le realice el examen de patentabilidad y se rechace de plano sin darle siquiera la posibilidad al solicitante para poder defenderse y argumentar el porque si cumple con los requisitos de patentabilidad. Al presentarse una solicitud divisional, esta debe seguir un trámite independiente del de la solicitud original, y a cada una de las solicitudes fraccionarias se les debe realizar todo el trámite como si se presentara una solicitud nueva, esto es publicarla, realizarle un examen de patentabilidad a cada solicitud fraccionaria, etc. Por lo tanto no se entiende el porque no se le realizó un examen de patentabilidad a cada solicitud fraccionaria, ya que claramente cumplían con los requisitos de forma, y así darle al solicitante de poder presentar sus argumentos como defensa a las objeciones citadas por el examinador. Al no haberse dado esta oportunidad, se está presentando una clara violación a los derechos fundamentales consagrados en la Constitución Nacional dentro del artículo 29 como lo son el derecho al debido proceso y a la defensa, por cuanto el solicitante nunca tuvo al oportunidad de presentar sus argumentos de defensa.

Sin embargo, aunque no se comparte la posición del examinador, se procedió a hacer caso a las sugerencias presentadas por este, y por lo tanto, como se enunció anteriormente, se presentan nuevamente las 8 divisionales.

6. Nuevamente, me permito llamar la atención de ese despacho al hecho que para la solicitud originalmente presentada fue concedido el privilegio de patente por la Oficina Europea de Patentes bajo el número **EP1198170 (WO 00/54591 A3)** de la cual anexo copia de la portada y el capítulo reivindicatorio. Aunque es claro para el solicitante que la concesión del beneficio de patente en un país no obliga a proceder de igual manera en ningún otro; es claro que la concesión de la patente por una Oficina que es ampliamente reconocida por la rigurosidad de sus exámenes tal como lo es la Europea, permite apreciar que se ha reconocido la existencia de Unidad de Invención en dicha solicitud, por lo cual este hecho debería constituir un indicio de que en efecto sí existe Unidad de Invención para la solicitud originalmente presentada lo cual lleva a que indudablemente las nueve solicitudes divisionales que resultan de la solicitud de patente

colombiana radicada originalmente con el número de expediente **00-017.310**, cumplen con este requisito.

7. Para finalizar, me permito llamar la atención del señor Examinador al hecho de que en ese Despacho reposan los siguientes documentos tanto para la solicitud original, como para las ocho divisionales; los cuales fueron presentadas junto con memorial de 27 de Junio de 2006:

- Capítulo descriptivo para cada solicitud;
- Nuevo Resumen-Objeto y Finalidad de la Invención, el cual ha sido modificado con respecto al de la solicitud original, con el fin de hacer referencia a la materia reclamada tal como se mencionó anteriormente;
- Los recibos Nos. (A) 06-53.123, 06-56.303 y 06-56.304; (B) 06-53.124, 06-56.305 y 06-56.306; (C) 06-53.125, 06-56.307 y 06-56.308; (D) 06-53.126, 06-56.309 y 06-56.310; (E) 06-53.127, 06-56.311 y 06-56.312; (F) 06-53.128, 06-56.313 y 06-56.314; (G) 06-53.129, 06-56.315 y 06-56.316 y (H) 06-56.319, 06-56.317 y 06-56.318, expedidos por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acreditan el pago de las modificaciones mencionadas, los cuales fueron anexados con memorial de 27 de Julio de 2006; y un nuevo recibo número 07- 5.451, que acredita el pago de las actuales modificaciones realizadas a la solicitud original;
- Fotocopias de las copias auténticas debidamente certificadas de las solicitudes de patente presentadas para el invento arriba nombrado **respecto de las cuales reclamo prioridad**, a saber de las solicitudes número 60/124,306 de 12 de Marzo de 1999 y 60/158,201 de 7 de Octubre de 1999, junto con las Traducciones Oficiales números 0243 y 0244;
- Copia del documento que acredita el traspaso que los autores del invento de la referencia hacen de sus derechos sobre el mismo junto con la Traducción Oficial número 093;
- Tarjeta de propietario; y
- Formato Único de Conversión, División y Fusión para las ocho solicitudes.

Por lo tanto, lo único que se anexará nuevamente será el recibo número 07-5.451, que acredita el pago de las modificaciones realizadas, el capítulo reivindicatorio, el extracto y cuando aplique, los datos experimentales, ya que los anteriores documentos se presentaron junto con memorial de 27 de Julio de 2006.

8. Anexo los documentos que detallo a continuación, relacionados con cada una de las solicitudes resultantes del presente fraccionamiento:

(1) **Solicitud original: "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE AMIDINOHIDRAZONA".-**

- a) Nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 3 reivindicaciones tal como se ilustró anteriormente, cuyo sustento se encuentra en la descripción y las reivindicaciones 1, 3, y 6 originalmente presentadas con la solicitud No. **00-017.310** inicialmente radicada el 9 de Marzo de 2000 reenumeradas como reivindicaciones 1 a 3; y
- b) Recibo número 06-54,897 expedido por la Superintendencia de Industria y Comercio, que acredita el pago de las modificaciones mencionadas, el cual como ya se mencionó reposa en ese Despacho junto con el expediente de la solicitud en mención y el nuevo recibo número 07-5451, que acredita el pago de las actuales modificaciones.

(2) Teniendo en cuenta que se presentan 8 solicitudes divisionales, para cada una de éstas anexos me permito presentar:

- (a) Un nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 2 reivindicaciones tal como se ilustró anteriormente, que tiene pleno sustento en la descripción y las reivindicaciones 1, 3 y 4 presentadas en la solicitud No **00-017.310**, reenumeradas como nuevas reivindicaciones 1 a 2;
- (b) Extracto de la solicitud, en sus dos formas, que incluye el título que se encuentra de acuerdo con el objeto de la presente invención fraccionada y que incluye las reivindicaciones 1 a 2;

(3) Adicionalmente, para las solicitudes divisionales **E** y **H** me permito presentar como anexo a la descripción el sustento experimental que demuestra el sinergismo existente para la mezcla reclamada.

(4) Como la fecha de presentación de las solicitudes resultantes del presente fraccionamiento es la misma --9 de Marzo de 2000-- atentamente solicito a usted se sirva dar a la solicitud fraccionada el mismo número de Expediente de la solicitud original, acompañada de la letra **A, B, C, D, E, F, G** o **H** según corresponda, para su identificación.

(5) Ratifico a usted que de conformidad al cambio de nombre solicitado mediante memorial de 11 de Abril de 2005, la titular de la solicitud fraccionada en cuestión **WYETH HOLDINGS CORPORATION**; sociedad

organizada y existente de conformidad con las leyes del Estado de Maine, Estados Unidos de América y domiciliada en Madison, Estado de New Jersey, Estados Unidos de América.

- (6) En cuanto a la Fuente Normativa de la Reciprocidad requerida para la prioridad respecto de las solicitudes divisionales, es la misma invocada respecto de la solicitud original.
- (7) Así mismo, reitero a usted que el documento que acredita mi calidad de Representante Legal en dicha sociedad para todos los asuntos de la Propiedad Industrial, fue presentado con mi memorial de 11 de Abril de 2005, en la solicitud original número **00-017.310**.

9. Adicionalmente, me permito presentar nuevamente los títulos que identificarán a cada una de las solicitudes divisionales presentadas:

- a) **Solicitud divisional A:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO PIRETROIDE O DE TIPO PIRETROIDE"
- b) **Solicitud divisional B:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN NUCLEOPOLIHEOVIRUS RECOMBINANTE CAPAZ DE EXPRESAR UNA NEUROTOXINA DE INSECTO"
- c) **Solicitud divisional C:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE ORGANOFOSFATO"
- d) **Solicitud divisional D:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE CARBAMATO"
- e) **Solicitud divisional E:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LACTONA MACROCÍCLICA"
- f) **Solicitud divisional F:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO ANTAGONISTA DE GABA"
- g) **Solicitud divisional G:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LIGANDO RECEPTOR DE ACETILCOLINA"

h) **Solicitud divisional H:** "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE FORMAMIDINA

10. Anexo me permito presentar copia de las páginas 3696 y 3694 del libro " Römpp Chemie Lexikon" en su versión original y traducida del alemán y de la portada y capítulo reivindicatorio de la patente Europea concedida identificada con el número **EP 1198170**.

11. En vista de lo anterior, y de conformidad con lo establecido por el Artículo 36 de la Decisión 486, solicito a ese Despacho se sirva aceptar y estudiar las solicitudes divisionales presentadas y conceder el privilegio de patente solicitado.

Señor Superintendente,


ALICIA LLOREDA RICAURTE
T.P. 53.215

T.P. 53.215


 1990
 1991
 1992
 1993
 1994
 1995
 1996
 1997
 1998
 1999
 2000
 2001
 2002
 2003
 2004
 2005
 2006
 2007
 2008
 2009
 2010
 2011
 2012
 2013
 2014
 2015
 2016
 2017
 2018
 2019
 2020
 2021
 2022
 2023
 2024
 2025
 2026
 2027
 2028
 2029
 2030
 2031
 2032
 2033
 2034
 2035
 2036
 2037
 2038
 2039
 2040
 2041
 2042
 2043
 2044
 2045
 2046
 2047
 2048
 2049
 2050
 2051
 2052
 2053
 2054
 2055
 2056
 2057
 2058
 2059
 2060
 2061
 2062
 2063
 2064
 2065
 2066
 2067
 2068
 2069
 2070
 2071
 2072
 2073
 2074
 2075
 2076
 2077
 2078
 2079
 2080
 2081
 2082
 2083
 2084
 2085
 2086
 2087
 2088
 2089
 2090
 2091
 2092
 2093
 2094
 2095
 2096
 2097
 2098
 2099
 2100
 2101
 2102
 2103
 2104
 2105
 2106
 2107
 2108
 2109
 2110
 2111
 2112
 2113
 2114
 2115
 2116
 2117
 2118
 2119
 2120
 2121
 2122
 2123
 2124
 2125
 2126
 2127
 2128
 2129
 2130
 2131
 2132
 2133
 2134
 2135
 2136
 2137
 2138
 2139
 2140
 2141
 2142
 2143
 2144
 2145
 2146
 2147
 2148
 2149
 2150
 2151
 2152
 2153
 2154
 2155
 2156
 2157
 2158
 2159
 2160
 2161
 2162
 2163
 2164
 2165
 2166
 2167
 2168
 2169
 2170
 2171
 2172
 2173
 2174
 2175
 2176
 2177
 2178
 2179
 2180
 2181
 2182
 2183
 2184
 2185
 2186
 2187
 2188
 2189
 2190
 2191
 2192
 2193
 2194
 2195
 2196
 2197
 2198
 2199
 2200
 2201
 2202
 2203
 2204
 2205
 2206
 2207
 2208
 2209
 2210
 2211
 2212
 2213
 2214
 2215
 2216
 2217
 2218
 2219
 2220
 2221
 2222
 2223
 2224
 2225
 2226
 2227
 2228
 2229
 2230
 2231
 2232
 2233
 2234
 2235
 2236
 2237
 2238
 2239
 2240
 2241
 2242
 2243
 2244
 2245
 2246
 2247
 2248
 2249
 2250
 2251
 2252
 2253
 2254
 2255
 2256
 2257
 2258
 2259
 2260
 2261
 2262
 2263
 2264
 2265
 2266
 2267
 2268
 2269
 2270
 2271
 2272
 2273
 2274
 2275
 2276
 2277
 2278
 2279
 2280
 2281
 2282
 2283
 2284
 2285
 2286
 2287
 2288
 2289
 2290
 2291
 2292
 2293
 2294
 2295
 2296
 2297
 2298
 2299
 2300
 2301
 2302
 2303
 2304
 2305
 2306
 2307
 2308
 2309
 2310
 2311
 2312
 2313
 2314
 2315
 2316
 2317
 2318
 2319
 2320
 2321
 2322
 2323
 2324
 2325
 2326
 2327
 2328
 2329
 2330
 2331
 2332
 2333
 2334
 2335
 2336
 2337
 2338
 2339
 2340
 2341
 2342
 2343
 2344
 2345
 2346
 2347
 2348
 2349
 2350
 2351
 2352
 2353
 2354
 2355
 2356
 2357
 2358
 2359
 2360
 2361
 2362
 2363
 2364
 2365
 2366
 2367
 2368
 2369
 2370
 2371
 2372
 2373
 2374
 2375
 2376
 2377
 2378
 2379
 2380
 2381
 2382
 2383
 2384
 2385
 2386
 2387
 2388
 2389
 2390
 2391
 2392
 2393
 2394
 2395
 2396
 2397
 2398
 2399
 2400
 2401
 2402
 2403
 2404
 2405
 2406
 2407
 2408
 2409
 2410
 2411
 2412
 2413
 2414
 2415
 2416
 2417
 2418
 2419
 2420
 2421
 2422
 2423
 2424
 2425
 2426
 2427
 2428
 2429
 2430
 2431
 2432
 2433
 2434
 2435
 2436
 2437
 2438
 2439
 24

NOTARIA SEXTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTE
Bogotá, D.C.
Ante mí JUAN MANUEL NOTARIO
NOTARIO SEXTO DEL C.I.C. No. 39.690.713
Comparacion con: Alicia Lloreda Ricaurte
C.I. 39.690.713
T.P. 53.215
y declaro que es la misma persona que el contenido del mismo documento y que la firma es diligencia.
ALICIA LLORED RICAURTE
C.C. No. 39.690.713 de Usaquén

1742

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 5.451
FECHA : ENERO 18 DE 2007

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 00-017310- -00016-0000
Fec: 2007-02-06 16:42:31 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tra. 2 PATENTES
Eve: 1 REGDEPOSITO
Act 329 CTOINFORMACION Folios: 95

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
LLORERA Y CIA S. A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55643017	18/01/2007	67,916,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-03	CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	
		12 MARCAS Y LEHAS COMERCIALES	99,000.00
		TOTAL :	\$ 99,000.00

SON: NOVENTA Y NUEVE MIL PESOS

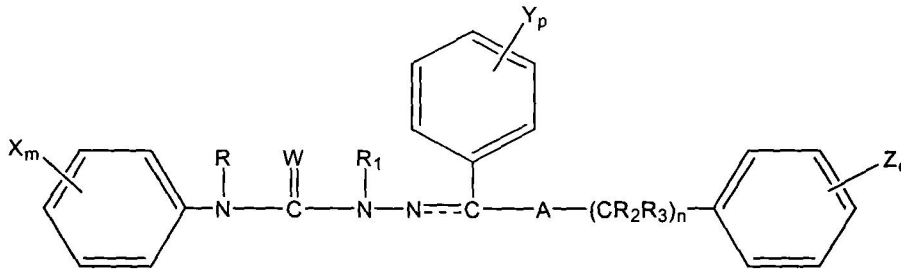
RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE Nº. _____

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno; alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alqueno C_2-C_6 , alquino 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_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

(5,5-dimetilperhidropirimidin-2-ona-4-trifluorometil- α -(4-trifluorometilstiril) cinamilidenohidrazona (**hidrametilnón**);

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con hidrametilnón en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de hidrametilnón.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

R y R₁ son cada uno H

3. Una composición de cebo que contiene de 0.01 a 20% en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió en la reivindicación 1 en combinación con hidrametilnón.

RÖMPP CHEMIE LEXIKON

9., erweiterte
und neu-
bearbeitete
Auflage

Herausgeber

Prof. Dr. Jürgen Falbe Düsseldorf

und

Prof. Dr. Manfred Regitz Kaiserslautern

Bearbeitet von zahlreichen Fachkollegen
Zentralredaktion:

Dr. Elisabeth Hillen



Georg Thieme Verlag Stuttgart · New York

2,4-Dihydro-3-pyrazolon (veraltet: 2-Pyrazolin-5-on), $C_4H_4N_2O$, MG. 84,08, als Grundkörper einer großen Gruppe gut wirksamer *Antipyretika u. *Antineuralgika am wichtigsten.

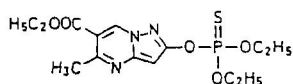


Einige der *Phenazone haben allerdings wegen gelegentlich auftretender unerwünschter *Arzneimitteln Nebenwirkungen Anwendungsbeschränkungen od. -verbote erfahren. Einige P. dienen als Reagentien u. zur Herst. von Azofarbstoffen (Pyrazolon-Farbstoffe wie *Flavazine u. *Tartrazin). - E = F pyrazolones - I pirazoloni - S pirazonas

Lit.: Becker u. Moebius, Listen der pyrazolonhaltigen Arzneimittel, Berlin: Arzneimittel-Informations-Dienst (ATI) 1982 ■ Beilstein E III/IV 24, 58; EV 24/1 in Vorbereitung ■ Brune, 100 Jahre Pyrazolone, München: Urban & Schwarzenberg 1985 ■ Brune, 100 Years of Pyrazolone Drugs, Basel: Birkhäuser 1986 ■ Hager (4.) 3, 9-12; 6a, 115-119, 571-575 ■ Kirk-Othmer (3.) 19, 445-451 ■ Snell-Hilton 6, 207-219 ■ Ullmann (4.) 7, 650; 19, 583-590 ■ Winnacker-Küchler (3.) 4, 287, 354, 535-537.

Pyrazon s. Chloridazon.

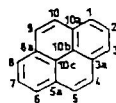
Pyrazophos.



Common name für 2-Diethoxythiophosphoryloxy-5-methylpyrazolo[1,5-a]pyrimidin-6-carbonsäureethylester, $C_{14}H_{20}N_4O_5PS$, MG. 373,4, Schmp. 50-51°, LD₅₀ Ratte oral weiblich 151 mg/kg, männlich 242 mg/kg (Wirkstoffe iva), von Hoechst 1971 eingeführtes system. *Fungizid mit protektiver u. kurativer Wirkung gegen Echte Mehltauipilze v. a. im Obst-, Gemüse- u. Zierpflanzenbau. - E = F pyrazophos - I = S pirazofos

Lit.: Agro. ■ Büchel, S. 127 (Afugan*) ■ Farm. ■ Pesticide Manual ■ Wirkstoffe iva. - [Z 2933.59; CAS 13457-18-6]

Pyren (Benzo[def]phenanthren).



$C_{16}H_{10}$, MG. 202,26. Im reinen Zustand farblose, in techn. Qualitäten durch Naphthalen-Spuren gelb gefärbte Krist., D. 1,271, Schmp. 150°, Sdp. 393°, fluoresziert in fester u. gelöster Form blau; in Wasser unlösl., in Ether u. arom. Lsgm. löslich. P. als solches ist im Gegensatz zu manchen anderen *polycyclischen aromatischen Kohlenwasserstoffen (bes. *Benzo[a]pyren) nach neueren Unters. (Lit.¹) nicht carcinogen. Mutagen u. carcinogen sind allerdings z.B. Nitropyrene (Lit.²), von denen geringe Mengen in Tonern für die *Elektrophotographie gefunden worden waren (Lit.³).

Vork.: P. ist ubiquitär in allen Prod. unvollständiger Verbrennung, in fossilen Brennstoffen u. zu etwa 2% im *Steinkohlenteer enthalten, aus dem es bei fraktionierter Dest. gewonnen wird.

Verw.: Zur Herst. von Naphthalintetracarbonsäure, als Vorprod. für Farbstoffe (sog. Teerfarbstoffe).

Name von griech.: pyr = Feuer, weil P. bei trockener Dest. von Steinkohle entsteht. - E pyrene - F pyrène - I pirene - S pireno

Lit.: ¹IARC Monogr. 32, 431-445 (1983). ²IARC Monogr. 33, 171-222 (1984). ³Science 209, 1037-1043 (1980). allg.: Beilstein E IV 5, 2467 ■ Ullmann (4.) 14, 686f.; (5.) A 13, 271f. - [Z 2902.90; CAS 129-00-0]

Pyrenit s. Tetryl.

Pyrethrine s. Pyrethrum.

Pyrethrinsäure s. Pyrethrum.

Pyrethroide. Bez. für lipophile synthet. Verb. mit naher od. ferner struktureller Verwandtschaft zu den Wirkprinzipien des *Pyrethrum, deren insektizide Wirkung wie bei dem Hauptwirkstoff des Pyrethrums, dem Pyrethrin I, auf einer starken Beeinflussung der Natrium-Kanäle in den Nervenmembranen beruht. Die Pyrethroid-Forschung begann mit der Aufklärung der wirksamen Bestandteile des natürlichen Insektenvernichtungsmittels Pyrethrum vor mehr als 70 Jahren durch Staudinger u. Ruzicka, die auch die ersten synthet. Abwandlungen herstellten. Die geringe Stabilität u. die relativ hohen Herstellkosten stehen einer ökonom. sinnvollen Verw. des Pyrethrums in der Landwirtschaft entgegen. Ziel der Forschungsarbeiten war deshalb die Entwicklung analoger synthet. leicht zugänglicher Verb. erhöhter Stabilität. Die nachfolgende Abb. zeigt die wichtigsten synthet. Wirkstoffe, die zum größten Teil in Einzelstichwörtern ausführlicher behandelt werden, dort finden sich auch Angaben zur Stereochemie. Das erste sehr wirksame P. war Allethrin, das sich strukturell noch sehr eng an das Pyrethrin I anlehnte. Durch Variation der Alkohol-Komponente u. die Einführung von Halogen entfernten sich die P. in ihrer Struktur immer weiter von ihrem natürlichen Vorbild. Wie die Beisp. Fenvalerat, Flucythrinate u. Tau-fluvalinat zeigen, ist selbst der Cyclopropan-Ring für die insektizide Wirkung nicht unbedingt notwendig. Auch Wirkstoffe ohne Carboxy-Gruppe sind bekannt.

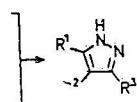
Während bei Insektiziden aus der Gruppe der chlorierten Kohlenwasserstoffe, Carbamate u. Phosphorsäureester Aufwandmengen von ca. 1 kg/ha nötig sind, kommt man bei den P. mit rund 50-200 g/ha, teilw. sogar mit nur bis zu 10-25 g/ha aus. Die P. besitzen in der Regel eine starke, schnell einsetzende Kontakt- u. Fraßgiftwirkung gegen fast alle Insekten (ausgenommen Schildläuse, Milben u. bodenlebende Arten). Von Nachteil ist ihre Giftigkeit gegenüber Bienen, die jedoch zum Teil durch eine gleichzeitige Repellent-Wirkung nicht zum Tragen kommt, u. Fischen. - E pyrethroids - F pyrethroides - I piretroidi - S piretroides

Lit.: Büchel, S. 5-9 ■ Naumann, in Chemistry of Plant Protection, Bd. 4 u. 5, Berlin-Heidelberg: Springer 1990 ■ Naumann, in Wegler, Chemie der Pflanzenschutz- u. Schädlingsbekämpfungsmittel, Bd. 7, Berlin-Heidelberg: Springer 1981 ■ Pestic. Sci. 27, 337-351 (1989) ■ Ullmann (5.) A 14, 273-277 ■ Winnacker-Küchler (4.), 7, 308-312. - [Z 2916.20]

e wichtige
wichtigster

ichtaromat.
rch *sigma-
: stabileren

ketonen mit
cloaddition
en mit Alki-



1990) ■
sol.

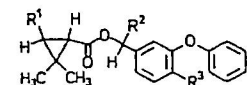
nder Grund-
Gruppe der
zon. - E = F
- S pirazoli-

b. Apoth. Ztg.
28-1042 ■ s. a.

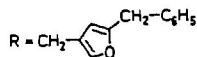
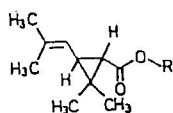
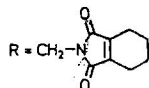
5 nicht mehr
ydropyrazole,
h d: erblie-
ten omen
zwischen den
C-4 befindet,
l. 3-P. (früher
n sind heute:
l- u. 2,3-

er s. stuer-
a P. leiten sich
. Aufheller ab;
pyrazolines - I

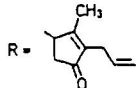
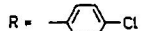
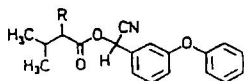
name für die
als Dihydropy-
iv. der Dihy-
somen ist das



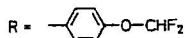
R ¹	R ²	R ³	
CH=CCl ₂	CN	H	Cypermethrin α-Cypermethrin β-Cypermethrin Cyfluthrin β-Cyfluthrin
CH=CCl ₂	CN	F	
CH=C(CF ₃) Cl	CN	H	Cyhalothrin
CH=CCBr ₂	CN	H	Deltamethrin
CH ₃	CN	H	Fenpropathrin
CH=CCl ₂	H	H	Permethrin
CHBr-CCBr ₃	CN	H	Tralomethrin
CH=C(CH ₃) ₂	H	H	Phenothrin

Resmethrin
Bioresmethrin
(Cismethrin)

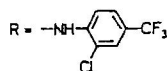
Tetramethrin

Allethrin
Bioallethrin
s-Bioallethrin

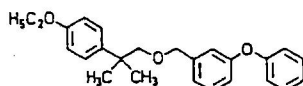
Fenvalerat



Flucythrinate



Tau-fluvalinat

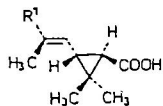
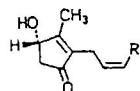
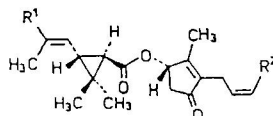


Etofenprox

Abb.: Die wichtigsten Pyrethroide (Stereochemie s. Einzelstichworte).

Pyrethrum. Aus den getrockneten Blütenköpfen verschiedener Chrysanthemum-Arten durch Pulverisieren od. Extraktion gewonnenes *Insektizid, dessen Hauptwirkstoffe die insgesamt sechs opt. akt. Ester der (+)-*trans*-Chrysanthemumsäure u. der (+)-*trans*-Pyrethrinsäure u. der Hydroxyketone (+)-

Pyrethron, (+)-Cinerolon u. (+)-Jasmolon sind (s. Abb.):

R¹ = CH₃ (+)-*trans*-ChrysanthemumsäureR¹ = COOCH₃ (+)-*trans*-PyrethrinsäureR² = CH=CH₂ (+)-PyrethronR² = CH₃ (+)-CinerolonR² = C₂H₅ (+)-Jasmolon

R ¹	R ²	
CH ₃	CH=CH ₂	Pyrethrin I
COOCH ₃	CH=CH ₂	Pyrethrin II
CH ₃	CH ₃	Cinerin I
COOCH ₃	CH ₃	Cinerin II
CH ₃	C ₂ H ₅	Jasmolin I
COOCH ₃	C ₂ H ₅	Jasmolin II

Abb.: Die insektiziden Bestandteile des Pyrethrum u. ihre Bausteine.

Alle sechs Verb. sind farblose Flüssigkeiten, lösl. in Alkohol, Petrolether u. Tetrachlormethan, die leicht oxidieren, ihre Aktivität an Licht u. Luft schnell verlieren u. auch gegen Feuchtigkeit u. Alkalien empfindlich sind. Es sind reine Kontaktgifte, die rasch in das Nervensyst. gelangen u. bei dem Insekt die hierfür charakterist. Symptome (starke Erregung, gefolgt von Koordinationsstörungen, Lähmung u. schließlich Tod) hervorrufen. Die Anfangswirkung setzt dabei sehr schnell ein, d.h. das Insekt ist innerhalb weniger Min. bewegungsunfähig. Dieser „knock-down“-Effekt wird bes. bei Fliegen nur von wenigen Insektiziden erreicht. Die hierfür nötige Dosis reicht aber meist nicht für eine tödliche Wirkung aus, da die Wirkstoffe des P. im Insekt durch enzymat. Oxid. schnell entgiftet werden, so daß sich ein Teil der Tiere wieder erholen kann. Dies kann durch Zusatz von *Synergisten od. Wirkstoffen aus der Gruppe der Phosphorsäureester u. Carbamate verhindert werden. Für Menschen u. Warmblüter (Vögel, Säugetiere) ist P. – v. a. unter den empfohlenen Anwendungsbedingungen – relativ harmlos. Hauptausfuhrgebiete des P. sind Kenia, Tansania, Ecuador, Kolumbien, Neuguinea u. Japan. Kenia u. Tansania produzierten 1983 mit ca. 25000 t über 90% der Welternte. Bei den pulverisierten Blüten unterscheidet man im Handel zwischen dalmatin. u. persischem Insektenplv.; das dalmatin. Prod. gewinnt man aus *P. cinerariaefolium*, das persische aus *P. roseum* (*P. carneum* u. *causasicum*). Extrakte werden mit Lösungsmittelgemischen wie Methanol/Kerosin, Petrolether/Acetonitril od. Petrolether/Nitromethan gewonnen. P. wird seit alters in Asien als natürliches Insektenvernichtungsmittel verwendet u. auch heute noch ist es in zahlreichen Mitteln bes. gegen Hygiene-

u. V.
tät u.
ökon.
entg.
Pflan.
hoch.
kung.
kelt.
Lit.:
Hirz.
Pyre.

Pyre.
Papi.
& S.

Pyre.
*Bo.
SiO₂
chei.
koei.
grol.
Küc.
mer.
Na₂
Cl,

Pyr.

Pyr.
thio.
Pyr.

Pyr.

(4-

C₁₀

Ni

*A

ge

Th

W

b

Li

Py

C

yl

Se

m

L

ge

G

L

f

R

In diesem Lexikon sind zahlreiche Gebrauchs- und Handelsnamen, Warenzeichen, Firmenbezeichnungen sowie Angaben zu Vereinen und Verbänden, DIN-Vorschriften, Codenummern des Zolitarifs, MAK- und TRK-Werten, Gefährklassen, Patenten, Herstellungs- und Anwendungsverfahren aufgeführt. Alle Angaben erfolgten nach bestem Wissen und Gewissen. Herausgeber und Verlag machen ausdrücklich darauf aufmerksam, daß vor deren gewerblicher Nutzung in jedem Falle die Rechtslage sorgfältig geprüft werden muß.

E I N G A N G
2 3. MRZ. 1991
ZSD/H
Hauptbücherei

1. Auflage: 1 Band, 1947; Dr. H. Römp
2. Auflage: 2 Bände, 1950; Dr. H. Römp
3. Auflage: 2 Bände, 1952; Dr. H. Römp
4. Auflage: 2 Bände, 1958; Dr. H. Römp
5. Auflage: 3 Bände, 1962; Dr. H. Römp
6. Auflage: 4 Bände, 1966; Dr. E. Uhlein
7. Auflage: 6 Bände, 1972; Dr. O.-A. Neumüller
8. Auflage: 6 Bände, 1979; Dr. O.-A. Neumüller

Die Deutsche Bibliothek – CIP-Einheitsaufnahme

Römp-Chemie-Lexikon / Hrsg.: Jürgen Falbe u. Manfred Regitz. Bearb. von zahlr. Fachkollegen. – Stuttgart ; New York : Thieme.

Bis 8. Aufl. u.d.T.: Neumüller, Otto-Albrecht: Römps Chemie-Lexikon

NE: Römp, Hermann [Begr.]; Falbe, Jürgen [Hrsg.] Bd. 5. Pi-S. – 9., erw. u. neubearb. Aufl. – 1992

Das Werk, einschließlich aller seiner Teile, ist urheberrechtlich geschützt. Jede Verwertung außerhalb der engen Grenzen des Urheberrechtsgesetzes ist ohne Zustimmung des Verlages unzulässig und strafbar. Das gilt insbesondere für Vervielfältigungen, Übersetzungen, Mikroverfilmungen und die Einspeicherung und Verarbeitung in elektronischen Systemen.

© 1992 Georg Thieme Verlag
Rüdigerstraße 14, D-7000 Stuttgart 30
Printed in Germany

Typographie: Brigitte und Hans Peter Willberg

Gesamtherstellung:
Konrad Tritsch GmbH
Graphischer Betrieb, 8700 Würzburg

Gedruckt auf säurefreies, archivierfähiges Werkdruckpapier, Permaplan, von Gebrüder Buhl Papierfabriken, Ettlingen und Dettingen.

ISBN 3-13-735009-3 1 2 3 4 5 6

Korrespondenzanschriften

Herausgeber:
Prof. Dr. Jürgen Falbe
Henkel KGaA
Postfach 11 00
4000 Düsseldorf 1

Prof. Dr. Manfred Regitz
Universität Kaiserslautern
Postfach 30 49
6750 Kaiserslautern

Zentralredaktion:
Dr. Elisabeth Hillen
Georg Thieme Verlag
Rüdigerstr. 14
7000 Stuttgart 30

unter Mitarbeit von
Ute Rohlf
Tübingen
Dr. Barbara Frunder
Tübingen

Codenummern
des Zolitarifs (HS)
überarbeitet von:
Karl Kettner
Sigmaringen

Beilsteinzitate und
Nomenklatur
überprüft von:
Eva Hoffmann
Frankfurt am Main
Dr. Bruno Langhammer
Frankfurt

Übersetzung
der Stichworte:
Englisch:
Durch die Autoren
Französisch:
Durch die Autoren
Italienisch:
Dipl.Chem. Salvatore Veneri
Ludwigshafen
Spanisch:
Dipl.Chem. Ricard Wilshusen
Darmstadt
(unter Mitarbeit von
Barbara Cisneros-Schulze,
Viernheim)

Sac
bea

Dr.
Wü

Dr.
Lev

Dr.
Lev

Pro
Gö

Di
Bü

Dr
Wt

Dr
Le

Dr
Di

Di
Di

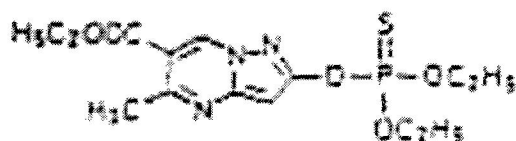
Pr
D

D
D

3693

Pirazona *ver* Cloridazona

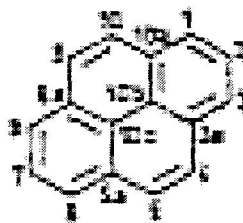
Pirazofos



Nombre común del ácido 2-dietoxitiofosforiloxi-5-metilpirazolo[1,5-a]pirimidin-6-carboxílico etil éster, $C_{14}H_{20}N_3O_2PS$, peso molecular 373,4, punto de fusión 50-51°, LD₅₀ en rata hembra oral 151 mg/kg, macho 242 mg/kg (principios activos), *fungicida sistémico introducido por Hoechst en 1971, con efecto protector o curativo contra el oidio blanco, en especial en cultivos de frutas, hortalizas y plantas ornamentales. – E = F pirazofos – I = S pirazofos.

Lit.: Agro

Pireno (Benzo[def]fenantreno)



$C_{14}H_{10}$, peso molecular 202,26. En estado puro, cristales incoloros; en calidades técnicas, cristales de color amarillo debido a trazas de naftaceno, D. 1,271, punto de fusión 150°, punto de ebullición 393°, fluorescencia azul en forma disuelta o sólida; insoluble en agua, soluble en éter y en disolventes aromáticos. El pireno como tal, en oposición a varios otros hidrocarburos *policíclicos (en particular, *Benzo[a]pireno), de acuerdo con estudios recientes (Lit.¹), no es cancerígeno. Sin embargo, son mutágenos y cancerígenos, por ejemplo, nitropirenos (Lit.²), de los cuales se habían encontrado pequeñas cantidades en tintas en polvo (toners) par al *electrofotografía (Lit.³).

Observación: El pireno se encuentra contenido ampliamente en todos los productos de combustión incompleta, en combustibles fósiles y alrededor del 2% en la *brea de hulla, de la cual se obtiene con destilación fraccionaria.

Uso: Para la fabricación de ácido naftalintetracaboxílico como material de partida para colorantes (los llamados *colantes de alquitrán*).

Su nombre procede del griego: pyr = fuego, porque el pireno con destilación en seco se deriva de la hulla.

– E pyrene F pyrène I pirene S pireno

Lit¹... etc.

Piranita *ver* Tetrilo.

Piretrinas *ver* Pyretrum

Ácido de piretrina *ver* Pyretrum

Piretroides. Denominación de compuestos sintéticos lipófilos con afinidad estructural próxima o lejana con los principios activos del *pyrethrum (piretro), cuyo efecto insecticida como en el caso del principal principio activo del pyrethrum, la piretrina I, se basa en un fuerte efecto de los canales de sodio en las membranas neuronales. La investigación de los piretroides se inició con el esclarecimiento de los componentes activos del insecticida natural hace más de 70 años por Staudiger y Ruzicka, quienes produjeron también las primeras modificaciones sintéticas. La baja estabilidad, los costos de producción relativamente elevados se oponen a un empleo económicamente razonable del pyrethrum en la agricultura. Por esa razón, el objetivo de los trabajos de investigación fue el desarrollo de compuestos análogos, obtenibles fácilmente por medios sintéticos, de mayor estabilidad. La siguiente Fig. muestra los principios activos más importantes, los cuales en gran parte se tratan con más exhaustivamente en palabras claves individuales; allí también se encuentran datos sobre la estereoquímica.

El primer piretroide muy efectivo fue la aletrina la cual, desde el punto de vista estructural, se apoyaba aún muy estrechamente en la piretrina I.

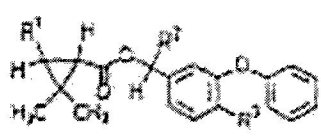
Mediante variación de los componentes alcoholes y la introducción de halógenos se alejaron los piretroides en su estructura cada vez más de su modelo natural. Tal como lo muestran los ejemplos fenvalerato, flucitrinato y tau-fluvalinato, incluso el anillo ciclopropano no es absolutamente necesario para la acción insecticida. Se conocen asimismo principios activos sin el grupo carboxi.

Mientras que en el caso de los insecticidas del grupo de los hidrocarburos clorados, carbamatos y éster de ácido fosfórico, son necesarias cantidades de empleo de aprox. 1 kg/ha, con los piretroides son suficientes alrededor de 50-200 g/ha, en parte incluso con sólo hasta 10-25 g/ha. Por lo general los piretroides poseen un fuerte efecto insecticida de ingestión y contacto de rápida acción contra casi todos los insectos (con excepción de cochinillas, ácaros y especies que viven en el suelo). Una desventaja es su toxicidad contra las abejas, la cual no se hace efectiva sin embargo gracias a un efecto repelente simultáneo, y contra los peces.

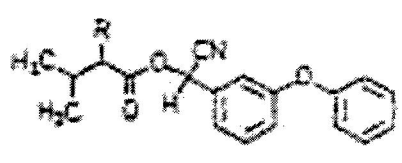
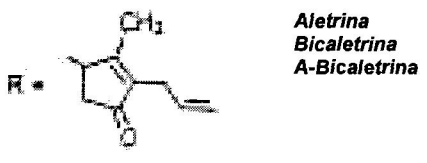
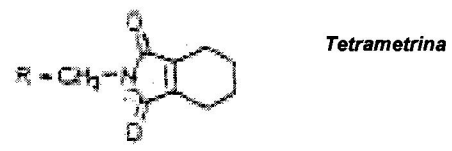
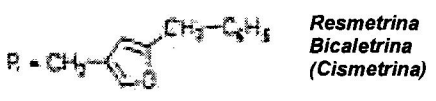
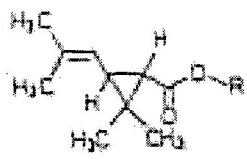
– *E pyrethroids* - *F pyrethroides* - *I piretroidi* - *S piretroides*

Lit. Büschel,

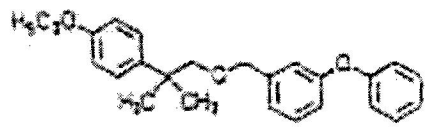
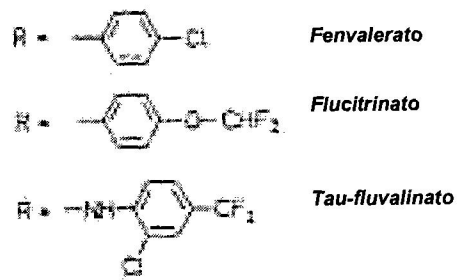
3694



R ¹	R ²	R ³	
CH=CHCl ₂	CN	H	Cipermetrina
		H	α-Cipermetrina
		H	β-Cipermetrina
CH=CHCl ₂	CN	F	Ciflutrina
		F	β-Ciflutrina
CH=CH-CF ₃	CN	H	Cihalotrina
CH=CH-CF ₃	CN	H	Deltametrina
CH ₃	CN	H	Fenpropatrina
CH=CHCl ₂	H	H	Permetrina
CH=CH-CF ₃	CN	H	Tralometrina
CH=CH-CH ₃	H	H	Fenotrina



1752



Etofenprox

Fig.: Los piretroides más importantes (esteroquímica ver palabras claves individuales)

1953

TRADUCCION OFICIAL No. 2006-07-27-466
DE UN DOCUMENTO ESCRITO EN INGLES

PCT

ORGANIZACIÓN MUNDIAL DE PROPIEDAD INTELECTUAL

Buró Internacional

SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA BAJO EL TRATADO DE COOPERACION DE PATENTES (PCT)

(51) Clasificación de Patente Internacional:
A01N 47/00

A2

(11) Número de Publicación Internacional: WO 00/54591

(43) Fecha de Publicación Internacional: Sept. 21 de 2000
(21.09.00)

(21) Número de Solicitud Internacional: PCT/US00/05879

(22) Fecha de Registro Internacional: Marzo 7 de 2000
(07.03.00)

(30) Fecha de Prioridad:

60/124,306 Marzo 12 de 1999 (12.03.99) US
60/158,201 Octubre 7 de 1999 (07.10.99) US

(75) Solicitante: AMERICAN CYANAMID COMPANY [US/US];
Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940 (US).

(72) Inventores: TREACY, Michael, Franks; 53 Sequoia Drive,
Newtron, PA 18940 (US). BORYSEWICZ, Raymond,
Frank; 12 Albermarle Road, Hamilton Square, NJ 08690
(US). SCHWINGHAMMER, Kurt, Allen; 1206 University
Drive, Yardley, PA 19067 (US). RENSNER, Paul, Erich;
1267 Woodthrush Court, Yardley, PA 19067 (US).
OLOUMI-SADEGHI, Hassan; 1204 Goldenrod Court,
Yardley, PA 19067 (US).

(74) Agentes: HOGAN, John, W.; American Home Products
Corporation, Patent Law Dept. 2B2, One Campus Drive,
Parsippany, NJ 07054 (US) et al.

(81) Estados Designados: AE, AL, AT, AU,
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR,
CR, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD,
GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, L, LV,
MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL,
PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM,
TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW,
Patente ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZW), Patente Euroasiática
(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
Patente Europea (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT,
SE.), Patente OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,
GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publicada

Sin reporte de búsqueda internacional y a ser
Republicada a la recepción de ese reporte.

(50) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGISTICAS

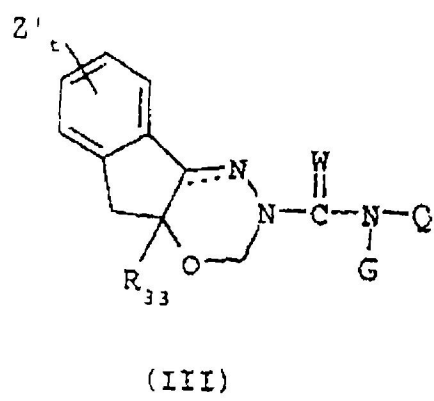
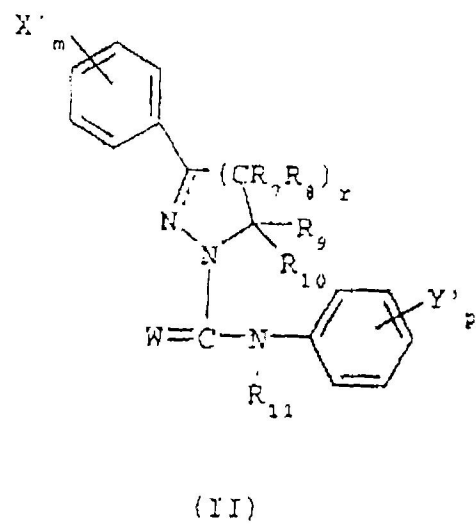
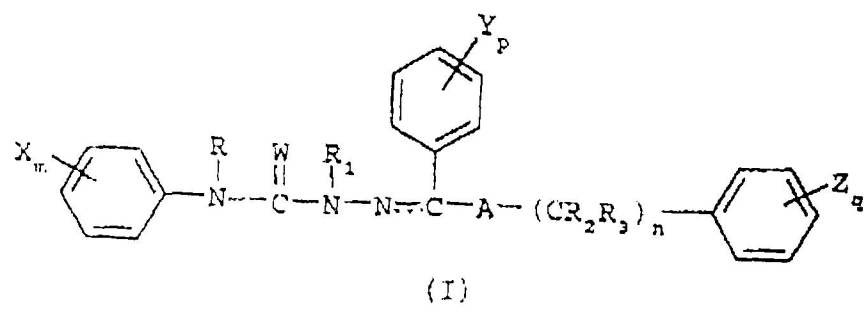
(57) Resumen

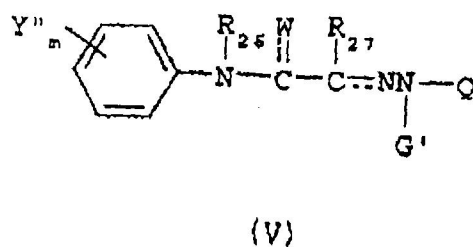
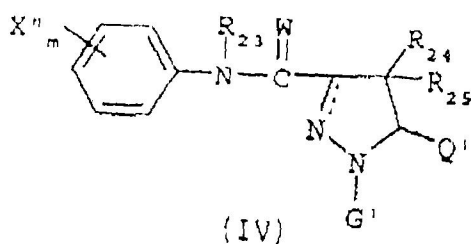
La presente invención provee una composición insecticida sinérgica que comprende como ingredientes activos esenciales un antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más compuestos seleccionados del grupo que consiste de piretroides, compuestos del tipo piretroide, núcleopoliedro virus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, organofosfatos, carbamatos, formamidinas, lactosas

macrocíclicas, amidinohidrazonas, antagonistas de GABA y ligandos del receptor acetilcolina. También se proveen los métodos para el control de insecto sinérgico y la protección del cultivo.

REIVINDICACIONES:

1. Una composición insecticida sinérgica que comprende una cantidad sinérgicamente efectiva de un antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más compuestos seleccionados del Grupo A, en donde el antagonista del canal de sodio neuronal es un compuesto de formula





en donde A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

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

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

alcoxi C_1-C_6 carbonilo, cicloalquil C_3-C_6 carbonilo, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxi C_1-C_6 carbonilo; alquil C_1-C_6 sulfonilo; alqueno C_2-C_6 ; o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 o 2;

r es un entero de 1 o 2;

t es un entero de 1, 2, 3, o 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 alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 alquilo, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquilo C_1-C_6 carbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquil C_1-C_6 tio, o haloalquil C_1-C_6 tio;

R_7 y R_8 son cada uno independientemente H; halógeno; alquilo C_1-C_6 ; alquilo C_1-C_6 carbonilo; o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más 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 , alquilo C_1-C_6 carbonilo, alcoxi C_1-C_6 carbonilo, o haloalcoxi C_1-C_6 carbonilo;

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

G es H; alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más grupos 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 sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, haloalquilo C_1-C_3 o haloalcoxi C_1-C_3 ;

cicloalquilo C_3-C_6 ; o feniltio;

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

u es un entero de 0, 1 o 2;

R_{14} , R_{15} , R_{16} , R_{18} , R_{19} , R_{21} y R_{22} son cada uno independientemente H o 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' y Y' son cada uno independientemente H; halógeno, CN, SNC; alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más de grupos halógeno,

NO₂, CN, alcoxiC₁-C₄, alquiloC₁-C₄tio, fenilo, halofenilo, alquiloC₁-C₄sulfonilo, haloalquiloC₁-C₄sulfonilo, o alcoxiC₁-C₄carbonilo;

alqueniloC₂-C₄, haloalqueniloC₂-C₄, alquiniloC₂-C₄; haloalquiniloC₂-C₄, cicloclaquiloC₃-C₆, halocicloalquiloC₃-C₆; fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, NO₂, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄; alquilC₁-C₄tio, alquilC₁-C₄sulfonilo o haloalquilC₁-C₄sulfonilo;

alquilC₁-C₄carbonilo, haloalquilC₁-C₄carbonilo; o NR²⁸R₂₉;

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

un anillo heteroaromático de 5 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados de 0 o 1 átomos de oxígeno, 0 o 1 de azufre y 0, 1 o 2 de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 5 miembros está unido mediante carbono y está opcionalmente sustituido 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 o 1 átomos de oxígeno, 0 o 1 de azufre y 0, 1 o 2 de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 6 miembros está unido mediante carbono y está opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de X'';

Q' es H; alquiloC₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más de grupos halógeno, CN, alcoxiC₁-C₃, alcoxiC₁-C₆carbonilo, o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, NO₂, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alquilC₁-C₄sulfonilo o alquilC₁-C₄sulfinilo;

alqueniloC₂-C₆, alquiniloC₂-C₆; o fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de X';

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ y R₂₉ son cada uno independientemente H o alquiloC₁-C₄; y la configuración de línea punteada $\text{C} \cdots \text{N}$ representa un enlace doble o un enlace simple; o

un estereoisomero del mismo.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el antagonista del canal de sodio neuronal es un compuesto de formula I o III y la configuración de línea punteada $C \cdots N$ representa un enlace doble.
3. La composición de acuerdo con la reivindicación 2, en donde W es O; X es trifluorometoxi y está en la posición 4; Y es trifluorometilo y está en la posición 3; z es CN y está en la 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_3 ; y Q es p-(trifluorometoxi)fenilo.
4. La composición de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el uno o más compuestos seleccionados del Grupo A son cipermetrina, cihalometrina, ciflutrina, permetrina, etofenprox, silafluofeno, fipronil, endosulfona, imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, tiametoxam, profenofos, acefato, sulfopros, malation, diazinon, metil parationa, terbufos, metonil, tiodicarb, fenotiocarb, amitraz, clordimeform, clorfenamidina, avermectina, emamectina, milbemectina, nemadectina o moxidectina.
5. La composición de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el uno o más compuestos seleccionados del Grupo A es un núcleopoliedrovirus recombinante capaz de expresar toxina de insecto.
6. La composición de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el uno o más compuestos seleccionado del Grupo A es hidrametilnona.
7. Un método para el control de insectos sinérgico que comprende contactar dicho insecto con una composición de cualquiera de las reivindicaciones 1-6.
8. El método de acuerdo con la reivindicación 7, en donde el insecto se selecciona del grupo que consiste de Blattaria, Isoptera, Diptera, e Himenoptera.

9. El método de acuerdo con la reivindicación 8, en donde los insectos son lepidoptera o coleoptera.

10. Un método para proteger una planta de la infestación y ataque de insectos, que comprende aplicar al follaje o tallo de dicha planta una cantidad sinérgicamente efectiva de una composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1-6.

Traducido según mi mejor saber y entender, este día 27 de julio de 2006, en la ciudad de Bogotá, D.C., por Anita Escobar de Tamayo, Traductora Oficial, Res. 2177 de 1989, Ministerio de Justicia, República de Colombia.

TRADUCTORA OFICIAL
RES. 2177/89 MINJUSTICIA
Anita Escobar de Tamayo
ANITA ESCOBAR DE TAMAYO

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION
International Bureau



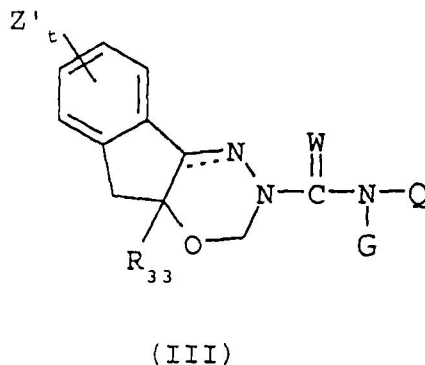
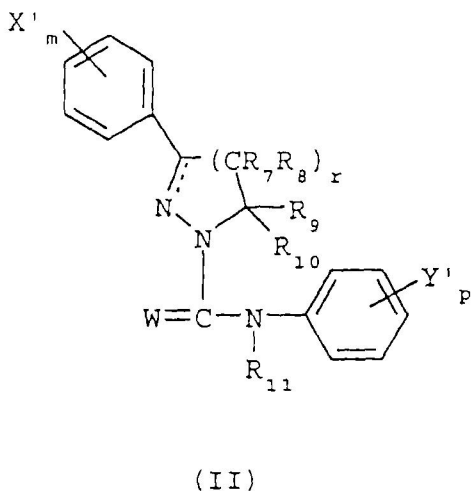
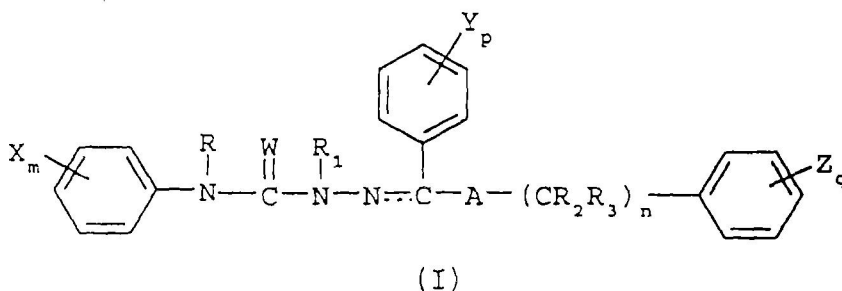
1760

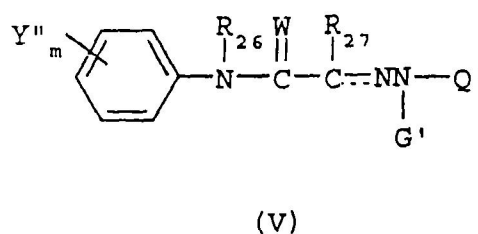
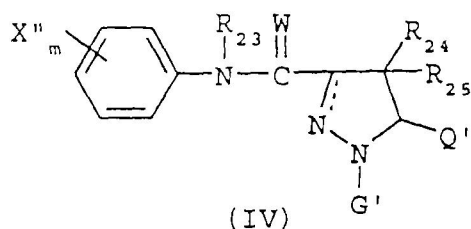
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International Patent Classification ⁷ : A01N 47/00		A2	(11) International Publication Number: WO 00/54591
			(43) International Publication Date: 21 September 2000 (21.09.00)
(21) International Application Number: PCT/US00/05879 (22) International Filing Date: 7 March 2000 (07.03.00) (30) Priority Data: 60/124,306 12 March 1999 (12.03.99) US 60/158,201 7 October 1999 (07.10.99) US (71) Applicant: AMERICAN CYANAMID COMPANY [US/US]; Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940 (US). (72) Inventors: TREACY, Michael, Frank; 53 Sequoia Drive, Newtown, PA 18940 (US). BORYSEWICZ, Raymond, Frank; 12 Albermarle Road, Hamilton Square, NJ 08690 (US). SCHWINGHAMMER, Kurt, Allen; 1206 Uni- versity Drive, Yardley, PA 19067 (US). RENSNER, Paul, Erich; 1267 Woodthrush Court, Yardley, PA 19067 (US). OLOUMI-SADEGHI, Hassan; 1204 Goldenrod Court, Yardley, PA 19067 (US). (74) Agents: HOGAN, John, W.; American Home Products Corpo- ration, Patent Law Dept. 2B2, One Campus Drive, Parsip- pany, NJ 07054 (US) et al.		(81) Designated States: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG). Published <i>Without international search report and to be republished upon receipt of that report.</i>	
(54) Title: SYNERGISTIC INSECTICIDAL COMPOSITIONS			
(57) Abstract			
The present invention provides a synergistic insecticidal composition comprising as essential active ingredients a neuronal sodium channel antagonist in combination with one or more compounds selected from the group consisting of pyrethroids, pyrethoid-type compounds, recombinant nucleopolyhedroviruses capable of expressing an insect toxin, organophosphates, carbamates, formamidines, macrocyclic lactones, amidinohydrazones, GABA antagonists and acetylcholine receptor ligands. Also provided are methods for synergistic insect control and crop protection.			

WHAT IS CLAIMED IS:

1. A synergistic insecticidal composition comprising a synergistically effective amount of a neuronal sodium channel antagonist in combination with one or more compounds selected from Group A wherein the neuronal sodium channel antagonist is a compound of formula





wherein A is CR_4R_5 or NR_6 ;

W is O or S;

X, Y, Z, X', Y' and Z' are each independently H;

halogen; OH; CN; NO_2 ; C_1 - C_6 alkyl optionally substituted with one or more halogen,

C_1 - C_3 alkoxy, C_1 - C_3 haloalkoxy, C_3 - C_6 cycloalkyl, C_2 - C_6 alkenyloxy or sulfonyloxy groups;

C_1 - C_6 alkoxy optionally substituted with one or more halogen, C_1 - C_3 alkoxy or C_3 - C_6 cycloalkyl groups;

C_1 - C_6 alkoxycarbonyl, C_3 -

C_6 cycloalkylcarbonyloxy, phenyl optionally substituted with one or

more halogen, C_1 - C_4 alkyl, or C_1 - C_4 alkoxy groups;

aminocarbonyloxy optionally substituted with one or more C_1 - C_3 alkyl groups;

C_1 - C_6 alkoxycarbonyloxy; C_1 - C_6 alkylsulfonyloxy; C_2 - C_6 alkenyl; or $NR_{12}R_{13}$;

m, p and q are each independently an integer of 1, 2, 3, 4, or 5;

n is an integer of 0, 1 or 2;

r is an integer of 1 or 2;

t is an integer of 1, 2, 3 or 4;

R, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 and R_5 are each independently H or C_1 - C_4 alkyl;

R_6 is H, C_1 - C_6 alkyl, C_1 - C_6 haloalkyl, C_1 - C_6 alkoxyalkyl, C_1 - C_6 alkoxy, C_1 - C_6 haloalkoxy, C_2 - C_6 alkenyl,

C₂-C₆alkynyl, C₁-C₆alkylcarbonyl, C₁-C₆alkoxy-carbonyl, C₁-C₆alkylthio, or C₁-C₆haloalkylthio;

R₇ and R₈ are each independently H; halogen; C₁-C₆alkyl; C₁-C₆alkylcarbonyloxy; or phenyl optionally substituted with one or more halogen, CN, NO₂, C₁-C₆alkyl, C₂-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkoxy or C₁-C₆haloalkoxy groups;

R₉ and R₁₀ are each independently H, or C₁-C₆alkyl; R₁₁ is H, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, C₁-C₆alkylcarbonyl, C₁-C₆alkoxycarbonyl, or C₁-C₆haloalkoxycarbonyl;

R₁₂ and R₁₃ are each independently H or C₁-C₆alkyl; G is H; C₁-C₆alkyl optionally substituted with one or more halogen, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy, CN, NO₂S(O)_uR₁₄, COR₁₅, CO₂R₁₆, phenyl or C₃-C₆cycloalkyl groups;

C₁-C₆alkoxy; C₁-C₆haloalkoxy; CN; NO₂; S(O)_uR₁₇; COR₁₈; CO₂R₁₉; phenyl optionally substituted with one or more halogen, CN, C₁-C₃haloalkyl, or C₁-C₃haloalkoxy groups; C₃-C₆cycloalkyl; or phenylthio;

Q is phenyl optionally substituted with one or more halogen, CN, SCN, NO₂, S(O)_uR₂₀, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkoxyalkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₆haloalkoxy, or NR₂₁R₂₂ groups;

u is an integer of 0, 1 or 2;

R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₈, R₁₉, R₂₁ and R₂₂ are each independently H or C₁-C₆alkyl;

R₁₇ and R₂₀ are each independently C₁-C₆alkyl or C₁-C₆haloalkyl;

R₃₃ is CO₂R₃₄;

R₃₄ is H, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆haloalkyl, phenyl or

-26-

halophenyl;

X' and Y' are each independently H; halogen; CN; SCN; C₁-C₆alkyl optionally substituted with one

or more halogen, NO₂, CN, C₁-C₄alkoxy, C₁-C₄alkylthio, phenyl, halophenyl, C₁-C₄alkylsulfonyl, C₁-C₄haloalkylsulfonyl, or C₁-C₄alkoxycarbonyl groups;

C₂-C₄alkenyl; C₂-C₄haloalkenyl; C₂-C₄alkynyl; C₂-C₄haloalkynyl; C₃-C₆cycloalkyl; C₃-C₆halo-cycloalkyl; phenyl optionally substituted

with one or more halogen, CN, NO₂, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkoxy, C₁-C₄haloalkoxy, C₁-C₄alkylthio, C₁-C₄alkylsulfonyl or

C₁-C₄haloalkylsulfonyl groups;

C₁-C₄alkylcarbonyl; C₁-C₄haloalkylcarbonyl; or NR₂R₂;

G' is phenyl optionally substituted with one or more groups which may be the same or different selected from X' ;

a 5-membered heteroaromatic ring containing one or two heteroatoms selected from 0 or 1 oxygen, 0 or 1 sulfur and 0, 1 or 2 nitrogen atoms said 5-membered heteroaromatic ring being attached via carbon and being optionally substituted with one or more groups which may be the same or different selected from X' ; or

a 6-membered heteroaromatic ring containing one or two heteroatoms selected from 0 or 1 oxygen, 0 or 1 sulfur and 0, 1 or 2 nitrogen atoms said 6-membered heteroaromatic ring being attached via carbon and being optionally substituted

1765

-27-

with one or more groups which may be the same or different selected from X' ;

Q' is H; C₁-C₆alkyl optionally substituted with one or more halogen, CN, C₁-C₃alkoxy, C₁-C₆alkoxycarbonyl, or phenyl optionally

substituted with one or more halogen, CN, NO₂, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl, C₁-C₄alkylsulfonyl or C₁-C₄alkylsulfinyl groups;

C₂-C₆alkenyl; C₂-C₆alkynyl; or phenyl optionally substituted with one to three groups, which may be the same or different, selected from X' ;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ and R₂₉ are each independently H or C₁-C₄alkyl; and the dotted line configuration C=N represents a double bond or a single bond; or a stereoisomer thereof.

2. The composition according to claim 1 wherein the neuronal sodium channel antagonist is a compound of formula I or III and the dotted line configuration C=N represents a double bond.

3. The composition according to claim 2 wherein W is O; X is trifluoromethoxy and is in the 4-position; Y is trifluoromethyl and is in the 3-position; Z is CN and is in the 4-position; A is CH₂; n is 0; m, p and q are each 1; R and R₁ are each H; Z' is Cl; R₃₃ and G are each CO₂CH₃; and Q is p-(trifluoromethoxy)phenyl.

4. The composition according to claim 3 wherein the one or more compounds selected from Group A are

cypermethrin, cyhalomethrin, cyfluthrin, permethrin, ethofenprox, silafluofen, fipronil, endosulfon, imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram, thiamethoxam, profenofos, acephate, sulprofos, malathion, diazinon, methyl parathion, terbufos, methonyl, thiodicarb, fenothiocarb, amitraz, chlordimeform, chlorfenamidin, avermectin, emamectin, milbemectin, nemadectin, or moxidectin.

5. The composition according to claim 3 wherein the one or more compounds selected from Group A is a recombinant nucleopolyhedrovirus capable of expressing insect toxin.

6. The composition according to claim 3 wherein the one or more compounds selected from Group A is hydramethylnon.

7. A method for synergistic insect control which comprises contacting said insect with a composition of any one of claims 1-6.

8. The method according to claim 7 wherein the insect is selected from the group consisting of Blattaria, Isoptera, Diptera, and Hymenoptera.

9. The method according to claim 8 wherein the insects are lepidoptera or coleoptera.

10. A method for protecting a plant from infestation and attack by insects which comprises applying to the foliage or stem of said plant a synergistically effective amount of a composition according to any one of claims 1-6.

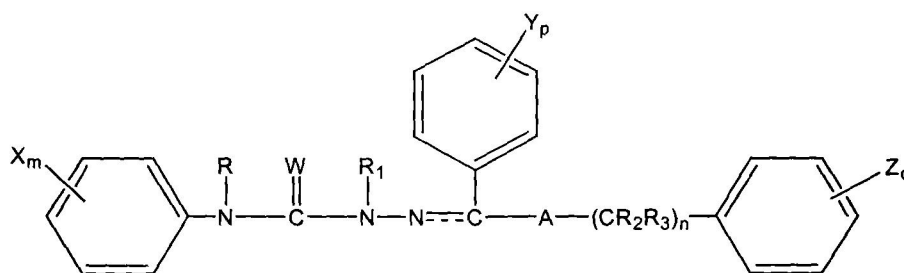
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310A

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alqueno C_2-C_6 , alquino 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_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y
 uno o más compuestos piretroides o de tipo piretroide, seleccionados del grupo consistente en:

(RS)- α -ciano-3-fenoxibenzil (1RS, 3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**cipermetrina**);

(RS)- α -ciano-3-fenoxibenzil (Z)-(1RS,3RS)-(2-cloro-3,3,3-trifluoropropenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**cihalotrina**);

(RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibenzil (1RS, 3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**ciflutrina**);

3-fenoxibenzil (1RS, 3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**permetrina**);

2-(4-etoxifenil)-2-metilpropil 3-fenoxibenzil eter (**etofenprox**); y

(4-etoxifenil)[3-(4-fluoro-3-fenoxifenil)propil](dimetil)silano (**silafuofén**).

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O; m, p y q son cada uno 1; y

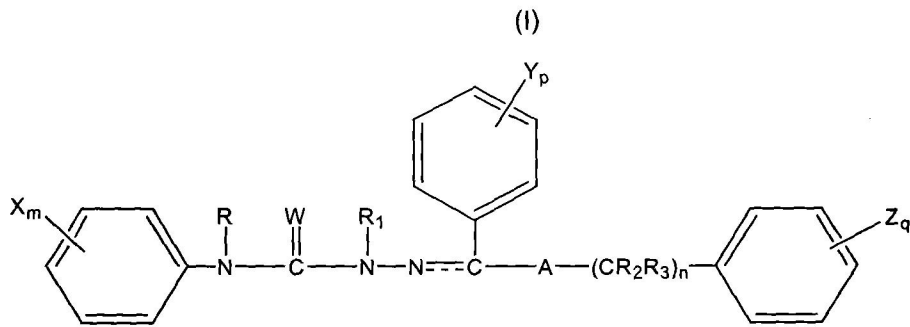
R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 A		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO PIRETROIDE O DE TIPO PIRETROIDE			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆ o sulfoniloxi;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxycarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarboniloxi C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarboniloxi no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxycarboniloxi C₁-C₆; alquilsulfoniloxi C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcocalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆,

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno o más compuestos piretroides o de tipo piretroide, seleccionados del grupo consistente en:

(RS)- α -ciano-3-fenoxibenzil (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato
(**cipermetrina**);

(RS)- α -ciano-3-fenoxibenzil (Z)-(1RS, 3RS)-(2-cloro-3,3,3-trifluoropropenil)-2,2-
dimetilciclopropanocarboxilato (**cihalotrina**);

(RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibenzil (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-
dimetilciclopropanocarboxilato (**ciflutrina**);

3-fenoxibenzil (1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato
(**permetrina**);

2-(4-etoxifenil)-2-metilpropil 3-fenoxibencil eter (**etofenprox**); y

(4-etoxifenil)[3-(4-fluoro-3-fenoxifenil)propil](dimetil)silano (**silaflluofén**).

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide.

1771


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

 (21) N° de solicitud: **00-017.310 A**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

 (74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

 No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

 (54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO PIRETROIDE O DE TIPO PIRETROIDE**

1772



Industria y Comercio

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

(21) N° de solicitud: 00-017.310A		(22) Fecha de solicitud: 09-03-00	
(51) Clasificación Internacional: A01N			
(71) Solicitante(s): WYETH HOLDINGS CORPORATION			
(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi			
(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE			
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
(85) Fecha límite inicio fase nacional:		(87) Publicación internacional:	
(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT		Fecha:	
Fecha de presentación de la solicitud:		No. Publicación:	
No. de solicitud PCT/			

FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm

(54) Título:
COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO PIRETROIDE O DE TIPO PIRETROIDE

(57) Resumen: **Reivindicación número 1.-**

uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide en una relación de 1 parte en peso de antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos piretroides o de tipo piretroide.

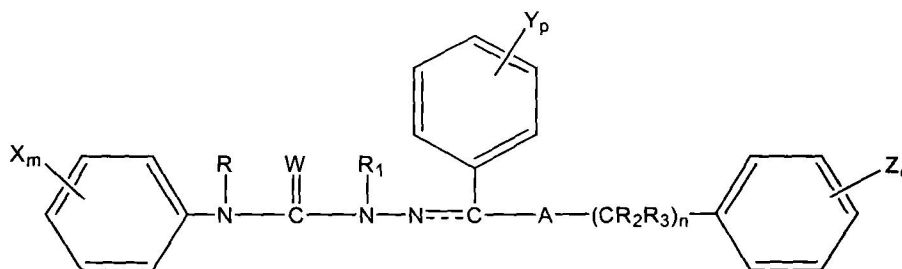
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310B

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alqueno C_2-C_6 , alquino 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_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

H_zNPVAaIT, Helicoverpa Nucleopolihedrovirus que expresa la toxina del insecto *Androctonus australis*;

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con H_zNPVAaIT, en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de H_zNPVAaIT.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

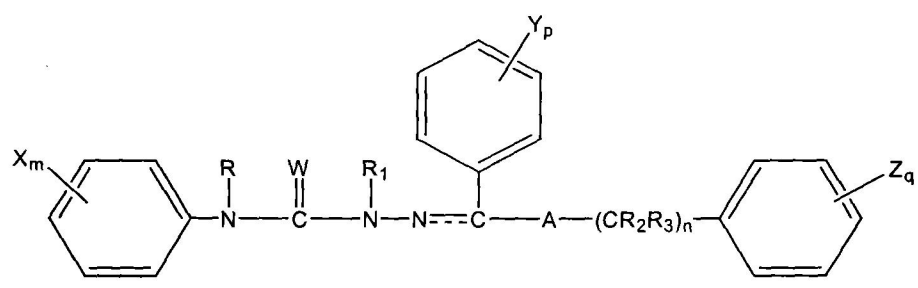
R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 B		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN NUCLEOPOLIHEDROVIRUS RECOMBINANTE CAPAZ DE EXPRESAR UNA NEUROTOXINA DE INSECTO			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S:

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆ o sulfoniloxi;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarboniloxi C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarboniloxi no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxicarboniloxi C₁-C₆; alquilsulfoniloxi C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆.

R_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

H_zNPVAaIT, Helicoverpa Nucleopolihedrovirus que expresa la toxina del insecto Androctonus australis;

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con H_zNPVAaIT, en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de H_zNPVAaIT.

1777


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

 (21) N° de solicitud: **00-017.310 B**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional : A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es) : Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

 (74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

 No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

 (54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN NUCLEOPOLIHDROVIRUS RECOMBINANTE CAPAZ DE EXPRESAR UNA NEUROTOXINA DE INSECTO**



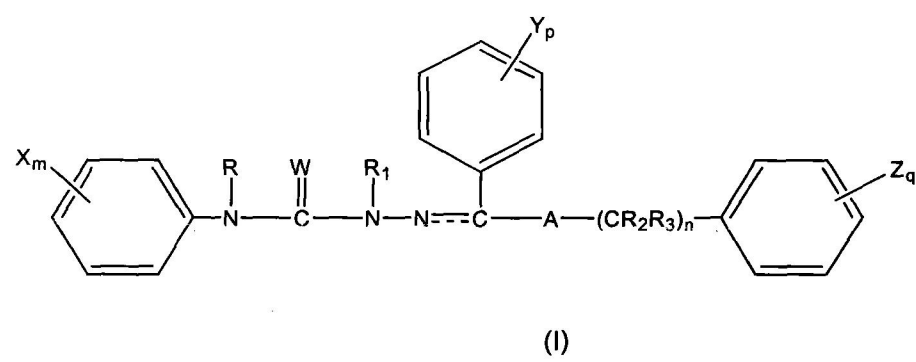
Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO TEMATICO
PATENTE DE INVENCION ☐ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ☐ DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(21) N° de solicitud: 00-017.310 B		(22) Fecha de solicitud: 09-03-00
(51) Clasificación Internacional: A01N		
(71) Solicitante(s): WYETH HOLDINGS CORPORATION		
(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi		
(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE		
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha (33) País
	60/124,306	12-03-99 US
	60/158,201	07-10-99 US
(85) Fecha límite inicio fase nacional:		(87) Publicación internacional: Fecha: No. Publicación:
(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT Fecha de presentación de la solicitud: No. de solicitud PCT/		
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN NUCLEOPOLIHEOVIRUS RECOMBINANTE CAPAZ DE EXPRESAR UNA NEUROTOXINA DE INSECTO		
(57) Resumen: <u>Reivindicación número 1.-</u>		

FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S:

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆ o sulfonyloxi;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxycarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarboniloxi C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarboniloxi no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxycarboniloxi C₁-C₆; alquilsulfonyloxi C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆,

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;

y la configuración de línea punteada australis;

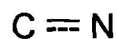
en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con HzNPVAalT, en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de HzNPVAalT.

1779

DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310C



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo y;

uno o más compuestos de organofosfato seleccionados del grupo consistente en:

O-4-bromo-2-clorofenil O-etil S-propil fosforotioato (**profenofos**);

O,S-dimetil acetilfosforamidotioato (**acefato**);

O-etil O-4-(metiltio)fenil S-propil fosforoditioato (**sulprofos**);

dietil (dimetoxitiofosforiltio)succinato (**malatión**);

O,O-dietil O-2-isopropil-6-metilpirimidin-4-il fosforotioato (**diazinón**);

O,O-dimetil O-4-nitrofenil fosforotioato (**metilparatión**); y

S-tert-butiltiometil O,O-dietil fosforoditioato (**terbufós**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de organofosfato en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente, a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de organofosfato.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

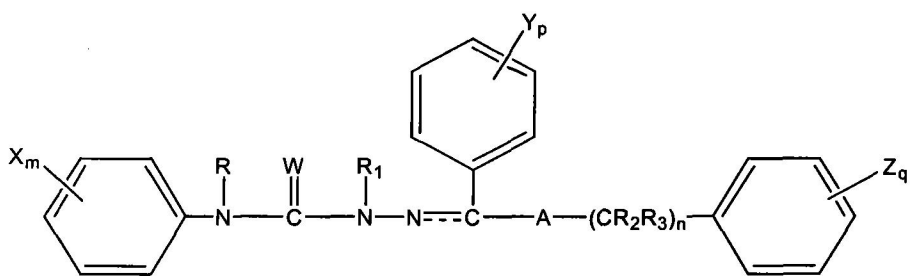
R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 C		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Priodidad	32) Fecha	(33) Pais
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Titulo: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE ORGANOFOSFATO			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S:

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆ o sulfonilo;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarbonilo C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno; alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; alquilsulfonilo C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcohalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquileno C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆;

R_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo y;

uno o más compuestos de organofosfato seleccionados del grupo consistente en:

O-4-bromo-2-clorofenil O-etil S-propil fosforotioato (**profenofos**);

O,S-dimetil acetilfosforamidotioato (**acefato**);

O-etil O-4-(metiltio)fenil S-propil fosforoditioato (**sulprofos**);

dietil (dimetoxitiofosforiltio)succinato (**malatión**);

O,O-dietil O-2-isopropil-6-metilpirimidin-4-il fosforotioato (**diazinón**);

O,O-dimetil O-4-nitrofenil fosforotioato (**metilparatión**); y

S-tert-butiltiometil O,O-dietil fosforoditioato (**terbufós**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de organofosfato en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente, a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de organofosfato.

1283



Industria y Comercio

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS**

SUPERINTENDENCIA

PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

(21) N° de solicitud: **00-017.310 C**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha limite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

(54) Titulo: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE ORGANOFOSFATO**

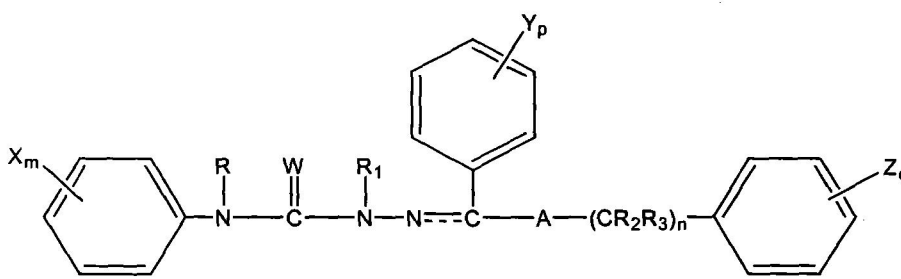
EXPEDIENTE No. 00-017.310D

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

DIVISIONAL

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alcohalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino 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_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;
o un esteroisómero del mismo; y
uno o más compuestos de carbamato seleccionados del grupo
consistente en:

S-metil N-(metilcarbamoiloxi)tioacetimidato (**metomil**);

3,7,9,13-tetrametil-5,11-dioxa-2,8,14-tritia-4,7,9,12-tetra-azapentadeca-
3-12-dieno-6,10-diona (**tiodicarb**); y

S-4-fenoxibutil dimetiltiocarbamato (**fenotiocarb**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de carbamato en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de carbamato.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X es trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

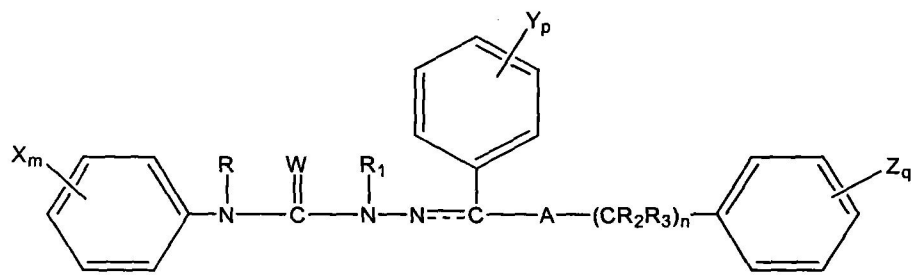
R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 D		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Titulo: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE CARBAMATO			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆ o sulfonilo;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarbonilo C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; alquilsulfonilo C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcohalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆.

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;
o un esteroisómero del mismo; y
uno o más compuestos de carbamato seleccionados del grupo consistente en:

S-metil N-(metilcarbamoiloxi)tioacetimidato (**metomil**);

3,7,9,13-tetrametil-5,11-dioxa-2,8,14-tritia-4,7,9,12-tetra-azapentadeca-3-12-dieno-6,10-diona
(**tiodicarb**); y

S-4-fenoxibutil dimetiltiocarbamato (**fenotiocarb**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de carbamato en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de carbamato.

1789


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

 (21) N° de solicitud: **00-017.310 D**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

 (74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

 No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

 (54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE CARBAMATO**

1790


Industria y Comercio
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**
TARJETA ARCHIVO TEMATICO
SUPERINTENDENCIA
PATENTE DE INVENCION
PCT ☒
MODELO DE UTILIDAD
DISEÑO INDUSTRIAL

 (21) N° de solicitud: **00-017.310 D**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s):

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

 (74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad

 (31) **No. Prioridad**

(32)

Fecha

(33)

País

60/124,306

12-03-99

US

60/158,201

07-10-99

US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

 No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional:

Fecha:

No. Publicación:

FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm

(54) Título:

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE CARBAMATO

 (57) Resumen: **Reivindicación número 1.-**

uno o más de los compuestos de carbamato en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de carbamato.

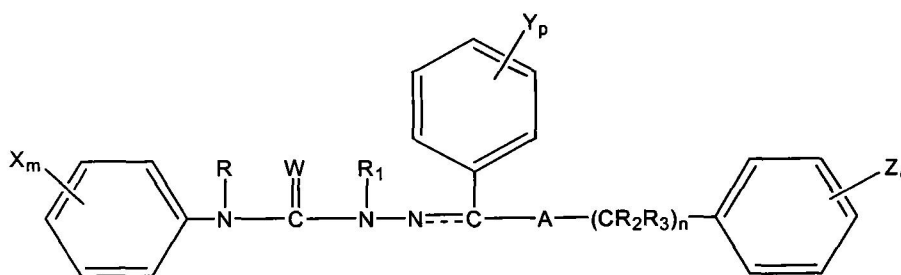
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310E

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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

C_4 ;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆,

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno más compuestos de lactona macrocíclica seleccionados del grupo consistente en:

Espinosad;

mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-
(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-6'-[(S)-sec-butil]-21,24-
dihidroxi-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-
trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-
espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-4-O-(2,6-dideoxi-3-O-
metil- α -L-arabino-hexopiranosil)-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosido y
(10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-21,22-
dihidroxi-6'-isopropil-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-
trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}] pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-
espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-4-O-(2,6-dideoxi-3-O-
metil- α -L-arabino-hexopiranosil)-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosido
(**avermectina**);

mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-
(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-6'-[(S)-sec-butil]-21,24-
dihidroxi-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-
trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-
espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-3-O-metil-4-O-(2,4,6-
trideoxi-3-O-metil-4-metilamino- α -L-lixo-hexapiranosil)- α -L-arabino-

hexapiranosido y (10E,14E,16E,22Z)-
 (1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-21,24-dihidroxi-6'-
 isopropil-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo(3,7,19-
 trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-
 espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-3-O-metil-4-O-(2,4,6-
 trideoxi-3-O-metil-4-metilamino- α -L-lixo-hexapiranosil)- α -L-arabino-
 hexapiranosido (**emamectina**);
 mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-
 (1R,4S,5'S,6R,6'R,8R,13R,20R,21R,24S)-6'-etil-21,24-dihidroxi-
 5',11,13,22-tetrametil-3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]pentacosa-
 10,14,16,22-tetraeno-6-espiro-2'-tetrahidropiran-2-ona y
 (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6R,6'R,8R,13R,20R,21R,24S)-21,24-
 dihidroxi-5',6',11,13,22-pentametil-3,7,19-
 trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]pentacosa-10,14,16,22- tetraeno-6-
 espiro-2'-tetrahidropiran-2-ona en la proporción 7 a 3 (**milbemectina**);
 [6R,23E,25S,(E)]-5-O-demetil-28-deoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil)-6,28-
 epoxi-23-hidroxi-milbemicina B (**nemadectina**); y
 [6R,23E,25S,(E)]-5-O-demetil-28-deoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil-6,28-
 epoxi-23-metoxiimino)milbemicina B (**moxidectina**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I
 W es O;
 X trifluorometoxi y está en la posición 4;

1795

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

R y R₁ son cada uno H

Para demostrar el efecto sinérgico en términos de porcentaje de control de la mezcla de espinosad (**lactona macrocíclica**) con el compuesto Ia, se utilizó la ecuación de Colby (Colby, S. R., 1967, Calculating Synergistic and Antagonistic Responses in Herbicide Combinations, *Weeds*, 15, 20-22

$E = XY/100$, en donde X y Y representan a los compañeros de mezcla

Cuando se observa un efecto de control combinado que es mayor que el control combinado esperado (E), entonces el efecto combinado es sinérgico.

1. Control de la mosca de la fruta del Mediterráneo

Para evaluar el control de la mosca de la fruta del Mediterráneo (*Ceratitis capitata*), se usaron placas de microtítulo de 96 pozos las cuales contenían el alimento de los insectos y de 50 a 80 huevos de *C. capitata*. Se formularon el compuesto Ia, espinosad o mezclas de ambos compuestos, usando una solución que contenía 75% de agua y 25% de DMSO. Las diferentes concentraciones de los compuestos o mezclas formuladas se rociaron sobre el alimento de los insectos a un volumen de 5 uL usando un microatomizador. Se manejaron dos réplicas.

Para las mezclas experimentales en estas evaluaciones, se mezclaron volúmenes idénticos de los dos agentes de mezcla a las concentraciones deseadas respectivamente. Tras la aplicación, se incubaron las placas de microtítulo a $28 \pm 1^{\circ}\text{C}$, $80 \pm 5\%$ de humedad relativa (HR) durante 5 días. Posteriormente, se evaluó la mortalidad de los huevos y las larvas de manera visual.

En la tabla 1 se encuentran los resultados de las evaluaciones para la mosca de la fruta del Mediterráneo:

Tabla 1

MOSCA DE LA FRUTA DEL MEDITERRÁNEO	PPM	PROMEDIO (% CONTROL)
Control	0+0	0
Compuesto Ia	1+0	0
Spinosad	0+10	0
Compuesto Ia + espinosad	0.3 + 1	75*

2. Control del gusano del tabaco

Para evaluar el control del gusano del tabaco (*Heliothis virescens*) se usaron placas de microtítulo de 96 pozos que contenían el alimento de los insectos y de 15 a 25 huevos de *H. virescens*. Se formuló El compuesto Ia, espinosad o mezclas de ambos compuestos usando una solución que contenía 75% de agua y 25% de DMSO. Las diferentes concentraciones de los compuestos o mezclas formuladas se rociaron sobre el alimento de los insectos a un volumen de 10 uL usando un microatomizador. Se manejaron dos réplicas.

Para las mezclas experimentales en estas evaluaciones, se mezclaron volúmenes idénticos de los dos agentes de mezcla a las concentraciones deseadas respectivamente. Tras la aplicación, se incubaron las placas de microtítulo a 28 ± 1°C, 80 ± 5% de humedad relativa (HR) durante 5 días. Posteriormente, se evaluó la mortalidad de los huevos y las larvas de manera visual.

En la tabla 2 se encuentran los resultados de las evaluaciones para el gusano del tabaco:

Tabla 2

GUSANO DEL TABACO	PPM	PROMEDIO (% CONTROL)
Control	0+0	0
Compuesto Ia	0.1+0	0
Spinosad	0+0.3	0
Compuesto Ia + espinosad	0.03 + 0.3	100*

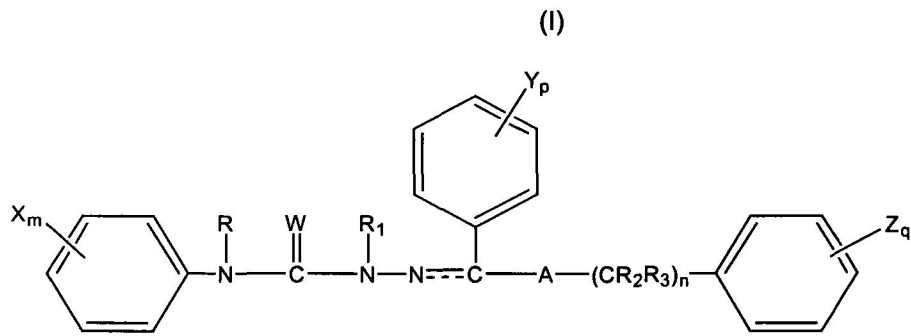
* Efecto de control sinérgico de acuerdo con la ecuación de Colby

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 E		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Priodidad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLORED A RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LACTONA MACROCÍCLICA			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆ o sulfonilo;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxycarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarbonilo C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxycarbonilo C₁-C₆; alquilsulfonilo C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆.

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno más compuestos de lactona macrocíclica seleccionados del grupo consistente en:

Espinosad;

mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-6'-[(S)-sec-butil]-21,24-dihidroxi-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-4-O-(2,6-dideoxi-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosil)-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosido y (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-21,22-dihidroxi-6'-isopropil-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]] pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-4-O-(2,6-dideoxi-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosil)-3-O-metil- α -L-arabino-hexopiranosido (**avermectina**);

mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-6'-[(S)-sec-butil]-21,24-dihidroxi-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-3-O-metil-4-O-(2,4,6-trideoxi-3-O-metil-4-metilamino- α -L-lixo-hexapiranosil)- α -L-arabino-hexapiranosido y (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6S,6'R,8R,12S,13S,20R,21R,24S)-21,24-dihidroxi-6'-isopropil-5',11,13,22-tetrametil-2-oxo-(3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno)-6-espiro-2'-(5',6'-dihidro-2'H-piran)-12-il 2,6-dideoxi-3-O-metil-4-O-(2,4,6-trideoxi-3-O-metil-4-metilamino- α -L-lixo-hexapiranosil)- α -L-arabino-hexapiranosido (**emamectina**);

mezcla de (10E,14E,16E,22Z)-

(1R,4S,5'S,6R,6'R,8R,13R,20R,21R,24S)-6'-etil-21,24-dihidroxi-5',11,13,22-tetrametil-3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno-6-espiro-2'-tetrahidropiran-2-ona y (10E,14E,16E,22Z)-(1R,4S,5'S,6R,6'R,8R,13R,20R,21R,24S)-21,24-dihidroxi-5',6',11,13,22-pentametil-3,7,19-trioxatetraciclo[15.6.1.1^{4,8}.0^{20,24}]]pentacosa-10,14,16,22-tetraeno-6-espiro-2'-tetrahidropiran-2-ona en la proporción 7 a 3 (**milbemectina**);

[6R,23E,25S,(E)]-5-O-demetil-28-deoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil)-6,28-epoxi-23-hidroxi-milbemicina B (**nemadectina**); y

[6R,23E,25S,(E)]-5-O-demetil-28-deoxi-25-(1,3-dimetil-1-butenil)-6,28-epoxi-23-metoxiimino)milbemicina B (**moxidectina**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica.

1799

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES****TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS**PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____(21) N° de solicitud: **00-017.310 E**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

(54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LACTONA MACROCÍCLICA**

1860



Industria y Comercio

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA

PATENTE DE INVENCION ____ **PCT** ☒ **MODELO DE UTILIDAD** ____ **DISEÑO INDUSTRIAL** ____

(21) N° de solicitud: **00-017.310 E**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s):

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Aporoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

FIGURA CARACTERISTICA

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de lactona macrocíclica.

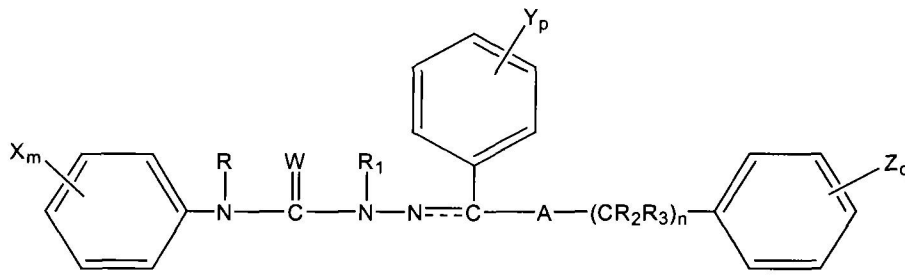
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310F

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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

y la configuración de línea punteada

$C \equiv N$

representa un doble enlace;
o un esteroisómero del mismo; y
uno más compuestos antagonistas de GABA seleccionados del grupo
conformado por:

(RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibenzil (1RS,3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-
diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**fipronil**); y
(1,4,5,6,7,7-hexacloro-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ilenobismetileno)sulfito
(**endosulfón**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio
neuronal en combinación con uno o más de los compuestos
antagonistas de GABA en una relación de 1 parte en peso del
antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se
definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o
más de los compuestos antagonistas de GABA.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la
fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

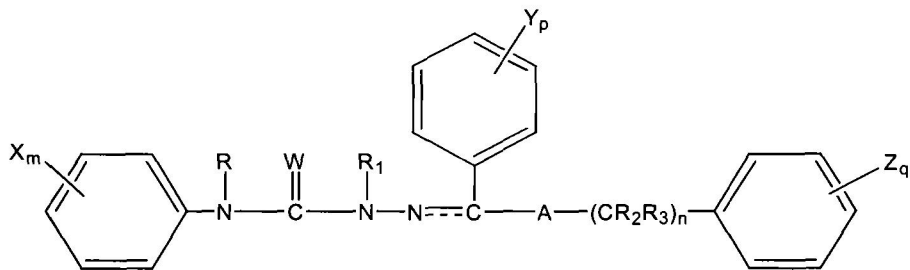
R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 F 22) Fecha de solicitud: 09-03-00 (30) Prioridad (31) <i>No. Prioridad</i> (32) <i>Fecha</i> (33) <i>País</i> 60/124,306 12-03-99 US 60/158,201 07-10-99 US		(51) Int Cl: A01N (71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION (72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi (74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO ANTAGONISTA DE GABA			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S:

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆ o sulfonilo;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarbonilo C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxicarbonilo C₁-C₆; alquilsulfonilo C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆,

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno más compuestos antagonistas de GABA seleccionados del grupo conformado por:

(RS)- α -ciano-4-fluoro-3-fenoxibenzil (1RS,3RS;1RS,3SR)-3-(2,2-diclorovinil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato (**fipronil**); y

(1,4,5,6,7,7-hexacloro-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ilenobismetileno)sulfito (**endosulfón**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos antagonistas de GABA en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos antagonistas de GABA.

1805

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO**DIVISION DE NUEVAS CREACIONES****TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS**PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____(21) N° de solicitud: **00-017.310 F**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

(54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO ANTAGONISTA DE GABA**

1806

**Industria y Comercio**

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____
(21) N° de solicitud: **00-017.310 F** (22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s):

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional:

Fecha:

No. Publicación:

FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm

(54) Título:

**COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO
NEURONAL Y UN COMPUESTO ANTAGONISTA DE GABA**

(57) Resumen: **Reivindicación número 1.-**

un metileno propionato de amonio de
(1,4,5,6,7,7-hexaclaro-8,9,10-trinorborn-5-en-2,3-ileno bismetileno)sulfito
(**endosulfón**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en
combinación con uno o más de los compuestos antagonistas de GABA en una

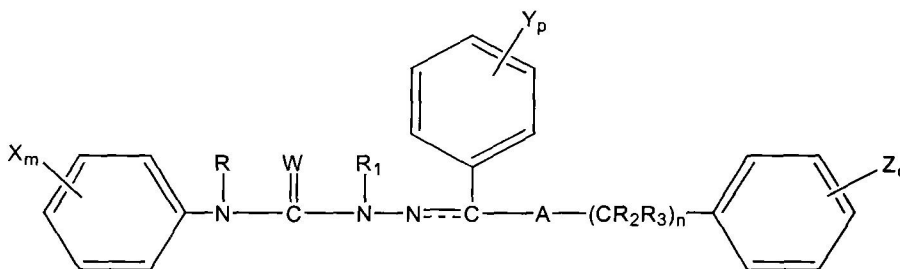
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310G

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxycarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , o haloalquiltio C_1-C_6 ;

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

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno más compuestos de ligando receptor de acetilcolina seleccionados del grupo conformado por:

1-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-nitroimidazolidin-2-ilidenoamina

(**imidacloprid**); (E)-N¹-[(6-cloro-3-piridil-metil]-N²-ciano-N¹-

metilacetamida (**acetamiprid**); (E)-N-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-etil-N'-metil-2-nitrovinilidenodiamina (**nitenpiram**); y

3-(2-cloro-1,3-tiazol-5-ilmetil)-5-metil-1,3,5-oxadiazinan-4-ilideno(nitro)amina (**tiametoxam**).

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de ligando receptor de acetilcolina en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de ligando receptor de acetilcolina.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

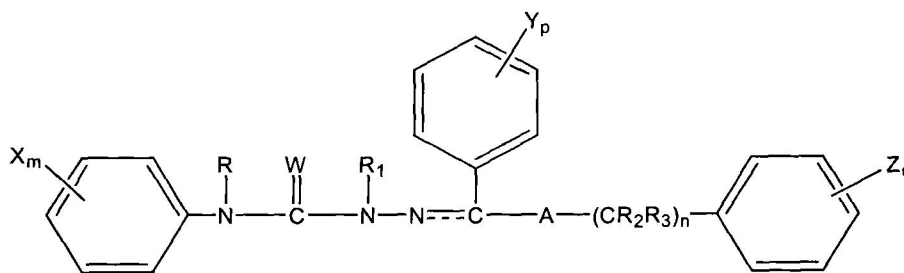
m, p y q son cada uno 1; y

R y R₁ son cada uno H

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 G		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LIGANDO RECEPTOR DE ACETILCOLINA			

Resumen:**Reivindicación número 1.-**

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , o haloalquiltio C_1-C_6 ;

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno más compuestos de ligando receptor de acetilcolina seleccionados del grupo conformado por:

1-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-nitroimidazolidin-2-ilidenoamina (**imidacloprid**); (E)-N¹-[(6-cloro-3-piridilmetil)-N²-ciano-N¹-metilacetamida (**acetamiprid**); (E)-N-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-etil-N'-metil-2-nitrovinilidenodiamina (**nitenpiram**); y

3-(2-cloro-1,3-tiazol-5-ilmetil)-5-metil-1,3,5-oxadiazinan-4-ilideno(nitro)amina (**tiametoxam**).

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de ligando receptor de acetilcolina en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a un valor de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de ligando receptor de acetilcolina.

1811

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____
(21) N° de solicitud: **00-017.310 G**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

(54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LIGANDO RECEPTOR DE ACETILCOLINA**



Industria y Comercio

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA

PATENTE DE INVENCION

PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD

DISEÑO INDUSTRIAL

(21) N° de solicitud: **00-017.310 G**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s):

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

(74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad

(31) *No. Prioridad*

(32)

Fecha

(33)

País

60/124,306

12-03-99

US

60/158,201

07-10-99

US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud *PCT/*

(87) Publicación internacional:

Fecha:

No. Publicación:

**FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm**

(54) Título:

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE LIGANDO RECEPTOR DE ACETILCOLINA

(57) Resumen: **Reivindicación número 1.-**

3-(2-cloro-1,3-diazol-5-il)-5-metil-5,6,6-trimetil-3,4-dihidro-2H-piridin-2-one

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de ligando receptor de acetilcolina en una relación de 1 parte en peso

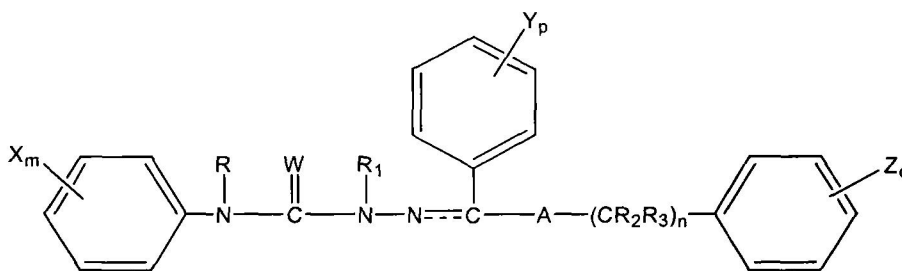
DIVISIONAL

**WYETH HOLDINGS
CORPORATION**

EXPEDIENTE No. 00-017.310H

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



(I)

Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno; alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alqueno C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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 , alqueno C_2-C_6 , alquino 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_{12} y R_{13} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;
o un esteroisómero del mismo; y
uno o más compuestos de formamidina seleccionados del grupo
consistente en:

N-metilbis(2,4-xililiminometil)amina (**amitraz**);

N²-(4-cloro-o-tolil)-N¹,N¹-dimetilformamidina (**clordimeform**); y

N'-(4-cloro-2-metilfenil)-N,N-dimetilmetanimidamida (**clorfenamidina**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de formamidina en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a una cantidad de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de formamidina.

2. La composición de acuerdo con la reivindicación 1, en donde en la fórmula I

W es O;

X es trifluorometoxi y está en la posición 4;

Y es trifluorometilo y está en la posición 3;

Z es CN y está en la posición 4

A es CH₂;

n es O;

m, p y q son cada uno 1; y

R y R₁ son cada uno H

ANEXO

Para evaluar el control del gusano del tabaco (*Heliothis virescens*) se usaron placas de microtítulo de 96 pozos que contenían el alimento de los insectos y de 15 a 25 huevos de *H. virescens*. Se formuló El compuesto Ia, amitraz o mezclas de ambos compuestos usando una solución que contenía 75% de agua y 25% de DMSO. Las diferentes concentraciones de los compuestos o mezclas formuladas se rociaron sobre el alimento de los insectos a un volumen de 10 uL usando un microatomizador. Se manejaron dos réplicas.

Para las mezclas experimentales en estas evaluaciones, se mezclaron volúmenes idénticos de los dos agentes de mezcla a las concentraciones deseadas respectivamente. Tras la aplicación, se incubaron las placas de microtítulo a 28 ± 1°C, 80 ± 5% de humedad relativa (HR) durante 5 días. Posteriormente, se evaluó la mortalidad de los huevos y las larvas de manera visual.

La presencia de un efecto sinérgico en términos de porcentaje de control, entre los dos compañeros de mezcla, se determinó usando la ecuación de Colby (Colby, S. R., 1967, Calculating Synergistic and Antagonistic Responses in Herbicide Combinations, *Weeds*, 15, 20-22

$E = XY/100$, en donde X y Y representan a los compañeros de mezcla

Cuando se observa un efecto de control combinado que es mayor que el esperado (E), entonces el efecto combinado es sinérgico.

En la tabla 1 se encuentran los resultados de las evaluaciones realizadas:

Tabla 1

GUSANO DEL TABACO	PPM	PROMEDIO (% CONTROL)
Control	0+0	0
Compuesto Ia	0.3+0	0
amitraz	0+300	0
Compuesto Ia + amitraz	0.3 + 300	75*

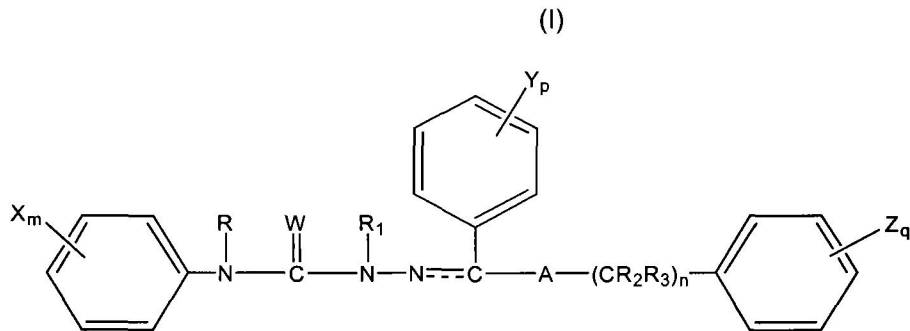
* Efecto de control sinérgico de acuerdo con la ecuación de Colby

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION	
(21) N° de solicitud: 00-017.310 H		(51) Int Cl: A01N	
22) Fecha de solicitud: 09-03-00		(71) Solicitante(s) WYETH HOLDINGS CORPORATION	
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US
		(72) Inventor(es) Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi	
		(74) Apoderado: ALICIA LLOREDA RICAURTE	
(54) Título: COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE FORMAMIDINA			

Resumen:

Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



Donde

A es CR₄R₅ o NR₆;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO₂; alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆ o sulfoniloxi;

alcoxi C₁-C₆ no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

alcoxycarbonilo C₁-C₆; cicloalquilcarboniloxi C₃-C₆; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno; alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄;

aminocarboniloxi no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C₁-C₃;

alcoxycarboniloxi C₁-C₆; alquilsulfoniloxi C₁-C₆; alquenilo C₂-C₆ o NR₁₂R₁₃;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

R, R₁, R₂, R₃, R₄ y R₅ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄;

R₆ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, o haloalquiltio C₁-C₆,

R₁₂ y R₁₃ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆;
y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno o más compuestos de formamidina seleccionados del grupo consistente en:

N-metilbis(2,4-xililiminometil)amina (**amitraz**);

N²-(4-cloro-o-tolil)-N¹,N¹-dimetilformamidina (**clordimeform**); y

N'-(4-cloro-2-metilfenil)-N,N-dimetilmetanimidamida (**clorfenamidina**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de formamidina en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a una cantidad de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de formamidina.

1818


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

 PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

 (21) N° de solicitud: **00-017.310 H**

(22) Fecha de solicitud: 09-03-00

(51) Clasificación Internacional: A01N

(71) Solicitante(s)

WYETH HOLDINGS CORPORATION

(72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

 (74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

(85) Fecha límite inicio fase nacional:

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

 No. de solicitud **PCT/**

(87) Publicación internacional

Fecha:

N° publicación:

 (54) Título: **COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE FORMAMIDINA**



SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PATENTE DE INVENCION

PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD

DISEÑO INDUSTRIAL

21) N° de solicitud: **00-017.310 H** (22) Fecha de solicitud: 09-03-00

51) Clasificación Internacional: A01N

71) Solicitante(s):

WYETH HOLDINGS CORPORATION

72) Inventor(es): Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz, Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi-Sadeghi

74) Apoderado: **ALICIA LLOREDA RICAURTE**

30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	60/124,306	12-03-99	US
	60/158,201	07-10-99	US

FIGURA CARACTERISTICA
6 x 6 cm

85) Fecha límite inicio fase nacional:

86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

Fecha de presentación de la solicitud:

No. de solicitud PCT/

(87) Publicación internacional:

Fecha:

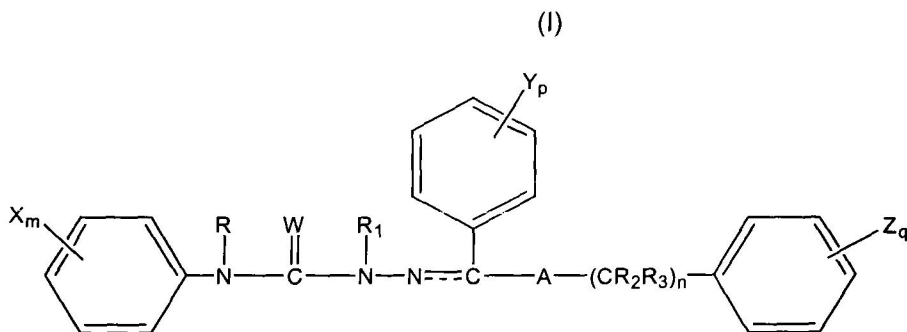
No. Publicación:

54) Título:

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINÉRGICAS QUE COMPRENDEN UN ANTAGONISTA DEL CANAL DE SODIO NEURONAL Y UN COMPUESTO DE FORMAMIDINA

57) Resumen: Reivindicación número 1.-

Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I):



Donde

A es CR_4R_5 o NR_6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 o sulfonilo;

alcoxi C_1-C_6 no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 o cicloalquilo C_3-C_6 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 ; fenilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos halógeno; alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarbonilo no sustituido o sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxicarbonilo C_1-C_6 ; alquilsulfonilo C_1-C_6 ; alquenilo C_2-C_6 o $NR_{12}R_{13}$;

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

n es un entero de 0, 1 ó 2;

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

y la configuración de línea punteada



representa un doble enlace;

o un esteroisómero del mismo; y

uno o más compuestos de formamidina seleccionados del grupo consistente en:

N-metilbis(2,4-xililiminometil)amina (**amitraz**);

N^2 -(4-cloro-o-tolil)- N^1, N^1 -dimetilformamidina (**clordimeform**); y

N' -(4-cloro-2-metilfenil)-N,N-dimetilmetanimidamida (**clorfenamidina**)

en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más de los compuestos de formamidina en una relación de 1 parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I) tal como se definió anteriormente a una cantidad de 0.01 a 100 partes en peso de uno o más de los compuestos de formamidina.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Radicación No. 00-17310
Clasificación Internacional (IPC): A01N47/08
Concepto Técnico No. 2955

Patente de Invención ☒ Patente de Modelo de Utilidad ☐
Vía Nacional ☒
Vía PCT (fase nacional) ☐ Cap. I ☐ Cap. II ☐
No. Sol. Internacional _____
Fecha de Presentación Internal. _____

Como resultado del examen definitivo, realizado con fundamento en el artículo 48 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le comunica:

1. Documentos estudiados

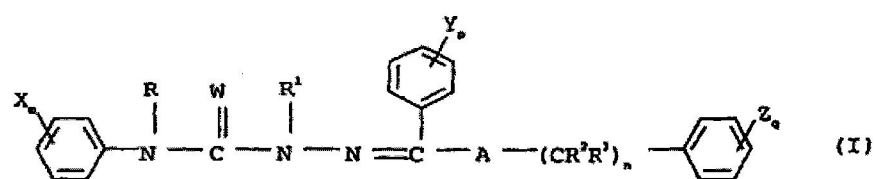
1.1. Descripción: Folios: 5 a 25 (como se radicó inicialmente)
Folios 181 a 191 (modificación).
1.2. Reivindicaciones: Folios 26 a 31 (como se radicó inicialmente)
Folios 253 a 257 (modificación)

1.3 Rta. del Solicitante: Folios: 1725 a 1741

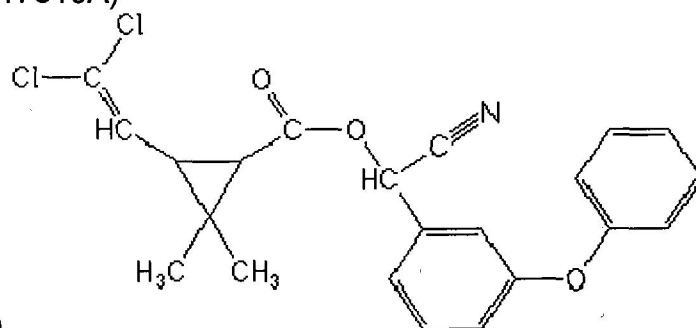
1.4 Prioridad Folios: 72 a 103 y folios 130 a 161
(12-03-99, US60/124,306)y (07-10-99,US60/158,201)

2 Modificaciones no aceptadas (artículo 34 D.486)

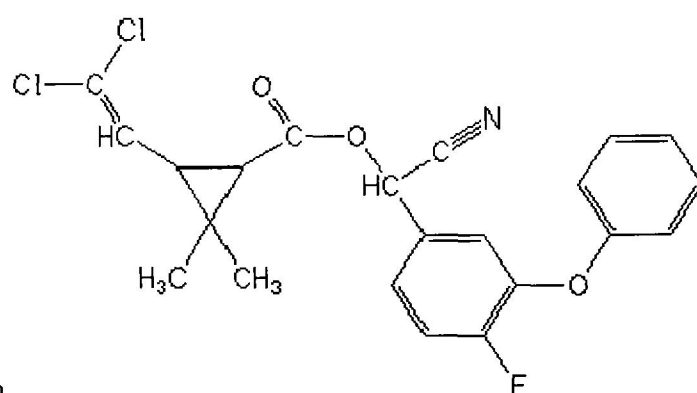
Con respecto a la division de la solicitud, memorial de respuesta folios 1725 a 1741 y a los nuevos capitulos reivindicatorios resultado de la división realizada por el interesado, no se aceptan en razón a que continuan presentando falta de unidad de invención, dado que se contemplan composiciones que comprenden un compuesto de fórmula I , en combianción con compuestos estructuralmente diferentes, como ya se había indicado en el concepto técnico anterior a pesar de que tengan en común una misma función química, estructuralmente son diferentes, lo cual se corrobora del simple hecho de comparar la estructura de los compuestos que se especifican en las correspondientes reivindicaciones , así en cada capitulo presentado se reivindica una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula (I)



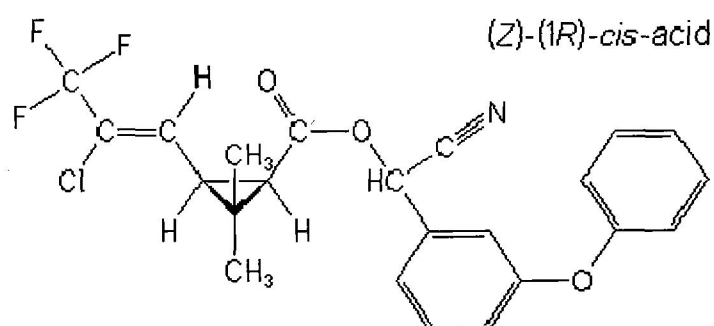
y uno o más compuestos de:
para (00-17310A)



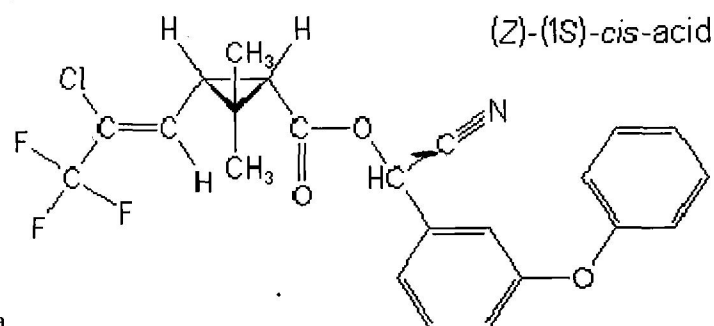
cipermetrina



ciflutrin

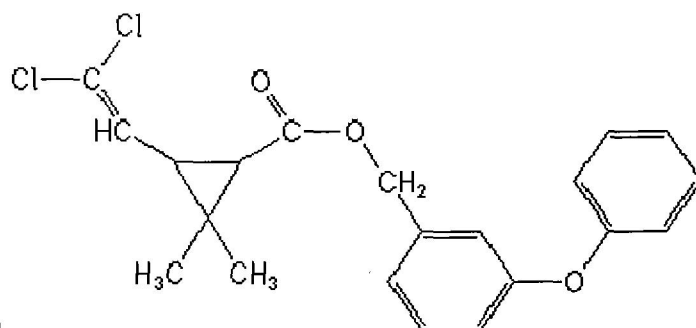


(Z)-(1R)-cis-acid

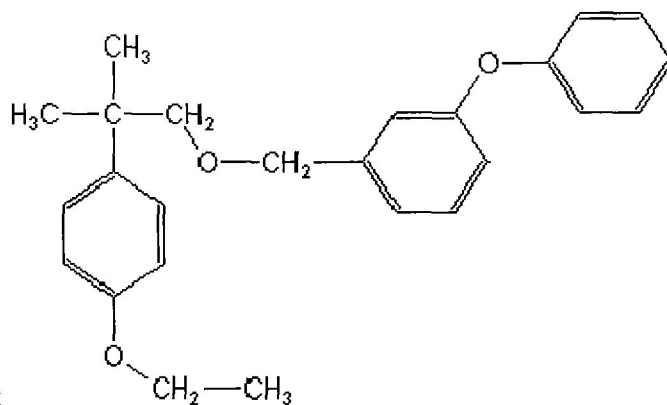


(Z)-(1S)-cis-acid

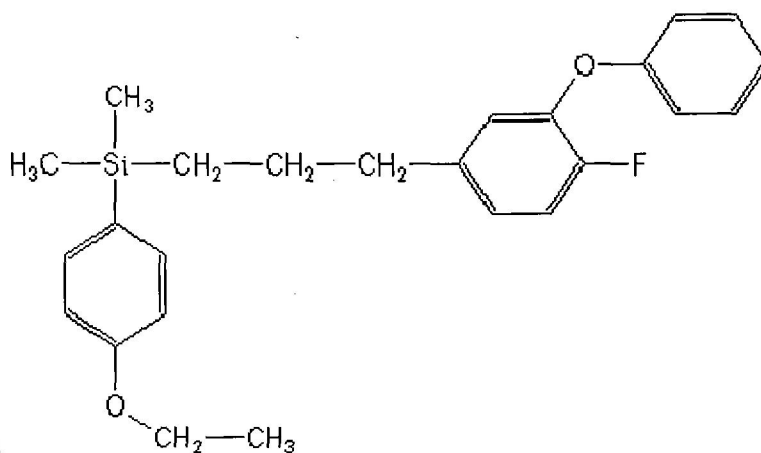
cihalotrina



permetrina



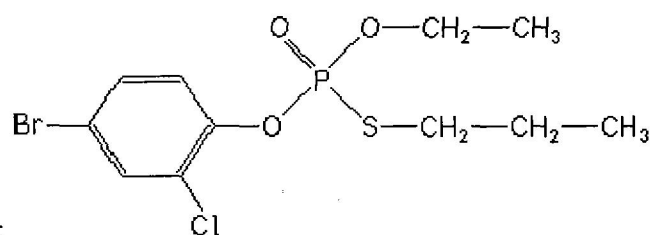
etofenprox



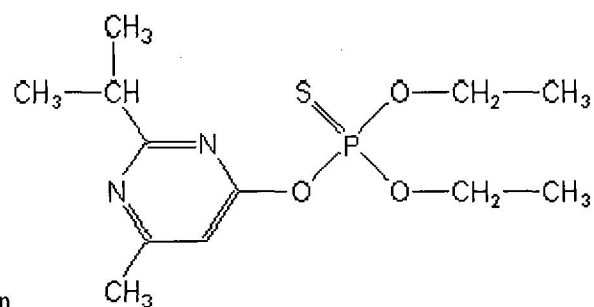
silafluofen

donde el etofenprox y el silafluofén difieren estructuralmente de los demás compuestos puesto que presentan en su estructura un anillo bencénico con sustituyentes en posición para, mientras que los otros compuestos poseen un ciclopropanocarboxilato.

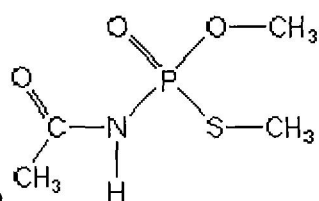
Para (00-17310C)



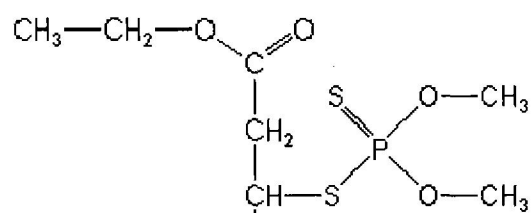
profenofos:



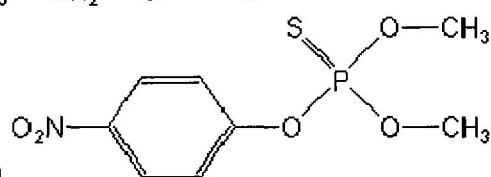
diazinon



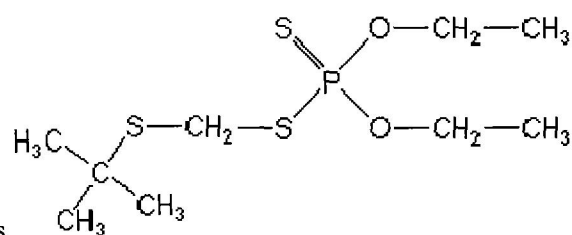
acefato



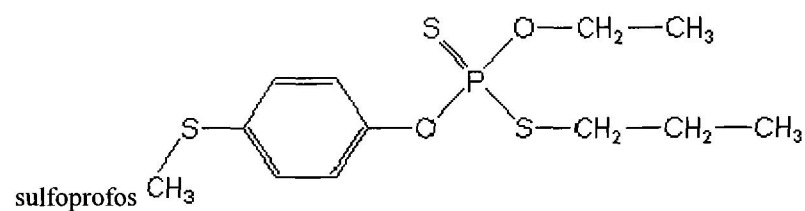
malation



metil-paration

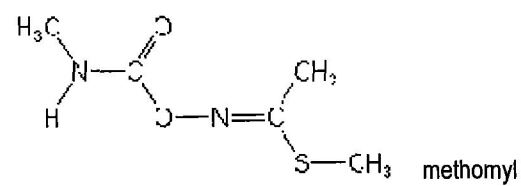


terbufos

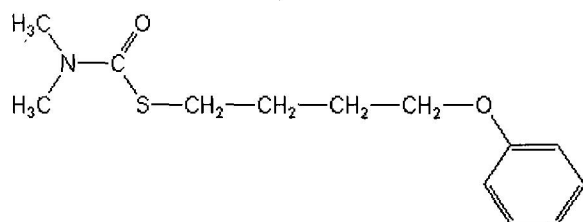
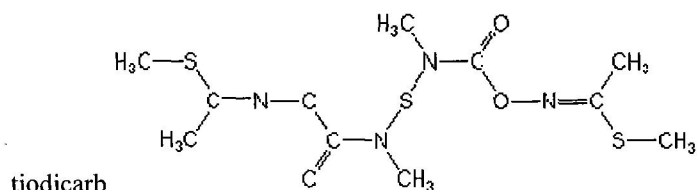


sulfoprofos

para (00-17310D)

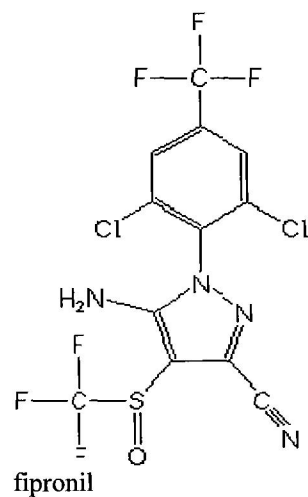
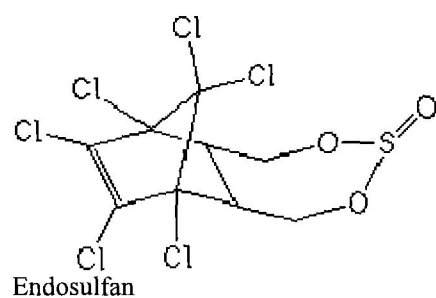


methomyl



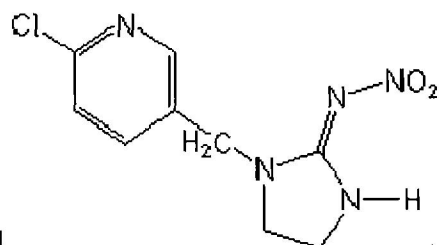
para (00-17310E) los compuestos de fórmula I con uno o más compuestos de lactona macrocíclica.

Para (00-17310F)

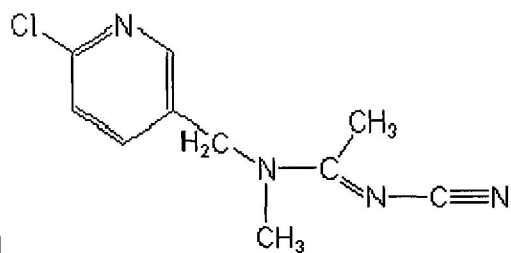


son compuestos con estructuras completamente diferentes donde el endosulfan posee una estructura tricyclic condensada, mientras que el fipronil corresponde a un aril pirazol, que no posee ciclos condensados

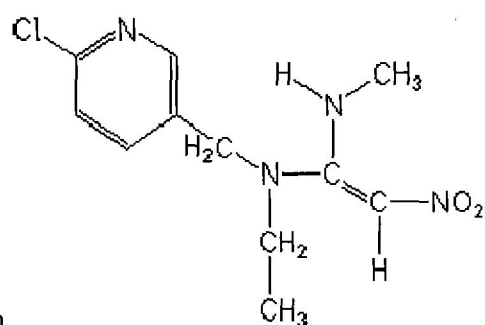
para (00-17310G)



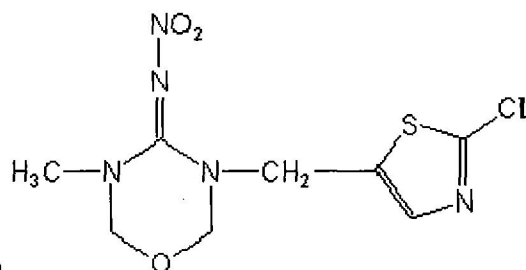
imidacloprid



acetamiprid



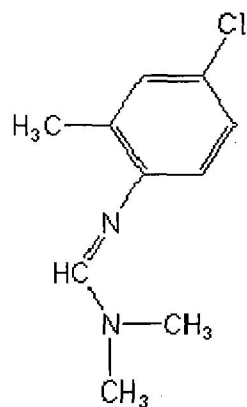
nitenpiram



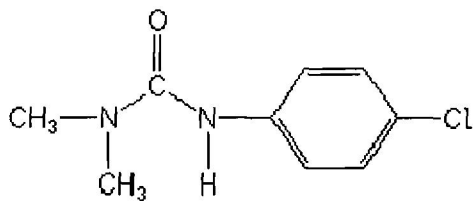
tiametoxam

el tiametoxan comprende una estructura completamente diferente dado que tiene un heterocilo de cinco miembros con sustituyente cloro unido a una nitro-oxadiazinimina, mientras que en los otros compuestos se tiene una cloropiridina

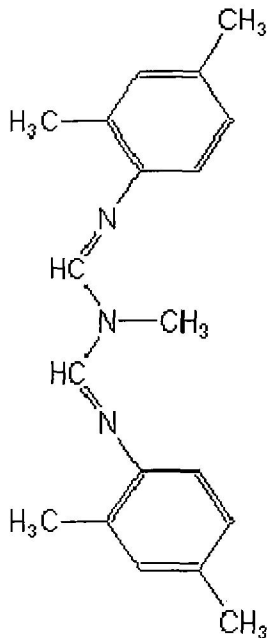
para (00-17310H)



clordimeform



Clorfenamidina



amitraz

clorfenamidina corresponde a un compuesto del tipo de las fenil-ureas, mientras que el amitraz y el clordimeform son compuestos del tipo de las formamidinas. Además la forma como se presenta la reivindicación independiente conduce a multiples composiciones insecticidas dado que se pueden combinar compuestos de fórmula I, con cada uno de los correspondientes compuestos seleccionados para tal efecto, o con mezclas de los mismos en razón a que se indica que se puede realizar con “uno o más compuestos de..” De otra parte, como ya se había expresado en el concepto técnico anterior, no se encuentra suficiente sustento técnico en el capítulo descriptivo que demuestre que toda esa amplia gama de posibles mezclas, de acuerdo a lo reivindicado, presente efecto sinérgico, los ejemplos que se muestran no son representativos frente a las posibles mezclas resultantes, de acuerdo con el contenido de las reivindicaciones.

3. Análisis de la Prioridad

- La materia comprendida en la solicitud corresponde a la materia contenida en las prioridades reivindicadas.

4. Objeto de la invención

- Título de la solicitud: Composiciones insecticidas sinérgicas que comprenden un antagonista del canal de sodio neuronal y un insecticida.
- El objeto de la solicitud comprendido en las reivindicaciones N°s 1 a 6 consiste en: Una composición insecticida que comprende un antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I y uno o más compuestos

seleccionados del grupo I: (1) compuestos piretroides, (2) compuestos tipo piretroide, (3) nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, (4) compuestos de organofosfato; (5) compuestos de carbamato, (6) compuestos de formamidina, (7) compuestos de lactona macrocíclica, (8) compuestos de amidinohidrazona; (9) compuestos antagonistas de GABA; y (10) compuestos de ligando de receptor de acetilcolina; en una cantidad sinérgicamente activa del antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con uno o más compuestos seleccionados entre el grupo I en una relación de una parte en peso del antagonista del canal de sodio neuronal a 0,01-100 partes en peso de los compuestos seleccionados del grupo (I).

- (reivindicaciones 7 a 10): Método para el control de insectos que comprende poner en contacto dicho insecto con una de las composiciones reivindicadas.y,
- 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 la composición.

El problema planteado en esta solicitud es la necesidad de composiciones sinérgicas con alto efecto controlador y poco impacto negativo en el medio ambiente

Para solucionar este problema técnico la solicitud en estudio proporciona composiciones que contienen como ingrediente activo un antagonista del canal de sodio neuronal y un compuesto seleccionado del grupo de compuestos piretroides, (2) compuestos tipo piretroide, (3) nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, (4) compuestos de organofosfato; (5) compuestos de carbamato, (6) compuestos de formamidina, (7) compuestos de lactona macrocíclica, (8) compuestos de amidinohidrazona; (9) compuestos antagonistas de GABA; y (10) compuestos de ligando de receptor de acetilcolina;

- Clasificación Internacional de Patentes A01N47/28.

5. De la solicitud de Patente (según el caso)

5.1 Descripción (artículo 28 D. 486)

- En el capítulo descriptivo no existe el suficiente sustento técnico que demuestre que ese ilimitado numero de mezclas que se pretende proteger presente sinergismo.

5.2 Reivindicaciones (artículo 30 D 486)

En razón a que no se aceptan las solicitudes divisionales, de acuerdo a lo expuesto en el numeral (2), se reitera nuevamente lo dicho en los conceptos técnicos 381 de marzo 16 de 2006 y 1485 de 28 de septiembre de 2006, por lo tanto el capítulo reivindicatorio (folios 253 a 257) continua presentando los mismos defectos, de manera que la reivindicación 1, es muy general por cuanto no delimita el alcance de la invención puesto que abarca diez grupos de compuestos que corresponden a funciones químicas diferentes y donde no se especifican los compuestos. Tampoco existe suficiente sustento en el capítulo descriptivo que permita

producto de los compuestos que se combinan y de las propiedades de los mismos.

- En materia de patentes para que exista un único concepto común inventivo, el elemento novedoso e inventivo debe estar presente en todas las reivindicaciones, así como también en el caso de las mezclas en cada una de ellas, de manera que debería existir dicho elemento novedoso e inventivo en todas las mezclas, así que los compuestos de fórmula I que corresponden al elemento común para todas las mezclas no son nuevos ni inventivos, por lo tanto no se está tomando cada compuesto independientemente, justamente se hace esta referencia en razón a se trata de mezclas muy diferentes con compuestos estructuralmente muy diferentes y aunque cada una podría ser nueva, la combinación de los compuestos que es lo nuevo e inventivo no es la misma para todas las mezclas, de otra parte no se puede afirmar como lo hace el interesado que el efecto sinérgico se constituya en el concepto común inventivo, porque si así fuera toda mezcla sinérgica podría ser contemplada en una única solicitud, es de anotar nuevamente que el efecto sinérgico es el resultado de la mezcla específica de dos o más componentes activos y lo que se protege como invención es la composición más no sus propiedades que son inherentes a la misma.
- No obstante el interesado en su memorial de respuesta manifiesta su deseo de dividir la solicitud, no se acepta dicha división por las razones expuestas en el numeral (2) del presente concepto; por tanto en cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 se recomienda negar la solicitud, en razón a que no se ajusto de acuerdo a los requerimientos.

7. Respuesta a los argumentos del solicitante:

En primer lugar no se ha rechazado la solicitud divisional por no cumplir los requisitos de patentabilidad, el rechazo como se explico en los conceptos técnicos correspondientes se debió a que no se realizó una división adecuada de la materia; ahora bien con el propósito de que el interesado subsanara tanto la falta de claridad como de unidad de invención, para poder continuar con el estudio de patentabilidad, se requirió en tres oportunidades al interesado (conceptos técnicos N°s 682 de jun16/05, 381 de 16 de mar/06 y 1485 de sep28/06), además se le aclaró y oriento con respecto de cómo ajustar su solicitud, y no fue posible obtener una respuesta adecuada. Por lo tanto el interesado tuvo varias oportunidades para presentar sus argumentos y para ajustar la solicitud de acuerdo a los requerimientos de claridad y unidad de invención, necesarios para poder continuar con el estudio de patentabilidad de cada una de las solicitudes resultantes de la división. Ahora bien en la oficina europea en el momento de realizar la búsqueda en el estado de la técnica, ésta se realizó parcialmente y se requirió al solicitante para el pago de las tasas correspondientes a las búsquedas restantes, dado que no había unidad de invención, después de lo cual se realizó el estudio de patentabilidad para determinar novedad, nivel inventivo y aplicación industrial. Una cosa es negar la solicitud con base en el artículo 45 que dice claramente que: "En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de 60 días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente." Como es el caso de la presente solicitud, donde no se dio cumplimiento a los requerimientos formulados con fundamento en dicho artículo; y otra negar la solicitud porque no reúne los

requisitos de patentabilidad como son la novedad, el nivel inventivo y la aplicación industrial, estudio que no fue posible realizar en el presente caso, dado que no se ajustó la solicitud de acuerdo a los requerimientos formulados.

Cabe anotar con respecto a los piretroides, que en el documento aportado por el interesado se expresa claramente que se entiende por "piretroides: denominación de compuestos sintéticos lipófilos con afinidad estructural próxima o lejana...." Y se indica también que " mediante variación de los componentes alcoholes y la introducción de halógenos se alejaron los piretroides en su estructura cada vez más de su modelo natural". De manera que el hecho de que se designen como piretroides no implica que sean estructuralmente similares.

- **Conclusión:**

En consecuencia y por todo lo expuesto anteriormente, se recomienda **Negar** las reivindicaciones: 1 a 10 (folios: 253 a 257)

Bogotá, D.C.30-09-08

CONCEPTO TECNICO No.2955	EXAMINADOR TECNICO Código No.202013
---------------------------------	---

1831



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 250 117**

(51) Int. Cl. 7: **A01N 47/34**

A01N 47/38

A01N 43/56

A01N 37/50

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Número de solicitud europea: **00914839 .6**

(86) Fecha de presentación : **07.03.2000**

(87) Número de publicación de la solicitud: **1198170**

(87) Fecha de publicación de la solicitud: **24.04.2002**

(54) Título: **Composiciones insecticidas sinérgicas.**

(30) Prioridad: **12.03.1999 US 124306 P**
07.10.1999 US 158201 P

(45) Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.04.2006

(45) Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.04.2006

(73) Titular/es: **BASF Aktiengesellschaft**
67056 Ludwigshafen, DE

(72) Inventor/es: **Treacy, Michael, Frank;**
Borysewicz, Raymond, Frank;
Schwinghammer, Kurt, Allen;
Rensner, Paul, Erich y
Oloumi-Sadeghi, Hassan

(74) Agente: **Carvajal y Urquijo, Isabel**

ES 2 250 117 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 00/05879**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see additional sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☒ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

1-10 (as far as they cover subject-matter relating to items 1, 2 or 5;
i.e. claims 1-4, 7-10 partially, claims 5 and 6 completely)
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☒ No protest accompanied the payment of additional search fees.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET**

International application No. PCT/US00/05879

1935

Re Item I

A discrepancy appears between the hand-written amended claim 1 and the version presented in the annexes : silafluofen is not disclosed in the latter, whereas it is in the hand-written version.

If according to the hand written amendments version, silafluofen is part of claim 1, then the amendments are acceptable (Art. 34(2)(b) PCT).

If effectively silafluofen is not part of claim 1, then the choice of pyrethroid/pyrethroid-type compounds as disclosed in present claim 1 represents a sub-group of pyrethroid/pyrethroid-type compounds which is itself associated to another sub-group (compounds I, II, IV and V out of I-V) : the resulting sub-group being not disclosed in the application as filed, said claim, and all the claims depending directly or indirectly and dealing with pyrethroid/pyrethroid-type compounds, namely claim 2, 3, 6, 7 would not be acceptable (Art. 34(2) PCT).

The other amendments are accepted since they meet the requirements of Art. 34(2)(b) PCT.

Re Item III

The subject matter of the compound claims 8-11 has not been searched. Nevertheless, in view of the documents cited in the description, the IPEA can raise a novelty objection (see point V).

Re Item IV

The application proposes to combine a neuronal sodium channel antagonist of formula I, II, IV and V with different type of biocides (= group A) :

1. specific pyrethroid and pyrethroid type compounds
2. recombinant nucleopolyhedroviruses capable of expressing insect toxin
3. specific formamidines and amidinohydrazones

The compounds of these 3 groups are not structurally related and must have very different action mode.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. PCT/US00/05879

(Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.)

6. Additional observations, if necessary:

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non-obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

- ☐ the entire international application.
- ☒ claims Nos. 8-11 (all partially).

because:

- ☐ the said international application, or the said claims Nos. relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):
 - ☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):
 - ☐ the claims, or said claims Nos. are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.
 - ☒ no international search report has been established for the said claims Nos. 8-11.
2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:
- ☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.
 - ☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

- ☐ restricted the claims.
- ☒ paid additional fees.
- ☐ paid additional fees under protest.
- ☐ neither restricted nor paid additional fees.



US006479543B1

(12) **United States Patent**
Treacy et al.

(10) **Patent No.:** **US 6,479,543 B1**
(45) **Date of Patent:** **Nov. 12, 2002**

(54) **SYNERGISTIC INSECTICIDAL
COMPOSITIONS**

(75) Inventors: **Michael Frank Treacy**, Newtown, PA
(US); **Raymond Frank Borysewicz**,
Hamilton Square, NJ (US); **Kurt Allen**
Schwinghammer, Yardley, PA (US);
Paul E. Rensner, Yardley, PA (US);
Hassan Oloumi-Sadeghi, Yardley, PA
(US)

(73) Assignee: **BASF Aktiengesellschaft**,
Ludwigshafen (DE)

(*) Notice: Subject to any disclaimer, the term of this
patent is extended or adjusted under 35
U.S.C. 154(b) by 0 days.

(21) Appl. No.: **09/521,987**

(22) Filed: **Mar. 9, 2000**

Related U.S. Application Data

(60) Provisional application No. 60/158,201, filed on Oct. 7,
1999, and provisional application No. 60/124,306, filed on
Mar. 12, 1999.

(51) Int. Cl.⁷ **A01N 47/34; A01N 9/12;**
C07C 281/14

(52) U.S. Cl. **514/522; 514/522; 514/521;**
514/590; 564/290; 558/417

(58) Field of Search 514/590, 272,
514/522, 521; 564/290; 558/417

(56) **References Cited**

U.S. PATENT DOCUMENTS

4,663,341 A	5/1987	Jacobson	514/403
5,116,850 A	5/1992	Stevenson	514/341
5,304,573 A	4/1994	Hino et al.	514/522
5,324,837 A	6/1994	Renga et al.	544/333
5,369,121 A	11/1994	Harrison et al.	514/403
5,462,938 A	10/1995	Annus et al.	514/229

5,543,573 A	8/1996	Takagi et al.	514/590
5,708,170 A	1/1998	Annis et al.	544/212
5,958,922 A	9/1999	McAuliffe et al.	

FOREIGN PATENT DOCUMENTS

WO WO 96/10560 4/1996

OTHER PUBLICATIONS

Harder, H. H. et al. Brighton Crop Protection Conference,
Pests Dis. (1996), (vol. 2), pp. 449-454, XP000925283.
Research Disclosure, GB, Industrial Opportunities Ltd.
Havant, No. 397, May 1, 1997, pp. 361-363, XP000726479.
Journal of Economic Entomology, vol. 90, No. 5, Oct. 1997,
pp. 1170-1180.

G. Payne, et al., Structure-Activity Relationships for the
Action of Dihydropyrazole Insecticides on Mouse Brain
Sodium Channels, Pesticide Biochemistry and Physiology,
vol. 60, No. 3, Aug. 1, 1998, pp. 177-185.

K. Wing, et al., A Novel Oxadiazine Insecticide is Bioacti-
vated in Lepidopteran Larvae, Archives of Insect Biochem-
istry and Physiology, 37:91-103 (1998), pp. 91-103.

Primary Examiner—Sabiha Qazi

(74) *Attorney, Agent, or Firm*—Keil & Weinkauff

(57) **ABSTRACT**

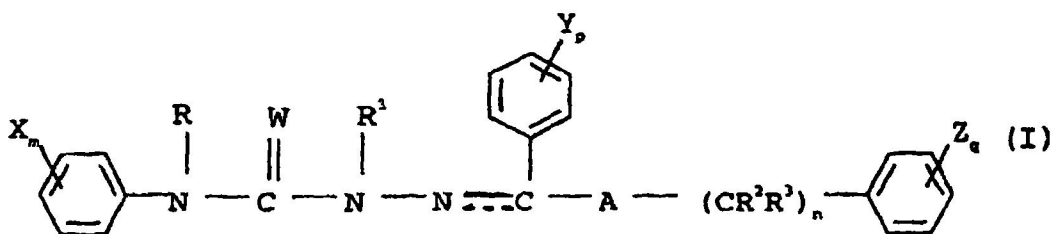
The present invention provides a synergistic insecticidal
composition comprising as essential active ingredients a
neuronal sodium channel antagonist in combination with
one or more compounds selected from the group consisting
of pyrethroids, pyrethroid-type compounds, recombinant
nucleopolyhedroviruses capable of expressing an insect
toxin, organophosphates, carbamates, formamidines, mac-
rocyclic lactones, amidinohydrazones, GABA antagonists
and acetylcholine receptor ligands.

Also provided are methods for synergistic insect control and
crop protection.

9 Claims, No Drawings

REIVINDICACIONES

1. Una composición insecticida que comprende un antagonista de los canales de sodio neuronales de fórmula I:



en donde

A es CR^4R^5 o NR^6 ;

W es O o S;

X, Y y Z son cada uno independientemente H; halógeno; OH; CN; NO_2 ; alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenil(C_2-C_6)oxi o sulfoniloxi;

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

alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, cicloalquil(C_3-C_6)carboniloxi, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 ;

aminocarboniloxi opcionalmente sustituido con uno o más grupos alquilo C_1-C_3 ;

alcoxi(C_1-C_6)carboniloxi; alquil(C_1-C_6)sulfoniloxi;

alquenilo C_2-C_6 ; o NR^7R^8 ;

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

n es un entero de 0, 1 o 2;

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 , alquil(C_1-C_6)carbonilo, alcoxi(C_1-C_6)carbonilo, alquil(C_1-C_6)tio o haloalquil(C_1-C_6)tio;

R^7 y R^8 son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_6 ;

y la configuración de línea de puntos $C \cdots N$ representa un enlace doble o un enlace sencillo (es decir; C-N o C=N);

o un estereoisómero de los mismos,

y uno o más compuestos seleccionados del Grupo A:

1) compuestos de piretroides;

2) compuestos de tipo piretroide;

3) nucleopolihedrovirus capaces de expresar una toxina de un insecto;

4) compuestos de organofosfato;

5) compuestos de carbamato;

6) compuestos de formamidina;

7) compuestos de lactona macrocíclica;

8) compuestos de amidinohidrazona;

5 9) compuestos antagonistas de GABA; y

10) compuestos ligandos de receptores de acetilcolina,

en cantidades sinérgicamente activas.

10

2. Una composición según la reivindicación 1, en donde, en la fórmula I,

W es O;

15

X es trifluormetoxi;

Y es trifluormetilo;

Z es CN;

20

A es CH₂;

n es 0;

25

m, p y q son cada uno 1;

R y R¹ son cada uno H;

y la configuración de la línea de puntos C --- N representa un enlace doble.

30

3. Una composición según la reivindicación 2, en donde el compuesto o los compuestos seleccionados del Grupo A son cypermethrin, cyhalomethrin, cyfluthrin, permethrin, ethofenprox, silafluofen, fipronil, endosulfon, imidacloprid, acetamiprid, nitepyram, thiamethoxam, profenofos, acephate, sulprofos, malathion, diazinon, methyl parathion, terbufos, methonil, thiodicarb, fenothiocarb, amitraz, chlordimeform, chlorfenamidine, avermectin, emamectin, milbemectin, nemadectin o moxidectin.

35

4. Una composición según la reivindicación 2, en donde el compuesto o los compuestos seleccionados del Grupo A consisten en hydramethylnon.

40

5. Una composición de cebo que contiene, en peso, de 0,01 a 20% de una antagonista de los canales de sodio neuronales de fórmula I como se ha definido en la reivindicación 1 en combinación con hydramethylnon.

6. Una composición según las reivindicaciones 1 a 4, en donde la relación de los ingredientes activos es de 1 parte en peso de un antagonista de los canales de sodio neuronales de fórmula I como se ha definido en la reivindicación 1 por 0,01 a 100 partes en peso de uno o más compuestos del Grupo A como se ha definido en la reivindicación 1.

45

7. Un método para el control de insectos que comprende poner en contacto dicho insecto con una composición según las reivindicaciones 1 a 4.

50

8. Un método para proteger una planta frente a la infestación y ataque por insectos, que comprende aplicar al follaje o tallos de dicha planta una cantidad sinérgicamente eficaz de una composición según las reivindicaciones 1 a 4.

9. Uso de las composiciones según las reivindicaciones 1 a 6 para combatir insectos de los géneros de los Lepidópteros y Coleópteros.

55

10. Uso de las composiciones según las reivindicaciones 1 a 6 para el control de plagas higiénicas o plagas para la salud pública seleccionadas del grupo consistente en Dípteros, Himenópteros y Blattaria.

60

11. Uso de las composiciones según las reivindicaciones 1 a 6 para el control de insectos que se alimentan de la madera seleccionados del grupo consistente en Himenópteros, Isópteros y Coleópteros.

65



1840

①9

OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

①1 Número de publicación: **2 250 117**⑤1 Int. Cl.7: **A01N 47/34**

A01N 47/38

A01N 43/56

A01N 37/50

①2

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

⑧6 Número de solicitud europea: **00914839 .6**⑧6 Fecha de presentación : **07.03.2000**⑧7 Número de publicación de la solicitud: **1198170**⑧7 Fecha de publicación de la solicitud: **24.04.2002**⑤4 Título: **Composiciones insecticidas sinérgicas.**③0 Prioridad: **12.03.1999 US 124306 P**
07.10.1999 US 158201 P④5 Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.04.2006④5 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.04.2006⑦3 Titular/es: **BASF Aktiengesellschaft**
67056 Ludwigshafen, DE⑦2 Inventor/es: **Treacy, Michael, Frank;**
Borysewicz, Raymond, Frank;
Schwinghammer, Kurt, Allen;
Rensner, Paul, Erich y
Oloumi-Sadeghi, Hassan⑦4 Agente: **Carvajal y Urquijo, Isabel**

ES 2 250 117 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).