



00 17310

DE
IN

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00017310 00000033

Folios 35

Fecha (F40) 2000-03-09 16 43 53

Trasite : 002 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 411 PRESENTAC

Dependencia 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social AMERICAN CYANAMID COMPANY sociedad existente y organizada de conformidad con las leyes del Estado de Maine, Estados Unidos de América

No de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad

Estados Unidos de América

New Jersey

Five Giralda Farms, Madison, New Jersey 07940-0874,

Estados Unidos de América

Madison

Teléfono 1 973 6605000

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

Dirección y Domicilio

Ciudad

JOSE ANTONIO LLOREDA

Calle 72 No 5-83 Piso 6, Santafé de Bogotá, Colombia

BOGOTA

Teléfono 326 42 70

DATOS DEL INVENTOR

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

Identificación

Dirección

Ciudad

53 Sequoia Drive, Newtown, Pennsylvania 18940, 12 Albemarle Road,

Hamilton Square, New Jersey 08690, 1206 University Drive, Yardley,

Pennsylvania 19067, 1267 Woodthrush Court, Yardley, Pennsylvania 19067

y 1204 Goldenrod Court, Yardley, Pennsylvania 19067, Estados Unidos de América

Newtown, Hamilton Square y Yardley

Teléfono 1 973 6605000

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención "COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS"

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☒ NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

US

(32) Fecha

12-03-99

(31) No Solicitud

60/124,306

US

07-10-99

60/158,201

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

☐ 18 meses

a partir de la fecha de la presente Solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención proporciona 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 entre el grupo que consiste de piretroides, compuestos del tipo piretroide, nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, organofosfatos, carbamatos, formamidas, lactonas macrocíclicas, amidinohidrazonas, antagonistas de GABA y ligandos de receptor de acetilcolina.

Además se proporcionan métodos para el control sinérgico de insectos y protección de cultivos.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

- | | |
|---|-------------------------------------|
| Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica | ☐ |
| Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la S I C 16.333 | ☒ |
| Recibo de la tasa respectiva \$608 000,00 | ☒ |
| Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación | ☐ |
| Si se reivindica prioridad Andina | |
| Copia dela primera solicitud | ☐ |
| Traducción oficial | ☐ |
| Si se reivindica prioridad Unionista. | |
| Copia certificada de la primera solicitud | ☐ |
| Nota Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior | |
| Traducción Simple | ☐ |
| Capítulo descriptivo | ☒ |
| Dibujos, planos necesarios | ☐ |
| Capítulo reivindicatorio | ☒ |
| Tarjeta archivo propietarios según formato | ☒ |
| Tarjeta archivo temático según formato | ☒ |
| Extracto para publicación según formato | ☒ |
| Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms | ☐ |
| Otros Documentos | ☐ |
| Nota Anexo información sobre la fuente normativa de reciprocidad y petición Reconocimiento Personería | ☒ |

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

FIRMA

NOMBRE JOSE ANTONIO LLOREDA

C C 17 159 681 de Bogotá TP No 10 784

RECIBO OFICIAL DE CAJA 14,722
FECHA MARZO 1 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
MIT 800176089- Radicacion 00017310 00000000 Folios 35
Fecha (CMD) 2000-03-09 16:43:53
Tramite 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No PAGO	Vr PAGO
LLORED A Y CIA S A	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	958158	5,164,900 00

***** CONCEPTO *****

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50003-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL DE PATENTE DE IN	608,000 00
		TOTAL	\$ 608,000 00

SOM SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No _____



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

ANEXO

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

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

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

- b) En el Artículo 4 del mencionado Anexo 1C, Aspectos de los Derechos de Propiedad Intelectual relacionados con el Comercio, del Acuerdo por el cual se establece la Organización Mundial de Comercio (OMC), el cual consagra el "Trato de la nación más favorecida" para los países Miembros del mismo.**
- c) En el Artículo 4 del Convenio de París, del cual ya era parte Colombia en el momento en que se presentaron las solicitudes cuyas prioridades ahora reivindico, con lo cual se cumple la reciprocidad exigida en el Artículo 12 de la Decisión 344 del Acuerdo de Cartagena para con solicitudes provenientes de los Países Miembros del Acuerdo de Cartagena.**

ANEXO

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



JOSE ANTONIO LLORED A

T P No 10 784

CODIGO 231

RESUMEN OBJETO Y FINALIDAD DE LA INVENCION

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS

La presente invención proporciona 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 entre el grupo que consiste de piretroides, compuestos del tipo piretroide, nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, organofosfatos, carbamatos, formamidinas, lactonas macrocíclicas, amidinohidrazonas, antagonistas de GABA y ligandos de receptor de acetilcolina

Además se proporcionan métodos para el control sinérgico de insectos y protección de cultivos

COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Las composiciones y agentes insecticidas se han desarrollado para el control de plagas de insectos, tales como plagas agrohortícolas, plagas higiénicas, o plagas que se alimentan de madera y en la practica se han usado como un agente simple o mixto Sin embargo, aun se están buscando composiciones para el control de insectos económicamente eficientes y ecológicamente seguras Las composiciones insecticidas que permiten reducidos Indices de dosificación efectivos, incrementada seguridad ambiental y menor incidencia de resistencia de insectos son sumamente deseables Si bien para una buena practica del manejo de plagas puede adoptarse la aplicación rotativa de agentes para el control de insectos que tienen diferentes modos de acción, este enfoque no necesadamente proporciona un control de insectos satisfactorio Ademas aun cuando se han estudiado combinaciones de agentes para el control de insectos, no siempre se ha hallado una alta accion sinérgica La obtencion de una composición insecticida que no demuestre resistencia cruzada a agentes insecticidas existentes, sin problemas de toxicidad y poco impacto negativo en el medioambiente es extremadamente difícil

Por lo tanto es un objetivo de esta invención proporcionar una composición insecticida sinérgica que demuestre un alto efecto controlador con concomitante reducido costo de producción de cultivos y reducida carga ambiental

Es otro objetivo de esta invención proporcionar métodos para el control de insectos sinérgico y mejorada proteccion de cultivos

SUMARIO DE LA INVENCION

La presente invencion proporciona una composici3n insecticida sin6rgica que comprende como ingredientes activos esenciales, una cantidad sin6rgicamente efectiva de un antagonista de canal de sodio neuronal, en combinacion con uno o m1s compuestos seleccionados entre el grupo que consiste de piretroides, compuestos del tipo piretroide nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto organofosfatos carbamatos, formamidinas, lactonas macroc3clicas, amidinohidrazonas, antagonistas de GABA (1cido gamma-aminobut3rico) y ligandos de receptor de acetilcolina

La presente invenci3n adem1s proporciona un m6todo para el control sin6rgico de insectos, que comprende poner en contacto dicho insecto con una cantidad sin6rgicamente efectiva de un antagonista de canal de sodio neuronal en combinacion con uno o mas compuestos seleccionados entre el grupo que consiste de piretroides, compuestos del tipo piretroide, nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto organofosfatos carbamatos, formamidinas lactonas macroc3clicas, amidinohidrazonas antagonistas de GABA y ligandos de receptor de acetilcolina

La presente invenci3n adem1s proporciona un m6todo para la mejorada proteccion de plantas contra la infestacion y ataque de insectos

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

Definiciones

"Compuesto ligando de receptor de acetilcolina", como se usa en esta solicitud, significa un compuesto que es capaz de enlazarse al sitio de receptor de acetilcolina

"Grupo A" como se usa en esta solicitud significa

- 1) compuestos piretroides
- 2) compuestos del 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, insecticidas

"Haloalquilo" como se usa en esta solicitud significa un grupo alquilo C_xH_{2x+1} que tiene 1 a $2x+1$ átomos de halogeno que pueden ser iguales o diferentes. De manera similar, los términos "haloalquenilo", "haloalquinilo", "haloalcoxi", "halofenilo" y similares, significan sustitución mono- a perhalógeno, en donde los halógenos pueden ser iguales o diferentes.

"Halógeno", como se usa en esta solicitud significa Cl, Br, I o F.

"Antagonista de canal de sodio neuronal" como se usa en esta solicitud significa un compuesto que es capaz de evitar la capacidad de una célula neuronal para transferir iones de sodio a través de la membrana celular.

"Compuestos del tipo piretroide", como se usa en esta solicitud, significa aquellos compuestos caracterizados por una porción arilo-fenoxibencilo ligada no ester.

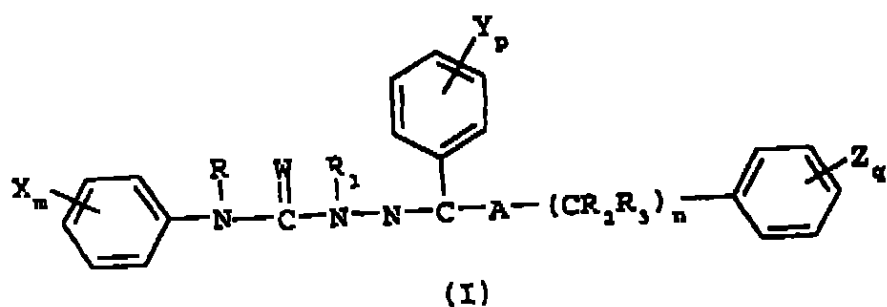
"Sinergismo" como se usa en esta solicitud significa una acción cooperativa encontrada en una combinación de dos o más componentes biológicamente

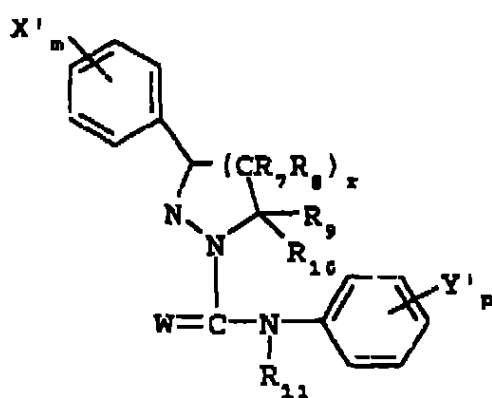
activos, en la cual la actividad combinada de los dos o mas componentes excede la suma de la actividad de cada componente solo

Sorprendentemente, ahora se ha descubierto que una composición que comprende una combinación de un antagonista de canal de sodio neuronal y un segundo ingrediente insecticida proporciona un control superior de insectos a niveles inferiores de los agentes activos combinados que lo que se puede lograr cuando el antagonista de canal de sodio neuronal o el segundo ingrediente insecticida se aplican solos

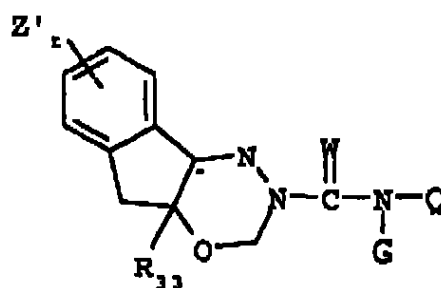
Como se afirma anteriormente, el termino antagonista de canal de sodio neuronal designa un compuesto que es capaz de evitar la capacidad de una célula neuronal para transferir iones de sodio a través de la membrana celular. Una célula neuronal así afectada es incapaz de dispararse, produciendo parálisis, y en ultima instancia mortalidad, en el huésped objetivo. Las descripciones de antagonistas de canal de sodio neuronal y su modo de acción pueden hallarse en *Pesticide Biochemistry and Physiology*, 60 177 - 185, o *Archives of Insect Biochemistry and Physiology*, 37 81 - 103

Los antagonistas de canal de sodio neuronal incluyen compuestos tales como aquellos que se describen en la U S 5 543 573, U S 5 708 170, U S 5 324 837 y U S 5 462 938 entre otras publicaciones. Ejemplares de los compuestos antagonistas de canal de sodio neuronal utiles en la composición de esta invención son aquellos compuestos que tienen la formula estructural





(II)



(III)

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 ,

alcoxicarbonilo C_1-C_6 , cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 , 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 ,

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 es un entero de 1 ó 2,

t es un entero de 1, 2, 3, o 4,

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,

R₇ y R₈ son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆ o fenilo opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆,

R₉ y R₁₀ son cada uno independientemente H, o alquilo C₁-C₄,

R₁₁ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₆, o haloalcovicarbonilo C₁-C₆,

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

G es H, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_uR₁₄, COR₁₅, CO₂R₁₆, fenilo o cicloalquilo C₃-C₆

alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_uR₁₇, COR₁₈, CO₂R₁₉, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, haloalquilo C₁-C₃, o haloalcoxi C₁-C₃

cicloalquilo C₃-C₆, o feniltio

Q es fenilo opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halógeno, CN, SCN, NO₂, S(O)_uR₂₀, alquilo C₁-C₄,

haloalquilo C₁-C₄, alcoxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, o NR₂₁R₂₂.

u es un entero de 0, 1 ó 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, y la configuración de línea punteada $C=N$ representa un enlace doble o un enlace simple (es decir $C-N$ o $C=N$), o

un estereoisomero de los mismos

Los antagonistas del canal de sodio neuronal preferidos adecuados para el uso en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula I, II ó III, en donde la configuración de línea punteada $C=N$ representa un enlace doble

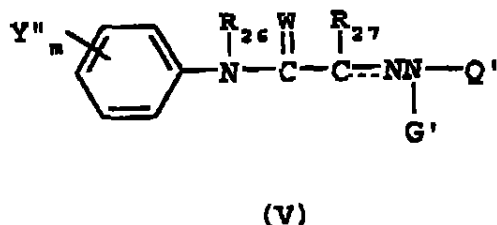
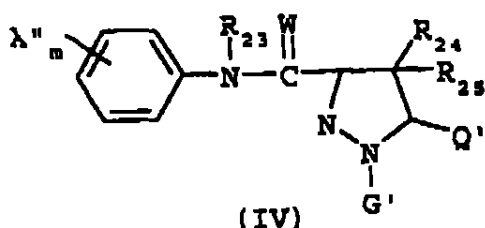
Los antagonistas del canal de sodio neuronal más preferidos adecuados para el uso en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula I o de fórmula III en donde la configuración de línea punteada representa un enlace doble

Los antagonistas del canal de sodio neuronal particularmente preferidos útiles en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula I o de fórmula III 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 C_1 , R_{33} y G son cada uno CO_2CH_3 , Q es p-(trifluorometoxi)fenilo, y la configuración de línea punteada

$C=N$ representa un enlace doble, o un estereoisomero de los mismos

Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal incluyen aquellos que se describen en la U.S. 5,116,850 y en la U.S. 5,304,573, entre

otras publicaciones Ejemplares de otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal adecuados para el uso en la composición de la invención son aquellos compuestos que tienen la fórmula estructural



en donde W es O o S

X'' e Y'' son cada uno independientemente H, halógeno, CN, SCN, alquilo C₁-C₈ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, NO₂, CN, alcoxi C₁-C₄, alquilio C₁-C₄, fenilo, halofenilo, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, o alcoxycarbonilo C₁-C₄,

alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, o haloalquilsulfonilo C₁-C₄,

alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, o NR_{2a}R_{2b},

m es un entero de 1, 2, 3, 4, ó 5,

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

un anillo heteroaromatico de 5 miembros que contiene uno o dos heteroatomos seleccionados entre 0 ó 1 átomos de oxígeno 0 ó 1 átomos de azufre y 0 1 o 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 5 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o mas grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X" o

un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene uno o dos heteroatomos seleccionados entre 0 o 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre, y 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 6 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o mas grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X",

Q es H, alquilo C₁-C₈ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno CN alcoxi C₁-C₃ alcoxicarbonilo C₁-C₆ o fenilo opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ o alquilsulfinilo C₁-C₄,

alquenilo C₂-C₆ alquinilo C₂-C₆, o fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes seleccionados entre X",

R₂₃ R₂₄, R₂₅, R₂₆ R₂₇ R₂₆ y R₂₈ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄, y la configuración de línea punteada $\text{C}\cdots\text{N}$ representa un enlace doble o un enlace simple (es decir, C-N o C=N), o

un estereoisomero de los mismos

Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal prefendos de la invención son aquellos compuestos de fórmula IV ó V en donde la configuración de línea punteada $\text{C}\cdots\text{N}$ representa un enlace doble

Otros compuestos antagonistas del canal de sodio neuronal prefendos adecuados para el uso en la composición de la invención son aquellos compuestos de fórmula IV ó V en donde W es O, X" e Y" son cada uno independientemente H o haloalquilo C₁-C₆, m es 1, R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ y R₂₇ son

cada uno H, G es fenilo opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno, Q es halofenilo o alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con un grupo fenilo o halofenilo, y la configuración de línea punteada $C=N$ representa un enlace doble, o un estereoisómero de los mismos

El segundo ingrediente activo de la composición insecticida de la invención incluye uno o mas compuestos seleccionados entre el Grupo A

1) compuestos piretroides que se saben son insecticidalmente activos, tales como cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina, permetrina o similares,

2) compuestos del tipo piretroide que se sabe son insecticidalmente activos tales como etofenprox, silaflunfen, o similares

3) nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto, con preferencia una neurotoxina de insecto, tal como toxina de insecto *Androctonus australis* (AaIT) por ejemplo, HzNPV-AaIT,

4) compuestos de organofosfato que se sabe son insecticidalmente activos tales como profenfos, acefato, sulprofos, malatión, diazinón, metil paratión, terbufós, o similares,

5) compuestos de carbamato que se sabe son insecticidalmente activos tales como metomil, tiodicarb, fenotiocarb, o similares,

6) compuestos de formamidina que se sabe son insecticidalmente activos tales como amitraz, clordimeform, hidrametilnón, clorfenamidina, o similares,

7) compuestos de lactona macrocíclica que se sabe son insecticidalmente activos tales como espinosad, avermectina, emamectina, milbemectina, nemadectina, moxidectina o similares,

8) compuestos de amidinohidrazona que se sabe son insecticidalmente activos, tales como hidrametilnón

9) compuestos antagonistas de GABA que se sabe son insecticidalmente efectivos tales como fipronil, endosulfán, o similares,

10) compuestos de ligandos de receptor de acetilcolina que se sabe son insecticidalmente efectivos tales como imidacloprid, acetamiprid nitenpiram, tiametoxam, o similares

Las descripciones de los compuestos comercialmente disponibles que se mencionan anteriormente se pueden hallar en The Pesticide Manual, 11va Edición, British Crop Protection Council (1997) entre otras publicaciones. Las descripciones de nucleopolihedrovirus recombinantes capaces de expresar una toxina de insecto incluyen Treacy y otros, Proceedings Beltwide Cotton Conference (1999) páginas 1076 - 1083

Las composiciones prefendas de la invención son aquellas composiciones que tienen un compuesto antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I o de fórmula III, en combinación con uno o mas compuestos seleccionados entre el Grupo A

Las composiciones más prefendas de la invención son aquellas composiciones que tienen un compuesto de fórmula I ó de fórmula III 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 CH₃, n es 0, m, p y q son cada uno independientemente 1. R y R₁ son cada uno independientemente H, Z' es Cl, R₃₃ y G son cada uno independientemente CO₂CH₃, Q es p-(trifluorometoxi)fenilo, y la configuración de línea punteada $\text{C}=\text{N}$ representa un enlace doble en combinación con uno o más compuestos seleccionados entre el Grupo A.

Cada uno de los compuestos de fórmula I, II, III, IV y V representan centros asimétricos que pueden ser representados en la forma R o en la forma S estereoisómera. La presente invención además incluye la forma R, la forma S, o mezclas que comprenden la forma R y la forma S en una relación arbitraria. Para compuestos de fórmula III, se prefiere la forma S.

Convenientemente, el compuesto antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula I, II, III IV ó V, o una mezcla de los mismos, puede ser formulado con un segundo ingrediente insecticidalmente efectivo, y opcionalmente otros adyuvantes de formulación habituales. Dicha formulación puede ser dispersada en un diluyente solido o liquido para aplicación al insecto, su suministro de alimento suelo de crianza o habitat, como un spray diluido o como un polvo fino solido o concentrado de polvo fino.

Los ingredientes activos de la composición de la invención además se pueden formular en forma separada como un polvo para mezclar con agua, concentrado emulsionable concentrado de suspensión acuosa o líquida fluible, o cualquiera de las formulaciones convencionales utilizadas para agentes de control de insectos, y mezclados en tanque en el campo con agua u otro liquido no costoso para aplicación como una mezcla de spray líquida. Las composiciones formuladas en forma separada pueden también aplicarse en forma secuencial.

Convenientemente la composición de la invención puede ser formulada como una composición de cebo que comprende una cantidad sinérgicamente efectiva de una combinación de un antagonista del canal de sodio neuronal más uno o mas compuestos seleccionados entre el Grupo A y una sustancia nutritiva comestible sólida o líquida. Una composición de cebo preferida puede contener en peso aproximadamente 0,01 % a 20 % de ingredientes activos, con preferencia un antagonista del canal de sodio neuronal en combinación con hidrametión.

En la practica real, la composición de la invención se puede aplicar al follaje de la planta o al tallo de la planta, o al habitat del insecto, o al lugar de una plaga higienica, como un spray diluido preparado a partir de cualquiera de las formulaciones mencionadas anteriormente. La relación de los ingredientes activos esenciales de la composición de la invención es aproximadamente 1 parte en

peso de un antagonista del canal de sodio neuronal a aproximadamente 0,01 - 100 partes en peso de uno o más compuestos seleccionados entre el Grupo A

Las composiciones de la invención son composiciones insecticidas superiores y son especialmente útiles para el control de plagas agrohortícolas, plagas higiénicas o plagas que se alimentan de madera. Dichas composiciones son sumamente efectivas para la protección de plantas en crecimiento y cosechadas, incluyendo cultivos leguminosos tales como habas de soja, habas verdes, arvejas, habas color crema y similares, así como también algodón, cultivos de follaje, cultivos de col, vegetales de hoja, tabaco, lupulos, tomates, papas, ornamentales de flores tales como crisantemo, cultivos de parra tales como uvas, calabaza, zapallo o melón, y árboles frutales tales como cerezo, duraznero, manzanero o cítricos, contra los estragos de insectos.

Se encuentra que la composición insecticida sinérgica de la invención es sumamente activa contra una amplia variedad de insectos lepidópteros y coleópteros tales como *Helicoverpa zea* (gusano del algodón), *Heliothis virescens* (lombriz del tabaco), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la papa de Colorado), *Diabrotica spp* (lombriz de las raíces del maíz) y similares.

De manera beneficiosa, la composición de la invención puede ser útil para la prevención y el control de plagas de la salud pública o higiénicas tales como Dípteros, por ejemplo, moscas hogareñas, mosquitos o similares, Himenópteros, por ejemplo, hormigas, avispas parasitarias, avispas o similares, Blatarios, por ejemplo, cucarachas, o similares.

Además, las composiciones de la invención pueden ser particularmente útiles para la prevención y el control de insectos que se alimentan de madera, tales como termitas (Isopteros), hormigas carpinteras (Himenópteros), escarabajos destructores de madera (Coleópteros) o similares.

Estas y otras ventajas de la invención pueden ser mas evidentes a partir de los ejemplos que se exponen en la presente a continuacion. Estos ejemplos se proporcionan meramente como ilustraciones de la invención, y no tienen la intención de ser interpretados como un límite a la misma.

EJEMPLO 1

Evaluación del Efecto Insecticida Sinérgico de una Combinación de un Antagonista del Canal de Sodio Neuronal Mas un Segundo Insecticida

En esta evaluación las larvas utilizadas de *Heliothis zea* (gusano del algodón) *Heliothis virescens* (lombriz del tabaco) y *Heliothis virescens* resistente a piretroides son obtenidas de colonias de laboratorio. *H. virescens* resistente a piretroides derivan de la cepa PEG (Campannola & Plapp Proceedings of Beltwide Cotton Conference (1988)).

Las hojas de algodón se sumergen en soluciones 1:1 v/v, acetona / agua de compuesto de evaluación, o soluciones de una combinación de compuestos de evaluación durante un periodo de aproximadamente 3 segundos. Luego de la inmersión las hojas se dejan secar al aire durante 2 - 3 horas. Se usan bandejas de bioensayo plásticas que contienen múltiples recipientes de cara abierta (4,0 x 4,0 x 2,5 cm) como las arenas de evaluación. Se colocan porciones cortadas de una hoja tratada, una mecha dental de algodón humedecida y una larva de la tercera crisálida individual, en cada recipiente, se cubre con una lámina plástica clara adhesiva con orificios y se mantiene bajo luz fluorescente constante a aproximadamente 27 °C durante un periodo de tiempo predeterminado. Se evalúa la mortalidad / morbilidad larval a 5 días luego del tratamiento. Todos los tratamientos se duplican 4 - 5 veces en un diseño de bloque completo randomizado, con 16 - 32 larvas por tratamiento. Usando análisis convencional de

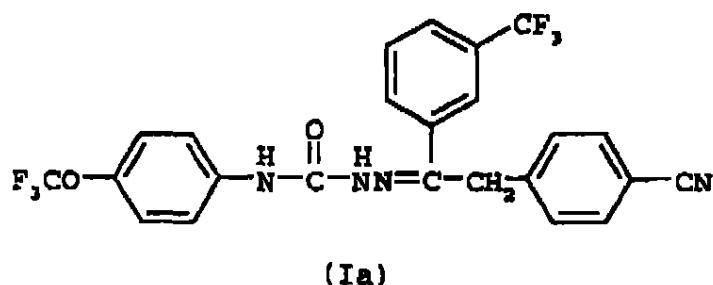
log-desviación de la curva de Gauss en más de cinco, se determina el LC_{50} de cada tratamiento

Usando el protocolo anterior, se puede evaluar un antagonista del canal de sodio neuronal (Compuesto A) solo a índices de dosificación de 0,1 ppm, 1,0 ppm y 10,0 ppm y en combinación con 1,0 ppm de un segundo compuesto insecticida. Los tratamientos que se pueden usar se muestran en la Tabla I.

Tabla I

Segundo Compuesto Activo	Índice de dosificación (ppm)	Compuesto A1 Índice de Dosificación			
		(ppm)	(ppm)	(ppm)	(ppm)
cipermetrina	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0
amitriz	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0
fipronil	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0
acetamiprid	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0
espinosad	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0
tiadicarb	0	0	0,1	1,0	10,0
	1,0	0	0,1	1,0	10,0

¹ Compuesto A = antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula Ia



EJEMPLO 2

Evaluación del Efecto Insecticida Sinérgico de una Combinación de un Antagonista del Canal de Sodio Neuronal Mas una Amidinohidrazona

En esta evaluación se usan cucarachas adultas macho alemanas (*Blattella germanica*) Para cada evaluación una porción de 40 g de Alimento para Perro de Purina molido (Hi-Pro Glo ®) se trata con una solución de acetona de compuesto de evaluación solo o en combinación con un segundo compuesto de evaluación Después del tratamiento, la acetona se evapora y el alimento para perro tratado se coloca en una copa plástica de ¾ onza, la cual se coloca en un anclaje hecho de láminas plegadas de papel secante colocado en una caja plástica (40,63 cm largo x 27,93 cm ancho x 15,23 cm alto (16" largo x 11" ancho x 6" alto)) La caja plástica (arena de evaluación) también se equipa con una botella de boca angosta de 28 34 g (1 onza) con 2 mechas dentales insertadas en la boca Se prepara una caja de control en la misma manera, usando alimento para perro molido que ha sido tratado con acetona de grado reactivo Cada tratamiento se duplica tres veces En cada arena de evaluación se colocan 20 cucarachas macho adultas sanas que han sido criadas en un insectario Las

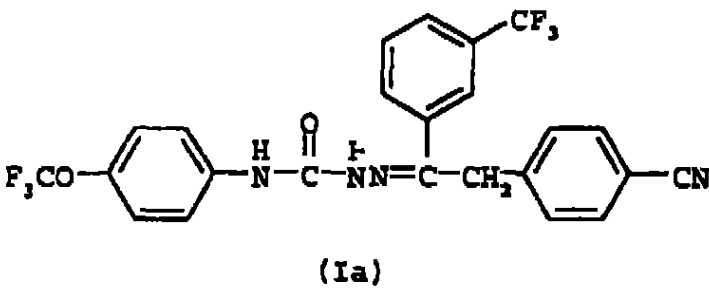
arenas de evaluación luego se almacenan a 24 44 °C (76 °F) y se determina la mortalidad diariamente por examinacion visual La información obtenida se expone en la Tabla II

Tabla II

Comp Test	% Ingr Activo	% Mortalidad					
		Días despues del tratamiento					
		3	4	5	6	7	8
A ¹	0 05	0	0	0	0	0	0
A	0 10	1 7	11,7	11,7	11 7	18,3	18,3
A	0 50	5,0	5,0	5 0	5,0	5 0	5,0
B ²	1 00	0	5 0	28 3	71,7	90,0	93,3
A + B	0 05 + 1,0	0	20 0	41 7	81,7	95,0	98 3
A + B	0 10 + 1 0	0	21,7	51,7	88,3	95,0	95,0
A + B	0 50 + 1,0	16,7	58 3	80 0	95,0	98 3	100,0
Control	0	0	1,7	3,3	3 3	3 3	5 0

¹ Compuesto A = antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula Ia

² Compuesto B = hidrametilnon



Como puede observarse de la informacion que se expone en la Tabla II, las combinaciones de un antagonista del canal de sodio neuronal más un insecticida de amidinohidrazona demuestran control de insectos sinergico

EJEMPLO 3

Evaluacion del Efecto Insecticida Sinérgico de una Combinación de un Antagonista del Canal de Sodio Neuronal Más un Nucleopolihedrovirus Recombinante Capaz de Expresar una Toxina de Insecto

En esta evaluación se obtienen larvas de *Helicoverpa zea* (gusano del algodón) de una colonia de laboratorio. Los compuestos de evaluación se disuelven en 1:1 v/v acetona / agua. Se usan bandejas de bioensayo plasticas (C-D International Pitman, NJ) como arenas de evaluación. Cada bandeja contiene 32 recipientes de cara abierta de 4.0 x 4.0 x 2.5 cm. Una porcion (5 ml) de una dieta artificial a base de harina de haba de soja - germen de trigo (Southland Products Lake Village, AR) se vierte en cada recipiente. Después de que la dieta se endurece, se vierten por pipeta 0.4 ml de solución de evaluación sobre la superficie de la dieta en cada recipiente. Las soluciones de evaluación se diseminan en forma pareja sobre las superficies de la dieta levantando la bandeja e inclinándola suavemente de lado a lado. Las bandejas luego se mantienen en un area con ventilación durante aproximadamente 2 horas, hasta que ya no se junta agua en la superficie de las dietas. Entonces se coloca una larva individual de *H. zea* de 4 días de edad, sobre la superficie de la dieta en cada recipiente. Luego de la infestación larval, cada recipiente se cubre con una lámina plastica clara adhesiva, con orificios.

Todas las arenas de evaluación se mantienen bajo luz fluorescente constante y a una temperatura de aproximadamente 27 °C durante la duración del ensayo. La mortalidad larval se determina a los 2, 3, 4 y 7 días luego del

tratamiento Se considero que una larva estaba muerta si exhibia poco a nada de movimiento aun después de ser sacudida en la bandeja de la dieta Se evaluó un total de 32 insectos para cada tratamiento

La información obtenida se expone en la Tabla III

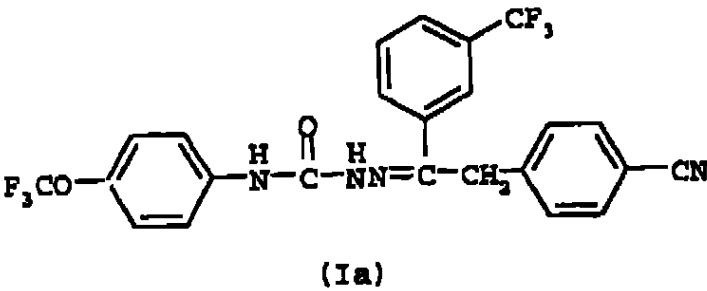
Tabla III

Comp Test	Conc Ingr Activo	% Mortalidad			
		Dias despues del tratamiento			
		2	3	4	7
A ¹	0 1 ppm	43,8	46 9	53,1	53,1
B ²	1000 OB ³ / ml	3 1	34,4	50 0	62,5
B	500 OB / ml	0,0	9 4	18 8	40 6
B	100 OB / ml	3,1	3,1	3,1	15,6
A + B	0 1 + 1000	87,5	90 6	93,8	96,9
A + B	0,1 + 500	75,0	78,1	84 4	87,5
A + B	0 1 + 100	62,5	75,0	75,0	78,1
Control	0	3,1	3,1	3 1	3,1

¹ Compuesto A = antagonista del canal de sodio neuronal de fórmula la

² Compuesto B = HzNPV-AaIT, *Helicoverpa zea* Nucleopolihedrovirus que expresa toxina de insecto *Androctonus australis*

³ OB = cuerpos de oclusión viral



Como puede observarse de la informacion que se muestra en la Tabla III, las combinaciones de un antagonista del canal de sodio neuronal más un nucleopolihedrovirus recombinante que es capaz de expresar una toxina de insecto, demuestran control de insectos sinérgico

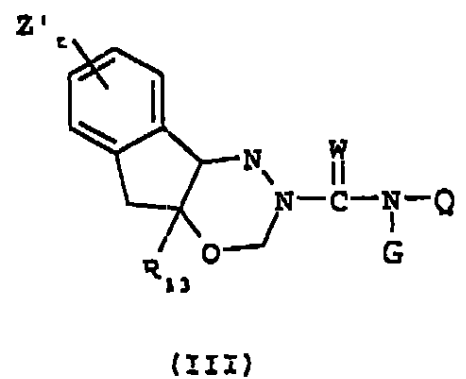
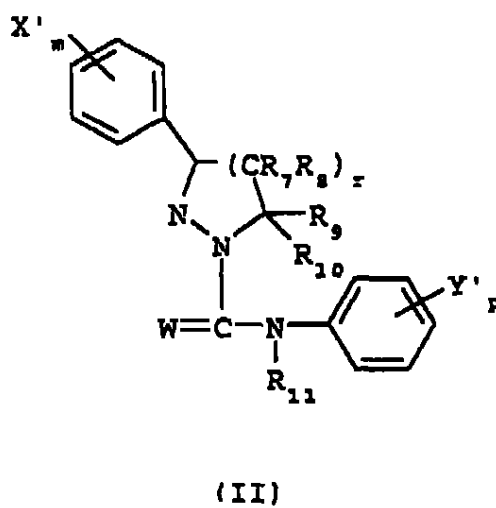
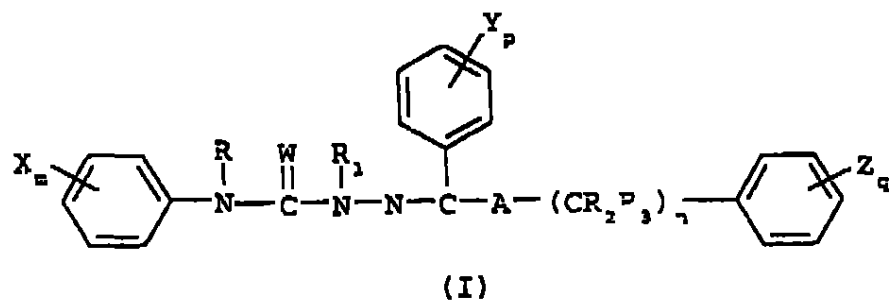
.

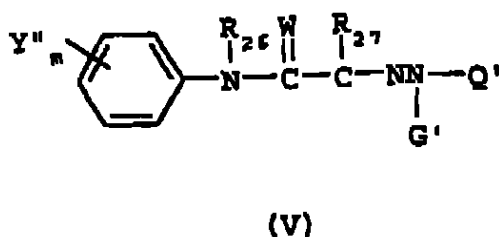
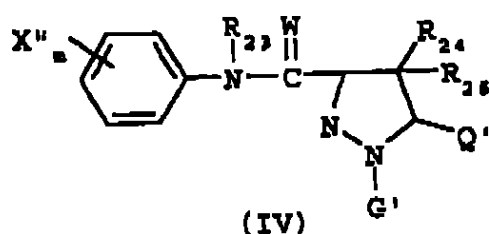
.

-- -

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 entre el Grupo A, en donde el antagonista del canal de sodio neuronal es un compuesto de fórmula





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 mas grupos halógeno, alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquienilo C_2-C_6 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

alcoxycarbonilo C_1-C_6 , cicloalquilcarbonilo C_3-C_6 , fenilo opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halogeno, alquilo C_1-C_4 , o alcoxi C_1-C_4 ,

aminocarbonilo opcionalmente 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 o 2

r es un entero de 1 ó 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 H alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi alquilo 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_7 y R_8 son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , o fenilo opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halógeno, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ,

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

R_{11} es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , o haloalcoxycarbonilo C_1-C_6 ,

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

G es H alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o mas grupos halógeno, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_u R_{14}$, COR_{15} , $CO_2 R_{16}$, fenilo o cicloalquilo C_3-C_6 ,

alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , CN, NO_2 , $S(O)_u R_{17}$, COR_{18} , $CO_2 R_{19}$, 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 , $S(O)_u R_{20}$, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxialquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , o $NR_{21} R_{22}$,

u es un entero de 0 1 ó 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 $CO_2 R_{34}$,

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

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

alquenilo C_2-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno CN, NO_2 , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , o haloalquilsulfonilo C_1-C_4 ,

alquilcarbonilo C_1-C_4 , haloalquilcarbonilo C_1-C_4 , o $NR_{2a}R_{2b}$

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

un anillo heteroaromático de 5 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre, y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 5 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X'' , o

un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre 0 o 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 6 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X'' ,

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

alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , o fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes seleccionados entre X'' ,

R_{23} , R_{24} , R_{25} , R_{26} , R_{27} , R_{28} y R_{29} son cada uno independientemente H o alquilo C_1-C_4 , y la configuración de línea punteada $C-N$ 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 fórmula I o III, y la configuración de línea punteada $C-N$ 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 o más compuestos seleccionados entre el Grupo A son cipermetrina, cihalometrina, ciflutrina, permetrina, etofenprox, silafluofén, fipronil, endosulfón, imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, tiametoxam, profenofos, acefato, sulprofos, malatión, diazinon, metil paration, terbufós, metonil, tiodicarb, fenotiocarb, amitraz, clordimeform, clorfenamidina, avermectina, emamectina, milbemectina, nemadectina, o moxidectina

5 La composición de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el o más compuestos seleccionados entre el Grupo A son un nucleopoliédrovirus recombinante capaz de expresar toxina de insecto

6 La composición de acuerdo con la reivindicación 3, en donde el o más compuestos seleccionados entre el Grupo A son hidrametilnón

7 Un método para el control sinérgico de insectos que comprende poner en contacto 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 entre el grupo que consiste de Blatarios, Isópteros, Dípteros e Himenópteros

9 El método de acuerdo con la reivindicación 8, en donde los insectos son lepidópteros o coleópteros

10 Un método para la protección de una planta contra 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

Folios 34 y 35 corresponden a Tarjetas temáticas
y de propietarios 202001

EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

(21) No. SOLICITUD

(51) INT CL

(22) FECHA DE PRESENTACIÓN 09-03-00

(71) SOLICITANTE AMERICAN CYANAMID COMPANY

(30) PRIORIDAD

(31) No. DE SOLICITUD 60/124 306 y 60/158 201

(72) INVENTOR/ES Michael Frank Treacy, Raymond Frank Borysewicz Kurt Allen Schwinghammer, Paul Erich Rensner y Hassan Oloumi - Sadeghi

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

(33) PAÍS US y US

(74) APODERADO JOSE ANTONIO LLOREDA

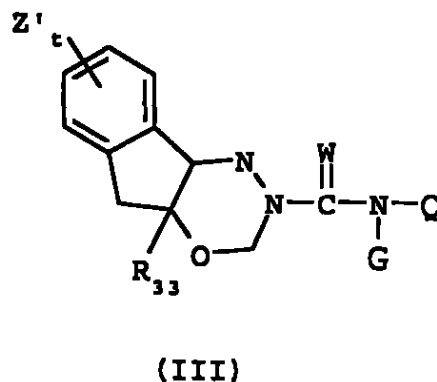
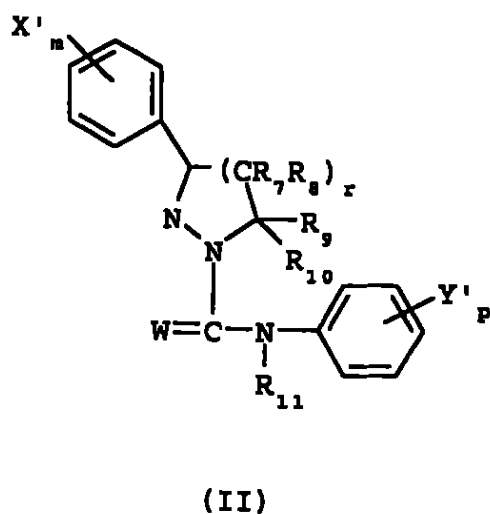
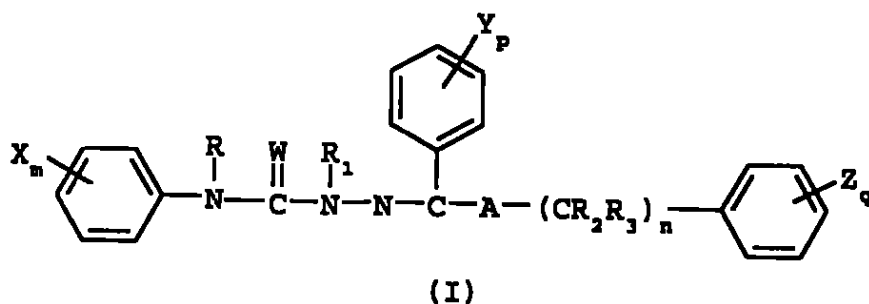
(54) TÍTULO

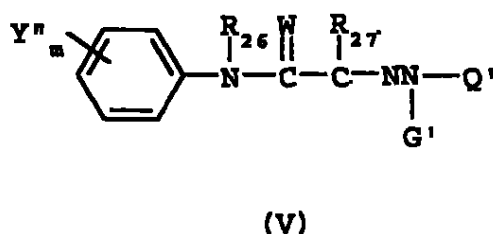
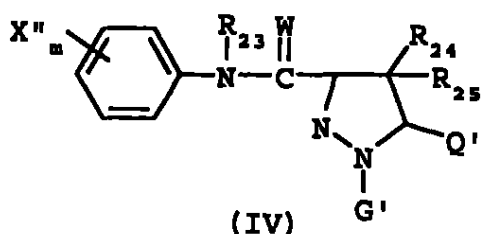
"COMPOSICIONES INSECTICIDAS SINERGICAS"

(57) RESUMEN

Reivindicación numero 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 entre el Grupo A, en donde el antagonista del canal de sodio neuronal es un compuesto de fórmula





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 ,

alcoxycarbonilo C_1-C_6 , cicloalquylcarbonilo C_3-C_6 , 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 ,

alcoxycarbonilo 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 es un entero de 1 ó 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 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 , alquylcarbonilo C_1-C_6 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , o haloalquiltio C_1-C_6 ,

R_7 y R_8 son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alquylcarbonilo C_1-C_6 , 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 , alquylcarbonilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , o haloalcoxycarbonilo C_1-C_6 ,

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

G es H, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₆, CN, NO₂S(O)_uR₁₄, COR₁₅, CO₂R₁₆, fenilo o cicloalquilo C₃-C₆,

alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, CN, NO₂, S(O)_uR₁₇, COR₁₈, CO₂R₁₉, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, haloalquilo C₁-C₃, o haloalcoxi C₁-C₃,

cicloalquilo C₃-C₆, o fenilito,

Q es fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, SCN, NO₂, S(O)_uR₂₀, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, o NR₂₁R₂₂,

u es un entero de 0, 1 ó 2,

R₁₄, R₁₅, R₁₆, R₁₈, R₁₉, R₂₁ y R₂₂ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₆,

R₁₇ y R₂₀ son cada uno independientemente alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆,

R₃₃ es CO₂R₃₄,

R₃₄ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, fenilo o halofenilo,

X" e Y" son cada uno independientemente H, halógeno, CN, SCN, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, NO₂, CN, alcoxi C₁-C₄, alquilito C₁-C₄, fenilo, halofenilo, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, o alcoxycarbonilo C₁-C₄,

alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, o haloalquilsulfonilo C₁-C₄,

alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, o NR₂₆R₂₆,

G' es fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X",

un anillo heteroaromático de 5 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre, y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 5 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X", o

un anillo heteroaromático de 6 miembros que contiene uno o dos heteroátomos seleccionados entre 0 ó 1 átomos de oxígeno, 0 ó 1 átomos de azufre, y 0, 1 ó 2 átomos de nitrógeno, dicho anillo heteroaromático de 6 miembros está ligado por medio de carbono y es opcionalmente sustituido con uno o más grupos que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X",

Q' es H, alquilo C₁-C₈ opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, alcoxi C₁-C₃, alcoxycarbonilo C₁-C₈, o fenilo opcionalmente sustituido con uno o más grupos halógeno, CN, NO₂, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ o alquilsulfinilo C₁-C₄,

alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈, o fenilo opcionalmente sustituido con uno a tres grupos, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados entre X''',

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆, R₂₇, R₂₈ y R₂₉ son cada uno independientemente H o alquilo C₁-C₄, y la configuración de línea punteada C≡N representa un enlace doble o un enlace simple, o

un estereoisómero del mismo

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante []
- Nombre e identificación del inventor []
- Título o nombre de la invención []
- Descripción []
- Reivindicaciones []
- Resumen []
- Comprobante de Pago []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

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

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Firma Responsable

Fecha

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

INFORME DE PROTOCOLO

35

Expediente 00-017310

Fecha: 10 de marzo del 2000.

Se certifica que:

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

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

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

Representante en Santafé de Bogotá D.C Los
mismos

Facultad para desistir si

Revisado _____

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

36

EXPEDIENTE 00-017310

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

- SI [x] NO [] NO APLICABLE []** Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a)
- SI [x] NO [] NO APLICABLE []** Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344, literal g) del art. 4 del Decreto 117/94)
- SI [x] NO [] NO APLICABLE []** Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000)
- SI [x] NO [] EXTEMPORANEAMENTE []** Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París.
- SI [] NO [x] NO APLICABLE []** Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.
- SI [] NO [x] NO APLICABLE []** Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París, Concepto: 5 de enero de 1999 S I C)
- SI [] NO [x] CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS**

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

OBSERVACIONES JURIDICAS Debe presentar comprobante de pago por concepto de excedente de palabras, a partir de la 150, en el extracto para publicación (artículo primero de la Resolución 02 del 2000)
En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud

- SI [] NO [x] Se ajusta a los aspectos FORMALES** indicados en la Decisión 344 y por tanto,
- SI [] NO [x] Se recomienda PUBLICAR** el extracto correspondiente.

Santafé de Bogotá, D C ,10 de marzo del 2000
EXAMINADOR JURIDICO. Código 202002

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

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES
Primer EXAMEN DE FORMA

RADICACIÓN N° 00-17310

CONCEPTO TÉCNICO N° 455 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES AQIN 47/28

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

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

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

Santa Fe de Bogotá, D C , 17-III-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

CONCEPTO TÉCNICO No 455
EXPEDIENTE No 00-17310

A01N47/28, 43/36

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

En la reivindicación 1, se deben definir cuáles son los compuestos del Grupo A y la relación en que se encuentra un ingrediente respecto del otro para que ocurra el efecto sinérgico, además puede confundirse el Grupo A con el radical A del antagonista, por lo cual para mayor claridad se sugiere modificar

No es claro el hecho que en la reivindicación 4 se nombran los compuestos del Grupo A, sin embargo no se incluyen a nucleopolihedrovirus ni a hidrametilón, los cuales son luego reivindicados como compuestos que forman parte del Grupo A

En la reivindicación 5 se debe precisar cuál es la familia del virus que forma parte de la mezcla sinérgica

Para mayor claridad se deben indicar los nombres químicos de los compuestos que se encuentran en la solicitud llamados por su nombre común

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

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

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

202001
Examinador Técnico de Patentes

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

EXPEDIENTE 00-017310

AUTO 0690

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

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

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

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

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

28 MAR 2000

Dado en Santafé de Bogotá D C , a los _____

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

Alix CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D C , **30 MAR 2000** notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI___ NO___

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA