

21



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

00-5909

21 EXPEDIENTE No

54 TITULO Represion de Malarias

Ver titulo nuevo en folio 43

51 CLASIFICACION INTERNACIONAL

A01N43/80

71 SOLICITANTE

Auentis Agriculture Limited

DOMICILIO

Fyfield Road Onor - Essex CH5 0HW, Inglaterra

74 APODERADO

Carlos E. Elarte

22 SANTAFE DE BOGOTA, D C

Febrero 1 / 2000

202038

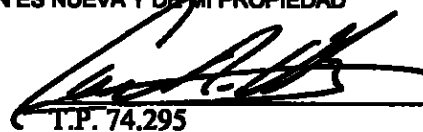
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO		SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO	
DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL		Folios: 33	
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES		Radicacon : 00005909 00000000	
		Fecha (AMB): 2000-02-01 17:17:00	
		Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 001 SOLICITUD	
		Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES	
71 SOLICITANTE (S) RAZON SOCIAL O APELLI AVENTIS AGRICULTURE LIMITE		RADICACION INTERNA	
C.C. NIT.			
DIRECCION Y DOMICILIO Fyfield Road Ongar – Essex CM 5 OHW, Inglaterra			
NACIONALIDAD INGLESA		PAIS RESIDENCIA INGLATERRA	
74 APODERADO CARLOS R. OLARTE			
72 NOMBRE DEL INVENTOR (ES) DAVID ALAN ROBERTS, ROBERT ZERROUK y RACHEL COLEGATE.			
54 TITULO DE LA INVENCION REPRESION DE MALEZAS.			
51 CLASIFICACION INTERNACIONAL A01N43/80.			
RESUMEN CON EL OBJETO Y FINALIDAD DE LA INVENCION		DILIGENCIAR FORMATO	
PRIORIDAD REIVINDICADA		SI ☒ NO ☐	
Con base en el Art. 4 del Convenio de París			
31 SOLICITUD No.	32 FECHA DE PRESENTACION	33 PAIS	
99 02232-9	Febrero 1, 1999	GB	
99 08313-1	Abril 12, 1999	GB	
ANEXOS			
CERTIFICADO DE EXISTENCIA Y REPRESENTACION LEGAL CUANDO EL SOLICITANTE SEA PERSONA JURIDICA		☐	
LOS PODERES DEBIDAMENTE OTORGADOS O MENCION DE SU PROTOCOLIZACION ANTE LA S.I.C No.		☐	
RECIBO DE LA TASA RESPECTIVA		DERECHOS ADMINISTRATIVOS PUBLICACION	
		☒	
		☒	
SI SE REIVINDICA PRIORIDAD, EL CERTIFICADO RESPECTIVO (COPIA LEGALIZADA)		☐	
TRADIUCCION OFICIAL		☐	
CAPITULO DESCRIPTIVO		☒	
DIBUJOS, PLANOS NECESARIOS		☐	
CAPITULO REVINDICATORIO		☒	
TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS		☒	
TARJETA ARCHIVO TEMATICO		☒	
EXTRACTO PARA O RESUMEN PARA PUBLICACION		☒	
OTROS		☐	

SE SOLICITA LA CONSECCION DE LA PATENTE DE INVENCION DECLARANDO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

Febrero 1, 2000

FIRMA:


T.P. 74.295



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 80017608 Radicación : 80005989 80000000 Folios: 23
Fecha (MB): 2000-02-01 17:17:00
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRAR/ 001 SOLICITUD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 99 - 65,692
FECHA : DICIEMBRE 1 DE 1999

***** CONSIGNACION *****

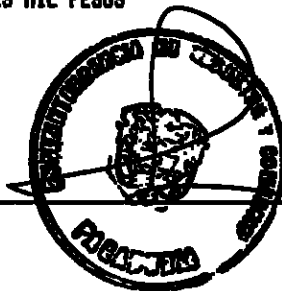
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
ALVARO CORREA ORDONEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00024-9	595310	01/12/1999	11,060,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. CONTABILITICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	553,000.00
	TOTAL :	553,000.00

SON: QUINIENTOS CINCUENTA Y TRES 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

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Folios: 33
Radicacion: 8005389 8000000
Fecha (AMB): 2000-02-01 17:17:06
Tramite: 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 001 SOLICITUD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT: 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE: 00 - 1,214
FECHA: ENERO 6 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
JORGE LUIS GOMEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00024-9	5970666	06/01/2000	8,690,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. CONTABILITICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	55,000.00
	TOTAL:	\$ 55,000.00

SON: CINCUENTA Y CINCO MIL PESOS



RESPONSABLE: _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

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

REPRESIÓN DE MALEZAS

Esta invención se refiere a un método para reprimir el crecimiento de malezas por la aplicación progresiva, a la capa superficial de un medio de crecimiento, o la liberación en dicho medio, de un herbicida de benzoilisoaxazol, y a composiciones para utilizar en dicho método.

Antecedentes de la invención

El uso de isoxazoles para reprimir malezas ha sido descrito en las publicaciones de patentes europeas N° 0418175, 0487357, 0527036 y 0560482. La actividad herbicida de los dicetonitrilos (DKN) que pueden formarse a partir de los isoxazoles también ha sido descrita en las publicaciones de patentes europeas N° 0213892, 0496630 y 0496631, y en la publicación de patente internacional N° WO 95/25099.

Después de la aplicación de los herbicidas de isoxazol, estos pueden descomponerse en dionas, en particular compuestos de dicetonitrilo (DKN). Esta conversión es generalmente irreversible. Los compuestos de DKN son también generalmente herbicidas. Normalmente son más solubles en agua que los herbicidas de isoxazol y pueden ser desplazados en el perfil del suelo tras la lluvia.

Se ha encontrado que modificando el modo en que son aplicados los herbicidas de isoxazol, la relación de isoxazol a DKN en un medio de crecimiento tal como suelo, puede ser alterado a favor del isoxazol, aumentando la relación de isoxazol a DKN.

Se ha encontrado que manteniendo la relación de isoxazol a DKN, a favor del isoxazol, en la capa superficial del suelo, por ejemplo, durante el período de aplicación del isoxazol en el establecimiento de una cosecha, puede obtenerse una mejor represión de las malezas. Además, puede mejorarse la selectividad de la cosecha y puede reducirse el riesgo de fuga y lixiviación.

Un objeto de la presente invención es proporcionar un método de aplicación y/o una composición que reduzca el desplazamiento neto del isoxazol y del DKN a través del suelo

y retenga los compuestos en el suelo que rodea, preferiblemente que rodea inmediatamente, el punto de aplicación del isoxazol.

Otro objeto de la presente invención es proporcionar un método y/o una composición que permita el suministro de menores dosis individuales de herbicidas de isoxazol manteniendo mientras (y algunas veces mejorando) su eficacia herbicida.

Un objeto más de la presente invención es proporcionar una composición, que comprende un isoxazol, con mejor actividad sobre las especies de malezas y/o mejor selectividad para las cosechas.

Los objetos de la invención pueden conseguirse en su totalidad o en parte por la presente invención.

Se sabe que los isoxazoles ejercen su actividad herbicida en plantas por conversión en compuestos de DKN. Por consiguiente, podría esperarse que sería ventajoso la aplicación del isoxazol de tal modo que acelere o favorezca su conversión en DKN. Los solicitantes han encontrado que también es verdad la premisa opuesta.

La presente invención proporciona un método para reprimir el crecimiento de malezas en un lugar en un medio de crecimiento sólido, que comprende tratar el lugar con una composición que comprende un herbicida de isoxazol para proporcionar un suministro o liberación progresivo o secuencial del herbicida de isoxazol a la capa superficial del medio.

El medio de crecimiento incluye compostes pero preferiblemente es suelo.

El lugar es preferiblemente un lugar en el que crecen cosechas, por ejemplo, donde se siembra y cultiva una cosecha.

La capa superficial va generalmente desde la superficie hasta una profundidad de 10 cm, preferiblemente hasta una profundidad de 5 cm, más preferiblemente hasta una profundidad de 3 cm.

De acuerdo con un aspecto de la invención, el

método comprende aplicar al lugar, por ejemplo donde se siembra y cultiva una cosecha, bajas dosis secuenciales de herbicidas de isoxazol. Por ejemplo, la dosificación normal puede dividirse en dos o más, por ejemplo 2 a 5, porciones
5 generalmente iguales y aplicarse a intervalos espaciados, realizándose en primer lugar cada aplicación, por ejemplo 1 a 4 días, preferiblemente 1 día, después de la anterior.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, el método comprende tratar el lugar con una
10 composición de liberación retardada que comprende el herbicida de isoxazol.

La composición de liberación retardada, que constituye un aspecto de la invención, puede comprender, por ejemplo, una composición encapsulada que comprende el
15 isoxazol propiamente dicho o una composición que lo contiene. Las composiciones de liberación controlada pueden prepararse por métodos conocidos.

El producto encapsulado puede tener una pared exterior sólida, estando constituida dicha pared por un
20 material inerte, generalmente que no tiene actividad herbicida sustancial.

El isoxazol encapsulado de acuerdo con la presente invención puede comprender gránulos que están constituidos por un derivado de isoxazol de fórmula (I), estando cada uno
25 de estos gránulos encapsulado dentro de una película sólida que está constituido por un material inerte propiamente dicho que no tiene actividad herbicida sustancial.

Preferiblemente, el material inerte es un material polímero soluble en agua, modificado por tratamiento para
30 hacerlo sustancialmente insoluble en agua.

Los materiales solubles que pueden utilizarse incluyen:

copoliéster; poli(alcohol vinílico); poliacrilato; policarboxilato; gelatina; polisulfonato, por ejemplo
35 poliestiril-polisulfonas; proteína, poli(óxido de etileno); almidón modificado o no; celulosa, por ejemplo carboximetil-celulosa; dextrano, maltosa, alquil-, hidroxialquil-,

carboxialquil-celulosa; polivi-niléter; poli(2,4-dietil-6-triazoliletileno); poli(ácido vinilsulfónico), polianhídrido, resina de urea-formaldehído de bajo peso molecular, resina de melamina-formaldehído de bajo peso molecular, polimetacrilato, por ejemplo poli(cianoacrilato de alquilo), poli(cianoacrilato de isobutilo), poli(metacrilato de 2-hidroxietilo), poli(ácido acrílico) o uno de sus homólogos; anfífilos de baja masa molar; anfífilos polímeros de baja masa molar; poli(ácido acético-ácido glutámico); dendrímeros (polímeros hiper-ramificados); fosfolípidos, por ejemplo diestearoilfosfatidilcolina, dioleoilfosfatidiletanolamina, dipalmitoilfosfatidilcolina, dipalmitoilfosfatidilglicerol, fosfatidiletanolamina, fosfatidilinositol; lipoproteína, poli(ortoéster)policarboxilatos semisólidos; hidrogeles. Los materiales pueden estar en forma de, por ejemplo, nano/micro-esferas lípidas sólidas; microesferas de poliéster; nanocápsulas, niosomas; liposomas, micelas polímeras. Puede utilizarse un aceite para facilitar la producción de una emulsión con pequeños tamaños de partículas y para inhibir la aglomeración.

Preferiblemente, el material soluble en agua es un copoliéster, por ejemplo gerol, que es un copolímero por ejemplo: polímero de la sal 5-sulfomonosódica del ácido 1,3-benzenodicarboxílico con ácido 1,3-benzenodicarboxílico, ácido 1,4-benzenodicarboxílico, 1,2-etanodiol, 2,2'-[1,2-etanodiilbis(oxi)]bis[etanol] y 2,2'-oxibis[etanol]. Los materiales solubles en agua pueden variar de peso molecular y pueden incluir oligómeros.

El polímero soluble en agua inerte se precipita generalmente por asociación (por formación de complejo o mezcla) con un material que no solubiliza el mismo el polímero soluble en agua antes citado. Los materiales que dan como resultado la precipitación del polímero incluyen las sales solubles de metales alcalino-térreos (por ejemplo calcio). La asociación puede modularse ajustando el pH de la solución soluble en agua del polímero que solubiliza los iones (del metal alcalino-térreo antes citado) que efectúa la

precipitación del ahora polímero insolubilizado para encapsular las partículas del material activo. El pH puede ajustarse utilizando, por ejemplo, ácido acético. La precipitación puede también inducirse ajustando el disolvente o disolventes sin necesidad de asociación con otro material.

El tamaño de los gránulos del material activo de un derivado de isoxazol de fórmula (I) es generalmente de 0,1 a 50 μm , preferiblemente de 1 a 20 μm .

El espesor del revestimiento del material encapsulante es generalmente de 0,1 a 50 μm , preferiblemente de 1 a 20 μm .

Los gránulos del derivado de 4-benzoilisoxazol encapsulado de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención pueden estar, por ejemplo, en estado de polvo o en una formulación líquida o sólida, contenidos dentro de un soporte (o un vehículo para aplicación).

Las composiciones de la presente invención mejoran la liberación de un herbicida en el lugar del suelo en el que se aplica y se reduce el desplazamiento resultante por el agua de lluvia o de riego. Se proporciona una mejora notable en la transmigración descendente del ingrediente activo desde la zona de aplicación inmediata (zona de las semillas de maleza) a través del perfil del suelo.

Las composiciones de la presente invención proporcionan un método para reprimir la liberación de un herbicida en una gama de tipos de suelo y condiciones edáficas por modificación de las relaciones de isoxazol:material vehículo.

El uso de composiciones de la presente invención permite un uso más eficaz de herbicida que es retenido en la zona de aplicación del suelo, por ejemplo la zona de las semillas de malezas; así puede reducirse la cantidad de herbicida aplicado. Además, el herbicida se mantiene en el área de la zona de las semillas de maleza durante mayor tiempo que el usual.

La localización del herbicida en la zona de las semillas de maleza mejora la selectividad de las especies de cosecha, por ejemplo el maíz.

Las composiciones de la presente invención proporcionan un método para reducir la velocidad de liberación de herbicidas, tales como isoxazoles, en el suelo retardando con ello la velocidad total de degradación. La encapsulación en un vehículo matriz aumenta la estabilidad de los herbicidas puesto que los protege de los componentes que pueden promover su degradación, tales como la humedad o la actividad microbiana.

Por la expresión "aplicación antes del brote" se entiende una aplicación al suelo en el que están presentes semillas o plántulas de maleza antes del brote de la cosecha. Un ejemplo de una aplicación antes del brote se conoce como "pre-planta incorporada" (PPI), en la que se incorpora el herbicida al suelo antes de sembrar la cosecha. Otro es aquel en el que se aplica el herbicida a la superficie del suelo después de sembrar la cosecha. Por la expresión "actividad folial" se entiende actividad herbicida producida por aplicación a las partes aéreas o expuestas de las malezas que han brotado en la superficie del suelo.

En general, la tasa de aplicación de los herbicidas de 4-benzoilisoxazol de fórmula (I) en composiciones de la presente invención es de 0,005 kg a 0,5 kg de compuesto herbicidamente activo, preferiblemente de 0,015 kg a 2 kg de compuesto herbicidamente activo, más preferiblemente de 0,02 kg a 0,12 kg de compuesto herbicidamente activo, incluso más preferiblemente de 0,05 a 0,09 kg de compuesto herbicidamente activo por hectárea. Cuando se emplean dosis secuenciales bajas de herbicida de isoxazol, como se describe a continuación, pueden dividirse las tasas de aplicación dadas antes.

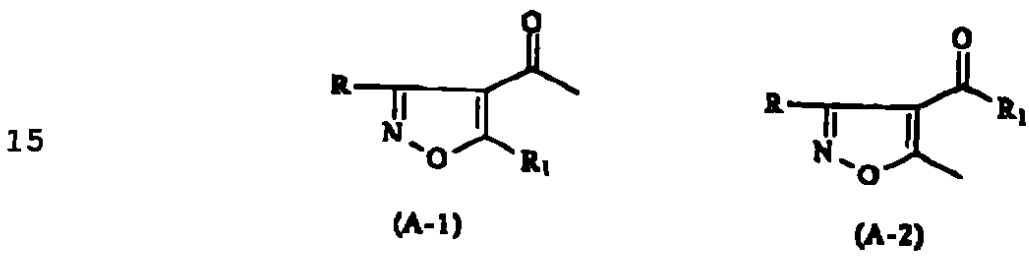
El método de la invención se aplica generalmente a un lugar antes del brote de las malezas y de la planta de cosecha. Preferiblemente el lugar se cultiva y/o se trata en primer lugar para eliminar las malezas existentes. Por ejemplo puede utilizarse un herbicida exterminador, tal como glifosato.

Los herbicidas representativos cuya movilidad en el suelo es controlada por las composiciones de la presente

invención incluyen derivados de 4-benzoilisoxazol de fórmula general (I):



10 en la que
A representa un grupo (A-1) o (A-2):



en las que:

20 R representa un átomo de hidrógeno o halógeno; un grupo alquilo o alquenilo o alquinilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta seis átomos de carbono, que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo cicloalquilo que contiene de 3 a 6 átomos
25 de carbono opcionalmente sustituido con uno o más grupos R⁵, uno o más átomos de halógeno o un grupo -CO₂R³; o un grupo seleccionado de -CO₂R³, -COR⁵, ciano, nitro, -CONR³R⁴ y -S(O)_nR¹³,

30 R₁ representa un grupo alquilo, alquenilo o alquinilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta seis átomos de carbono que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; o un grupo cicloalquilo que contiene de tres a seis átomos de carbono, opcionalmente sustituido con uno o más grupos R⁵ o uno o más átomos de
35 halógeno;

R² representa un átomo de halógeno; un grupo alquilo, alquenilo o alquinilo, de cadena lineal o ramifica-

da, que contiene hasta seis átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que contiene hasta seis átomos de carbono que está sustituido con uno o más grupos $-OR^5$; o un grupo seleccionado de nitro, ciano, $-CO_2R^5$, $-S(O)_pR^5$, $-O(CH_2)_mOR^5$, $-COR^5$, $-NR^{11}R^{12}$, $-N(R^6)SO_2R^7$, $-N(R^6)CO_2R^7$, $-OR^5$, $-OSO_2R^7$, $-SO_2NR^3R^4$, $-CONR^3R^4$, $-CSNR^3R^4$, $-(CR^9R^{10})_t-S(O)_qR^7$ y $-SF_5$; o dos grupos R^2 , en átomos de carbono adyacentes del anillo de fenilo pueden, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, formar un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 a 7 miembros que contiene hasta tres heteroátomos en el anillo seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre, el cual está opcionalmente sustituido con uno o más grupos seleccionados de halógeno, nitro, $-S(O)_pR^{13}$, alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , haloalcoxi de C_{1-4} , $=O$ (o uno de sus acetales cíclicos de 5 o 6 miembros) y $=NO-R_3$, entendiéndose que un átomo de azufre, cuando está presente en el anillo, puede estar en forma de un grupo $-SO-$ o $-SO_2-$;

n representa un número entero de uno a cinco, cuando n es mayor que uno, los grupos R^i pueden ser iguales o diferentes;

R^3 y R^4 representa cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta seis átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno;

R^5 representa un grupo alquilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta seis átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; o un grupo alquenilo o alquinilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene de dos a seis (preferiblemente de tres a seis) átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno;

R^6 y R^7 , que pueden ser iguales o diferentes, representa cada uno R^5 , o fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco grupos que pueden ser iguales o diferentes

seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que contiene hasta seis átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; nitro, ciano, $-\text{CO}_2\text{R}^5$, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^{13}$, $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$,
5 $-\text{OR}^5$ y $-\text{CONR}^3\text{R}^4$;

R^8 , R^9 y R^{10} representa cada uno un átomo de hidrógeno o R^6 ;

R^{11} y R^{12} representa cada uno hidrógeno o R^5 ;

R^{13} representa un grupo alquilo, de cadena lineal
10 o ramificada, que contiene hasta seis átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno;

k , p y q representan independientemente los valores cero, uno o dos;

15 m representa uno, dos o tres;

t representa un número entero de uno a cuatro; cuando t es mayor que uno, los grupos R^9 y R^{10} pueden ser iguales o diferentes;

o una de sus sales o complejos metálicos agrícola-
20 mente aceptables.

En ciertos casos, los grupos R a R^{13} pueden dar lugar a isomería óptica y/o estereoisomería. Todas las formas son abarcadas por la presente invención.

Por la expresión "sales agrícolamente aceptables"
25 se entiende sales en las que los cationes o aniones son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso agrícola u hortícola. Preferiblemente las sales son solubles en agua. Las sales de adición de ácido adecuadas, formadas por compuestos de fórmula (I) que
30 contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, hidroccloruros, sulfatos, fosfatos y nitratos, y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético. Las sales adecuadas formadas por compuestos de fórmula (I) que son ácidas, es decir compuestos que contienen
35 uno o más grupos carboxi, con bases incluyen sales de metal alcalino (por ejemplo sodio y potasio), sales de metal alcalino-térreo (por ejemplo, calcio y magnesio), sales de

amonio y amina (por ejemplo dietanolamina, trietanolamina, octilamina, dioctilmetilamina y morfolina).

En la descripción a menos que se especifique otra cosa "halógeno" significa un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I) en la que A representa (A-1).

El anillo de fenilo de los compuestos de fórmula (I) está preferiblemente disustituido en las posiciones 2,4, disustituido en 2,3 o trisustituido en 2,3,4.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I) en la que R representa hidrógeno o $-\text{CO}_2\text{R}^3$, en donde R^3 representa un grupo alquilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta tres átomos de carbono; y R^1 representa ciclopropilo.

Se prefieren los compuestos de fórmula (I) en la que R^2 representa un átomo de halógeno; un grupo alquilo, de cadena lineal o ramificada, que contiene hasta tres átomos de carbono y que está opcionalmente sustituido con uno o más átomos de halógeno; $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$; $-\text{OR}^5$ o $\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{R}^7$; en donde R^5 , R^6 y R^7 representa cada uno el mismo o diferente grupo metilo o etilo opcionalmente halogenado,.

Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) en la que A representa (A-1) es aquella en la que:

R es hidrógeno o $-\text{CO}_2\text{Et}$;

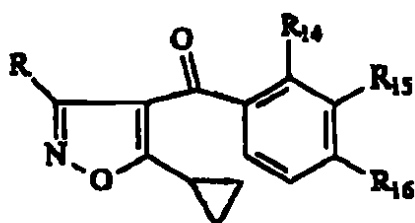
R^1 es ciclopropilo;

y dos grupos R^2 , en átomos de carbono adyacentes al anillo de fenilo pueden, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, combinarse para formar un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 ó 6 miembros que se fusiona a las porciones 2,3 o 3,4 del anillo de benzoilo; en el que el anillo heterocíclico contiene dos heteroátomos seleccionados de azufre y oxígeno que están situados en las posiciones 2 y 3, o 3 y 4 del anillo de benzoilo; y en el que el sustituyente en la posición 4 del anillo de benzoilo es halógeno o $\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$, o el sustituyente en la posición 2 del anillo de benzoilo es metilo, $\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$ o $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{Me}$ respectivamente; y opcionalmente el anillo heterocíclico puede estar

sustituido con uno o más átomos de halógeno.

Una clase más preferida de los compuestos de fórmula (I) es aquella en la que A representa (A-1); R es hidrógeno o -CO₂Et; R¹ es ciclopropilo; R² es un átomo de halógeno o un grupo seleccionado de -CF₃, Me, Et, -S(O)_pMe, -CH₂S(O)_pMe y metoxi o etoxi opcionalmente halogenado; y n es dos o tres.

Una clase todavía más preferida de los compuestos de fórmula (I) es aquella que tiene la fórmula (Ia):



(Ia)

en la que:

R es hidrógeno o -CO₂Et;

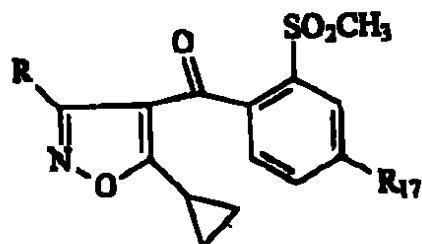
R¹⁴ se selecciona de -S(O)_pMe, Me, Et, un átomo de cloro, bromo o flúor, metoxi, etoxi y -CH₂S(O)_pMe;

R¹⁵ se selecciona de un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, bromo o flúor, metoxi, etoxi y -S(O)_pMe;

R¹⁶ se selecciona de un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, bromo o flúor, metoxi y CF₃;

y en la que al menos uno de R¹⁵ y R¹⁶ es distinto de hidrógeno.

Una clase especialmente preferida de compuestos de fórmula (I) tiene la fórmula (Ib):



(Ib)

en la que R¹⁷ es cloro, bromo o trifluorometilo; y R es hidrógeno o CO₂Et.

Los siguientes compuestos de fórmula (I) están entre los más preferidos para utilizar en la presente
5 invención:

5-ciclopropil-4-[2-cloro-3-etoxi-4-(etilsulfo-
nil)benzoil]isoxazol;

4-(4-cloro-2-metilsulfonilbenzoil)-5-ciclopropili-
soxazol;

10 5-ciclopropil-4-(2-metilsulfonil-4-trifluorometil-
benzoil)isoxazol;

4-(4-bromo-2-metilsulfonilbenzoil)-5-ciclopropili-
soxazol;

15 5-ciclopropil-4-[4-fluoro-3-metoxi-2-(metilsulfo-
nil)benzoil]isoxazol;

4-(4-bromo-2-metilsulfonilmetilbenzoil)-5-ciclopro-
pilisoxazol;

5-ciclopropil-4-(2-metilsulfonil-4-trifluorometil-
benzoil)isoxazol-3-carboxilato de etilo;

20 5-ciclopropil-4-(2-metilsulfonil-4-trifluorometil-
benzoil)-3-metiltioisoxazol.

El compuesto más preferido es 5-ciclopropil-4-(2-
metilsulfonil-4-trifluorometilbenzoil)isoxazol (isoxaflutol).

Los procedimientos para preparar los isoxazoles de
25 fórmula (I) son como los descritos en las publicaciones de
patentes europeas N° 0418175, 0487357, 0527036 y 0560482.

El método de la invención puede utilizarse en
cosechas modificadas genéticamente.

30 Por cosecha modificada genéticamente se entiende la
cosecha que ha sido hecha tolerante a los herbicidas por
métodos de siembra y cultivo conventuales o métodos de
ingeniería genética.

De acuerdo con un aspecto adicional de la presente
invención, se proporcionan composiciones adecuadas para uso
35 herbicida en el método de la invención que comprenden uno o
más de los 4-benzoilisoxazoles de fórmula (I) o una de sus
sales o sus complejos metálicos agrícolamente aceptables (que

pueden ser encapsulados como se ha descrito antes), en asociación, y preferiblemente dispersadas homogéneamente, con uno o más diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos agrícolas aceptables y compatibles [es decir diluyentes
5 o vehículos y/o agentes tensioactivos del tipo aceptado generalmente en la técnica por ser adecuado para uso en composiciones herbicidas y que son compatibles con los compuestos de fórmula (I)]. La expresión "dispersadas homogéneamente" se utiliza para indicar composiciones en las
10 que los compuestos de fórmula (I) están disueltos en otros componentes. La expresión "composiciones herbicidas" se utiliza en un sentido amplio para indicar no sólo composiciones que están listas para su uso como herbicidas sino también concentrados que deben ser diluidos antes de su uso. Preferi-
15 blemente, las composiciones contienen de 0,05 a 90% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I).

Las composiciones herbicidas pueden contener tanto un diluyente o vehículo como un agente tensioactivo (por ejemplo humectante, dispersante o emulsionante). Los agentes
20 tensioactivos que pueden estar presentes en las composiciones herbicidas de la presente invención pueden ser de tipo iónico o no iónico, por ejemplo sulforricinoleatos, derivados de amonio cuaternario, productos basados en condensados de óxido de etileno con alquil y poliaril-fenoles, por ejemplo nonil-
25 u octil-fenoles, triestiril-fenoles, condensados de óxido de etileno con alcoholes, o ésteres de ácidos carboxílicos de anhidrosorbitoles que han sido hechos solubles por eterificación de los grupos hidroxí libres por condensación con óxido de etileno, sales de metales alcalinos y alcalino-térreos de
30 ésteres de ácido sulfúrico y ácidos sulfónicos, tales como dinonil- y dioctil-sulfosuccinatos de sodio y sales de metales alcalino y alcalino-térreos de derivados de ácidos sulfónicos de alto peso molecular, tales como lignosulfonatos de sodio y calcio y alquilbencenosulfonatos de sodio y
35 calcio.

Adecuadamente, las composiciones herbicidas de acuerdo con la presente invención pueden comprender hasta 10%

17
en peso, por ejemplo de 0,05% a 10% en peso, de agente tensioactivo pero, si se desea, las composiciones herbicidas de acuerdo con la presente invención pueden comprender mayores proporciones de agente tensioactivo, por ejemplo
5 hasta 15% en peso de concentrados en suspensión, emulsionables, líquidos y hasta 25% en peso de concentrados solubles en agua líquidos.

Ejemplos de diluyentes o vehículos sólidos adecuados son silicato de aluminio, dióxido de silicio microfino,
10 talco, creta, óxido de magnesio calcinado, kiéselgur, fosfato tricálcico, corcho en polvo, negro de carbono adsorbente y arcillas, tales como caolín, atapulgita, tierra de diatomeas, mica, óxido de aluminio, óxido de titanio y bentonita. Las composiciones sólidas (que pueden tomar forma de polvos,
15 gránulos o polvos humectables) se preparan preferiblemente triturando los compuestos de fórmula (I) con diluyentes sólidos o impregnando los diluyentes o vehículos sólidos con soluciones de los compuestos de fórmula (I) en disolventes volátiles, evaporando los disolventes y, si es necesario,
20 triturando los productos para obtener polvos. Las formulaciones granulares pueden prepararse siendo absorbidos los compuestos de fórmula (I) disueltos en disolventes adecuados (que pueden, si se desea, ser volátiles) por los diluyentes o vehículos sólidos en forma granular y, si se desea,
25 evaporando los disolventes, o granulando las composiciones en forma de polvo obtenido como se ha descrito antes. Las composiciones herbicidas sólidas, particularmente polvos humectables y gránulos, pueden contener agentes humectantes o dispersantes (por ejemplo de los tipos antes descritos),
30 que pueden también, cuando son sólidos, servir como diluyentes o vehículos.

Las composiciones líquidas de acuerdo con la invención pueden tomar forma de soluciones, suspensiones y emulsiones acuosas, orgánicas o acuoso-orgánicas que pueden
35 incorporar un agente tensioactivo. Diluyentes líquidos adecuados para incorporación en las composiciones líquidas incluyen agua, glicoles, glicol-éteres, alcohol tetrahidro-

21

furfurílico, acetofenona, ciclohexanona, isoforona, alquil-
pirrolidonas, butirilolactona, tolueno clorado, xileno,
aceites minerales, animales y vegetales, aceites vegetales
esterificados y fracciones aromáticas y nafténicas ligeras de
5 petróleo (y mezclas de estos diluyentes). Los agentes
tensioactivos, que pueden estar presentes en las composicio-
nes líquidas, pueden ser iónicos o no iónicos (por ejemplo de
los tipos descritos antes) y, cuando son líquidos, pueden
también servir como diluyentes o vehículos.

10 Polvos, gránulos dispersables y composiciones
líquidas en forma de concentrados pueden diluirse con agua u
otros diluyentes adecuados, por ejemplo aceites minerales o
vegetales, particularmente en el caso de concentrados
líquidos en los que el diluyente o vehículo es un aceite,
15 para dar composiciones listas para su uso.

 Cuando se desea, las composiciones líquidas de los
compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse en forma de
concentrados autoemulsionantes que contienen las sustancias
activas disueltas en los agentes emulsionantes o en disolven-
20 tes que contienen agentes emulsionantes compatibles con las
sustancias activas, produciendo la simple adición de dichos
concentrados a agua composiciones listas para su uso.

 Los concentrados líquidos en los que el diluyente
o vehículo es un aceite pueden utilizarse sin más dilución
25 usando la técnica de pulverización electrostática.

 Las composiciones herbicidas de acuerdo con la
presente invención pueden contener también, si se desea,
coadyuvantes convencionales, tales como adhesivos, coloides
protectores, agentes espesantes, agentes penetrantes, agentes
30 dispersantes, estabilizadores, tampones, agentes secuestran-
tes, agentes antiapelmazantes, agentes colorantes e inhibido-
res de la corrosión. Estos coadyuvantes pueden también servir
como vehículos o diluyentes.

 A menos que se especifique otra cosa, los siguien-
35 tes porcentajes se dan en peso. Las composiciones herbicidas
preferidas de acuerdo con la presente invención son encapsu-
laciones que contienen gránulos dispersables en agua que

67

comprenden de 1 a 90%, por ejemplo 25 a 75%, de uno o más compuestos de fórmula (I), de 1 a 15%, por ejemplo 2 a 10%, de agentes tensioactivos y de 5 a 95%, por ejemplo 20 a 60%, de diluyente sólido, por ejemplo arcilla, granuladas con
5 adición de agua para formar una pasta y a continuación secadas;

concentrados en suspensión acuosa que comprenden de 5 a 70% de uno o más compuestos de fórmula (I), de 2 a 10% de agente tensioactivo, de 0,1 a 5% de agente espesante y de 15
10 a 87,9% de agua;

polvos humectables que comprenden de 5 a 90% de uno o más compuestos de fórmula (I), de 2 a 10% de agente tensioactivo y de 8 a 88% de diluyente o vehículo sólido;

polvos solubles en agua o dispersables en agua que
15 comprenden de 5 a 90% de uno o más compuestos de fórmula (I), de 2 a 40% de carbonato de sodio y de 0 a 88% de diluyente sólido;

concentrados líquidos solubles en agua, que comprenden de 5 a 50%, por ejemplo de 10 a 30%, de uno o más
20 compuestos de fórmula (I), de 0 a 25% de agente tensioactivo y de 10 a 90%, por ejemplo 45 a 85%, de disolvente miscible en agua, por ejemplo trietilenglicol, o una mezcla de disolvente miscible en agua y agua;

concentrados líquidos en suspensión emulsionables
25 que comprenden de 5 a 70% de uno o más compuestos de fórmula (I), de 5 a 15% de agente tensioactivo, de 0,1 a 5% de agente espesante y de 10 a 84% de disolvente orgánico, por ejemplo aceite mineral; y

concentrados emulsionables que comprenden 0,05 a
30 90%, y preferiblemente de 1 a 60%, de uno o más compuestos de fórmula (I), de 0,01 a 10%, y preferiblemente de 1 a 10%, de agente tensioactivo y de 9,99 a 99,94%, y preferiblemente de 39 a 98,99%, de disolvente orgánico.

Los gránulos dispersables en agua que comprenden
35 isoxazoles de fórmula (I) cuya densidad aparente era 0,25-0,75, tenían un tamaño de partículas generalmente de 10-2000 μm , preferiblemente 300-1500 μm .

Las composiciones herbicidas de acuerdo con la presente invención pueden comprender también los compuestos de fórmula (I) en asociación con uno o más compuestos plaguicidamente activos, y preferiblemente dispersados
5 homogéneamente en ellos, y, si se desea, uno o más diluyentes o vehículos plaguicidamente aceptables compatibles, agentes tensioactivos y coadyuvantes convencionales como se han descrito antes.

Ejemplos de otros compuestos plaguicidamente
10 activos que pueden incluirse junto con las composiciones herbicidas de la presente invención, o utilizarse con ellas, incluyen herbicidas, por ejemplo para aumentar la gama de especies de malezas reprimidas, por ejemplo acetoclor, alaclor [2-cloro-2,6'-dietil-N-(metoxi-metil)-acetanilida],
15 atrazina [2-cloro-4-etilamino-6-isopropilamino-1,3,5-triazina], bromoxinil [3,5-dibromo-4-hidroxibenzonitrilo], clortolurón [N'-(3-cloro-4-metilfenil)-N,N-dimetilurea], cianazina [2-cloro-4-(1-ciano-1-metiletilamino)-6-etilamino-1,3,5-triazina], 2,4-D [ácido 2,4-diclorofenoxi-acético], dicamba
20 [ácido 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico], difenzocuat [sales de 1,2-dietil-3,5-difenil-pirazolio], dimetanamida, flampropmetil [N-2-(N-benzoil-3-cloro-4-fluoroanilino)-propionato de metilo], flufenacet, fluometrón [N'-(3-trifluoro-metilfenil)-N,N-dimetilurea], glifosato, glufosinato, isoproturón [N'-(4-isopropilfenil)-N,N-dimetilurea], metolacloro, metribuzin,
25 insecticidas, por ejemplo piretroide sintético, por ejemplo permetrin y cipermetrin, fipronil y fungicidas, por ejemplo carbamatos, por ejemplo N-(1-butil-carbamoil-bencimidazol-2-il)carbamato de metilo, y triazoles, por ejemplo 1-(4-clorofenoxi)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-il)-butan-2-ona.
30

Los compuestos plaguicidamente activos y otros materiales biológicamente activos que pueden incluirse en las composiciones herbicidas de la presente invención, o utilizarse junto con ellas, por ejemplo los antes mencionados, y
35 que son ácidos, pueden utilizarse, si se desea, en forma de derivados convencionales, por ejemplo sales y ésteres de metales alcalinos y aminas.

Los siguientes Ejemplos ilustran las composiciones herbicidas que pueden utilizarse en la presente invención. El ingrediente activo recogido en los siguiente ejemplos se refiere a un compuesto de fórmula general (I).

5

Ejemplo C1:

Un concentrado emulsionable se forma a partir de:

	Ingrediente activo	20% p/v
	N-metilpirrolidinona (NMP)	25% p/v
10	Dodecibencenosulfonato de calcio	70%
	(CaDDBS)	4% p/v
	Condensado de óxido de nonilfenol-etileno y óxido de propileno (NPEOPO)	4% p/v
	Disolvente aromático	hasta 100 volúmenes
15	agitando NMP, el ingrediente activo (Compuesto 1), CaDDBS, NPEOPO y el disolvente aromático hasta que se forme una solución transparente y ajustándola hasta el volumen con el disolvente aromático.	

20

Ejemplo C2

Un polvo humectable se forma a partir de:

	Ingrediente activo	50% p/p
	Dodecibencenosulfonato de sodio	3% p/p
	Metil-oleoil-aurato de sodio	5% p/p
25	Policarboxilato de sodio	1% p/p
	Policarboxilato de sodio	1% p/p
	Dióxido de silicio microfino	3% p/p
	Caolín	38% p/p
30	mezclando los ingredientes anteriores y triturando la mezcla en un molino de chorro de aire.	

Ejemplo C3

Un concentrado en suspensión se forma a partir de:

	Ingrediente activo	50% p/v
35	Anticongelante (propilenglicol)	50% p/v
	Triestirilfenol-fosfato etoxilado	0,5% p/v
	Nonilfenol etoxilado con 9 moles	

22

- de óxido de etileno 0,05% p/v
 - Policarboxilato de sodio 0,02% p/v
 - Atapulgita 1,5% p/v
 - Antiespumante 0,003% p/v
 - 5 Agua hasta 100 volúmenes
- agitando los ingredientes anteriores y mezclándolos en un molino de bolas.

Ejemplo C4

- 10 Un gránulo dispersable en agua se forma a partir de:
 - Ingrediente activo 50% p/p
 - Dodecylbencenosulfonato de sodio 3% p/p
 - Metil-oleoil-aurato de sodio 5% p/p
 - Policarboxilato de sodio 1% p/p
 - 15 Aglutinante (lignosulfonato de sodio) 8% p/p
 - Caolín 30% p/p
 - Dióxido de silicio microfino 3% p/p
- mezclando los ingredientes anteriores, triturando la mezcla en un molino con chorro de aire y granulándola por
- 20 adición de agua en una planta de granulación adecuada (por ejemplo secador en lecho fluido) y secándola. Opcionalmente el ingrediente activo puede triturarse bien solo o mezclado con algunos o todos los ingredientes.
- El Ejemplo siguiente no limitativo ilustra la
- 25 invención.

EJEMPLO 1

- Experimento en invernadero que mostró una mejora inesperada de la actividad biológica sobre malezas después de
- 30 aplicación del compuesto (isoxaflutol).
- Tiestos de 7 x 7 cm² se rellenaron con tierra de marga no estéril. Se colocaron semillas de malezas (*Amarant-*
hus retroflexus, *Echinochloa crus-galli* y *Setaria viridis*) en tres pocillos poco profundos separados con una semilla de
- 35 maíz (Pioneer 3394) insertada a una profundidad de 4 cm en cada tiesto y las semillas ligeramente cubiertas con tierra.
- Una solución de 1 ml de isoxaflutol técnico,

diluido adecuadamente para proporcionar una dosis equivalente a 6,25, 12,5, 25, 50 y 100 g/ha en acetonitrilo, se pipeteó uniformemente sobre la superficie de la tierra de los tiestos (se repitió 10 veces) de acuerdo con el siguiente régimen.

5 El día 1, se trató un conjunto de 5 tiestos con 5 dosis (6,25-100 g/ha) y se puso aparte en el invernadero. Al mismo tiempo, el día 1 se trató un segundo conjunto de 4 tiestos con 4 dosis (tratamiento A: 6,25-50 g/ha) junto con un tercer conjunto de 3 tiestos tratados con 3 dosis (tratamiento B: 6,25-25 g/ha). El día 2, se trató de nuevo cada uno de los tiestos del segundo y tercer conjuntos, recibiendo los tiestos tratamientos A y B idénticos y el segundo conjunto de tiestos se puso aparte en el invernadero. El tercer día se trató de nuevo cada uno de los tiestos del 10 tercer conjunto, recibiendo los tiestos el tratamiento B idéntico. El día 4 se trató cada uno de los tiestos del tercer conjunto, recibiendo los tiestos tratamiento B idéntico y se puso aparte en el invernadero.

Se mantuvieron los tiestos en un invernadero, con 20 una riego por la parte superior (3 veces al día) e limunicación suplementaria. 14 días después del tratamiento (DAT) se realizó una valoración visual del % de reducción, comparándola con las plantas testigo no tratadas. Los resultados (media de 10 repeticiones) se muestran en la Tabla 1, en la que el 25 régimen de dosificación se refiere al número de aplicaciones diarias seguido por la dosis de compuesto cada día.

30

35

24

TABLA 1

% de daño 14 DAT: Comparación de la aplicación única frente a las aplicaciones múltiples

5	% de daño				
	Régimen de dosificación	A.retro-flexus	E. crus-galli	S. viridis	Maíz (P3394)
	2 x 6,25	34	18	18	0
	1 x 12,5	0	0	0	0
10	4 x 6,25	80	97	75	0
	2 x 12,5	46	68	42	0
	1 x 25	8	32	10	0
15	4 x 12,5	79	100	91	6
	2 x 25	42	70	44	0
	1 x 50	50	84	24	2
	4 x 25	90	100	77	6
	2 x 50	78	96	66	10
	1 x 100	79	94	59	8

20 Como puede observarse en la Tabla 1, la eficacia del herbicida sobre especies de malezas claves se mejora por 2 aplicaciones separadas por 1 día y sorprendentemente incluso se mejora más por 4 aplicaciones separadas por 3 días, en comparación con una única aplicación de la misma 25 dosis total de compuesto. Las aplicaciones repetidas no parece que tengan ningún impacto sobre la fitotoxicidad del maíz.

EJEMPLO 2

30 Se preparó una solución acuosa al 30% de Gerol y se añadieron 67 g a 80 g de una suspensión de isoxaflutol (250 g/l) en agua que contenía un dispersante (polinaftalensulfato de sodio para mantener la suspensión) con agitación. Se 35 añadió carbonato de calcio en polvo (1 g) y la mezcla resultante se trató con ultrasonido antes de la adición de aceite de polisiloxano (600 ml) para proporcionar una

23

emulsión. Se añadió ácido acético (3 ml) y se continuó la agitación durante 2 horas. Se detuvo la agitación y la capa superior se decantó del precipitado. Este sólido se separó por filtración, se lavó con agua y se secó dando micropartículas del isoxaflurol encapsulado. El material encapsulado puede formularse utilizando los métodos descritos anteriormente.

Gerol: Copolímero de dietilenglicol-etilenglicol-ácido isoftálico-5-sulfoisofталato de sodio-ácido tereftálico-trietilenglicol.

EJEMPLO 3

Se sembró maíz y a continuación se dejó crecer en zonas en las que estaban presentes malezas y semillas de malezas. Las malezas eran una selección de *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Eleusine indica*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Sorghum halepense*, *Cyperus esculentus*, *Cyperus iria*, *Cyperus rotundus*, *Eleocharis acicularis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Bidens pilosa*, *Chenopodium album*, *Galium aparine*, *Ipomoea purpurea*, *Lamium purpureum*, *Matricaria inodora*, *Sesbania exalta*, *Sinapis arvensis*, *Solanum nigrum*, *Stellaria media*, *Veronica hederifolia*, *Veronica persica*, *Viola arvensis* y *Xanthium strumarium*.

Una semana después de sembrado el maíz, se pulverizó isoxazol como una formulación encapsulada como se ha descrito antes a una tasa de 105 g/ha de compuesto herbicidamente activo, siendo la relación en peso de isoxazol:copoliéster 1:10. Al cabo de 4 días se midieron las cantidades de isoxazol de fórmula (I) y DKN en un núcleo de suelo de 5 cm de profundidad alrededor de la semilla o plántula. Se encontró que la relación en peso de isoxazol:DKN era 1.

Después de 3 semanas se observó la actividad del isoxazol sobre la cosecha y las malezas y se encontró que era igual al 2% y al 95%, respectivamente.

Una aplicación similar en condiciones de suelo similares sin el copoliéster proporcionó una relación en peso

28

de isoxazol:DKN de 0,1 y una actividad herbicida tanto sobre la cosecha como sobre las malezas del 15% y del 95% respectivamente.

5 EJEMPLO 4

Se sembró maíz en una zona donde estaban presentes malezas y semillas de malezas de la especie *Setaria viridis*. Se pulverizó isoxazol sobre la superficie del suelo como una formulación encapsulada en una tasa de 105 g de compuesto herbicidamente activo por hectárea. Se observó la actividad del isoxazol sobre maíz y *Setaria viridis* 6, 11, 14 y 17 días después de tratamiento (DAT).

15 Actividad de 4-benzoilisoxazol sobre *Setaria viridis*

Tasa de aplicación g/ha	Formulación	DAT			
		6	11	14	17
105	encapsulada	0	40	70	90
	WG	10	50	75	100

25 Actividad de 4-benzoilisoxazol sobre maíz

Tasa de aplicación g/ha	Formulación	DAT			
		6	11	14	17
105	encapsulada	0	0	3	8
	WG	0	5	7	10

La actividad sobre *Setaria viridis* por la formulación encapsulada era igual a la de la formulación WG. La formulación encapsulada disminuía la fitotoxicidad sobre el

maíz en un 20-30% en comparación con la formulación de WG.

EJEMPLO 5

Se sembró maíz y se dejó crecer en una zona en la que estaban presentes malezas y plántulas de malezas. Las malezas eran *Amaranthus retroflexus*, *Echinochloa crus-galli* y *Setaria viridis*. Las soluciones de isoxazol en acetonitrilo se aplicaron directamente a la superficie del suelo en unas tasas de 100, 50 y 25 g/ha a los tiestos A, B y C respectivamente. Un DAT se aplicaron tasas de 50 y 25 g/ha a los tiestos B y C, respectivamente, 2 y 3 DAT se aplicó al tiesto C una tasa de 25 g/ha.

14 días después de tratamiento (DAT) se observó la actividad del isoxazol sobre el maíz y las especies de malezas.

Régimen de dosificación	A. retroflexus	E. crus-galli	S. viridis	Maíz
4 x 25 g/ha	90	100	77	6
2 x 50 g/ha	78	96	66	10
1 x 100 g/ha	79	94	59	8

Manteniendo el isoxazol en la superficie del suelo dentro de la zona que contiene las semillas y plántulas de malezas, por aplicaciones secuenciales de bajas tasas de isoxazol, se obtienen mejor actividad sobre las malezas.

REIVINDICACIONES

- 1.- Un método para reprimir el crecimiento de malezas en un lugar en un medio de crecimiento sólido, que
5 comprende tratar el lugar con una composición que contiene un herbicida de isoxazol para proporcionar un suministro o liberación progresivo o secuencial del herbicida de isoxazol a la capa superficial del medio.
- 2.- Un método de acuerdo con la reivindicación 1,
10 en el que el medio de crecimiento es suelo.
- 3.- Un método de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, en el que el lugar es un lugar en el que crecen cosechas.
- 4.- Un método de acuerdo con la reivindicación 1,
15 2 ó 3, en el que la capa superficial del medio abarca desde la superficie hasta una profundidad de 10 cm.
- 5.- Un método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, que comprende aplicar al lugar dosis bajas secuenciales del herbicida de isoxazol.
- 20 6.- Un método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, que comprende tratar el lugar con una composición de liberación retardada que contiene el herbicida de isoxazol.
- 7.- Un método de acuerdo con la reivindicación 6,
25 en el que la composición de liberación retardada contiene una composición encapsulada.
- 8.- Un método de acuerdo con la reivindicación 6 ó 7, en el que se utiliza un isoxazol encapsulado, que contiene un derivado de isoxazol encapsulado dentro de una
30 película sólida que está constituida por un material inerte que por sí mismo no tiene actividad herbicida sustancial.
- 9.- Un método de acuerdo con la reivindicación 8, en el que se utilizan gránulos de un derivado de isoxazol con un tamaño desde 0,1 hasta 50 μm .
- 35 10.- Un método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones anteriores, en el que el derivado de isoxazol tiene la fórmula general I que se ha definido

anteriormente. '2

11.- Una composición de liberación retardada que contiene un herbicida de isoxazol.

12.- Un método de acuerdo con la reivindicación 1, sustancialmente como se ha descrito antes en el Ejemplo 1. 5

13.- Una composición de liberación retardada de acuerdo con la reivindicación 9, sustancialmente como se ha descrito antes.

RESUMEN

La invención proporciona un método para reprimir el crecimiento de malezas en un lugar en un medio de crecimiento sólido, que comprende tratar el lugar con una composición que
5 comprende un herbicida de isoxazol para proporcionar un suministro o liberación progresivo o secuencial del herbicida de isoxazol a la capa superficial del medio.

Folios 31 y 32 corresponden a Tarjetas temático y de
propietarios 201001

31/10

EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD:	(51) INT. CL.
(22) FECHA DE PRESENTACION:	(71) SOLICITANTE: AVENTIS AGRICULTURE LIMITED.
(30) PRIORIDAD:	
(31) No. DE SOLICITUD: 9902232-9 y 9908313-1	(72) INVENTOR/ES: DAVID ALAN ROBERTS, ROBERT ZERROUK, y RACHEL COLEGATE.
(32) FECHA DE PRESENTACION: 01-02-99 12-04-99	(74) APODERADO: CARLOS R. OLARTE
(33) PAIS: GB/GB	

(54) TITULO : REPRESION DE MALEZAS.

(57) RESUMEN :

La invención proporciona un método para reprimir el crecimiento de malezas en un lugar en un medio de crecimiento sólido, que comprende tratar el lugar con una composición que comprende un herbicida de isoxazol para proporcionar un suministro o liberación progresivo o secuencial del herbicida de isoxazol a la capa superficial del medio.

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN/TRÁMITE

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Indicación : 00005989 00000000 Folios: 33
Fecha (IMP): 2000-02-01 17:17:00
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRADO/ 001 SOLICITUD
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Patente de Invención ☒ Modelo de Utilidad

- | | | | |
|-------------------------------------|---|----|--------------------------|
| ☐ | Nombre e identificación del solicitante | 1 | ☐ |
| ☐ | Nombre e identificación del inventor | 2 | ☐ |
| ☐ | Título o nombre de la invención | 3 | ☐ |
| ☐ | Descripción | 4 | ☐ |
| ☐ | Reivindicaciones | 25 | ☐ |
| ☐ | Resumen | 27 | ☐ |
| ☒ | Comprobante de pago | 2 | ☐ |

COMPLETA

INCOMPLETA

Diseño Industrial ☐

- | | |
|-------------------------------------|--|
| ☐ | Nombre e identificación del solicitante |
| ☐ | 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 _____

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 0-05909

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 [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI [] | NO [x] | 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 el Decreto 298 del 17 de febrero de 1999). |
| SI [x] | NO [] | EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI [] | NO [x] | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

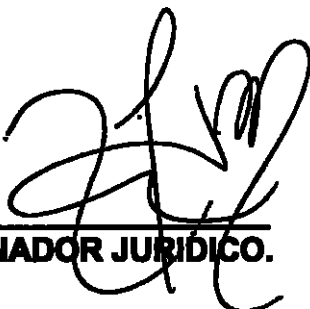
OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud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

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

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

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

Santafé de Bogotá, D.C., 2 de Febrero del 2000


EXAMINADOR JURÍDICO.

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES

Primer EXAMEN DE FORMA

RADICACIÓN N° 0-05969

CONCEPTO TÉCNICO N° 301 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES A01N 43/80

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., 25-02-00.

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
1er examen de forma

CONCEPTO TÉCNICO No.301

EXPEDIENTE No. 0-05909

A01N43/80

El título debe estar acorde con las reivindicaciones y la descripción por lo tanto para mayor claridad debe complementarse indicando que además del método para la represión de malezas, la composición de liberación retardada que contiene un herbicida de isoxazol.

Las unidades de área se deben expresar según el Sistema Internacional de unidades (SI).

Respecto a las reivindicaciones 7, 8 y 10 es de anotar que definitivamente el método no se caracteriza por el ingrediente activo y la forma como se encuentre en la composición que se utilice en dicho método sino por las etapas y condiciones de operación características del mismo.

La reivindicación 11 y la 13 no definen ninguna composición de liberación retardada puesto que ella no sólo se caracteriza por el ingrediente activo sino por los demás componentes que le dan forma de aplicación a la misma, junto con la proporción definida en forma precisa en que se encuentran cada uno de ellos.

Para la reivindicación 12 se anota que por razones de claridad y precisión en las reivindicaciones no se aceptan referencias a los ejemplos ni a la descripción.

Adicionalmente, para tenerse en cuenta en la presentación del nuevo capítulo reivindicatorio vale decir que el término sustancial utilizado en la reivindicación 8 es ambiguo. También la reivindicación 10 es incoherente, se está haciendo referencia a un derivado de isoxazol el cual no se encuentra definido anteriormente, como se indica. Respecto a la reivindicación 13 es incoherente puesto que hace referencia a la composición de la reivindicación 9 siendo que dicha reivindicación 9 se relaciona es con un método.

En el resumen del extracto debe estar contenido la composición de liberación retardada.

De acuerdo a lo anterior se deben hacer las correcciones respectivas presentando NUEVO capítulo reivindicatorio COMPLETO de forma que sea claro y preciso.

Anexar nuevo extracto y tarjetas archivo temático y de propietarios.

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

CÓDIGO 202001
Examinador Técnico de Patentes

Santa Fe de Bogotá, D.C. 25 febrero de 2000

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

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 0-05909

AUTO 0231

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor XXXXXX 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 complemente 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

07 MAR. 2000

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los _____

EL JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., **09 MAR 2000** notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI___ NO___

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA