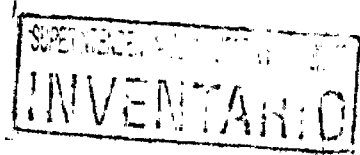




Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organización CSA



**SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION**

00-9716

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO

NOVEDOSAS SALES DE PIRIDILSULFONILUREA HERBICIDAMENTE ACTIVAS,
PROCESOS PARA SU PREPARACION, COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN ESTOS COMPUESTOS Y
USO DE LAS MISMAS.

Ver titulo nuevo en folio 60

51.

CLASIFICACION INTERNACIONAL

AOIN 47/36, 43/40

71.

SOLICITANTE

NOVARTIS AG

DOMICILIO

BASILEA, SUITZA

74.

APODERADO

JIMENA ESCOBAR URIBE

22.

SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

14 DE FEBRERO DEL 2000

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00009716 00000000

Folios: 53

Fecha (AMD): 2000-02-14 16:54:31

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2000 DIVISION DE MARCAS ORIENTADAS

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social NOVARTIS AG

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio SUIZA

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad BASILEA

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección y Domicilio CRA. 11A No. 94-76, OFICINA 305

Ciudad SANTAFÉ DE BOGOTÁ

Teléfono 6 162051/61

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

1. ANDREA ROLF STING; 2. STEFAN KÖNIG; 3. WOLFGANG STUTZ;

4. ANDRÉ JOSEPH GEOFFROY; 5. RAFFAELE MARRO; 6. FREDDY

PFAMMATTER; 7. ANDREAS BURKHARD.

Identificación

Dirección

1. GIPF-OBERFRICK, SUIZA; 2. KAISERAUGST, SUIZA; 3. MONTHY,

SUIZA; 4. HABSHEIM, FRANCIA; 5. MOEHLIN, SUIZA; 6. RHEINFELDEN,

Ciudad

SUIZA; 7. BASILEA, SUIZA.

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención NOVEDOSAS SALES DE PIRIDILSULFONILUREA HERBICIDAMENTE ACTIVAS, PROCESOS

PARA SU PREPARACIÓN, COMPOSICIONES QUE COMPRENEN ESTOS COMPUESTOS Y USO DE LAS MISMAS.

PRIORIDAD REIVINDICADA:

SÍ ☒

NO

TIPO DE PRIORIDAD:

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País SUIZA

Fecha MARZO 1, 1999

(31) No. Solicitud 369/99

Para publicar a los

☒

6 meses

☐

12 meses

☐

18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

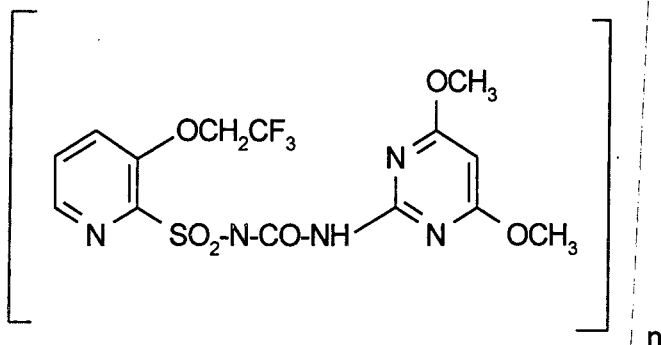
(51) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

C 07

2305/P

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

Proveer con los compuestos de la formula I:



en donde:

M es un metal alcalino o un metal alcalinotérreo;

n es 1 ó 2;

r y s, independientemente uno del otro, son 0, 1/2, 1, 1 1/2, 2, 2-1/2 ó 3; y

L es acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetilica, acetamida dimetilica, N-metil-2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario, clorobenceno, tolueno, o xileno, con la condición de r sea diferente de 1-1/2 si L es dioxano y s es 0.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica No. 17.398 ☒

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC No. 17.398 ☒

Recibo de la tasa respectiva No. 00 - 5,317 ☒

Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación ☐

Si se reivindica prioridad Andina:

Copia de la 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 propiedad según formato ☒

Tarjeta archivo temático según formato ☒

Extracto para publicación según formato ☒

Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms ☐

Otros documentos ☐

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

FIRMA
NOMBRE

Jimena Escobar Uribe
JIMENA ESCOBAR URIBE

C.C. 39.779.452 Usaquén.

T.P. No. 68.228

2305

2

Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 00 - 5,317
FECHA : ENERO 24 DE 2000

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00009716 00000000 Folios: 53
NIT : 800176089-2 Fecha (AMD): 2000-02-14 16:54:31
Trabite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

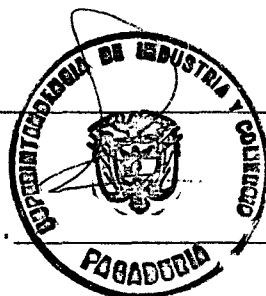
DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BOBAR UNIZE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00024-9	777983	24/01/2000	3,848,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50035-01-01	SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN 608,000.00
			TOTAL : \$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

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

HERBICIDAS NOVEDOSOS

La presente invención se refiere a novedosas sales de piridilsulfonilurea herbicidamente activas, a procesos para su preparación, a composiciones que comprenden estos compuestos, y al uso de las mismas para controlar hierbas, en particular, en cultivos de plantas cultivadas, o para inhibir el crecimiento de las plantas.

Diferentes formas de cristal (modificaciones) de un compuesto químico pueden exhibir propiedades físicas muy diferentes, que pueden conducir a problemas imprevisibles durante la preparación técnica y el procesamiento de estos compuestos.

Las características de las modificaciones de cristales con frecuencia tienen una influencia crucial sobre la capacidad de separación (filtración), posibilidad de agitación (volumen de cristal), actividad superficial (espumación), velocidad de secado, solubilidad, calidad, capacidad de formulación, y estabilidad al almacenamiento (por ejemplo higroscopía) de, por ejemplo, compuestos farmacéuticamente y agronómicamente activos. Por ejemplo, las propiedades de molienda y formulación (por ejemplo, formación de tabletas) de los productos pueden ser completamente diferentes, dependiendo de la modificación del cristal respectivo (Pharm. Ind. 59, 2, 165-169 (1997)).

Debido a que, en las diferentes etapas de síntesis de un proceso de preparación, son importantes diferentes propiedades físicas de los productos de síntesis respectivos, es especialmente conveniente encontrar la forma de cristal óptimamente adecuada para la etapa de síntesis respectiva.

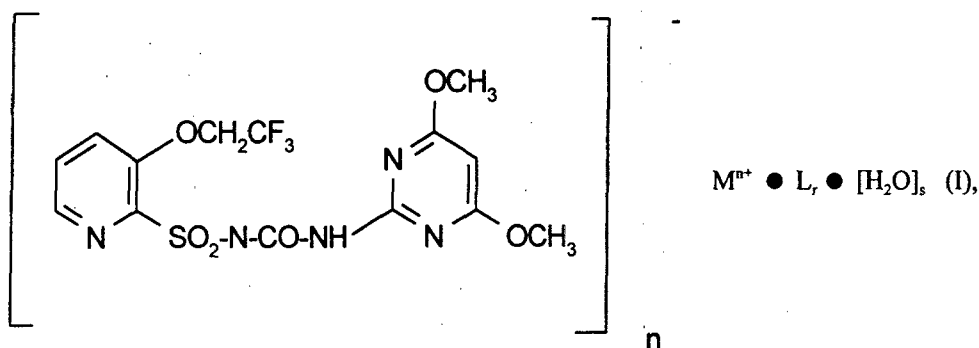
Además, una modificación puede transformarse repentinamente en otra modificación indeseada bajo ciertas condiciones termodinámicas. Estas transformaciones pueden ser reversibles o irreversibles, y en general no son predecibles.

Las sales de piridilsulfonilurea con actividad herbicida se describen, por ejemplo, en la Publicación Internacional Número WO 97/41112. A partir de la descripción de la preparación de la sal sódica de N-[3-(2-trifluoroetoxi)-piridin-2-il-sulfonil]-N'-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-urea mencionada en este documento, sin embargo, no es posible deducir si se obtienen productos amorfos o cristalinos, o cuáles modificaciones o mezclas de modificaciones de cristal se producen, debido a que no se mencionan los parámetros físicos, tales como temperatura, humedad, y presión, que son cruciales para la síntesis dirigida. En adición, el punto de fusión solamente caracteriza una estructura de cristal de una manera insuficiente, debido a que, durante el procedimiento de medición, la modificación del cristal original se puede transformar en otra modificación o en mezclas de modificaciones. Más aún, el punto de fusión se puede falsificar

por la presencia de material amorfo y por la evaporación del solvente solvatante.

Por consiguiente, es el objetivo de la presente invención proporcionar específicamente modificaciones del cristal de sales de N-[3-(2-trifluoroetoxi)-piridin-2-il-sulfonil]-N'-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-urea, cuyas propiedades mejoren sustancialmente la preparación técnica del ingrediente activo, su formulación, y su posibilidad de almacenamiento.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se refiere a compuestos de la fórmula I:



en donde:

M es un metal alcalino o un metal alcalinotérreo;

n es 1 ó 2;

r y s, independientemente uno del otro, son 0, 1/2, 1, 1 1/2, 2, 2-1/2 ó 3; y

L es acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetílica, acetamida dimetílica, N-metil-

2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario, clorobenceno, tolueno, o xileno, con la condición de r sea diferente de 1-1/2 si L es dioxano y s es 0.

M como un metal alcalino y como un metal alcalinotérreo, en el contexto de la presente invención, es de preferencia sodio, potasio, magnesio, y calcio.

La presente invención incluye todas las modificaciones de cristal que se puedan formar mediante los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos preferidos de la fórmula I se caracterizan porque L es dioxano, tetrahidrofurano, o agua.

Se da una preferencia adicional a los compuestos de la fórmula I en donde n es 1, y M es especialmente sodio.

También se prefieren los compuestos de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0.

También es notoria la forma sólida amorfa del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0.

Por ejemplo, esta forma se puede utilizar para producir otras modificaciones de cristal, tal como la modificación C. Por consiguiente, la forma amorfa forma un objeto adicional de la presente invención.

Los compuestos individuales particularmente preferidos que caen dentro del alcance de la fórmula I son los compuestos seleccionados a partir de:

- la modificación B del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$: 10.0/promedio; 9.2/fuerte; 8.6/muy débil; 8.1/débil; 7.2/fuerte; 6.9/fuerte; 6.4/promedio; 5.82/fuerte; 5.75/fuerte; 5.64/muy fuerte; 5.53/muy débil; 5.13/promedio; 4.97/muy fuerte; 4.65/promedio; 4.30/muy fuerte; 4.22/débil; 4.15/muy débil; 4.02/débil; 3.94/promedio; 3.79/promedio; 3.73/débil; 3.68/promedio; 3.61/débil; 3.58/débil; 3.52/muy fuerte; 3.42/muy débil; 3.37/débil; 3.31/muy débil; 3.27/muy débil; 3.23/débil; 3.18/promedio; 3.08/muy débil; 3.03/muy débil; 2.95/muy débil; 2.87/fuerte; 2.82/muy débil; 2.79/muy débil; 2.73/muy débil; 2.68/muy débil; 2.65/muy débil; 2.63/muy débil; 2.60/débil; 2.57/débil;

- la modificación J del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahidrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$: 15.7/débil; 10.2/muy fuerte; 8.2/débil; 7.8/débil; 7.3/débil; 6.7/débil; 6.5/muy débil; 6.2/promedio; 5.64/muy débil; 5.53/débil; 5.42/débil; 5.09/débil; 4.96/promedio; 4.86/muy débil; 4.60/promedio; 4.37/promedio; 4.24/débil; 4.11/muy fuerte; 3.95/muy débil; 3.90/débil;

3.81/muy débil; 3.71/promedio; 3.62/débil; 3.62/muy débil;
 3.52/muy débil; 3.43/fuerte; 3.37/débil; 3.32/muy débil;
 3.27/débil; 2.94/muy débil; 2.82/promedio;

- la modificación K del compuesto de la fórmula I,
 5 en donde M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 0, caracterizada
 por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$:
 13.4/débil; 10.1/muy débil; 9.3/muy fuerte; 7.8/débil; 6.9/muy
 débil; 6.7/muy débil; 5.63/muy débil; 5.35/promedio;
 4.66/débil; 4.44/muy débil; 4.35/débil; 4.12/fuerte;
 10 3.94/fuerte; 3.87/muy débil; 3.76/débil; 3.61/promedio;
 3.49/muy débil; 3.40/muy débil;

- la modificación C del compuesto de la fórmula I,
 en donde M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 1, caracterizada
 por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$:
 15 13.1/promedio; 11.0/muy fuerte; 8.8/débil; 7.7/muy fuerte;
 7.2/muy fuerte; 7.0/débil; 6.4/débil; 6.2/fuerte; 5.96/débil;
 5.90/débil; 5.64/fuerte; 5.47/débil; 5.34/promedio; 5.19/débil;
 4.79/débil; 4.74/promedio; 4.64/muy débil; 4.55/fuerte;
 4.47/débil; 4.35/fuerte; 4.26/promedio; 4.13/débil; 4.06/muy
 20 débil; 3.92/muy fuerte; 3.87/débil; 3.79/muy fuerte;
 3.67/débil; 3.61/promedio; 3.58/fuerte; 3.47/débil; 3.32/muy
 débil; 3.24/promedio; 3.14/débil; 3.12/débil; 3.07/débil;
 3.04/fuerte; 2.97/muy débil; 2.92/muy débil; 2.88/débil;
 2.82/débil; 2.77/muy débil; 2.74/muy débil; 2.69/débil;
 25 2.66/muy débil; y

- la modificación I del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es 1, y s es 1, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$: 1.6/débil; 9.8/muy débil; 8.0/muy fuerte; 7.6/promedio; 6.7/fuerte; 6.4/muy débil; 6.3/débil; 6.1/muy débil; 5.80/promedio; 5.66/muy débil; 5.47/fuerte; 5.12/muy débil; 5.08/muy débil; 4.84/débil; 4.76/débil; 4.47/fuerte; 4.40/débil; 4.21/promedio; 4.19/promedio; 4.15/muy débil; 4.00/muy débil; 3.93/muy débil; 3.84/promedio; 3.72/muy fuerte; 3.58/promedio; 3.52/promedio; 3.32/muy débil; 3.28/muy débil; 3.25/muy débil; 3.11/muy débil; 3.07/muy débil; 2.95/muy débil; 2.86/débil; 2.82/muy débil; 2.75/muy débil; 2.57/débil; 2.49/muy débil.

Se atribuye un significado especial a la modificación B.

También se da preferencia a:

- la modificación K del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0, producida secando el compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0 (modificación J), a una temperatura de 35°C a 65°C al vacío.

- la modificación C del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1, producida ya sea mediante:

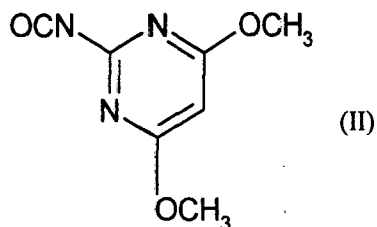
el contacto de la forma esencialmente amorfa (modificación A) con aire de una humedad relativa del 98 por ciento, o mezclando la modificación K del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0, con 5 agua, en una proporción del agua a la modificación K de 0.01:1 a 0.4:1, y separando y secando el producto obtenido a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar;

- la modificación B del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1, producida 10 mediante la adición de agua al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, y L, r , y s se definen como para la fórmula I, en una proporción del agua a este compuesto de 0.05:1 a 20:1, filtrando y secando el residuo de la filtración a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 15 bar, o producida de preferencia mediante la adición de agua al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0 (modificación K), o al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0 (modificación J), o al 20 compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es 1, y s es 1 (modificación I), o al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1 (modificación C), en una proporción del agua a la modificación K, J, I, ó C de 0.5:1 a 20:1, filtrando y secando

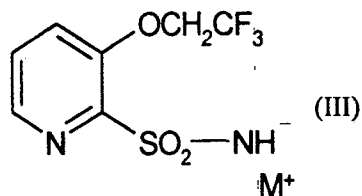
el residuo de la filtración a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

En la modificación K, la estabilidad termodinámica sorprendentemente alta y las propiedades no higroscópicas, son especialmente notorias. La modificación B tiene similarmente una alta estabilidad en la presencia de agua. Esta propiedad es conveniente especialmente en la preparación de formulaciones del ingrediente activo. Por consiguiente, se da una importancia particular a las modificaciones K y B.

El compuesto de la fórmula I se puede producir mediante un proceso generalmente conocido, mediante el cual, se hace reaccionar un compuesto de la fórmula II:



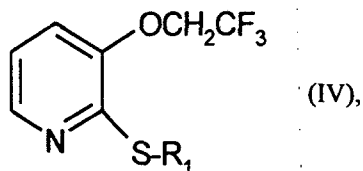
en acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetílica, acetamida dimetílica, N-metil-2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario, clorobenceno, tolueno, o xileno, con un compuesto de la fórmula III:



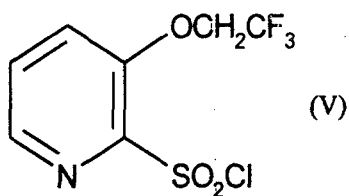
en donde M es como se define en la fórmula I.

El compuesto de la fórmula II se hace reaccionar con el compuesto de la fórmula III a temperaturas de -20°C a 180°C , prefiriéndose una escala de temperatura de 30°C a 80°C . Los compuestos de las fórmulas II y III se pueden utilizar en cantidades estequiométricas equivalentes, aunque puede ser conveniente un ligero exceso de isocianato.

La preparación del compuesto de partida de la fórmula II se describe, por ejemplo, en la Patente Europea Número EP-A-0,232,067, página 29. Los compuestos de la fórmula III se pueden preparar, por ejemplo, convirtiendo el compuesto de la fórmula IV:



en donde R_1 es $-\text{CH}_2$ -fenilo o isopropilo, por medio de cloración acuosa, en el compuesto de la fórmula V:



Este compuesto se trata con amoníaco acuoso, y luego la sulfonamida resultante se hace reaccionar con metilato de sodio al 30 por ciento. Estas reacciones son conocidas, y son familiares para el especialista.

Las modificaciones del cristal preferidas de los compuestos de la fórmula I se producen mediante procesos que se han desarrollado especialmente para la presente invención. Por consiguiente, estos procesos forman un objeto adicional de la presente invención.

El proceso para la preparación de la modificación J del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0, por consiguiente, se caracteriza porque b7se agrega una solución del 5 al 25 por ciento en peso de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en tetrahydrofurano exento de agua, a una temperatura de 35°C a 65°C, a una suspensión del 15 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahydrofurano exento de agua.

Después de agregar el 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato, la mezcla de reacción se agita hasta que se termina la conversión. Este proceso de preferencia se realiza a una temperatura de 40°C a 50°C. La modificación J obtenida se puede
5 separar de la mezcla de reacción mediante filtración.

El proceso para la preparación de la modificación K del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, *n* es 1, *r* es 0, y *s* es 0, se caracteriza porque se agrega una solución del 5 al 25 por ciento en peso de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en
10 tetrahidrofurano exento de agua, a una temperatura de 35°C a 65°C, a una suspensión del 15 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahidrofurano exento de agua, luego se filtra, y el residuo de la filtración (modificación J) subsecuentemente se seca a
15 una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

Después de agregar el 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato, la mezcla de reacción se agita hasta que se termina la conversión. Para el secado en esta variante del proceso, se
20 prefieren una temperatura de 40°C a 60°C, y una presión de 0.02 a 0.06 bar.

El proceso para la producción de la modificación C del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, *n* es 1, *r* es 0, y *s* es 1, se caracteriza porque se expone ya sea la forma
25 esencialmente amorfa (modificación A) a una atmósfera de

humedad relativa del 98 por ciento, o bien la modificación K se mezcla con agua en una proporción del agua a la modificación K de 0.1:1 a 0.4:1, luego se filtra, y el residuo de la filtración subsecuentemente se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

Cuando se produce la modificación C, la proporción del agua a la modificación K puede variar de 0.1:1 a 0.4:1, prefiriéndose en articular una proporción de 0.1:1 a 0.3:1. La adición de agua puede tener lugar a una temperatura de 0°C a 60°C, más preferiblemente a una temperatura de 5°C a 40°C. El secado de la modificación C de preferencia se efectúa a una temperatura de 40°C a 60°C, y a una presión de 0.02 a 0.06 bar.

La modificación C convenientemente se puede producir mediante la adición de N-[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)carbamoyl]-3-(2,2,2-trifluoro-etoxi)-piridin-2-sulfonamida a una solución de hidróxido de sodio acuoso, después se concentra por evaporación al vacío a una temperatura de 50°C, el residuo así obtenido se agita con dietiléter, se filtra, se seca a temperaturas de $\geq 120^{\circ}\text{C}$, y la sal esencialmente amorfa así obtenida (modificación A) se expone entonces a una atmósfera de humedad relativa del 98 por ciento.

El proceso para la preparación de la modificación I del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahidrofurano, r es 1, y s es 1, se caracteriza porque se agrega una solución del 5 al 25 por ciento en peso de 4,6-

dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en tetrahidrofurano exento de agua, a una temperatura de 0°C a 30°C, a una suspensión del 10 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahidrofurano exento de agua, y subsecuentemente se agregan de 1 a 20 equivalentes molares de agua, basándose en la sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida.

En esta variante, se prefiere en particular la adición de 2 a 5 equivalentes molares de agua.

El proceso para la producción de la modificación B del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 1, y s es 1, se caracteriza porque se agrega agua al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, y L, r , y s son como se definen en la fórmula I, en una proporción del agua a este compuesto de 0.5:1 a 20:1, luego tiene lugar la filtración, y el residuo de la filtración se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

Una variante preferida del proceso de acuerdo con la invención para la producción de la modificación B, se caracteriza porque se agrega agua al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0 (modificación K), o al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahidrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0 (modificación J), o al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es

tetrahidrofurano, r es 1, y s es 1 (modificación I), o al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1 (modificación C), en una proporción del agua a la modificación K, J, I, ó C de 0.5:1 a 20:1, luego tiene lugar la filtración, y el residuo de la filtración subsecuentemente se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

La temperatura durante la adición de agua puede variar de 0°C a 80°C. Se prefiere en particular una temperatura de 5°C a 40°C. El residuo de la filtración se puede secar a temperaturas de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar, de preferencia a una temperatura de 40°C a 60°C, y a una presión de 0.02 a 0.06 bar. Es más conveniente mezclar la suspensión con cristales de siembra de la modificación B con el objeto de acelerar el crecimiento del cristal.

Los compuestos de la fórmula I se pueden utilizar como herbicidas en una forma no modificada, es decir, como se obtengan en la síntesis. Sin embargo, de preferencia se procesan de una manera convencional con los excipientes que se acostumbran en la tecnología de la formulación, por ejemplo en soluciones directamente rociables o diluibles, polvos humectables, polvos solubles o dispersables, granulados solubles o dispersables, polvos secos, y también los denominados fluibles no acuosos. Una composición que se prefiere especialmente de acuerdo con la invención, está

presente en la forma de granulados solubles o dispersables, y contiene la modificación del cristal B como el compuesto de la fórmula I.

Las formulaciones adecuadas para los compuestos de la fórmula I se describen, por ejemplo, en la Publicación Internacional Número WO 97/34485, en las páginas 9 a 13. Como con el tipo de agentes, los métodos de aplicación, tales como rociado, atomización, espolvoreo, humectación, dispersión, o riego, se seleccionan de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalecientes.

Las formulaciones, es decir, los agentes, las preparaciones, o las composiciones que contienen al ingrediente activo de la fórmula I, o cuando menos un ingrediente activo de la fórmula I, y usualmente uno o más auxiliares de formulación sólidos o líquidos, se preparan de una manera conocida, por ejemplo mediante mezcla homogénea y/o molienda de los ingredientes activos con los auxiliares de formulación, normalmente solventes o vehículos sólidos. Adicionalmente se pueden utilizar compuestos de actividad superficial (tensoactivos) para la preparación de las formulaciones. Los ejemplos de los solventes y vehículos sólidos se describen en la Publicación Internacional Número WO 97/34485, en la página 6.

Dependiendo del tipo de ingrediente activo de la fórmula I que se vaya a formular, los compuestos de actividad

superficial adecuados son tensoactivos y mezclas de tensoactivos no iónicos, catiónicos, y/o aniónicos que tengan buenas propiedades dispersantes y humectantes.

Los ejemplos de los tensoactivos aniónicos, no iónicos, y catiónicos adecuados se enlistan, por ejemplo, en la Publicación Internacional Número WO 97/34485, en las páginas 7 y 8.

También los tensoactivos acostumbrados para la técnica de la formulación, y descritos, entre otras cosas, en "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood, Nueva Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch" (Manual de Tensoactivos), Carl Hanser Verlag, Munich/Viena, 1981, y M. Y H. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Volúmenes I-III, Chemical Publishing Co., Nueva York, 1980-81, son adecuados para la fabricación de los herbicidas de acuerdo con la invención.

Las formulaciones herbicidas, como regla, contendrán del 0.1 al 99 por ciento en peso, de preferencia del 0.1 al 95 por ciento en peso de herbicida, del 1 al 99.9 por ciento en peso, de preferencia del 5 al 99.8 por ciento en peso de un auxiliar sólido o líquido, y del 0 al 25 por ciento en peso, de preferencia del 0.1 al 25 por ciento en peso de un tensoactivo. Aunque se prefiere formular los productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente utilizará formulaciones diluidas. Las composiciones también pueden

contener ingredientes adicionales, tales como estabilizantes, por ejemplo cuando sea apropiado, aceites vegetales epoxidados (aceite de coco epoxidado, aceite de semilla de colza, o aceite de frijol de soya), antiespumantes, normalmente aceite de
5 silicona, conservadores, reguladores de viscosidad, aglutinantes, y viscosantes, así como fertilizantes u otros agentes químicos.

Los compuestos de la fórmula I normalmente se aplican con éxito a las plantas o al lugar de las mismas en
10 concentraciones de 0.01 a 0.5 kilogramos/hectárea, de preferencia de 0.005 a 0.25 kilogramos/hectárea. La concentración requerida para lograr la acción deseada se puede determinar mediante experimentación. Dependerá del tipo de acción, de la etapa de desarrollo de la planta cultivada, y la
15 hierba, así como de la aplicación (lugar, tiempo, método), y como un resultado de estas variables, puede variar sobre un amplio rango.

Los compuestos de la fórmula I tienen excelentes propiedades herbicidas e inhibidoras del crecimiento, que los
20 hacen adecuados para aplicarse en cultivos de plantas cultivadas, especialmente en cereales, algodón, frijoles de soya, remolacha azucarera, caña de azúcar, plantaciones, colza, maíz, y arroz, y para el control no selectivo de hierbas. También se entenderá que los cultivos significan aquellos
25 cultivos que se han hecho tolerantes a los herbicidas o a

clases de herbicidas mediante métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Las hierbas que se van a controlar pueden ser monocotiledóneas, así como hierbas dicotiledóneas, normalmente *Stellaria*, *Nasturtium*, *Agrostis*, *Digitaria*, *Avena*, *Setaria*, *Sinapsis*, *Lolium*, *Solanum*, *Echinochloa*, *Scirpus*, *Monochoria*, *Sagittaria*, *Bromus*, *Alopecurus*, *Sorghum halepense*, *Rottboellia*, *Cyperus*, *Abutilon*, *Sida*, *Xanthium*, *Amaranthus*, *Chenopodium*, *Ipomoea*, *Chrysanthemum*, *Galium*, *Viola*, y *Veronica*.

Los compuestos de la fórmula I también se pueden utilizar en combinación con un co-herbicida. Los co-herbicidas adecuados son, por ejemplo, ametrina, atracina, hexazinona, asulam, diurón, 2,4-D, halosulfurón, fluometurón, prometrina, metolaclor, α -metolaclor, norflurazón, piritiobac-sodio, DSMA, MSMA, trifluralina, pendimetalina, bromoxinil, glifosato, glufosinato, y clomazona.

La invención se ilustra mediante los siguientes ejemplos no limitantes.

Ejemplos de Formulación

F1. Granulados Recubiertos

Ingrediente activo de la

a)	b)	c)
0.1%	5%	15%

Fórmula I.

	Polietilenglicol, peso molecular:200.	1.0%	2%	3%
	Acido silícico altamente dispersado.	0.9%	1%	2%
5	Vehículo inorgánico (ø 0.1-1 mm), tal como CaCO_3 ó SiO_2 .	98.0%	92%	80%

La sustancia activa finamente molida se aplica uniformemente en una mezcladora al vehículo humedecido con polietilenglicol. De esta manera se obtienen granulados recubiertos no polvosos.

	<u>F2. Granulados para Extrusora</u>	a)	b)	c)	d)
15	Ingrediente activo de la Fórmula I.	0.1%	3%	5%	15%
	Ligninsulfonato de sodio	1.5%	2%	3%	4%
	Carboximetilcelulosa	1.4%	2%	2%	2%
	Caolín	97.0%	93%	90%	79%

20

El compuesto se mezcla y se muele con los auxiliares, y la mezcla se humedece con agua. Esta mezcla se extruye y luego se seca en una corriente de aire.

F3. Polvos Secos

	a)	b)	c)
Ingrediente activo de la	0.1%	1%	5%
Fórmula I.			
Talco	39.9%	49%	35%
5 Caolín	60.0%	50%	60%

Se obtienen polvos listos para usarse mezclando el ingrediente activo con los vehículos, y moliendo en un molino adecuado.

10

Ejemplo F4: Preparación de un granulado humectable del compuesto de la fórmula I:

Las siguientes sustancias se mezclan y subsecuentemente se muelen utilizando un molino convencional.

15 75 por ciento de la modificación del cristal A del compuesto de la fórmula I.

4 por ciento de sal sódica de ácido dibutilnaftalensulfónico.

8 por ciento de ligninsulfonato de sodio.

20 0.5 por ciento de desespumante de silicona.

hasta el 100 por ciento de dióxido de silicio.

La mezcla subsecuentemente se mezcla con del 22 al 26 por ciento en peso de agua, y se granula. Después de secarse en
25 una secadora continua comercial hasta una humedad residual de

<4.5 por ciento, el granulado obtenido se tamiza (tamiz de vibración/volteador) hasta un tamaño de grano de 0.4 a 1.6 milímetros. Se obtienen granulados, los cuales contienen al compuesto de la fórmula I como la modificación del cristal C.

5

Ejemplo F5: Preparación de un granulado humectable del compuesto de la fórmula I:

Las siguientes sustancias se mezclan y subsecuentemente se muelen utilizando un molino convencional.

10 75 por ciento de la modificación del cristal B del compuesto de la fórmula I.

4 por ciento de sal sódica de ácido dibutilnaftalensulfónico.

8 por ciento de ligninsulfonato de sodio.

15 0.5 por ciento de desespumante de silicona.

hasta el 100 por ciento de dióxido de silicio.

La mezcla subsecuentemente se mezcla con del 18 al 20 por ciento en peso de agua, y se granula. Después de secarse en
20 una secadora continua comercial hasta una humedad residual de <4.5 por ciento, el granulado obtenido se tamiza (tamiz de vibración/volteador) hasta un tamaño de grano de 0.4 a 1.6 milímetros. Se obtienen granulados, los cuales contienen al compuesto de la fórmula I como la modificación del cristal B.

Ejemplo F6: Preparación de un granulado humectable del compuesto de la fórmula I:

Las siguientes sustancias se mezclan y subsecuentemente se muelen utilizando un molino convencional.

5 75 por ciento de la modificación del cristal K del compuesto de la fórmula I.

 4 por ciento de sal sódica de ácido dibutilnaftalensulfónico.

 8 por ciento de ligninsulfonato de sodio.

10 0.5 por ciento de desespumante de silicona.

 hasta el 100 por ciento de dióxido de silicio.

 La mezcla subsecuentemente se mezcla con del 43 al 48 por ciento en peso de agua, y se granula. Después de secarse en
15 una secadora continua comercial hasta una humedad residual de <4.5 por ciento, el granulado obtenido se tamiza (tamiz de vibración/volteador) hasta un tamaño de grano de 0.4 a 1.6 milímetros. Se obtienen granulados, los cuales contienen al compuesto de la fórmula I como una mezcla de la modificación
20 del cristal B y la modificación del cristal C.

 El patrón de polvo de rayos X indica los valores d (intervalos del plano inter-celosía), las intensidades asociadas de las reflexiones de rayos X, y el ángulo de refracción 2θ (específico del aparato) de la modificación
25 del cristal correspondiente.

La medición del patrón de polvo de rayos X se efectuó con una cámara Enraf-Nonius Guinier FR 552, utilizando radiación Cukalpa1. Los diagramas registrados en la película de rayos X se evaluaron en un Johansson Line-Scanner LS-18, utilizando el Software Scanpi.

Ejemplos de Preparación:

Ejemplo P1: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$ y s es 0

10 (modificación J):

Una solución de 40 gramos de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en 300 gramos de tetrahydrofurano (exento de agua), se agrega a una temperatura de 40°C a 45°C, a una suspensión de 59 gramos de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridin-15 il sulfonamida en 210 gramos de tetrahydrofurano exento de agua.

La mezcla de reacción subsecuentemente se agita a una temperatura de 40°C hasta que se termina la conversión. Finalmente se obtiene la modificación J filtrando y lavando con tetrahydrofurano exento de agua.

20 Tabla X1: Patrón de polvo de rayos X de la modificación J:

<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
5.6	15.7	débil
8.6	10.2	muy débil
10.7	8.2	débil

	11.3	7.8	débil
	12.1	7.3	débil
	13.1	6.7	débil
	13.6	6.5	muy débil
5	14.4	6.2	promedio
	15.7	5.64	muy débil
	16.0	5.53	débil
	16.3	5.42	débil
	17.4	5.09	débil
10	17.9	4.96	promedio
	18.2	4.86	muy débil
	19.3	4.60	promedio
	20.3	4.37	promedio
	21.0	4.24	débil
15	21.6	4.11	muy débil
	22.5	3.95	muy débil
	22.8	3.90	débil
	23.3	3.81	muy débil
	24.0	3.71	promedio
20	24.5	3.62	débil
	25.3	3.52	muy débil
	26.0	3.43	débil
	26.4	3.37	débil
	26.8	3.32	muy débil

27.3	3.27	débil
30.4	2.94	muy débil
31.7	2.82	promedio

5 **Ejemplo P2: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0 (modificación K):**

La modificación K se obtiene secando la modificación J del ejemplo P1 a una temperatura de 60°C, y a una presión de 0.04 bar. Esta forma de cristal está exenta de agua y exenta de
 10 solvente: la medición termogravimétrica a 175°C muestra una pérdida de peso menor del 0.1 por ciento en peso.

Tabla X2: Patrón de polvo de rayos X de la modificación K:

	<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
15	6.6	13.4	débil
	8.8	10.1	muy débil
	9.5	9.3	muy fuerte
	11.4	7.8	débil
	12.9	6.9	muy débil
20	13.3	6.7	muy débil
	15.7	5.63	muy débil
	16.6	5.35	promedio
	19.0	4.66	débil
	20.0	4.44	muy débil

	20.4	4.35	débil
	21.5	4.12	fuerte
	22.6	3.94	fuerte
	22.9	3.87	muy débil
5	23.7	3.76	débil
	24.6	3.61	promedio
	25.5	3.49	muy débil
	26.2	3.40	muy débil

10 **Ejemplo P3: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde**
M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es 1, y s es 1
(modificación I):

Una solución de 19.9 gramos de 4,6-dimetoxi-pirimidin-
 2-isocianato en 350 gramos de tetrahydrofurano (exento de
 15 agua), se agrega a una temperatura de 25°C a una suspensión de
 34.2 gramos de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridin-
 ilsulfonamida en 200 mililitros de tetrahydrofurano exento de
 agua.

La mezcla de reacción se agita a una temperatura de
 20 25°C hasta que se termina la conversión. Luego, se agregan 10
 gramos de agua, y la mezcla se agita durante 18 horas.
 Finalmente se obtiene la modificación I filtrando y lavando con
 tetrahydrofurano exento de agua.

Tabla X3: Patrón de polvo de rayos X de la modificación I:

	<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
	7.6	11.6	débil
	9.0	9.8	muy débil
	11.0	8.0	muy fuerte
5	11.6	7.6	promedio
	13.3	6.7	fuerte
	13.7	6.4	muy débil
	14.0	6.3	débil
	14.4	6.1	muy débil
10	15.3	5.80	promedio
	15.6	5.66	muy débil
	16.2	5.47	fuerte
	17.3	5.12	muy débil
	17.4	5.08	muy débil
15	18.3	4.84	débil
	18.6	4.76	débil
	19.8	4.47	fuerte
	20.1	4.40	débil
	21.1	4.21	promedio
20	21.2	4.19	promedio
	21.4	4.15	muy débil
	22.2	4.00	muy débil
	22.6	3.93	muy débil
	23.2	3.84	promedio

	23.9	3.72	muy fuerte
	24.8	3.58	promedio
	25.3	3.52	promedio
	26.9	3.32	muy débil
5	27.2	3.28	muy débil
	27.5	3.25	muy débil
	28.7	3.11	muy débil
	29.0	3.07	muy débil
	30.2	2.95	muy débil
10	31.2	2.86	débil
	31.7	2.82	muy débil
	32.6	2.75	muy débil
	34.9	2.57	débil
	36.0	2.49	muy débil

15

Ejemplo P4: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde

M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1 (modificación B):

La modificación B se obtiene selectivamente suspendiendo 100 gramos de la modificación K preparada en el

20 Ejemplo P2, en 230 gramos de agua durante 15 minutos, luego sembrando de preferencia con 1 a 3 gramos de cristales de siembra de la modificación B, y agitando la suspensión a una temperatura de 20°C a 25°C hasta que se termina la transformación. La suspensión subsecuentemente se filtra, y el

25 residuo de la filtración se seca a una temperatura de 60°C, y a

una presión de 0.04 bar, hasta que se obtenga un peso constante.

Tabla X4: Patrón de polvo de rayos X de la modificación B:

	<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
5	8.9	10.0	promedio
	9.6	9.2	fuerte
	10.3	8.6	muy débil
	11.0	8.1	débil
10	12.2	7.2	fuerte
	12.9	6.9	fuerte
	13.8	6.4	promedio
	15.2	5.82	fuerte
	15.4	5.75	fuerte
15	15.7	5.64	muy fuerte
	16.0	5.53	muy débil
	17.3	5.13	promedio
	17.8	4.97	muy fuerte
	19.1	4.65	promedio
20	20.6	4.30	muy fuerte
	21.0	4.22	débil
	21.4	4.15	muy débil
	22.1	4.02	débil
	22.5	3.94	débil

	23.4	3.79	promedio
	23.8	3.73	débil
	24.2	3.68	promedio
	24.6	3.61	débil
5	24.8	3.58	débil
	25.3	3.52	muy fuerte
	26.0	3.42	muy débil
	26.4	3.37	débil
	26.9	3.31	muy débil
10	27.3	3.27	muy débil
	27.6	3.23	débil
	28.0	3.18	promedio
	28.9	3.08	muy débil
	29.4	3.03	muy débil
15	30.3	2.95	muy débil
	31.2	2.87	fuerte
	31.7	2.82	muy débil
	32.1	2.79	muy débil
	32.7	2.73	muy débil
20	33.4	2.68	muy débil
	33.8	2.65	muy débil
	34.0	2.63	muy débil
	34.5	2.60	débil
	34.9	2.57	débil

Las formas de los cristales A, C, F, I, y J también se pueden transformar en la forma B de una manera análoga. Al hacerlo así, estas formas de cristal también pueden estar
 5 todavía húmedas con solvente. En este caso, se puede incrementar ligeramente la cantidad de agua.

Ejemplo P5: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0 (modificación C):

10 100 gramos de la modificación K producida en el Ejemplo P2, se mezclan con 20 gramos de agua por la duración de 3 horas, y subsecuentemente se secan a una temperatura de 60°C, y a una presión de 0.04 bar.

15 **Tabla X5: Patrón de polvo de rayos X de la modificación C:**

<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
6.7	13.1	promedio
8.1	11.0	muy fuerte
10.1	8.8	débil
20 11.4	7.7	muy débil
12.2	7.2	muy fuerte
12.7	7.0	débil
13.9	6.4	débil
14.3	6.2	fuerte

	14.9	5.96	débil
	15.0	5.90	débil
	15.7	5.64	fuerte
	16.2	5.47	débil
5	16.6	5.34	promedio
	17.1	5.19	débil
	18.5	4.79	débil
	18.7	4.74	promedio
	19.1	4.64	muy débil
10	19.5	4.55	fuerte
	19.9	4.47	débil
	20.4	4.35	fuerte
	20.8	4.26	promedio
	21.5	4.13	débil
15	21.9	4.06	muy débil
	22.7	3.92	muy fuerte
	23.0	3.87	débil
	23.5	3.79	muy fuerte
	24.2	3.67	débil
20	24.6	3.61	promedio
	24.9	3.58	fuerte
	25.7	3.47	débil
	26.9	3.32	muy débil
	27.5	3.24	promedio

	28.4	3.14	débil
	28.6	3.12	débil
	29.1	3.07	débil
	29.3	3.04	fuerte
5	30.1	2.97	muy débil
	30.6	2.92	muy débil
	31.0	2.88	débil
	31.7	2.82	débil
	32.3	2.77	muy débil
10	32.7	2.74	muy débil
	33.3	2.69	débil
	33.7	2.66	muy débil

Ejemplo P6: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde

15 **M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0, en una forma**
esencialmente amorfa (modificación A):

Se agregan 1.56 gramos de N-[(4,6-dimetoxi-2-pirimidin)carbamoil]-3-(2,2,2-trifluoroetoxi)-piridin-2-sulfonamida a una temperatura de 20°C, a una solución de 40
20 mililitros de hidróxido de sodio 0.1N acuoso. La mezcla de reacción se agita durante 18 horas a una temperatura de 20°C. El residuo obtenido después de la concentración por evaporación al vacío a una temperatura de 50°C, subsecuentemente se agita con éter, y se filtra. Se obtiene la modificación A secando el
25 filtrado a temperaturas elevadas (>120°C).

Ejemplo P7: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0 (modificación C), a partir de la modificación A:

5 Se exponen los cristales de la modificación A a una atmósfera de humedad relativa del 98 por ciento durante 4 horas a una temperatura de 20°C. Se obtiene la modificación C con los datos cristalográficos dados en el Ejemplo P5.

10 Ejemplo P8: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 2, L es dioxano, y s es 0 (modificación G):

15 15 gramos de la modificación A producida, por ejemplo, como en el Ejemplo P6, se agitan en 85 gramos de dioxano durante 2-1/2 días a una temperatura de 20°C, y la mezcla subsecuentemente se filtra. Después de la filtración, se obtiene la modificación G como el residuo de la filtración, con los datos cristalográficos de rayos X dados en la Tabla X8.

20 Tabla X8: Patrón de polvo de rayos X de la modificación G:

<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
5.8	15.3	fuerte
7.0	12.7	muy débil
8.4	10.5	débil

	11.1	7.9	promedio
	12.8	6.9	promedio
	13.4	6.6	muy débil
	14.3	6.2	muy fuerte
5	14.9	5.96	promedio
	17.4	5.08	promedio
	17.8	4.98	débil
	18.3	4.84	promedio
	19.3	4.60	promedio
10	19.7	4.51	promedio
	19.8	4.47	muy débil
	20.8	4.27	débil
	21.0	4.23	promedio
	22.3	3.98	promedio
15	22.7	3.91	promedio
	23.3	3.81	débil
	23.9	3.71	fuerte
	24.4	3.65	promedio
	24.9	3.57	débil
20	25.4	3.50	promedio
	26.2	3.39	muy débil
	26.7	3.33	débil
	28.9	3.08	muy débil
	29.5	3.02	muy débil

30.5 2.93 débil

Ejemplo P9: Preparación del compuesto de la fórmula I, en donde

M es sodio, n es 1, r es 1, L es dioxano, y s es 0

5 **(modificación F):**

La modificación F se obtiene exponiendo a la modificación G producida en el Ejemplo P8 a una atmósfera de humedad relativa del 50 por ciento durante un período de 8 días a una temperatura de 20°C a 25°C.

10

Tabla X9: Patrón de polvo de rayos X de la modificación G:

<u>2θ[grados]</u>	<u>d[Å]</u>	<u>Intensidad</u>
6.0	14.7	muy débil
7.0	12.6	muy débil
15 8.1	10.9	promedio
11.4	7.8	promedio
12.0	7.4	muy débil
12.7	7.0	débil
13.4	6.6	débil
20 14.3	6.2	débil
16.2	5.45	fuerte
18.0	4.91	promedio
18.4	4.83	débil
18.6	4.76	muy débil

	20.8	4.28	muy débil
	21.7	4.10	débil
	22.2	4.00	muy débil
	23.7	3.75	muy fuerte
5	24.7	3.60	muy débil

Ejemplos Biológicos

Ejemplo B1: Acción herbicida después del surgimiento

Las plantas de prueba se siembran en tierra estándar en macetas de plástico en un invernadero, y se rocían en la etapa de 2 a 3 hojas con una suspensión acuosa de los compuestos de prueba de la fórmula I, preparados a partir de un polvo humectable al 25 por ciento [ejemplo F3, b) de la Publicación Internacional Número WO 97/34485] de los compuestos de prueba de la fórmula I, en una dosificación de 7.5 gramos/hectárea.

Luego las plantas de prueba se cultivan adicionalmente en el invernadero bajo condiciones óptimas. Después de una duración de la prueba de aproximadamente 21 días, se evalúa la prueba (100 = daño total, 0 = ningún daño). La tabla 1 muestra los resultados obtenidos.

20 **Tabla 1: Aplicación posterior en algodón**

Plantas de prueba	Modificación K
Algodón	15
<i>Ipomoea</i>	90
<i>Xanthium</i>	100
<i>Cassia</i>	98

Ejemplo B2: Acción herbicida después del surgimiento

Las plantas de prueba se siembran en tierra estándar en macetas de plástico en un invernadero, y se rocían en la etapa de 2 a 3 hojas con una suspensión acuosa de los compuestos de prueba de la fórmula I preparados a partir de un granulado humectable al 75 por ciento (Ejemplo F4 para la modificación A, o Ejemplo F5 para la modificación B) de los compuestos de prueba de la fórmula I, en una dosificación de 7.5 gramos/hectárea. Luego las plantas de prueba se cultivan adicionalmente en el invernadero, bajo condiciones óptimas. Después de una duración de la prueba de aproximadamente 21 días, se evalúa la prueba (100 = daño total, 0 = ningún daño). La Tabla 2 muestra los resultados obtenidos.

15 **Tabla 2: Aplicación posterior en algodón**

Plantas de prueba	Modificación A	Modificación B
algodón	5	0
<i>Ipomoea</i>	80	75

Se obtienen los mismos resultados formulando los compuestos de la fórmula I de acuerdo con los Ejemplos F2 y F6 a F8 de la Publicación Internacional Número WO 97/34485.

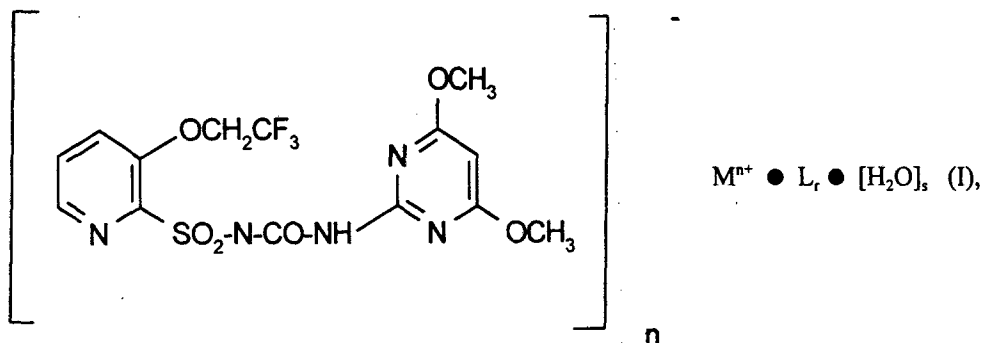
NOVEDAD DE LA INVENCION

Habiendo descrito la invención que antecede, se considera como una novedad, y por lo tanto, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula I:

10



en donde:

M es un metal alcalino o un metal alcalinotérreo;

15

n es 1 ó 2;

r y s, independientemente uno del otro, son 0, 1/2, 1, 1 1/2, 2, 2-1/2 ó 3; y

L es acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetílica, acetamida dimetílica, N-metil-2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclорометано, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario,

20

clorobenceno, tolueno, o xileno, con la condición de r sea diferente de 1-1/2 si L es dioxano y s es 0.

2. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde M es sodio, potasio, magnesio, o calcio.

3. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde L es dioxano, tetrahidrofurano, o agua.

4. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde n es 1, y M es sodio.

5. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0.

6. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, seleccionados a partir de:

- La modificación B del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$:
10.0/promedio; 9.2/fuerte; 8.6/muy débil; 8.1/débil;
7.2/fuerte; 6.9/fuerte; 6.4/promedio; 5.82/fuerte; 5.75/fuerte;
5.64/muy fuerte; 5.53/muy débil; 5.13/promedio; 4.97/muy fuerte;
4.65/promedio; 4.30/muy fuerte; 4.22/débil; 4.15/muy débil;
4.02/débil; 3.94/promedio; 3.79/promedio; 3.73/débil;
3.68/promedio; 3.61/débil; 3.58/débil; 3.52/muy fuerte;
3.42/muy débil; 3.37/débil; 3.31/muy débil; 3.27/muy débil;

3.23/débil; 3.18/promedio; 3.08/muy débil; 3.03/muy débil;
 2.95/muy débil; 2.87/fuerte; 2.82/muy débil; 2.79/muy débil;
 2.73/muy débil; 2.68/muy débil; 2.65/muy débil; 2.63/muy débil;
 2.60/débil; 2.57/débil;

5 - la modificación J del compuesto de la fórmula I,
 en donde M es sodio, **n** es 1, L es tetrahidrofurano, **r** es $\frac{1}{2}$, y **s**
 es 0, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con
 d[Å]/intensidad: 15.7/débil; 10.2/muy fuerte; 8.2/débil;
 7.8/débil; 7.3/débil; 6.7/débil; 6.5/muy débil; 6.2/promedio;
 10 5.64/muy débil; 5.53/débil; 5.42/débil; 5.09/débil;
 4.96/promedio; 4.86/muy débil; 4.60/promedio; 4.37/promedio;
 4.24/débil; 4.11/muy fuerte; 3.95/muy débil; 3.90/débil;
 3.81/muy débil; 3.71/promedio; 3.62/débil; 3.62/muy débil;
 3.52/muy débil; 3.43/fuerte; 3.37/débil; 3.32/muy débil;
 15 3.27/débil; 2.94/muy débil; 2.82/promedio;

 - la modificación K del compuesto de la fórmula I,
 en donde M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 0, caracterizada
 por el patrón de polvo de rayos X con d[Å]/intensidad:
 13.4/débil; 10.1/muy débil; 9.3/muy fuerte; 7.8/débil; 6.9/muy
 20 débil; 6.7/muy débil; 5.63/muy débil; 5.35/promedio;
 4.66/débil; 4.44/muy débil; 4.35/débil; 4.12/fuerte;
 3.94/fuerte; 3.87/muy débil; 3.76/débil; 3.61/promedio;
 3.49/muy débil; 3.40/muy débil;

 - la modificación C del compuesto de la fórmula I,
 25 en donde M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 1, caracterizada

por el patrón de polvo de rayos X con $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$:
 13.1/promedio; 11.0/muy fuerte; 8.8/débil; 7.7/muy fuerte;
 7.2/muy fuerte; 7.0/débil; 6.4/débil; 6.2/fuerte; 5.96/débil;
 5.90/débil; 5.64/fuerte; 5.47/débil; 5.34/promedio; 5.19/débil;
 5 4.79/débil; 4.74/promedio; 4.64/muy débil; 4.55/fuerte;
 4.47/débil; 4.35/fuerte; 4.26/promedio; 4.13/débil; 4.06/muy
 débil; 3.92/muy fuerte; 3.87/débil; 3.79/muy fuerte;
 3.67/débil; 3.61/promedio; 3.58/fuerte; 3.47/débil; 3.32/muy
 débil; 3.24/promedio; 3.14/débil; 3.12/débil; 3.07/débil;
 10 3.04/fuerte; 2.97/muy débil; 2.92/muy débil; 2.88/débil;
 2.82/débil; 2.77/muy débil; 2.74/muy débil; 2.69/débil;
 2.66/muy débil; y

- la modificación I del compuesto de la fórmula I,
 en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahidrofurano, r es 1, y s
 15 es 1, caracterizada por el patrón de polvo de rayos X con
 $d[\text{\AA}]/\text{intensidad}$: 1.6/débil; 9.8/muy débil; 8.0/muy fuerte;
 7.6/promedio; 6.7/fuerte; 6.4/muy débil; 6.3/débil; 6.1/muy
 débil; 5.80/promedio; 5.66/muy débil; 5.47/fuerte; 5.12/muy
 débil; 5.08/muy débil; 4.84/débil; 4.76/débil; 4.47/fuerte;
 20 4.40/débil; 4.21/promedio; 4.19/promedio; 4.15/muy débil;
 4.00/muy débil; 3.93/muy débil; 3.84/promedio; 3.72/muy fuerte;
 3.58/promedio; 3.52/promedio; 3.32/muy débil; 3.28/muy débil;
 3.25/muy débil; 3.11/muy débil; 3.07/muy débil; 2.95/muy débil;
 2.86/débil; 2.82/muy débil; 2.75/muy débil; 2.57/débil;
 25 2.49/muy débil.

7. Un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde:

M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 0 (modificación K), producido secando el compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, **n** es 1, L es tetrahidrofurano, **r** es $\frac{1}{2}$, y **s** es 0 (modificación J), a una temperatura de 35°C a 65°C al vacío,

o en donde:

M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 1 (modificación C), producido mediante cualquiera de:

10 el contacto de la forma esencialmente amorfa (modificación A) con aire de una humedad relativa del 98 por ciento, o mezclando la modificación K del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 0, con agua, en una proporción del agua a la modificación K de 0.01:1 a 0.4:1, y separando y secando el producto obtenido a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar;

o en donde:

20 M es sodio, **n** es 1, **r** es 0, y **s** es 1 (modificación B), producido mediante la adición de agua al compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, **n** es 1, y L, **r**, y **s** se definen como para la fórmula I, en una proporción del agua a este compuesto de 0.05:1 a 20:1, luego filtrando y secando el residuo de la filtración a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar. •

8. Un método para la preparación de compuestos de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, mediante el cual, con el objeto de producir la modificación J del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, L es tetrahydrofurano, r es $\frac{1}{2}$, y s es 0, se agrega una solución del 5 al 35 por ciento en peso de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en tetrahydrofurano exento de agua, a una temperatura de 35°C a 65°C, a una suspensión del 15 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahydrofurano exento de agua;

con el objeto de producir la modificación K del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 0, se agrega una solución del 5 al 35 por ciento en peso de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-isocianato en tetrahydrofurano exento de agua, a una temperatura de 35°C a 65°C, a una suspensión del 15 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahydrofurano exento de agua, luego se filtra, y el residuo de la filtración (modificación J) subsecuentemente se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar;

con el objeto de producir la modificación C del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, n es 1, r es 0, y s es 1, se expone ya sea la forma esencialmente amorfa (modificación A) a una atmósfera de humedad relativa del 98 por

ciento, o bien la modificación K se mezcla con agua en una proporción del agua a la modificación K de 0.1:1 a 0.4:1, luego se filtra, y el residuo de la filtración subsecuentemente se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar;

con el objeto de producir de la modificación I del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, *n* es 1, L es tetrahidrofurano, *r* es 1, y *s* es 1, se agrega una solución del 5 al 35 por ciento en peso de 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-
10 isocianato en tetrahidrofurano exento de agua, a una temperatura de 0°C a 30°C, a una suspensión del 10 al 35 por ciento en peso de sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida en tetrahidrofurano exento de agua, y subsecuentemente se agregan de 1 a 20 equivalentes molares de
15 agua, basándose en la sal sódica de 3-(2-trifluoroetoxi)-piridinil-sulfonamida; y

con el objeto de producir la modificación B del compuesto de la fórmula I, en donde M es sodio, *n* es 1, *r* es 1, y *s* es 1, se agrega agua al compuesto de la fórmula I, en donde
20 M es sodio, *n* es 1, y L, *r*, y *s* son como se definen en la fórmula I, en una proporción del agua a este compuesto de 0.5:1 a 20:1, luego tiene lugar la filtración, y el residuo de la filtración se seca a una temperatura de 30°C a 90°C, y a una presión de 0.01 a 0.1 bar.

9. Una composición herbicida e inhibidora del crecimiento de las plantas, la cual comprende una cantidad herbicidamente efectiva del compuesto de la fórmula I en un vehículo inerte.

5 10. La composición de acuerdo con la reivindicación 9, la cual contiene un co-herbicida.

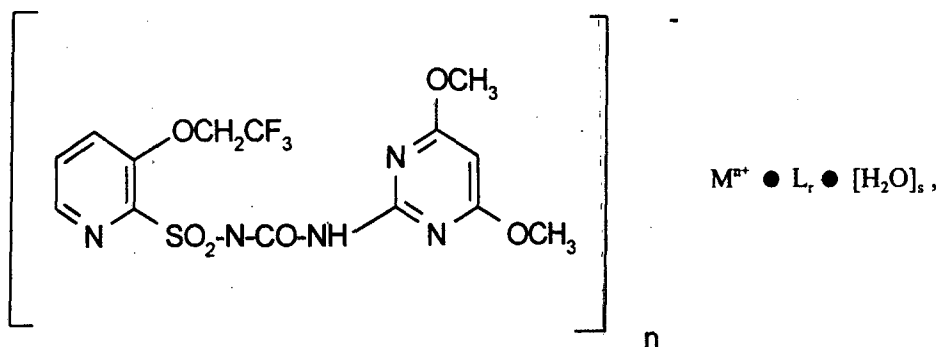
11. Un método para controlar el crecimiento indeseable de plantas, el cual comprende tratar las plantas o el lugar de las mismas con una cantidad herbicidamente efectiva
10 de un ingrediente activo de la fórmula I, o de una composición que contenga este ingrediente activo.

12. Un método para inhibir el crecimiento de las plantas, el cual comprende tratar las plantas o el lugar de las mismas con una cantidad herbicidamente efectiva de un
15 ingrediente activo de la fórmula I, o de una composición que contenga este ingrediente activo.

RESUMEN DE LA INVENCION

Los compuestos de la fórmula:

5



en donde:

M es un metal alcalino o un metal alcalinotérreo;

10

n es 1 ó 2;

r y s, independientemente uno del otro, son 0, 1/2, 1, 1 1/2, 2, 2-1/2 ó 3; y

15

L es acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetílica, acetamida dimetílica, N-metil-2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario, clorobenceno, tolueno, o xileno, con la condición de r sea diferente de 1-1/2 si L es dioxano y s es 0, son adecuados para
20 utilizarse como herbicidas.

* * * * *

EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD:

(51) INT. CL.: C 07

(22) FECHA DE
PRESENTACIÓN:

(71) SOLICITANTE: NOVARTIS AG.
domiciliada en Basilea, Suiza

(30) PRIORIDAD: SÍ

(31) No. DE SOLICITUD: 369/99

(72) INVENTORES: ANDREA ROLF STING, (Gipf-Oberfrick, Suiza); STEFAN KÖNIG, (Kaiseraugst, Suiza); WOLFGANG STUTZ, (Monthey, Suiza); ANDRÉ JOSEPH GEOFFROY, (Habsheim, Francia); RAFFAELE MARRO, (Moehlin, Suiza); FREDDY PFAMMATTER, (Rheinfelden, Suiza); ANDREAS BURKHARD, (Basilea, Suiza).

(32) FECHA DE
PRESENTACIÓN: Marzo 1, 1999

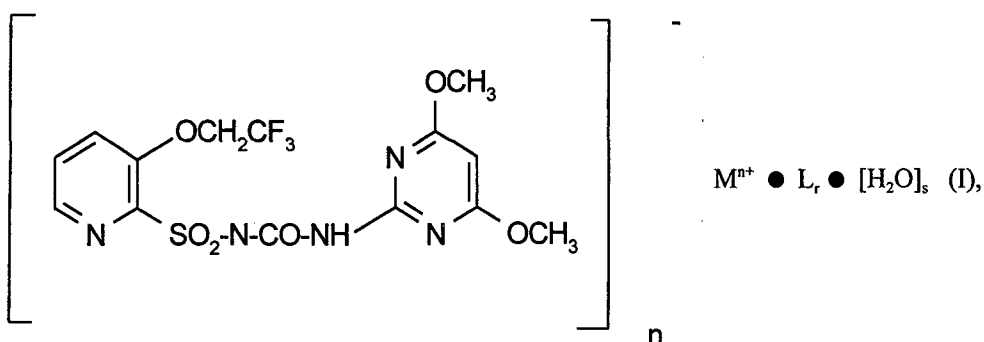
(33) PAÍS: SUIZA

(74) APODERADO: JIMENA ESCOBAR URIBE

(54) TÍTULO: NOVEDOSAS SALES DE PIRIDILSULFONILUREA HERBICIDAMENTE ACTIVAS, PROCESOS PARA SU PREPARACIÓN, COMPOSICIONES QUE COMPRENDEN ESTOS COMPUESTOS Y USO DE LAS MISMAS.

(57) RESUMEN:

La presente invención se relaciona con los compuestos de la formula I:



en donde:

M es un metal alcalino o un metal alcalinotérreo;

n es 1 ó 2;

r y s, independientemente uno del otro, son 0, 1/2, 1, 1 1/2, 2, 2-1/2 ó 3; y

L es acetato de etilo, acetonitrilo, sulfóxido de dimetilo, formamida dimetílica, acetamida dimetílica, N-metil-2-pirrolidona, acetona, butanona, cloruro de metileno, triclorometano, tricloroetano, tetrahidrofurano, dietiléter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, metiléter de butilo terciario, clorobenceno, tolueno, o xileno, con la condición de r sea diferente de 1-1/2 si L es dioxano y s es 0.

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN/TRÁMITE

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00009716 00000000

Folios: 53

Fecha (ACD): 2000-02-14 16:54:31

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREATIVIDADES

Patente de Invención



Modelo de Utilidad

☒ Nombre e Identificación del solicitante - 1



☒ Nombre e Identificación del inventor - 1



☒ Título o nombre de la invención - 1



☒ Descripción - 3



☒ Reivindicaciones - 42



☒ Resumen - 1



☒ 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

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-09716 .

Fecha: 15 de Febrero del 2000 .

Se certifica que:

Desde fecha 16 DE abril de 1997

del folio 90643 al folio 90650 del libro de Protocolo N° 311,

obra el poder N° 17398 conferido por NOVARTIS AG

(NOVARTIS S.A.) (NOVARTIS INC)

domiciliado(a) en BASILEA, SUIZA

al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE Y/O IGNACIO ESCOBAR

URIBE

Representante en Santafé de Bogotá D.C. LOS MISMOS

Facultad para desistir y sustituir SI .

Revisado *[Firma]*

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 00-09716

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 ☐ | NO APLICABLE ☐ Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI ☒ | 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 ☒ | 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 ☒ | NO ☐ | EXTEMPORANEAMENTE ☐ Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París. |
| SI ☐ | NO ☒ | 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 ☒ | 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 ☒ | 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 ☒ | Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto, |
| SI ☐ | NO ☒ | Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente. |

Santafé de Bogotá, D.C., 15 de febrero del 2000

[Firma]
EXAMINADOR JURIDICO.

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES

Primer EXAMEN DE FORMA2000-03-03
430RADICACIÓN N° 0.9716CONCEPTO TÉCNICO N° 358 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES AOIN47/36 43/40

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., 3-03-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
1er examen de forma

EXPEDIENTE No. 0-9716
CONCEPTO TÉCNICO No. 358

IPC: A01N47/36, 43/40

En el folio 6 y en la reivindicación 3 se deben aclarar los significados de r y s cuando corresponden a números quebrados puesto que técnicamente no puede existir $1/2$ molécula ni de agua ni de ninguna otra, por lo tanto tal como se presenta la notación en la fórmula estructural (I) no es correcta.

Tanto en la descripción como en las reivindicaciones se dan los compuestos preferidos de la fórmula (I), sin embargo, no es claro cuando L es agua, puesto que dentro de los significados dados anteriormente para L no existía dicha posibilidad.

En el folio 13 cuando se hace referencia al proceso de preparación de la modificación J, no es claro el significado de "b7".

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

La reivindicación 6 no es clara en el sentido que un compuesto químico no se caracteriza por el patrón de rayos X que presente dicho compuesto ni por las diferentes formas de cristalización sino por su estructura química.

La reivindicación 7 es confusa puesto que los compuestos químicos no se caracterizan por un método o procedimiento sino únicamente por su estructura química.

La reivindicación 8 se encabeza por un método para la preparación de compuestos de la fórmula (I) sin embargo, no se define la preparación de dichos compuestos en realidad sino que partiendo de los mismos se realizan las diferentes modificaciones dependiendo de su forma de cristalización lo cual es otra cosa muy distinta, por lo tanto el encabezado es incoherente con la materia que se define. Adicionalmente se hace referencia a la modificación A, sin embargo no se indica el tipo de compuesto que corresponde a dicha modificación.

La reivindicación 9 no define realmente ninguna composición puesto que se debe indicar la proporción en que se encuentran los componentes. La expresión "cantidad herbicidamente efectiva" es ambigua y le resta precisión a la reivindicación.

La reivindicación 10 no define ninguna composición se debe indicar la proporción en que se encuentra el co-herbicida, es decir, la relación en que se encuentra respecto del compuesto de fórmula (I).

Se debe modificar el título de tal manera que se elimine "y uso de las mismas" dado que debe estar acorde con la descripción y reivindicaciones.

De acuerdo con las observaciones realizar las correcciones necesarias presentando NUEVO CAPÍTULO REIVINDICATORIO COMPLETO, de tal forma que sea claro y preciso.

Anexar nuevas tarjetas de archivo temático y de propietario y el extracto para publicación con el resumen corregido.

Falta parte 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. 3 de marzo de 2000

57
59
2000-03-09
430

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

EXPEDIENTE 00-09716

AUTO398

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería a la doctora JIMENA ESCOBAR URIBE como apoderado del solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido.

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

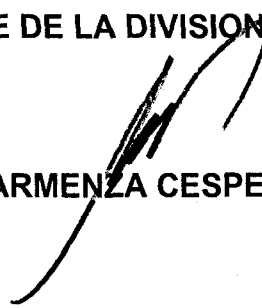
ARTICULO TERCERO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

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

07 MAR. 2000

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