

CAVELIER

ABOGAD S

WEB SITE: www.caveller-abogados.com
E-MAIL: caveller@colomsat.net.co

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación: 00039234 00039234

Folios: 52

Fecha (AMB): 2001-01-05/7:16:24

Trámite: 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Referencia : Expediente No. 00.059.234

Solicitante : BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

Asunto : Solicitud de patente para:
"HETEROCICLILBENZOFURANOS SUBSTITUIDOS,
PROCESO PARA SU PREPARACIÓN Y COMPUESTOS
HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN."

Fecha de la solicitud : 8 de agosto de 2000

TRAMITE:02 - EVENTO:01 - ACTUACION:444

1. Yo, Emilio FERRERO, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al auto número 2712, notificado por estado del 23 de noviembre de 2000.

2. Mediante el auto número 2712 se puso en conocimiento del solicitante el informe que contiene las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente. Atiendo a las observaciones de la manera siguiente:

2.1. Título del invento. Para atender a la observación hecha por su Despacho con relación al título, presento aquí nuevo título como sigue

**HETEROCICLILBENZOFURANOS SUBSTITUIDOS, PROCESO PARA SU
PREPARACIÓN Y COMPUESTOS HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN.**

Adicionalmente presento nuevo formato de solicitud en donde aparece el nuevo título que presento.

NIT. 860.041.367-3

182
187

2.2. En la descripción. Presento junto con este escrito un nuevo capítulo descriptivo donde las unidades de presión se han puesto de acuerdo al Sistema Internacional.

2.3. Extracto. Adjunto a este memorial presento nuevo extracto, nueva tarjeta temática y nueva tarjeta de archivo de propietarios (Formas P-103, P-104 y P-105), los cuales están en conformidad con las modificaciones hechas al título.

2.4. Recibos. Presento junto con este escrito, el recibo de pago por valor de \$68.000.00 por concepto de cambios en solicitud pendiente.

De igual manera, presento con este memorial recibo de pago por valor de \$ 118.000.00 por concepto de los derechos de publicación por palabra adicional.

3. Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, atentamente solicito que se continúe su tramitación.

Bogotá, 5 ENE 2001
Señora Jefe,



EMILIO FERRERO

T.P.A. No. 31.929

WCA
COLO 00698-801-122-4
JJC-ID-904

183-188



**SOLICITUD DE
PATENTE DE
INVENCION**

TRAMITE: 02 EVENTO:01 ACTUACION: 411

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

Alemania

Departamento o Estado

Dirección

D 51368 Leverkusen

Ciudad

(74) _ DATOS DEL APODERADO

Nombre

EMILIO FERRERO

Dirección y Domicilio

Carrera 4 no. 72-35 piso 4o.,

Ciudad

BOGOTA COLOMBIA

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

1- Dr. Karl-Helz LINKER 2- Dr. Roland ANDREE
3- Dr. Karl-Julius REUBKE 4- Dr. Otto SCHALLNER
5- Dr. Mark-Wilhelm DREWES 6- Dr. Peter DAHMEN
7- Dr. Dieter FEUCHT 8- Dr. Rolf PONTZEN

Identificación

1-. Kurt-Schumacher-Ring 56, 51377 Leverkusen, Alemania.
2- Dechant-Miebach-Weg 37, 40764 Langenfeld, Alemania.
3- Fürst-Pückler-Str.10, 50935 Köln, Alemania.
4- Noldeweg 22, 40789 Monheim, Alemania.
5- Goethestr. 38, 40764 Langenfeld, Alemania.
6- Altebrücker Str. 61, 41470 Neuss, Alemania.
7- Ackerweg 9, 40789 Monheim, Alemania.
8- Am Kloster 69, 42799 Leichlingen, Alemania.

Dirección

Ciudad

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

**HETEROCICLILBENZOFURANOS SUBSTITUIDOS, PROCESO
PARA SU PREPARACION Y COMPUESTOS HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN**

PRIORIDAD REIVINDICADA SI ☐ NO ☐ TIPO DE PRIORIDAD ANDINA ☐ UNIONISTA ☐

(33) País

Fecha

No. Solicitud

DE.
Convención de París.

09 de Agosto de 1999

199 37 500.3

Para Publicar a los ☐ 6 meses ☐ 12 meses ☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

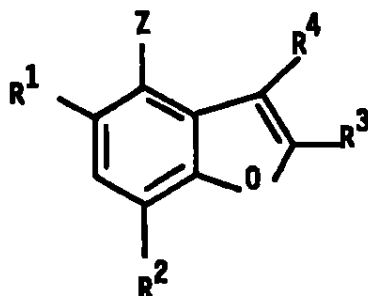
Colo: 00698-801-122-4

ATM/Mrm-832

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a nuevos heterociclibenzofuranos substituidos de la fórmula general (I):



en la que
Z, R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado en la descripción,
a un procedimiento para su obtención y a su empleo como herbicidas.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica	☐
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC	☐
Recibo de la tasa respectiva	☐
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 propietarios 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 CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES
NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

NOMBRE EMILIO FERRERO

CC. 438.019 de Usaquén

T.P.No. 31.929

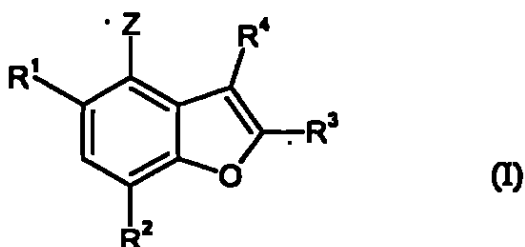
184 185

**HETEROCICLILBENZOFURANOS SUBSTITUIDOS, PROCESO PARA
PREPARACION Y COMPUESTOS HERBICIDAS QUE LOS CONTIENEN**

La invención se refiere a nuevos heterociclibenzofuranos substituidos, a un procedimiento para su obtención y a su empleo como herbicidas.

Se sabe ya que determinados heterociclibenzofuranos substituidos presentan propiedades herbicidas (véanse las EP-A-476697, EP-A-561319, WO-A-97/07104 / EP-A-850227, WO-A-97/28127 / EP-A-885885). Sin embargo, estos compuestos no han adquirido ningún significado especial hasta el presente.

Se ha encontrado ahora que los nuevos heterociclibenzofuranos substituidos de la fórmula general (I),



en la que

R¹ significa hidrógeno, ciano o halógeno,

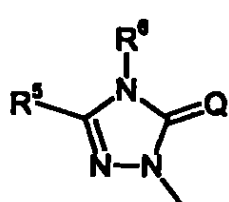
R² significa ciano o tiocarbamoilo,

R³ significa hidrógeno, amino, nitro, formilo, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa hidroxiiminoalquilo o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilamino, alcoxiiminoalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquinilo, alquiniloxi, alquiniltio, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquiloxi-carbonilo, fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado,

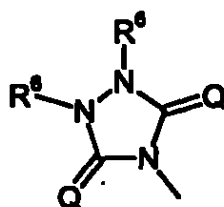
R⁴ significa hidrógeno, amino, nitro, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa hidroxiiminoalquilo o significa alquilo, alcoxi, alcocar-

bonilo, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alquilcarbonilamino, alcoxi-
iminoalquilo, alquenilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquinilo, alquiniloxi, alqui-
niltio, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquiloalquilo, cicloalquiloalquilo, fenilo o bencilo
substituidos respectivamente en caso dado, y

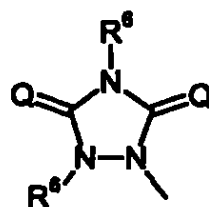
Z significa uno de los agrupamientos heterocíclicos siguientes,



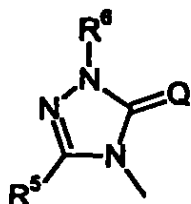
(Z¹)



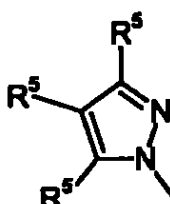
(Z²)



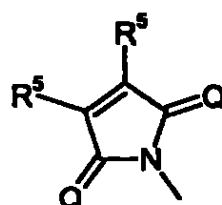
(Z³)



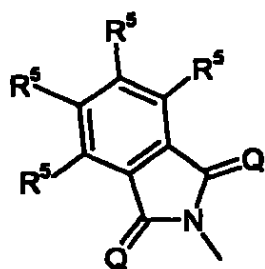
(Z⁴)



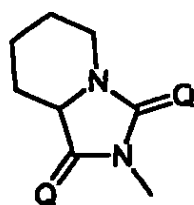
(Z⁵)



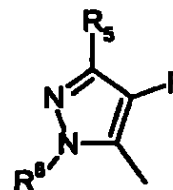
(Z⁶)



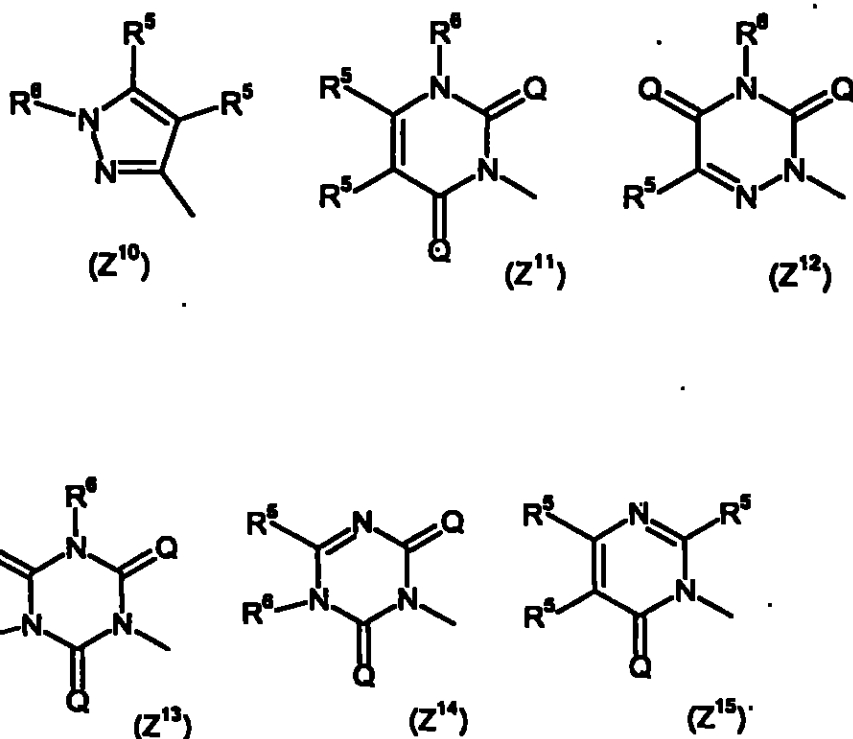
(Z⁷)



(Z⁸)



(Z⁹)



donde

Q significa O (oxígeno) o S (azufre),

R⁵ significa hidrógeno, amino, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, o significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino, alcoxicarbonilo, dialquilamino, alquenilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquinilo, alquiniloxi, alquiniltio, cicloalquilo o cicloalquilalquilo substituidos respectivamente en caso dado, y

R⁶ significa hidrógeno, hidroxí, amino, ciano, o significa alquilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilamino, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, fenilo o fenilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,

significando en caso dado dos restos contiguos -R⁵ y R⁵, R⁶ y R⁶ o R⁵ y R⁶ conjuntamente alcanodiilo o alquenodiilo substituidos respectivamente en caso dado y/o interrumpidos en caso dado por O(oxígeno), S(azufre) o por un agrupamiento

de la serie formada por $-\text{SO}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{NH}-$ o $-\text{N}(\text{alquilo})-$ al principio (o bien al final) o en el interior de la cadena hidrocarbonada.

En las definiciones, las cadenas hidrocarbonadas, tales como alquilo o alcanodiilo -incluso en combinación con heteroátomos, como en alcoxi- son respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada.

Preferentemente,

R^1 significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, o bromo.

Preferentemente,

R^2 significa ciano.

Preferentemente,

R^3 significa hidrógeno, amino, nitro, formilo, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa hidroxiiiminoalquilo con hasta 6 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por hidroxilo, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilcarbonilamino o alcoxiiiminoalquilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquinilo, alquiniloxi o alquiniltio con respectivamente hasta 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquiloxycarbonilo con respectivamente 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, con hasta 4 átomos de

carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁴ significa hidrógeno, amino, nitro, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa hidroxiiiminoalquilo con hasta 6 átomos de carbono, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno, por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, por alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, por alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, significa alcóxicarbonilo, alquilcarbonilamino o alcóxiiminoalquilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquinilo, alquiniloxi o alquiniltio con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo, cicloalquilalquilo o cicloalquiloxycarbonilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halógeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

Q significa O(oxígeno).

Preferentemente,

R⁵ significa hidrógeno, amino, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, halógeno, significa alquilo, alcoxi, alquiltio, alquilamino o alcoxycarbonilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa dialquilamino con respectivamente hasta 4 átomos de carbono en los grupos alquilo, significa alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alqueniltio, alquiniltio, con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, o significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 hasta 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y en caso dado hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Preferentemente,

R⁶ significa hidrógeno, hidroxi, amino, ciano, significa alquilo, alcoxi, alcoxycarbonilo o alquilamino con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, significa alquenilo o alquinilo con respectivamente hasta 6 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por halógeno, significa cicloalquilo o cicloalquilalquilo con respectivamente 3 a 6 átomos de carbono en los grupos cicloalquilo y, en caso dado, hasta 4 átomos de carbono en la parte alquilo, substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, o significa

fenilo, bencilo o feniletilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por halóxeno, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o por alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono.

Significando dos restos contiguos $-R^5$ y R^5 , R^6 y R^6 o R^5 y R^6 -, preferentemente, en conjunto alcanodiilo o alquenodiilo con respectivamente hasta 5 átomos de carbono, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno y/o interrumpidos en caso dado por O (oxígeno), por S (azufre) o por un agrupamiento de la serie $-SO-$, $-SO_2-$, $-NH-$ o $-N(\text{alquilo con 1 a 4 átomos de carbono})-$ al inicio (o bien al final) o en el interior de la cadena hidrocarbonada.

De forma especialmente preferente,

R' significa hidrógeno, flúor o cloro.

De forma especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno, amino, nitro, formilo, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa hidroxiiiminometilo, hidroxiiiminoetilo o hidroxiiiminopropilo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo, o etilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por hidroxí, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa acetilo, propionilo, n- o i-butirole, metoxi-carbonilo, etoxi-carbonilo, n- o i-propoxi-carbonilo, acetilamino, propionilamino, n- o i-butirole-amino, metoxiiiminometilo, etoxiiiminometilo, metoxiiiminoetilo o etoxiiiminoetilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propeniloxi,

buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniltio, o butiniltio substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropiloxicarbonilo, ciclobutiloxicarbonilo, ciclopentiloxicarbonilo o ciclohexiloxicarbonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituídos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por metoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁴ significa hidrógeno, amino, nitro, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, bromo, significa hidroxiiiminometilo, hidroxiiiminoetilo o hidroxiiiminopropilo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, n-, i-, s- o t-butiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por n- o i-propoxi, por metiltio, por etiltio, por n- o i-propiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n- o i-propoxicarbonilo, acetilamino, propinilamino, n- o i-butirolamino, metoxiiiminometilo, etoxiiiminometilo, metoxiiiminoetilo o etoxiiiminoetilo substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propeniloxi, buteniloxi, propeniltio, buteniltio, propinilo, butinilo, propiniloxi, butiniloxi, propiniltio, o butiniltio substituídos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor o por cloro,

significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo, ciclopropiloxycarbonilo, ciclobutiloxycarbonilo, ciclopentiloxycarbonilo o ciclohexiloxycarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por metoxi.

De forma especialmente preferente,

R⁵ significa hidrógeno, amino, nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, n-, i-, s- o t-butoxycarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa dimetilamino o dietilamino, significa propenilo, butenilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi, butiniloxi, propeniltio, buteniltio, propiniltio o butiniltio substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro o por bromo, o significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo.

De forma especialmente preferente,

R⁶ significa hidrógeno, hidroxí, amino, ciano, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, n-, i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, n-, i-, s- o t-butoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n- o i-propoxycarbonilo, n-, i-, s- o t-

butoxicarbonilo, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, i-, s- o t-butilamino substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor o por cloro, significa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo o ciclohexilmetilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metilo o por etilo, o significa fenilo o bencilo substituidos respectivamente en caso dado por nitro, por ciano, por flúor, por cloro, por bromo, por metilo o por metoxi.

Dos restos contiguos $-R^5$ y R^5 , R^6 y R^6 o R^5 y R^6 -significan en caso dado de forma especialmente preferente, de manera conjunta propano-1,3-diilo (trimetileno), butano-1,4-diilo (tetrametileno), pentano-1,5-diilo (pentametileno), propeno-1,3-diilo, 1-buteno-1,4-diilo o 2-buteno-1,4-diilo substituidos en caso dado por flúor o por cloro y/o interrumpidos en caso dado por O(oxígeno), S(azufre) o por un agrupamiento de la serie $-SO-$, $-SO_2-$, $-NH-$ o N(metilo)- al principio (o bien al final) o en el interior de la cadena hidrocarbonada.

De forma muy especialmente preferente,

R^1 significa flúor.

De forma muy especialmente preferente,

R^3 significa hidrógeno, carboxi, ciano, carbamoilo, tiocarbamoilo, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metiltio, etiltio, n- o i-propiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, metilsulfonilo o etilsulfonilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi, por etoxi, por metiltio, por etiltio, por metilsulfinilo, por etilsulfinilo, por metilsulfonilo o por etilsulfonilo, significa metoxycarbonilo, etoxycarbonilo,

n- o i-propoxycarbonilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi.

De forma muy especialmente preferente,

R⁴ significa hidrógeno.

De forma muy especialmente preferente,

R³ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, significa metilo, etilo, n- o i-propilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, significa dimetilamino, significa propenilo, butenilo, propinilo, butinilo, propeniloxi, buteniloxi, propiniloxi, butiniloxi, propeniltio, buteniltio, propiniltio o butiniltio substituidos respectivamente en caso dado por ciano o por flúor, por cloro o por bromo.

De forma muy especialmente preferente,

R⁶ significa hidrógeno, significa amino, significa metilo, etilo, n- o i-propilo substituidos respectivamente en caso dado por flúor, por cloro, por metoxi o por etoxi, o significa propenilo, butenilo, propinilo o butinilo substituidos respectivamente en caso dado por ciano, por flúor o por cloro.

Los restos R³ y R⁶ individuales -en tanto en cuanto estén enlazados mas de una vez con el mismo agrupamiento heterocíclico- pueden tener significados iguales o diferentes en el ámbito de las definiciones anteriormente indicadas como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes.

Las definiciones de los restos indicadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes son válidas tanto para los productos finales de la fórmula (I) como también, de manera correspondiente, para los productos de

196 201

partida o los productos intermedios necesarios respectivamente para la obtención. Estas definiciones de los restos pueden combinarse arbitrariamente entre sí, es decir incluso entre los intervalos preferentes indicados.

Según la invención serán preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como preferentes.

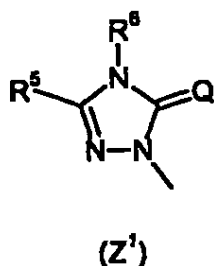
Según la invención son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I), en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como especialmente preferentes.

Según la invención son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en los cuales se presenta una combinación de los significados indicados anteriormente como muy especialmente preferentes.

Un grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como más preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



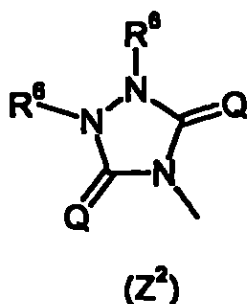
donde

Q, R⁵ y R⁶ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes.

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



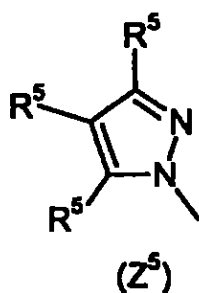
donde

Q y R^6 tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes.

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



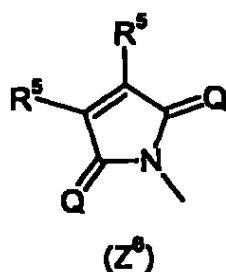
donde

R^3 tiene el significado indicado anteriormente como muy especialmente preferente.

Otro grupo muy, especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente



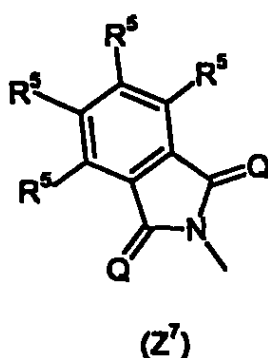
donde

Q y R^5 tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes.

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



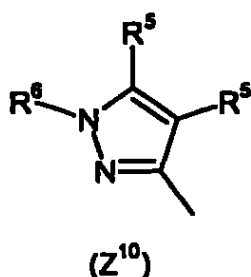
donde

Q y R⁵ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes.

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



donde

R⁵ y R⁶ tienen los significados anteriormente indicados como muy especialmente preferentes.

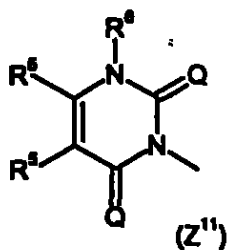
Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente

200 205

como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento heterocíclico siguiente,



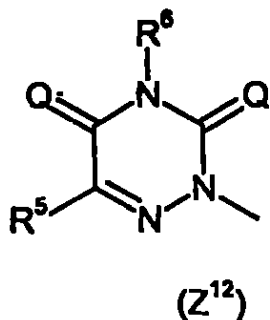
donde

Q, R³ y R⁶ tienen los significados indicados anteriormente, respectivamente como mas preferentes.

Otro grupo muy especialmente preferente está constituido por aquellos compuestos de la fórmula (I), en la que

R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente como mas preferentes y

Z significa el agrupamiento cíclico siguiente,



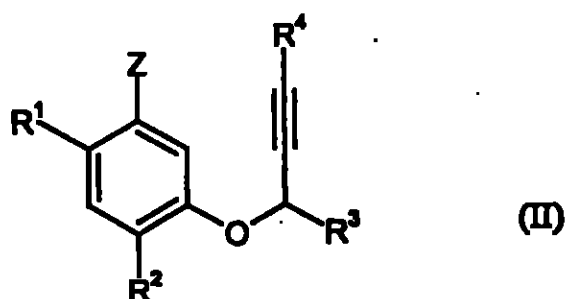
donde

Q, R³ y R⁶ tienen los significados anteriormente indicados, respectivamente como mas preferentes.

Los nuevos heterocicililbenzofuranos substituidos de la fórmula general (I)

presentan interesantes propiedades biológicas. Se caracterizan especialmente por una potente actividad herbicida.

Se obtienen los nuevos heterociclibenzofuranos substituidos de la fórmula general (I), si se pirolizan 3-alquiniloxi-fenilheterociclos de la fórmula general (II),

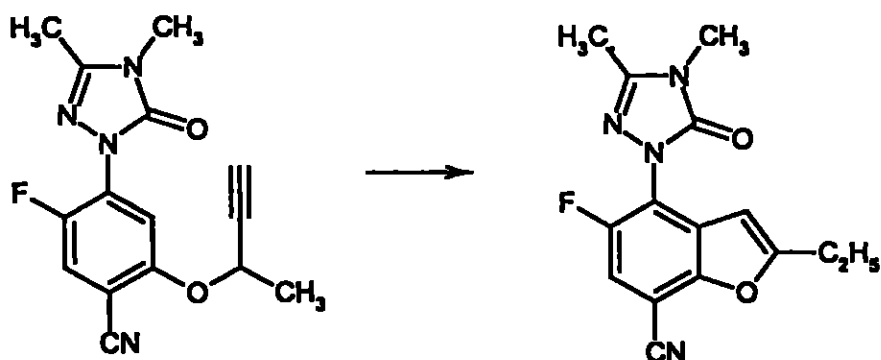


en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z tienen el significado anteriormente indicado,

en presencia de compuestos nitrogenados básicos y, en caso dado, en presencia de fluoruros metálicos..

Si se emplea, por ejemplo, el 4-(3,4-dimetil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-flúor-2-[(1-metil-2-propinil)-oxi]-benzonitrilo como producto de partida, podrá esquematizarse el desarrollo de la reacción en el caso del procedimiento según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Los 3-alquiniloxi-fenil-heterociclos a ser empleados como productos de

202 204

partida en el procedimiento según la invención para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I), están definidos en general por medio de la fórmula (II). En la fórmula general (II), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z tienen preferentemente o bien especialmente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente o bien de manera especialmente preferente para R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula general (I).

Los productos de partida de la fórmula general (II) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las publicaciones EP-A-370332, EP-A-597360, EP-A-599135, EP-A-610733, EP-A-617026, WO-A-96/18618, WO-A-97/30980, WO-A-97/26248, WO-A-97/40018, WO-A-97/46535, ejemplos de obtención).

El procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) se lleva a cabo con empleo de compuestos nitrogenados básicos orgánicos.

A éstos pertenecen, preferentemente, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, diciticlohexilamina, etil-diciticlohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-di-*tert*-butil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilaminopiridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN), y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU) y 1,3-dimetil-2-imidazolidindiona.

La 1,3-dimetil-2-imidazolidindiona es especialmente preferente como compuestos nitrogenado básico en el procedimiento según la invención.

El procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula general

(I) se lleva a cabo en caso dado con empleo de fluoruros metálicos. A éstos pertenecen, preferentemente, fluoruro de litio, de sodio, de potasio, de rubidio, de cesio, de magnesio, de calcio, de bario y de aluminio.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 150°C y 250°C, preferentemente entre 180°C y 220°C.

El procedimiento según la invención se lleva a cabo en general bajo presión normal. No obstante es posible también llevar a cabo el procedimiento según la invención bajo presión mas elevada o a presión mas reducida -en general comprendida entre 10 kPa y 1MPa.

En la realización del procedimiento según la invención se mezclan los componentes de la reacción en general a temperatura ambiente y la mezcla de la reacción se agita en general durante una o varias horas a la temperatura neccsaria. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales (véanse los ejemplos de obtención).

Los productos activos según la invención se pueden emplear como defoliantes, desecantes, agentes herbicidas y especialmente como agentes para eliminar las malas hierbas. Por malas hierbas, en el más amplio sentido, se han de entender las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. El hecho de que las sustancias, según la invención, actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de la cantidad empleada

Los productos activos según la invención pueden emplearse por ejemplo en las plantas siguientes:

Malas hierbas dicotiledóneas de las clases: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Cultivos dicotiledóneos de las clases: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Malas hierbas monocotiledóneas de las clases: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Cultivos monocotiledóneos de las clases: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

El empleo de los productos activos según la invención, no está sin embargo, limitado en forma alguna estas clases, sino que se extienden en igual forma también sobre otras plantas.

Los productos activos según la invención son adecuados, en función de la concentración, para combatir totalmente las hierbas malas, por ejemplo, en

instalaciones industriales y viarias y en caminos y plazas, con y sin crecimiento de árboles. Del mismo modo, se pueden emplear los compuestos para combatir las hierbas malas en cultivos permanentes, por ejemplo, en instalaciones forestales, de árboles de adorno, de árboles frutales, de viñedos, de árboles cítricos, de nogales, de plátanos, de café, de té, de goma de palmas de aceite, de cacao, de frutos de bayas y de lúpulo, sobre trazados ornamentales y deportivos y en superficies de prados y para combatir las hierbas malas en forma selectiva en los cultivos mono-anales.

Los compuestos según la invención de la fórmula (I) muestran una potente actividad herbicida y un amplio espectro de actividad sobre el terreno y sobre las partes aéreas de las plantas. Son adecuados en cierta medida también para combatir de manera selectiva las malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en el procedimiento de pre-brote como en el procedimiento de post-brote.

Los productos activos según la invención pueden emplearse también, en caso dado, a determinadas concentraciones y cantidades de aplicación también para combatir las plagas animales y las enfermedades de las plantas fúngicas o bacterianas. Pueden emplearse, en caso dado, también como productos intermedios y como productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser

protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo directamente o por acción sobre la localidad, sobre el medio ambiente o en el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, ampliamente por medio de recubrimientos con una o varias capas.

Los productos activos se pueden transformar en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos pulverizables, suspensiones, polvos, medios de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados, concentrados en suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con el producto activo, así como micro-encapsulados en materiales polímeros.

Estas formulaciones se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezcla de los productos activos con materiales extendedores, esto es, con disolventes líquidos y/o excipientes sólidos, en caso dado, empleando agentes tensioactivos, esto es, emulsionantes y/o dispersantes y/o medios generadores de espuma.

En el caso de emplear agua como material de carga se puede emplear, por ejemplo, también disolventes orgánicos como agentes disolventes auxiliares. Como

disolventes líquidos entran especialmente en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, los hidrocarburos aromáticos clorados y los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como los clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, o las parafinas, por ejemplo, las fracciones de petróleo crudo, los aceites minerales y vegetales, los alcoholes tales como butanol, o glicol, así como sus ésteres y éteres, las cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como el agua.

Como excipientes sólidos entran en consideración: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales molturados, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierras de diatoméas y minerales sintéticos molturados, tales como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como excipientes sólidos para granulados entran en consideración: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, cáscaras de nuez de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo, los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilenados de ácidos grasos, éteres polioxietilenados de alcoholes grasos, tales como por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como los hidrolizados de albúmina; como dispersantes entran en consideración: por ejemplo, lixivitaciones sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden emplear adhesivos tales como carboximetil-celulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de latex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden emplear colorantes, tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul ferrocianico y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y de ftalocianina metálicos y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen, por lo general, entre un 0,1 hasta un 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,5 y un 90 %.

Los productos activos según la invención pueden emplearse como tales o en sus formulaciones incluso en mezcla con herbicidas conocidos y/o con productos que mejoren la compatibilidad para con las plantas de cultivo ("protectores") para la lucha contra las malas hierbas, siendo posibles formulaciones acabadas o mezclas de tanque. También son posibles con agentes para combatir las malas hierbas, que contengan uno o varios herbicidas y protectores conocidos.

Para las mezclas entran en consideración herbicidas conocidos, por ejemplo: Acetochlor, Acifluorfen(-sodio), Aclonifen, Alachlor, Alloxydim(-sodio), Ametryne, Amidochlor, Amidosulfuron, Anilofos, Asulam, Atrazine, Azafenidin, Azimsulfuron, Benazolin(-etilo), Benfuresate, Bensulfuron(-metilo), Bentazon, Benzobicyclon, Benzofenap, Benzoylprop(-etilo), Bialaphos, Bifenox, Bispyribac(-sodio), Bromobutide, Bromofenoxim, Bromoxynil, Butachlor, Butroxydim, Butylate, Cafenstrole, Caloxydim, Carbetamide, Carfentrazone(-etilo), Chlomethoxyfen,

Chloramben, Chloridazon, Chlorimuron(-etilo), Chlornitrofen, Chlorsulfuron, Chlortoluron, Conidon(-etilo) Cinmethylin, Cinosulfuron, Clethodim, Clodinafop (-propargilo), Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, Clopyrasulfuron(-metilo), Cloransulam(-metilo), Cumyluron, Cyanazine, Cybutryne, Cycloate, Cyclosulfamuron, Cycloxydim, Cyhalofop(-butilo), 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DP, Desmedipham, Diallate, Dicamba, Diclofop(-metilo), Diclosulam, Diethatyl(-etilo), Difenzoquat, Diflufenican, Diflufenzopyr, Dimefuron, Dimepiperate, Dimethachlor, Dimethametryn, Dimethenamid, Dimexyflam, Dinitramine, Diphenamid, Diquat, Dithiopyr, Diuron, Dymron, Epoprodan, EPTC, Esprocarb, Ethalfluralin, Ethametsulfuron(-metilo), Ethofumesate, Ethoxyfen, Ethoxysulfuron, Etobenzanid, Fenoxaprop(-P-etilo), Fentrazamide, Flamprop(-isopropilo), Flamprop(-isopropilo-L), Flamprop(-metilo), Flazasulfuron, Florasulam, Fluazifop(-P-butilo), Fluazolate, Flucarbazone, Flufenacet, Flumetsulam, Flumiclorac(-pentilo), Flumioxazin, Flumipropyn, Flumetsulam, Fluometuron, Fluorochloridone, Fluoroglycofen(-etilo); Flupoxam, Flupropacil, Flupyrasulfuron(-metilo, -sodio), Flurenol(-butilo), Fluridone, Fluroxypyr(-meptyl), Flurprimidol, Flurtamone, Fluthiacet(-metilo), Fluthiamide, Fomesafen, Glufosinate(-amonio), Glyphosate(-isopropilamonio), Halosafen, Haloxypop(-etoxietilo), Haloxypop(-P-metilo), Hexazinone, Imazamethabenz(-metilo), Imazamethapyr, Imazamox, Imazapic, Imazapyr, Imazaquin, Imazethapyr, Imazosulfuron, Iodosulfuron(-metilo, -sodio), Ioxynil, Isopropalin, Isoproturon, Isouron, Isoxaben, Isoxachlortole, Isoxaflutole, Isoxapyrifop, Lactofen, Lenacil, Linuron, MCPA, MCPP, Mefenacet, Mesotrione, Metamitron, Metazachlor, Methabenzthiazuron, Metobenzuron, Metobromuron, (alfa-)Metolachlor, Metosulam, Metoxuron, Metribuzin, Metsulfuron(-metilo), Molinate, Monolinuron, Naproanilide, Napropamide, Neburon, Nicosulfuron, Norflurazon, Orbencarb, Oryzalin,

Oxadiargyl, Oxadiazon, Oxasulfuron, Oxaziclomefone, Oxyfluorfen, Paraquat, ácido pelargónico, Pendimethalin, Pendralin, Pentoxazone, Phenmedipham, Piperophos, Pretilachlor, Primisulfuron(-metilo), Prometryn, Propachlor, Propanil, Propaquizafop, Propisochlor, Propyzamide, Prosulfocarb, Prosulfuron, Pyraflufen (-etilo), Pyrazolate, Pyrazosulfuron(-etilo), Pyrazoxyfen, Pyribenzoxim, Pyributicarb, Pyridate, Pyriminobac(-metilo), Pyriothiobac(-sodio), Quinchlorac, Quinmerac, Quinoclamine, Quizalofop(-P-etilo), Quizalofop(-P-tefurilo), Rimsulfuron, Sethoxydim, Simazine, Simetryn, Sulcotrione, Sulfentrazone, Sulfometuron(-metilo), Sulfosate, Sulfosulfuron, Tebutam, Tebuthiuron, Tepraloxym, Terbutylazine, Terbutryn, Thenylchlor, Thiafluamide, Thiazopyr, Thidiazimin, Thifensulfuron (-metilo), Thiobencarb, Tiocarbazil, Tralkoxydim, Triallate, Triasulfuron, Tribenuron(-metilo), Triclopyr, Tridiphane, Trifluralin, Triflusulfuron, Tritosulfuron.

También es posible una mezcla con otras sustancias activas conocidas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas, sustancias protectoras contra la ingestión por pájaros, sustancias nutrientes de las plantas y medios mejoradores de la estructura del terreno.

Los productos activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de los mismos mediante diluciones ulteriores, tales como soluciones listas para su empleo, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y granulados. El empleo se lleva a cabo en forma usual por ejemplo mediante riego, pulverización, aspersión, esparcido.

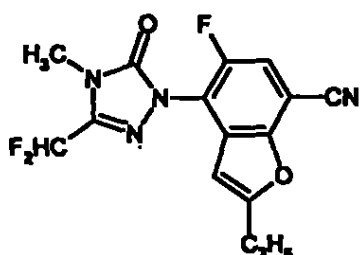
Los productos activos según la invención pueden aplicarse tanto antes como después del brote de las plantas. También pueden incorporarse, en el suelo antes de la siembra.

La cantidad de producto activo empleada puede oscilar dentro de un amplio margen. Esta depende fundamentalmente del tipo del efecto deseado. En general las cantidades empleadas se sitúa entre 1 g y 10 kg de producto activo por hm^2 de superficie del terreno, preferentemente entre 5 g y 5 kg por hm^2 .

La obtención y el empleo de las sustancias activas según la invención se deducen de los ejemplos siguientes:

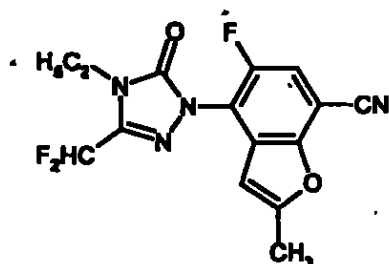
Ejemplos de obtención:

Ejemplo 1.



Se agita una mezcla constituida por 1,0 g (3 mmoles) de 4-(3-difluórmetil-4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-flúor-2-[(1-metil-2-propinil)-oxi]-benzonitrilo, 20 ml de 1,3-dimetil-2-imidazolindiona y 2 mg de fluoruro de potasio durante 4 horas a 200°C hasta 210°C, tras refrigeración con agua se agita y se acidifica con ácido clorhídrico concentrado (pH 2). El producto precipitado se aísla mediante filtración por succión, se lava con agua y se purifica mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice con tolueno/acetato de etilo (volumen: 3:1).

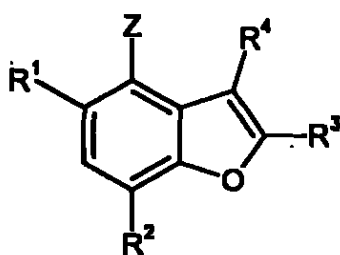
Se obtienen 0,40 g (40 % de la teoría) de 4-(3-difluórmetil-4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il)-2-etil-5-flúor-1-benzofurano-7-carbonitrilo con un punto de fusión de 115°C (logP: 2,79).

Ejemplo 2:

Se agita una mezcla constituida por 1,3 g (3,9 mmoles) de 4-(3-difluorometil-4-etil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-flúor-2-[(2-propinil)-oxi]-benzonitrilo y 20 ml de N,N-dietil-anilina durante 1 hora a 210°C, tras refrigeración con agua se agita y se acidifica con ácido clorhídrico concentrado (pH 2). El producto precipitado se aísla mediante filtración por succión, se lava con agua y se purifica mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice con tolueno/acetato de etilo (volumen: 3:1).

Se obtienen 0,60 g (46 % de la teoría) de 4-(3-difluorometil-4-etil-5-oxo-4,5-dihidro-1H-1,2,4-triazol-1-il)-2-metil-5-flúor-1-benzofurano-7-carbonitrilo con un punto de fusión de 102°C (logP: 2,73).

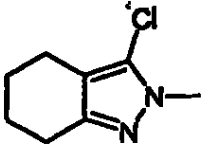
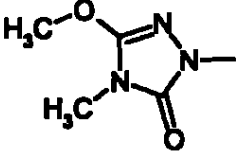
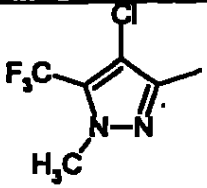
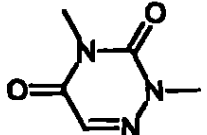
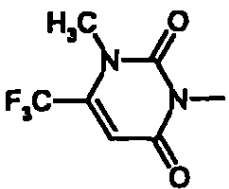
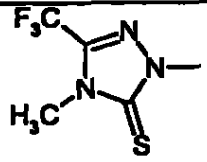
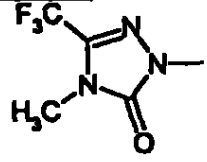
De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2 así como de acuerdo con la descripción general del procedimiento de obtención según la invención pueden prepararse por ejemplo también los compuestos de la fórmula general (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

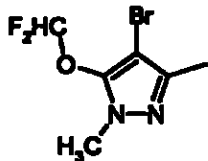
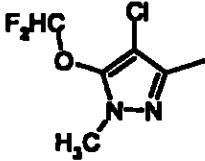
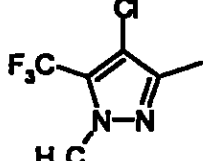
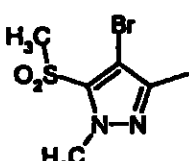
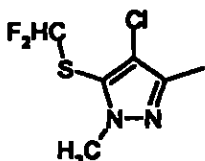
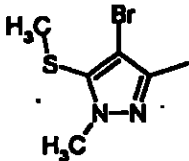
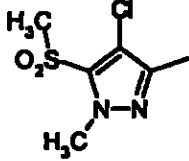


(I)

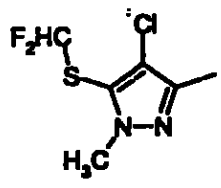
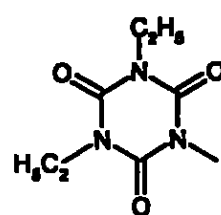
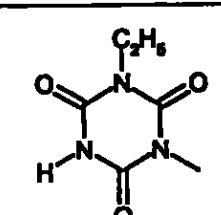
Tabla 1: Ejemplos de compuestos de la fórmula (I).

Ej. n°	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Datos físicos
3		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 162°C
4		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 240°C
5		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 54°C
6		F	CN	C ₂ H ₅	H	Fp.: 98°C
7		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 182°C
8		F	CN	C ₂ H ₅	H	Fp.: 72°C
9		F	CN	n-C ₃ H ₇	H	Fp.: 122°C
10		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 4,90 ¹⁾

Ej. n°	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Datos físicos
11		H	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 5,07 ^{a)}
12		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 2,28 ^{a)}
13		F	CN	CH ₃	H	logP = 4,29 ^{a)}
14		F	CN	CH ₃	H	logP = 2,29 ^{a)}
15		F	CN	C ₂ H ₅	H	¹ H-NMR (CDCl ₃): 3,59-3,60; 6,30; 6,41; 7,37-7,40 ppm
16		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 221°C
17		F	CN	CH ₃	H	Fp.: 109°C

Ej. n°	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Datos físicos
18		F	CN	CH ₃	H	logP = 3,71 ^{a)}
19		F	CN	CH ₃	H	logP = 3,67 ^{a)}
20		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 4,75 ^{a)}
21		F	CN	CH ₃	H	logP = 3,00 ^{a)}
22		F	CN	CH ₃	H	logP = 3,92 ^{a)}
23		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 4,54 ^{a)}
24		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 3,36 ^{a)}

216 ~~221~~

Ej. nº	Z	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Datos físicos
25		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 4,30 ^{a)}
26		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 3,83 ^{a)}
27		F	CN	C ₂ H ₅	H	logP = 2,87 ^{a)}

La determinación de los valores logP, indicados en la tabla 1, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna de inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

- (a) Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido: ácido fosfórico acuoso 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo – los resultados correspondientes de la medida se han marcado en la tabla 1 con ^{a)}.
- (b) Eluyentes para la determinación en el intervalo neutro: solución acuosa 0,01 molar de tampón de fosfato, acetonitrilo; gradiente lineal desde el 10 % de

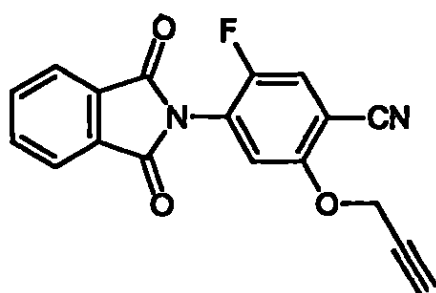
acetonitrilo hasta el 90 % de acetonitrilo – los resultados correspondientes de medida se han marcado en la tabla 1 con ^{b)}.

El calibrado se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

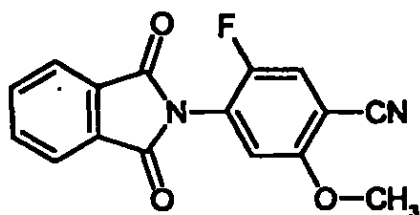
Los valores lambda máximos se determinaron por medio de los espectros UV de 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

Productos de partida de la fórmula (II):

Ejemplo (II-1).



Primera etapa.

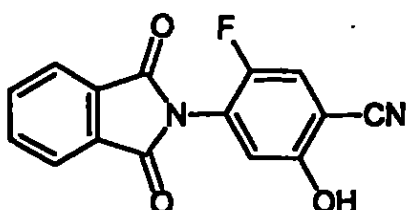


Se calienta durante 2 días a reflujo una mezcla constituida por 8,0 g (50 mmoles) de 4-ciano-2-flúor-5-metoxi-anilina, 7,4 g (50 mmoles) de anhídrido del ácido ftálico y 150 ml de metanol. A continuación se agregan 0,8 g de 4-dimetilamino-piridina y la mezcla se calienta a reflujo durante otras 24 horas. A continuación se concentra por evaporación, el residuo se combina con agua y con

acetato de etilo, el producto precipitado se aísla mediante filtración por succión y se lava con agua.

Se obtienen 11,2 g (76 % de la teoría) de la N-(2-flúor-4-ciano-5-metoxi-fenil)-ftalimida con un punto de fusión de 245°C (logP: 2,51).

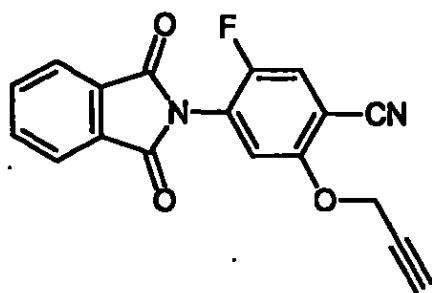
Segunda etapa.



Se disponen 10,6 g (35,8 mmoles) de la N-(2-flúor-4-ciano-5-metoxi-fenil)-ftalimida en 300 ml de diclorometano y se agregan, gota a gota, a 10°C hasta 20°C, 107 ml (107 mmoles) de tribromuro de boro (solución 1 molar en diclorometano). La mezcla se agita durante 2 días a 25°C, a continuación se combina con agua, se agita durante otros 10 minutos y el producto sólido se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 9,2 g (91 % de la teoría) de la N-(2-flúor-4-ciano-5-hidroxi-fenil)-ftalimida con un punto de fusión de 247°C (logP: 2,04).

Tercera etapa.

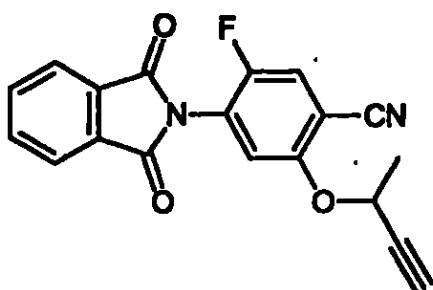


Se calienta durante 18 horas a reflujo una mezcla constituida por 3,0 g (10,6 mmoles) de N-(2-flúor-4-ciano-5-hidroxi-fenil)-ftalimida, 100 ml de acetonitrilo,

1,91 g (13,8 mmoles) de carbonato de potasio y 1,39 g (11,7 mmoles) de bromuro de propargilo. A continuación se concentra por evaporación, el residuo se combina con acetato de etilo y con ácido clorhídrico 2N, y el producto precipitado se aísla mediante filtración por succión.

Se obtienen 1,8 g (52,9 % de la teoría) de la N-(2-flúor-4-ciano-5-propargiloxi-fenil)-ftalimida con un punto de fusión de 242°C.

Ejemplo (II-2).



Se dispone 1,0 g (3,55 mmoles) de la N-(2-flúor-4-ciano-5-hidroxi-fenil)-ftalimida en 40 ml de tetrahidrofurano con 1,02 g (3,9 mmoles) de trifenilfosfina y 0,30 g (4,26 mmoles) de 3-butin-2-ol y se agregan, bajo refrigeración (máximo 20°C), 0,70 g (3,9 mmoles) de azodicarboxilato de dietilo (disueltos en 20 ml de tetrahidrofurano). La mezcla se agita durante 24 horas a 25°C, se concentra por evaporación y se purifica a través de gel de sílice con ciclohexano/acetato de etilo 2:1.

Se obtienen 0,35 g (29 % de la teoría) de la N-[2-flúor-4-ciano-5-(but-1-in-3-il)-oxi-fenil]-ftalimida con un punto de fusión de 170°C (logP: 2,92).

Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A.

Ensayo pre-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se siembran semillas de las plantas de ensayo en terreno normal. Al cabo de 24 horas, aproximadamente, se pulveriza el suelo con la preparación del producto activo de tal manera que se aplique, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada por unidad de superficie. La concentración del caldo de pulverización se elegirá de tal modo que se aplique en 1.000 litros de agua por hectárea, respectivamente, la cantidad de producto activo deseada

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo del control no tratados.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles no tratados).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1 y 2 un efecto muy potente contra las malas hierbas.

Ejemplo B.

Ensayo de post-brote.

Disolvente: 5 Partes en peso de acetona.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso de producto activo con la cantidad de disolvente indicada, se

agrega la cantidad de emulsionante señalada y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se pulverizan plantas de ensayo, que tienen una altura de 5 hasta 15 cm, con la preparación del producto activo de tal manera que, se apliquen respectivamente las cantidades de producto activo deseadas por unidad de superficie. La concentración de los caldos pulverizables se elige de tal forma que se aplique en 1.000 litros de agua/ha la cantidad deseada en cada caso de producto activo.

Al cabo de tres semanas se evalúa el grado de daños de las plantas en % de daños en comparación con el desarrollo de los controles sin tratar.

Significan:

0 % = sin efecto (igual que los controles sin tratar).

100 % = destrucción total.

En este ensayo muestran, por ejemplo, los compuestos según los ejemplos de obtención 1 y 2, un efecto muy potente contra las malas hierbas.

Refinados folios 227-234 → tarjetas y extracto
2002-08-10 202043

118.000 =
222 235

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 00059234 00000001 Folios: 52
Fecha (AMB): 2001-01-05 17:16:24
Frente : 002 PATENTES D I REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 75,463
FECHA : DICIEMBRE 11 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	2825232	14,157,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08	PRORROGA DE TERMINOS	31 PRORROGA DE TERMINOS
			50,000.00
		TOTAL :	\$ 50,000.00

SOM: CINCUENTA MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

\$ 68.000 =
RC 223 28

Industria y Comercio

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00059234 00000001
Fecha (AMD): 2001-01-05 17:16:24
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

HIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 76,653
FECHA : DICIEMBRE 14 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	1798647	16,484,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01 03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	68,000.00
	TOTAL :	\$ 68,000.00

SOM: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: Info@slc.gov.co
www.slc.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

224 234

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 00039234 00000001 Folios: 52
Fecha (ORD): 2001-01-05 17:16:24
Tramite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 444 REPUESTA
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
NIT : 000176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 70,136
FECHA : DICIEMBRE 21 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	1790646	14,680,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEYAS COMERCIALES	60,000.
	TOTAL :	\$ 68,000.00

CON: SESENTA Y OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Bole 00696-001-121-6

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5, 7 y 10
Conmutador: 382 0840
Fax: 350 5220
e-mail: Info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D.C., Colombia

2do. EXAMEN DE FORMA PATENTE DE INVENCION

Folio 238

Radicación no 00-59234

Concepto Técnico no 1610 Clasificación Internacional de Patentes: A 01 N 43/08

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 38 de la Decisión 486 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- | | |
|--|--|
| SI ☒] NO ☐] | Contiene un resumen de la invención (Art.26-e). |
| SI ☒] NO ☐] | Contiene el título o nombre de la invención (Art.27-d). |
| SI ☒] NO ☐] | Contiene la descripción de la invención (Art.26-b). |
| SI ☐] NO ☐] | NO ES APLICABLE ☒ Contiene los dibujos necesarios para comprender la invención (Art.26-d) |
| SI ☒] NO ☐] | Contiene una o más reivindicaciones. (Art.26-c). |
| SI ☐] NO ☒] | NO ES APLICABLE ☐ Han sido desarrollados los productos y/o procedimientos a partir de recursos genéticos o de sus productos derivados de los que cualquiera de los Países Miembros es país de origen. (Art. 26- h). |
| SI ☐] NO ☒] | NO ES APLICABLE ☐ Los productos y/o procedimientos han sido obtenidos o desarrollados a partir de los conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas, afroamericanas, o locales de los países miembros, de acuerdo a lo establecido en la Decisión 391 y sus modificaciones y reglamentaciones vigentes.(Art.26-i). |
| SI ☐] NO ☒] | La invención se refiere a un producto relativo a un material biológico. (Art.26-J). |
| SI ☒] NO ☐] | NO ES APLICABLE ☐ La prioridad coincide con la materia reivindicada. |
| SI ☒] NO ☐] | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS:

Se acepta título nuevo en folio 186. Se acepta nuevo capítulo descriptivo, folios 189-226, con la conversión de las unidades de medida al Sistema Internacional. Se acepta nuevo extracto para publicación junto con tarjetas de archivos.

EXAMINADOR TÉCNICO
202043

Bogotá D. C., 2002-08-10

2020
Bogotá D.C.

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado

REFERENCIA:	Radicación No.	00-59234
	Trámite	002
	Evento	001
	Actuación	416
	Oficio No.	1610
	Folios	001

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en los artículos 26 y 27 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, y en las demás disposiciones vigentes sobre la materia, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial, conforme lo establece el artículo 40 de la misma Decisión.

Cúmplase

Dado en Bogotá D.C., a los **6** AGO. 2002


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Bogotá, DC, **20/10-2003** El extracto de esta solicitud fue publicado en el número **523** de la Gaceta de Propiedad Industrial, de fecha **27-12-2002**. El término hábil señalado por la ley expiró el **26-03-2003** y SI ☐ NO ☒ se presentaron oposiciones por parte de terceros.

