

CAVELIER

ABOGADOS

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

Teléfono: (57-1) 347 3611
Telefax: (57-1) 211 8650
(57-1) 700 4814

www.cavelier.com
cavelier@cavelier.com

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-118659- -00005-0000

Fecha: 2012-11-14 17:00:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 379 FASENACIONALII
Act. 523 RESPUESTA Folios: 32

Señor Director
DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Trámite : 011
Evento : 379
Actuación : 444

Referencia
Asunto

Expediente No. 09118659
Solicitud de patente para:
**UNA MEZCLA QUE COMPRENDE TIADIAZURÓN Y
CIPROSULFAMIDA**
BAYER CROPSCIENCE AG
22 de octubre de 2009

Solicitante
Fecha de solicitud

1. Yo, LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, obrando como apoderado del solicitante en el asunto antes identificado, me refiero al oficio No. **14693** notificado por fijación en lista de 21 de agosto de 2012.
2. Mediante oficio No. **14693** 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. Reivindicaciones relativas a un uso o a un segundo uso

De acuerdo al Señor Examinador, las reivindicaciones 4 - 6 no son patentables; las reivindicaciones 10-12 hacen referencia a una manera de usar la composición y por tanto constituye un uso y no son patentables.

Atendiendo las observaciones del Señor Examinador nos permitimos presentar un nuevo capítulo reivindicatorio donde se han eliminado las reivindicaciones objetadas.

2.2. Título

De acuerdo con el Señor Examinador el título no corresponde con el objeto de la solicitud. En consecuencia nos permitimos presentar el siguiente nuevo título que refleja el contenido del capítulo reivindicatorio que presentamos a ustedes:

UNA MEZCLA QUE COMPRENDE TIADIAZURÓN Y CIPROSULFAMIDA

2.3. Claridad en las reivindicaciones

2.3.1. Reivindicaciones 1 y 7

Las reivindicaciones 1 y 7 no están debidamente sustentadas en la descripción pues allí sólo se encuentran soportadas las mezclas tiadiazurón y ciprosulfamida y además un adyuvante.

En relación a este aspecto, nos permitimos presentar un nuevo capítulo reivindicatorio donde la parte característica de la reivindicación principal 1 se encuentra la mezcla de tiadiazurón y ciprosulfamida y en la parte característica de la reivindicación 2 se encuentran la mezcla de tiadiazurón y ciprosulfamida junto con uno o más auxiliares de formulación.

2.3.2. Reivindicación 2

Se objeta la reivindicación 2.

Dicha reivindicación ha sido eliminada del nuevo capítulo reivindicatorio

2.3.3. Se objeta la expresión "uno o más"

Al respecto nos apartamos de la opinión del señor Examinador. En primer lugar, la expresión "uno o más" refiere una reivindicación de tipo "abierto", donde su mismo Despacho ha indicado en el "Instructivo de examen de solicitudes de patentes y de modelo de utilidad" que "(...) *el examinador*

interpretará que los productos o procedimientos incluyen también elementos no mencionados en la reivindicación. Así, si una reivindicación trata de “un producto que comprende A, B y C”, el examinador interpretará que el producto comprende los elementos A, B, C y cualquier otro elemento no mencionado en la reivindicación (...). Además, y contrario a lo manifestado por el examinador, la expresión “uno o más” no hace opcional las características técnicas esenciales sino que revela las modalidades preferidas de dichas características. Estamos de acuerdo con su Despacho en que ‘el examinador debe presentar una objeción cuando las reivindicaciones incluyan términos imprecisos del tipo “aproximadamente”, “alrededor de”, “opcionalmente” ya que en ese caso el alcance y ámbito de protección de la reivindicación deja de ser precisa, y no permite una comparación con el estado de la técnica.’ Sin embargo, la expresión “uno o más” como se emplea en la presente solicitud refiere un límite inferior exacto sobre una variable entera y donde el límite superior se obtiene por las mismas características técnicas del producto; en consecuencia si se habla de “uno o más” auxiliares de formulación, cualquier persona entiende que se están refiriendo a un auxiliar de formulación o dos auxiliares de formulación o tres o sus mezclas, claramente definidos en la solicitud y donde cualquier persona entiende a que se refiere dicha expresión. Reiteramos que se trata de una reivindicación abierta aceptada en cualquier parte del mundo y donde, anecdóticamente, sólo en Colombia ha sido objetada.

2.4. **Descripción**

El Señor Examinador refiere que el producto con marca registrada Agrotin® debe nombrarse con su estructura química

Atendiendo la sugerencia del señor Examinador nos permitimos aclarar que dicho producto es un agente humectante no iónico con la siguiente composición química: alcohol isotridecil etoxilado o, lo que es lo mismo, isotridecanol etoxilado, con un promedio de 8 unidades de EO (estándares de grupos etoxilados).

2.5. **Análisis de nivel inventivo**

2.5.1. De lo dicho por el examinador

2.5.1.1. El Señor Examinador refiere que los documentos del estado de la técnica cercanos a la invención de la reivindicación 1 corresponden a D1, D2 y D3.

El Señor Examinador refiere que la diferencia entre la reivindicación 1 y la mezcla de D1 consiste en el compuesto N-fenilsulfonil (het) arilamida que no menciona D1.

El Señor Examinador refiere que la diferencia entre la reivindicación 1 y la mezcla de D2 consiste en el compuesto N-fenilsulfonil (het) arilamida que no menciona D2.

De acuerdo al Señor Examinador, el Problema Técnico Objetivo a resolver es plantear una alternativa a la mezcla conocida según D1 o D2 para mejorar la eficiencia de exfoliantes novedosos que ofrezcan ventajas comparadas con los compuestos conocidos.

Sin embargo, según el examinador, la ciprosulfanamida con otros herbicidas ya está divulgada en el documento D3 que comprende una cantidad eficaz de uno o más protectores del grupo de las acilsulfamoilbenzamidas y uno o más herbicidas.

En consecuencia, el experto en la materia incluiría N-fenilsulfonil (het) arilamida, en especial ciprosulfanamida de D3 en la mezcla de D1 o la de D2 para llegar al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud por lo que se considera obvia.

2.5.1.2. El Señor Examinador refiere que los documentos del estado de la técnica cercanos a la invención de la reivindicación 7 corresponden a D1, D2 y D3.

El Señor Examinador refiere que la diferencia entre la reivindicación 7 y la mezcla de D1 consiste en el compuesto N-fenilsulfonil (het) arilamida que no menciona D1.

El Señor Examinador refiere que la diferencia entre la reivindicación 7 y la mezcla de D2 consiste en el compuesto N-fenilsulfonil (het) arilamida que no menciona D2.

De acuerdo al Señor Examinador, el Problema Técnico Objetivo a resolver es plantear una alternativa a la mezcla conocida según D1 o D2 para mejorar la eficiencia de exfoliantes novedosos que ofrezcan ventajas comparadas con los compuestos conocidos.

Sin embargo, según el examinador, la ciprosulfanamida con otros herbicidas ya está divulgada en el documento D3 que comprende una cantidad eficaz de uno o más protectores del grupo de las acilsulfamoilbenzamidas y uno o más herbicidas.

En consecuencia, el experto en la materia incluiría N-fenilsulfonil (het) arilamida, en especial ciprosulfanamida de D3 en la mezcla de D1 o la de D2 para llegar al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud por lo que se considera obvia.

2.5.1.3. Además afirma el señor examinador que el solicitante no relaciona evidencia alguna que indique que la presencia de ciprosulfanamida otorgue al exfoliante alguna ventaja técnica

Al respecto queremos comentar lo siguiente:

2.5.2. Del incorrecto análisis del nivel inventivo.

El Tribunal se ha pronunciado en diversas oportunidades sobre la forma de llevar a cabo el análisis de nivel inventivo de la siguiente manera: *"Para determinar si el objeto de la reivindicación resulta obvio o se deriva de manera evidente del estado de la técnica se recurre, siempre que sea posible, al método problema-solución"* (Proceso 36-IP-2010). Su Despacho, en el "Instructivo Examen de Solicitudes de

Patentes de Invención y Modelo de Utilidad”, sintetiza cómo se lleva a cabo el procedimiento:

Método “problema-solución”

Durante el examen de nivel inventivo debe hacerse un juicio de valor y un análisis objetivo de las divulgaciones previas del estado de la técnica, no influenciados por el conocimiento que ya se tiene de la Invención que se está evaluando. Por tanto, con el fin de minimizar la subjetividad y evitar que se realice un análisis en retrospectiva (“hindsight” ó “a posteriori”), el examen debe relacionar la invención con la solución de un problema técnico, mediante el Método “problema-solución”. Este consta de las siguientes etapas:

- *Identificar el estado de la técnica cercano a la invención reivindicada*

El estado de la técnica cercano es un documento que se encuentra en el mismo campo técnico que la invención o trata de solucionar el mismo problema o uno semejante. Suele ser el que tiene más características en común con la invención o presenta leves modificaciones de estructura e indica la misma función, propósito. En caso de que haya varios documentos relacionados, el estado de la técnica cercano es el documento que menciona una función, propósito, problema a resolver ó actividad semejante al de la invención.

- *Determinar la diferencia entre la invención y estado de la técnica cercano*

Comparar las características técnicas esenciales de la invención, con las del estado de la técnica cercano, mediante una matriz (...)

(...)- Definir el efecto técnico causado y atribuible al elemento diferencial

El examinador debe re plantear el problema técnico, que la solicitud había mencionado inicialmente, a la luz del informe de búsqueda. El problema técnico objetivo se plantea en términos de: De manera que el problema técnico objetivo se formulará así: “¿cómo modificar ó adaptar el estado de la técnica cercano para obtener el efecto técnico

que la invención proporciona?” La definición del problema técnico objetivo se basa en hechos objetivos concretos del estado de la técnica y en los resultados logrados por la invención. La expresión “problema técnico objetivo” deberá interpretarse en sentido amplio; no implica necesariamente que la solución constituya una mejora técnica en relación con el estado de la técnica; dado que puede ocurrir que el problema consista simplemente en buscar una solución de reemplazo a un dispositivo o a un procedimiento conocido que produzca efectos idénticos o similares.

- Evaluar si la invención reivindicada, partiendo del estado de la técnica cercano y del problema técnico objetivo, habría sido obvia para la persona medianamente versada en la materia

Esta etapa consiste en responder a la pregunta de si en el estado de la técnica en su conjunto hay un segundo documento que contiene una enseñanza que indicaría (no sólo que podría indicar, sino que indicaría) a la persona medianamente versada en la materia, enfrentada al problema técnico, cómo modificar o adaptar el estado de la técnica más cercano para resolver el problema, de la forma reivindicada, sin realizar una actividad inventiva. Si la respuesta es afirmativa, la Invención se considera obvia, y por tanto se concluye que no tiene nivel inventivo. Pero, si la respuesta es negativa, la invención no es obvia y se considera que tiene nivel inventivo.

Dentro de los errores que ha cometido su Despacho en la aplicación del método están:

- El Estado de la Técnica **debe ser un documento** que se encuentra en el mismo campo técnico que la invención o trata de solucionar el mismo problema o uno semejante. **En caso de que haya varios documentos relacionados, el estado de la técnica cercano es el documento que menciona una función, propósito, problema a resolver ó actividad semejante al de la invención.** El Señor Examinador ha citado **tres documentos** como los más cercanos; en

consecuencia no ha utilizado el método de forma correcta pues debe escoger **un documento** de acuerdo a las reglas que dicta el método.

- Dado que se tomaron tres documentos simultáneamente para realizar el examen de nivel inventivo, no es posible que el Señor Examinador determine la diferencia entre la invención y estado de la técnica cercano pues se trata de diferencias disímiles procedentes de las anterioridades lo que conlleva incongruencias en el análisis.
- Como se observa, la pregunta desarrollada por el Examinador es una pregunta genérica, pues no se ha identificado el estado del arte más cercano (**el documento** que lo representa), lo que demuestra que no se siguió la metodología establecida.
- Dado que no se ha determinado el estado del arte más cercano, no es posible evaluar si la invención reivindicada, partiendo del estado de la técnica cercano y del problema técnico objetivo, habría sido obvia para la persona medianamente versada en la materia.
- El Tribunal es claro en establecer que *"El examinador no debe basarse en apreciaciones personales; toda objeción respecto a la falta de nivel inventivo de una invención debe probarse a partir del estado de la técnica"* (proceso 36-IP-2010). Como ya se ha demostrado, el Señor Examinador no ha probado la falta de nivel inventivo toda vez que siguió una metodología ajena a lo que dicta la práctica; en consecuencia las conclusiones a las que llega se basan en apreciaciones personales que son totalmente contrarias a lo que debería hacer el Señor Examinador

En consecuencia, consideramos que el análisis hecho por el señor Examinador carece de validez.

2.5.3. De otros errores del Señor Examinador.

El examinador plantea como problemas objetivos en el análisis del nivel inventivo de las reivindicaciones 1 y 7 en cómo encontrar una alternativa a la mezcla conocida según D1 o D2 para mejorar la eficiencia de exfoliantes novedosos que ofrezcan ventajas comparadas con los compuestos conocidos. Sin embargo, el

examinador se equivoca en materia grave al identificar al Tidiázurón como herbicida. **El tidiázurón no es un herbicida. El tidiázurón es un regulador del crecimiento de las plantas.** En el "e-pesticide manual 15th edition" nos permitimos mostrarle a su Despacho que dicho compuesto no tiene nada que ver con herbicidas como lo conoce una persona versada en el arte y que al parecer desconoce el examinador. En consecuencia un experto en el arte no esperaría combinar un herbicida protector ciprosulfamida (ver "e-pesticide manual 15th edition") o compuestos relacionados de su clase química (n-fenilsulfonil (het) arilamidas) con reguladores de crecimiento de plantas. En consecuencia, la argumentación del examinador carece de sentido pues D1 o D2 donde se enseña la combinación de tidiázurón con otros compuestos no indica la combinación de tidiázurón con herbicidas lo que invalida su análisis y su examen.

Por otra parte, sorprende la afirmación del Examinador que indica que no es posible identificar efectos inesperados pues no se indica que la presencia de ciprosulfamida da a la mezcla alguna ventaja técnica sobre D1 o D2. La solicitud presenta en sus ejemplos especialmente, demostraciones fehacientes de cómo el efecto sinérgico es palpable y cuantificable. Allí se demuestra que el resultado sinérgico de la invención tiene un doble efecto toda vez que incrementa la actividad y posee una rápida acción.

2.5.4. La presente solicitud sí tiene nivel inventivo

Nótese que en el nuevo capítulo reivindicatorio que presentamos hacemos especial énfasis en la mezcla de tiadiázurón y ciprosulfamida en proporciones muy específicas. Como ya se ha dicho, la descripción ilustra cómo la consecuencia sinérgica se centra en un doble efecto toda vez que incrementa la actividad y posee una rápida acción. En particular se dice en la solicitud que en cultivos de algodón dicha combinación se recomienda para uso como defoliante dada su rápida acción y su actividad incremental además de las bajas tasas de aplicación (ver especialmente tablas).

Cómo ya se ha dicho, D1 a D3 no pueden ser el estado del arte cercano en la medida que se centran en herbicidas y donde el Tidiázurón no es un herbicida sino un regulador de crecimiento de plantas por lo que una persona versada en la materia no puede considerar D1 o D2 y combinarlo con D3 para obtener lo aquí relacionado. Nótese que ninguno de los documentos D1, D2 o D3 ni enseña ni tan siquiera sugiere el efecto de rápida acción que señalamos en este documento.

Además de lo anterior, queremos resaltar que las proporciones que indicamos no se pueden sugerir de ninguna forma del arte previo.

3. Modificación de la solicitud en trámite

Con el objeto de subsanar las objeciones presentadas por su Despacho y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, donde se establece que la modificación de una solicitud es posible en cualquier momento del trámite mientras no implique una ampliación de la solicitud inicial, me permito presentar nuevos capítulos descriptivo y reivindicatorio corregidos.

Las modificaciones realizadas fueron las siguientes:

- 3.1. Nuevo capítulo descriptivo donde se mantienen solamente dos reivindicaciones originales, la número 1 y la número 7, y donde las reivindicaciones restantes han sido eliminadas
- 3.2. Las reivindicaciones originales 1 y 7 han sido restringidas de forma tal que las composiciones incluyen los compuestos tiadiazurón y ciprosulfamida.
- 3.3. Se han incorporado la relación de las proporciones de los compuestos tiadiazurón y ciprosulfamida. Lo anterior tiene sustento en la página 6 de la descripción original.

4. Concesión de solicitudes equivalentes

Si bien entendemos y aceptamos que cada país es autónomo en la concesión o negación de los privilegios de patente, queremos resaltar el hecho que el análisis de los requisitos para el otorgamiento de esos derechos es prácticamente universal. Por lo mismo, también

queremos llamar la atención de este Despacho en relación a que esta misma solicitud de patente ha sido concedida en Europa, Estados Unidos, Sudáfrica, Egipto y en la OAPI.

5. ANEXOS

- Nuevo pliego descriptivo
- Nuevo pliego reivindicatorio conformado por 2 reivindicaciones
- Formulario para modificaciones.
- Copia del documento The e-Pesticide Manual (15th edn) "New cyprosulfamide"
- Copia del documento The e-Pesticide Manual (15th edn) "Thidiazuron"

Señor Director,


LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ

C.C. 35.456.344 de Usaquén

T.P.A. No. 23.555

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	Espacio reservado para el adhesivo de radicación
---	--

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
MODIFICACIONES Y/O CORRECCIONES

1. Identificación del Trámite

☐ Error material

☒ Modificación a una Solicitud en trámite

☒ Patente de Invención

☐ Patente de Modelo de Utilidad

☐ Registro de Diseño Industrial

☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural

☐

Persona Jurídica

☒

BAYER CROPSCIENCE AG

Nombre o denominación / Nombre o razón social completa

Nombre representante legal

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra ☐

Documento de identificación: ☐ C.C. ☐ C.E. ☐ NIT ☐ Otro Número _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección y domicilio del titular	Ciudad
Alemania	Alfred-Nobel-Strasse 50	40789 Monheim
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
clientes@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Apellidos y Nombre
De Páez Luz Clemencia

Documento de identificación
C.C. 35.456.344

Tarjeta profesional
T.P.A. 23.555

Dirección y domicilio	Ciudad	
Carrera 4ª No. 72 –35	Bogotá	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
cavelier@cavelier.com	2 11 86 50	3 47 36 11

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

4. Datos del trámite

Corrección:

Expediente No 09.118.659

Aparece

Debe ser

Modificación:**Modificación al capítulo reivindicatorio.**

Presento nuevo capítulo reivindicatorio compuesto por 2 reivindicaciones y pido respetuosamente que el examen de patentabilidad sea realizado sobre estas nuevas reivindicaciones presentadas. Respetuosamente manifiesto que a pesar de eliminar materia del pliego reivindicatorio originalmente presentado, mi representada no renuncia a la protección que pueda obtener sobre dicha materia y se reserva el derecho de presentar una solicitud divisional que la contenga durante el trámite de la presente solicitud, beneficiándose de la fecha de prioridad inicialmente reivindicada.

**Modificación al capítulo descriptivo.**

Presento nuevo capítulo descriptivo, el cual solicito que sea tenido en cuenta al realizar del examen de patentabilidad

**Modificación al resumen.****Modificación a los dibujos.****Modificación al solicitante.**

Solicito respetuosamente a su despacho tener en cuenta que el nuevo título de esta solicitud de patente ha quedado como sigue: **“UNA MEZCLA QUE COMPRENDE TIADIAZURÓN Y CIPROSULFAMIDA “**

5. Anexos

Poder, si fuere el caso.



Documento que contiene las modificaciones o correcciones.



Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético.

6. Firma	
Nombre y apellidos	Firma
LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	<i>Lu2 Clemencia SoePez</i>
C.C. 35.456.344 DE Usaquén	Tarjeta Profesional 23.555

RBL\VCBWPC13549\ID-230061

UNA MEZCLA QUE COMPRENDE TIADIAZURÓN Y CIPROSULFAMIDA

La invención se relaciona con el campo de los exfoliantes, en particular mezclas que contienen tiadiazurón, y su uso en cultivos de algodón.

El tiadiazurón se ha conocido durante algún tiempo como un exfoliante, en particular para uso en cultivos de algodón (ver, por ejemplo, "The Pesticide Manual"; 14 edición, Bristol Crop Protection Council; Hampshire 2006).

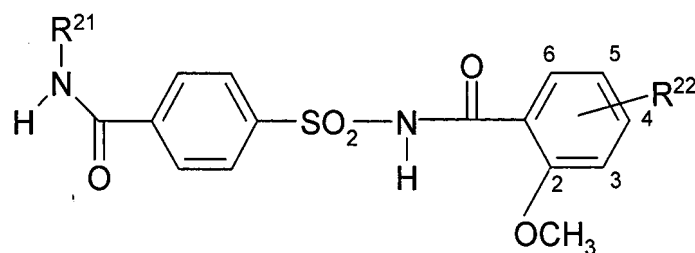
También se ha descrito el uso de tiadiazurón en mezclas, ver, por ejemplo, DE 26 46 712 A.

Sin embargo, debido a la elevación constante de la demanda económica y ecológica puesta en los exfoliantes modernos, por ejemplo con respecto al efecto, velocidad de aplicación, residuos, toxicidad y fabricación favorable, existe la tarea permanente de desarrollar, por ejemplo al combinar ingredientes activos conocidos, exfoliantes novedosos que ofrecen, por lo menos en algunas áreas, ventajas comparadas con los compuestos conocidos.

De manera sorprendente, se ha encontrado que el tiadiazurón y las mezclas ya utilizadas comercialmente de tiadiazurón y diurón en una mezcla con compuestos del grupo de N-fenilsulfonil(het)arilamidas tienen efectos sinérgicos.

La presente invención de acuerdo con lo anterior proporciona una mezcla que comprende

- (A) tiadiazurón o tiadiazurón y diurón, y
- (B) Uno o más compuestos del grupo de N-fenilsulfonil(het)arilamidas, si es apropiado también en forma de sal, de la Fórmula adelante:



En la que

R^{21} = ciclopropilo y R^{22} =H

R^{21} = ciclopropilo y R^{22} =5-Cl

R^{21} = etilo y R^{22} =H

R^{21} = isopropilo y R^{22} =5-Cl o

R^{21} = isopropilo y R^{22} =H.

Las mezclas de acuerdo con la invención son adecuadas en particular para uso como exfoliantes en cultivos de algodón, debido, por ejemplo, a la rápida acción y/o actividad incrementada de velocidades de aplicación más bajas.

Para los propósitos de la invención, el término exfoliante es sinónimo con "deseccante" y también abarca el efecto que regula el crecimiento conocido de tiadiazurón y mezclas que comprenden tiadiazurón.

13

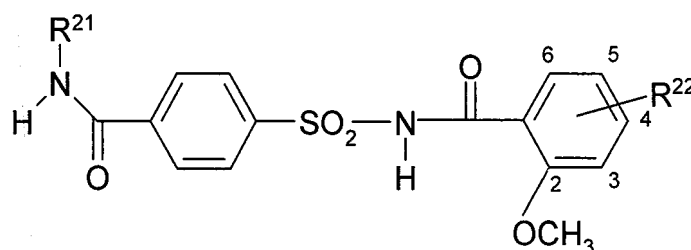
Los ingredientes activos (i.a.) tiadiazurón y diurón utilizados para el componente (A) se conoce y están disponibles comercialmente: tiadiazurón y diurón de Bayer CropScience, Alemania.

Mezclas de tiadiazurón y diurón están disponibles comercialmente, por ejemplo, bajo el nombre Dropp Ultra® (Bayer CropScience). Se describen tales mezclas, por ejemplo, en US 4,613,354 A.

Los ingredientes activos, con especificaciones alrededor de su preparación, mezcla y manipulación, se describen, por ejemplo en "The Pesticide Manual", 14 edición (ver anterior), y se listan bajo los siguientes números de ingreso: Tiadiazurón 814, Diurón 291. El componente preferido (A) es tiadiazurón.

Los compuestos que se pueden utilizar para el componente (A) del grupo de N-fenilsulfonil(het)arilamidas pertenece a una clase química que se describe, por ejemplo, en la EP 365484 A1, WO 97/45016 A1, WO 99/16744 A1 o US 6,251,827 B1, y de la que, por ejemplo, se conocen algunos representativos por su acción como protectores. Un representativo de esta clase química es, por ejemplo, el compuesto activo ciprosulfamida (Bayer CropScience).

El grupo de las N-fenilsulfonil(het)arilamidas se caracteriza por, si es apropiado también en forma de sal, compuestos de la Fórmula adelante:



En la que

R^{21} = ciclopropilo y R^{22} = H (4-ciclopropilaminocarbonil-N-(2-metoxibenzoil)-bencenosulfonamida; cipro sulfamida),

R^{21} = ciclopropilo y R^{22} = 5-Cl

R^{21} = etilo y R^{22} = H

R^{21} = isopropilo y R^{22} = 5-Cl o

R^{21} = isopropilo y R^{22} = H (4-ciclopropilaminocarbonil-N-(2-metoxibenzoil)-bencenosulfonamida).

La forma de sal significa que el compuesto en cuestión, depende que esté presente su acidez y basicidad, por ejemplo después de la acción de una base o un ácido, en la forma de la sal correspondiente. Ejemplos de sales son aquellas que tienen ión de metal alcalinotérreo, ión de metal alcali y amonio como catión. Se da preferencia a las sales de sodio y potasio. Otros ejemplos de sales son clorhidratos.

Se prefieren como el componente (B) los compuestos 4-ciclopropilaminocarbonil-N-(2-metoxibenzoil)-bencenosulfonamida (cipro sulfamida) y 4-isopropilaminocarbonil-N-(2-metoxibenzoil)-bencenosulfonamida; se prefiere particularmente como el componente (B) cipro sulfamida.

En principio, la aplicación también se puede llevar a cabo mediante aplicaciones sucesivas de los ingredientes activos individuales (componentes), cuando se pueda determinar el intervalo posible en ensayos preliminares rutinarios simples, se da preferencia a la aplicación conjunta. Si es apropiado, los ingredientes

activos también se pueden utilizar en combinación con otros agentes de protección de cultivo.

Mientras tenga el mismo efecto, la velocidad de aplicación de un ingrediente activo individual en la combinación se reduce considerablemente comparada con la velocidad de aplicación del ingrediente activo individual en cuestión cuando se utiliza en sí mismo. La elección óptima de la relación en peso y las velocidades de aplicación depende, por ejemplo, de la etapa de desarrollo, de los factores ambientales y las condiciones climáticas o del tipo de los agentes protectores de cultivo activos que se emplean adicionalmente, si es apropiado, y que se pueden determinar rápidamente por la persona experta en la técnica en ensayos de rutina simples.

La velocidad de aplicación del componente (A) está generalmente en el rango de 1 a 500 g del ingrediente activo (=i.a.)/ha.

Para el tiadiazurón, este está preferiblemente en el rango de 10 a 500 g de i.a./ha, particularmente preferiblemente de 10 a 300 g de i.a./ha, muy particularmente preferiblemente de 20 a 200 g i.a./ha, especialmente preferiblemente de 20 a 150 g de i.a./ha.

En el caso de mezclas de tiadiazurón/diurón (típicamente en una relación en peso de 2:1), la velocidad de aplicación está en el rango general de 10 a 500 g de i.a./ha, preferiblemente de 15 a 300 g i.a./ha, particularmente preferiblemente en el rango de 20 a 200 g de i.a./ha, particularmente preferiblemente de 30 a 200 de i.a./ha, en particular de 30 a 150 g de i.a./ha.

Las velocidades de aplicación para el componente (B) pueden variar dentro de amplios límites, que dependen del ingrediente activo, y ellos están generalmente entre 0.1 y 5000 g de i.a./ha.

Las velocidades de aplicación preferidas para el componente (B) son, por ejemplo (ciprosulfamida); de 1 a 1000 g de i.a./ha, particularmente preferiblemente de 5 a 500 g de i.a./ha.

Las relaciones en peso de los componentes (A):(B) pueden variar dentro de amplios límites; en general ellos están entre 1:100 y 100:1.

La relación aproximada de (A):(B) es preferiblemente 1:0.1-10, particularmente preferiblemente 1:0.5-2.

La invención también proporciona exfoliantes, es decir composiciones para efectuar abscisión de hoja, cuyos exfoliantes comprenden combinaciones de los ingredientes activos (A) y (B) y los auxiliares de formulación acostumbrados (C).

Las combinaciones de acuerdo con la invención y sus ingredientes activos individuales se pueden formular en varias formas, dependiendo de la prevalencia biológica y/o los parámetros fisicoquímicos. Ejemplos de posibles formulaciones adecuadas son: polvos humectantes (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsificantes (EC), emulsiones (EW), tal como emulsiones aceite en agua y agua en aceite, soluciones pulverizadas, concentrados de suspensión (SC), dispersiones con base en agua o aceite, soluciones que son miscibles con aceites, suspensiones en cápsula (CS), polvos (DP), gránulos (GR) en la forma de microgránulos, gránulos para rociado,

gránulos recubiertos y de adsorción, gránulos dispersibles en agua (WG), gránulos solubles en agua (SG), formulaciones ULV (volumen ultra bajo), microcápsulas y WSB (bolsas solubles en agua).

Los tipos individuales de formulación se conocen en principio y se describe, por ejemplo, en: Winnacker-Küchler, "Chemicals Technologie" [Chemical Technology], volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, cuarta Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, tercera Ed. 1979. G. Goodwin Ltd. Londres.

Los auxiliares de formulación requeridos, tal como materiales inertes, tensoactivos, disolventes, y otros aditivos también se conocen y se describen, por ejemplo, en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", segunda ed. Darland Books, Caldwell N.J., H.v., Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; segunda Ed., J, Wiley & Sons, N.Y.; C. Mariden, "Solvents Guide", segunda Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Word, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Surface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, cuarta Ed. 1986.

Con base en estas formulaciones, también es posible preparar combinaciones con otros agentes de protección de cultivo, tal como, por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores, otros reguladores de crecimiento y/o fertilizantes, por ejemplo en la forma de una mezcla lista o una mezcla de tanque.

Adicionalmente, dependiendo de la aplicación pretendida, también puede ser ventajoso agregar, separadamente, auxiliares de formulación adicionales (C) y/o aditivos adicionales, tal como, por ejemplo, agentes humectantes no iónicos, por ejemplo Agrotin® (Isotridecanol etoxilado con un promedio de 8 unidades de EO), de Bayer CropScience.

Los polvos humectantes son preparaciones que son uniformemente dispersibles en agua y que, a pesar del ingrediente activo, también comprenden tensoactivos iónicos y/o no iónicos (agentes humectantes, dispersantes), por ejemplo alquilfenoles polietoxilados, alcoholes grasos polietoxilados, aminas grasas polietoxiladas, sulfatos poliglicoléter de alcohol graso, alcanosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, lignosulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftaleno-sulfonato de sodio o oleilmetilaurinato de sodio, en adición a un diluyente o sustancia inerte. Para preparar los polvos humectantes, los ingredientes activos se muelen finamente, por ejemplo en equipo de costumbre tal como molinos de martillos, molinos sopladores y molinos de chorros de aire, y mezcla posteriormente o simultáneamente con los auxiliares de formulación.

Los concentrados emulsificables se preparan al disolver los ingredientes activos en un disolvente orgánico, por ejemplo butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno, o aromáticos o hidrocarburos de alta ebullición, o mezclas de los disolventes orgánicos con la adición de uno o más tensoactivos iónicos y/o no iónicos (emulsificantes). Ejemplos de emulsificantes que se pueden utilizar son: sales de calcio o ácido alquilarilsulfónico tal como dodecilbencenosulfonato de calcio, o emulsificantes no iónicos tal como poliglicolésteres de ácido graso,

poliglicoléteres alquilarilo, poliglicoléteres de alcohol graso, condensados de óxido de etileno/óxido de propileno, poliéteres alquilo, ésteres sorbitan, por ejemplo ésteres de ácido graso sorbitán o ésteres de sorbitán polioxietileno, por ejemplo ésteres de ácido graso sorbitán polioxietileno.

Se obtienen polvos al moler los ingredientes activos con sustancias sólidas finamente divididas, por ejemplo talco, arcillas naturales tal como caolín, bentonita y pirofilita, o tierra diatomácea. Los concentrados de suspensión pueden ser con base en agua o aceite. Ellos se pueden preparar, por ejemplo, mediante molido húmedo utilizando molinos de glóbulo disponibles comercialmente con o sin la adición de tensoactivos como ya se mencionaron anteriormente, por ejemplo en el caso de otros tipos de formulación.

Se pueden preparar emulsiones, por ejemplo emulsiones de agua en aceite (EW), por ejemplo, por medio de agitadores, molinos coloides y/o mezcladores estáticos utilizando disolventes orgánicos acuosos, si es apropiado, tensoactivos como ya se mencionó anteriormente, por ejemplo en el caso de otros tipos de formulación.

Se pueden preparar gránulos mediante rociar los ingredientes activos en material inerte granulado adsorbtivo o al aplicar concentrados de ingrediente activo a la superficie de los portadores tal como arena, caolinitas, o de material inerte granulado por medio de ligadores, por ejemplo, alcohol polivinílico, poliacrilato de sodio o aceites minerales. Los ingredientes activos también se pueden granular en la forma que es convencional para la producción de gránulos fertilizantes, si se desea en una mezcla con fertilizantes.

Los gránulos dispersibles en agua se preparan generalmente mediante los métodos acostumbrados tal como secado por rociado, granulación de lecho fluidizado, granulación de disco, mezcla con mezcladores de alta velocidad y extrusión con material inerte sólido.

En general, las mezclas de acuerdo con la invención comprenden 0.1 a 99% en peso, en particular 0.1 a 95% en peso, de los ingredientes activos de los componentes (A) y/o (B).

La concentración de ingrediente activo en polvos humectantes es, por ejemplo, aproximadamente 10 a 90% en peso, el resto a 100% en peso que se componen de los componentes de formulación acostumbrados. En el caso de concentrados emulsificables, la concentración de ingrediente activo puede ser una cantidad de aproximadamente 1 a 90% en peso. Las formulaciones en la forma de polvos comprenden, por ejemplo, 1 a 80% en peso del ingrediente activo, en muchos casos 5 a 60% en peso del ingrediente activo, las soluciones rociables comprende, por ejemplo, 0.05 a 80% en peso, en muchos casos 2 a 50% en peso, del ingrediente activo. El contenido de ingrediente activo de gránulos dispersibles en agua depende en parte de si el compuesto activo está en forma de sólido o líquido y en que se utilizan los auxiliares de granulación, rellenos y similares. El contenido de ingrediente activo de las cantidades de gránulos dispersibles en agua, por ejemplo, entre 1 y 95% en peso, en muchos casos entre 10 y 80% en peso.

Adicionalmente, las formulaciones mencionadas anteriormente de los ingredientes activos comprenden, si es apropiado, adhesivos, agentes humectantes, dispersantes, emulsificantes, penetrantes, conservantes, agentes anticongelantes, disolventes, rellenos, portadores, colorantes, antiespumantes, inhibidores de

evaporación y reguladores de la viscosidad y pH, que son acostumbrados en cada caso.

Los componentes que también se pueden utilizar en combinación con los ingredientes activos de acuerdo con la invención en formulaciones mezcladas o en una mezcla de tanque, por ejemplo, los ingredientes activos conocidos como se describen, por ejemplo, en Leed Research 26, 441-445 (1986), o "The Pesticide Manual", 14 edición, (ver anterior), y la literatura citada allí.

Para uso, las formulaciones, que están disponibles comercialmente, se, si es apropiado, diluyen en la forma acostumbrada, por ejemplo utilizando agua en el caso de polvos humectantes, concentrados emulsificantes, dispersiones y gránulos dispersibles en agua, y luego se aplican a las plantas. Esto incluye variantes de aplicación específicas acostumbradas en cultivos de algodón, por ejemplo la aplicación mediante aviones. Las preparaciones en la forma de polvos, gránulos para aplicación a la tierra o por difusión y también soluciones rociables no diluyen convencionalmente cualquier adición con otras sustancias inertes antes de uso.

La invención también proporciona el uso de componentes de las composiciones o mezclas de acuerdo con la invención como exfoliantes, es decir para efectuar abscisión de la hoja en las plantas, preferiblemente en cultivos adecuados de plantas útiles, tal como algodón, girasoles o papas. Se da particular preferencia al uso como exfoliante en cultivos de algodón.

La invención también proporciona un método para desfoliar una planta, preferiblemente una planta útil, particularmente preferiblemente una planta de

algodón, en donde la planta se trata con los componentes de una mezcla de acuerdo con la invención o una composición de acuerdo con la invención.

Las mezclas o composiciones y los métodos, por supuesto, también se pueden emplear para tratar plantas modificadas genéticamente (transgénicas), preferiblemente plantas útiles, particularmente preferiblemente algodón, en donde tales plantas contienen, por ejemplo, uno o más genes externos con el fin de obtener resistencia contra insecticidas y/o herbicidas.

La invención se ilustra en más detalle mediante los ejemplos, sin estar limitados por esto.

Ejemplos

1. Preparación de licores rociables.

Se carga inicialmente una velocidad de aplicación de agua de 300 l/ha. Los componentes herbicida y adyuvante luego se agregan con agitación en las velocidades de aplicación y en la forma mencionada en la tabla 1, de tal manera que se forma un licor rociable homogéneo. Allí, se emplean los ingredientes activos como concentrados de suspensión. El adyuvante utilizado es Agrotin® (Isotridecanol etoxilado con un promedio de 8 unidades de EO) (Bayer CropScience).

2. Pruebas biológicas

2.1 Método de prueba

Significados de las abreviaturas utilizadas adelante:

g de i.a./ha=	gramo de ingrediente activo/hectárea
l/ha=	litro/hectárea
TDZ=	tiadiazurón

Las semillas de algodón del cultivo “Linda” se siembran a una profundidad de 1 cm y se cultivan en una cámara climatizada (16 h de luz, temperatura durante el día: 26° C, en la noche: 20° C) hasta que ellas alcanzan la etapa de 8-10 hojas.

Las plantas se tratan en una pista para rociado de laboratorio con licores de rociado de tiadiazurón y tiadiazurón con patrones de combinación. La velocidad de aplicación de agua para la aplicación de rocío es 300 l/ha. Después de tratamiento, las plantas se regresan a la cámara aclimatizada.

1, 2 y 4 semanas después de la aplicación, se evalúa el efecto de goteo de la hoja de acuerdo con una escala de 0 a 100%.

0%=	Efecto no notable comparado con plantas no tratadas
100%=	todas las hojas tiene gotas.

2.2 Resultados de las combinaciones de (A) TDZ con (B) ciprosulfamida

Las evaluaciones 2 semanas después de aplicación dan los resultados listados en la tabla 1 que muestran claramente el efecto sinérgico para el efecto de gota en la hoja.

Tabla 1

Componentes	Dosis [g de i.a./ha]	Gota de hoja [%] 2 semanas después de aplicación
No tratado		6
TDZ*	35	67
Ciprosulfamida*	100	7
Ciprosulfamida*	200	0
TDZ+Ciprosulfamida*	35+100	87
TDZ+Ciprosulfamida*	35+200	79

* 1 l de Agrotin (isotridecanol etoxilado con 8 unidades de EO) se agrega a todos los licores de rocío

2.3 Resultados para las combinaciones de (A) TDZ con (B) ciprosulfamida durante el curso de tiempo

Las evaluaciones dan los resultados listados en la tabla 2 que muestra claramente el efecto sinérgico para el efecto de gota de hoja, que se incrementa continuamente durante el tiempo de 1 a 4 semanas después de aplicación.

Componentes	Dosis [g de i.a./ha]	Gota de hoja [%] 1 semana después de aplicación	Gota de hoja [%] 2 semanas después de aplicación	Gota de hoja [%] 4 semanas después de aplicación
No tratado		0	0	0
TDZ*	25	37	56	63
Ciprosulfamida	200	0	0	0
TDZ+Ciprosulfamida	25+200	46	79	92

* 0.2% en peso de Agrotin (isotridecanol etoxilado con 8 unidades de EO) se agrega a todos los licores de rocío

REIVINDICACIONES

1. Una mezcla, CARACTERIZADA PORQUE comprende

(A) tiadiazurón, y

(B) cipro sulfamida.

Y donde las proporciones en peso entre los componentes (A):(B) están entre 1:0.5 hasta 1:10

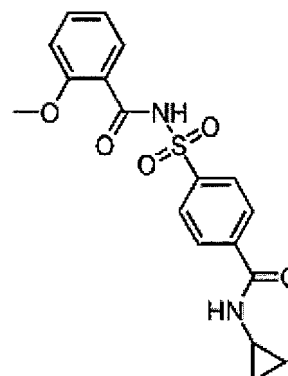
2. Un exfoliante, que comprende

(A) tiadiazurón, y

(B) cipro sulfamida y

(C) uno o más auxiliares de formulación.

Y donde las proporciones en peso entre los componentes (A):(B) están entre 1:0.5 hasta 1:10

NEW cyprosulfamide**Herbicide safener****NOMENCLATURE**

Common name cyprosulfamide (BSI, E-ISO, (m) F-ISO) **IUPAC name** *N*-[[4-(cyclopropylcarbamoyl)phenylsulfonyl]-*o*-anisamide

Chemical Abstracts name *N*-[[4-[(cyclopropylamino)carbonyl]phenyl]sulfonyl]-2-methoxybenzamide

CAS RN [221667–31–8] **Development codes** AE 0001789 **Smiles code** O=C(NS(=O)(=O)C1=CC=C(C=C1)C(=O)NC2CC2)C3=CC=CC=C3OC

PHYSICAL CHEMISTRY

Mol. wt. 374.4 **M.f.** C₁₈H₁₈N₂O₅S

COMMERCIALISATION

Manufacturers Bayer CropScience

PRODUCTS

mixtures Corvus (+isoxaflutole +thiencarbazone-methyl) (Bayer CropScience) **mixtures** Adengo (+isoxaflutole +thiencarbazone-methyl) (Bayer CropScience)

842 thidiazuron**Plant growth regulator**

phenylurea

**NOMENCLATURE**

Common name thidiazuron (BSI, E-ISO, (m) F-ISO, ANSI) **IUPAC name** 1-phenyl-3-(1,2,3-thiadiazol-5-yl) urea

Chemical Abstracts name *N*-phenyl-*N'*-1,2,3-thiadiazol-5-ylurea **CAS RN** [51707-55-2] **Development codes** SN 49 537 (Schering) **Smiles code** O=C(Nc1cnns1)Nc2ccccc2

PHYSICAL CHEMISTRY

Mol. wt. 220.2 **M.f.** C₉H₈N₄OS **Form** Colourless, odourless crystals. **M.p.** 210.5–212.5 °C (decomp.) **V.p.** 4 × 10⁻⁶ mPa (25 °C) (Langmuir method) **K_{ow}** logP = 1.77 (pH 7.3) **Henry** 2.84 × 10⁻⁸ Pa m³ mol⁻¹ (calc.)

Solubility In water 31 mg/l (pH 7, 25 °C). In hexane 0.002, methanol 4.20, dichloromethane 0.003, toluene 0.400, acetone 6.67, ethyl acetate 1.1 (all in g/l, 20 °C). **Stability** Rapidly converted to photoisomer, 1-phenyl-3-(1,2,5-thiadiazol-3-yl)urea, in presence of light (λ >290 nm). Hydrolytically stable at room temperature from pH 5–9. No decomposition in accelerated storage stability study (14 d, 54 °C). **pKa** 8.86

COMMERCIALISATION

History Plant growth regulator reported by F. Arndt *et al.* (*Plant Physiol.*, 1976, **57**, Supplement, p. 99). Introduced by Schering AG (now Bayer AG) in 1976. **Patents** DE 2506690; DE 2214632 **Manufacturers** Bayer CropScience; Anpon; Huifeng Agrochemical; AGROFINA; Jiangsu RuidongJIE

APPLICATIONS

Biochemistry Cytokinin activity. **Mode of action** Plant growth regulator, absorbed by the leaves, which stimulates formation of an abscission layer between the plant stem and the leaf petioles, causing the dropping of entire green leaves. **Uses** Used for defoliation of cotton, in order to facilitate harvesting; applied at 0.21 kg/ha per season. **Formulation types** EC; SC; WP.

PRODUCTS

Selected products Abridor (AGROFINA); Dropp (Bayer CropScience) **Other products** Daze (Winfield Solutions); Freefall (DuPont, ;Nufarm Americas); Reveal (Nufarm Ltd); Revent (Bayer CropScience); Separate (Feinchemie Schwebda); Takedown (Loveland, ;UAP) **mixtures** Adios (+diuron) (Arysta LifeScience N. America); Dropp Ultra (+diuron) (Bayer CropScience); Ginstar (+diuron) (Bayer CropScience); Redi-Pik (+diuron) (Makhteshim-Agan) **mixtures** Leafless* (+dimethipin) (Chemtura)

ANALYSIS

Product analysis by hplc. **Residues** determined by hplc/uv or by glc with ECD of a derivative (*Resid. Anal. Methods*). See also *Pestic. Anal. Man.*, II, 180.403, 186.5600. Details available from Bayer CropScience.

ENVIRONMENTAL FATE

Animals In rats and goats, metabolism involves hydroxylation of the phenyl group, followed by formation of water-soluble conjugates. Following oral administration, the compound is excreted in the urine and faeces within 96 hours. **Plants** Only small amounts of residue (normally <0.1 mg/kg) are likely in cottonseed. **Soli/Environment** Strongly adsorbed by soil. DT₅₀ in soil c. 26–144 d (aerobic), 28 d (anaerobic). Essential soil microbial processes are only temporarily influenced, if at all.

TOXICOLOGICAL & ENVIRONMENTAL REVIEWS**91/414/EC Annex 1 status** Not included, 2008/296/EC.**MAMMALIAN TOXICOLOGY**

Oral Acute oral LD₅₀ for mice >5000, rats >4000 mg/kg. **Skin and eye** Acute percutaneous LD₅₀ for rats >1000, rabbits >4000 mg/kg. Mild eye irritant; non-irritating to skin (rabbits). No skin sensitisation (guinea pigs). **Inhalation** LC₅₀ (4 h) for rats >2.3 mg/l air. **NOEL** **NOAEL** (1 y) for dogs 3.93 mg/kg b.w.; (2 y) for rats 8 mg/kg b.w. No significant effects observed in a 2 y carcinogenicity study in mice and a 3-generation reproduction study in rats. **ADI** (EPA) cRfD 0.0393 mg/kg b.w. [2005]. **Other** Acute i.p. LD₅₀ for rats 4200 mg/kg. Non-mutagenic. **Toxicity class** WHO (a.i.) U **EPA (formulation)** III

ECOTOXICOLOGY

Birds Acute oral LD₅₀ for Japanese quail >3160 mg/kg. Dietary LC₅₀ (8 d) for bobwhite quail and mallard ducks >5000 mg/kg diet. **Fish** LC₅₀ (96 h) for rainbow trout >19, bluegill sunfish >32 mg/l. **Daphnia** LC₅₀ (48 h) >10 mg/l. **Bees** Non-toxic to honeybees. **Worms** LC₅₀ (14 d) for earthworms >1400 mg/kg.

Copyright ©2011 BCPC (British Crop Production Council)
Database Right 2011 BCPC (British Crop Production Council)