



No. 11-040012-00000-0000

Fecha: 2011-03-31 17:11:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folia: 49

SUPERINTENDENCIA DE IN



DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL
División de Nuevas Creaciones



SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

ENTRADA FASE NACIONAL

21. EXPEDIENTE No.

11-40012

54. TITULO

COMPUESTOS DE URACILO Y HERBICIDAS QUE LOS COMPRENDEN

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY Y DONGBU HITEK CO., LTD

DOMICILIO

DAEJEON, COREA Y SEÚL, COREA, RESPECTIVAMENTE

74. APODERADO

JUAN PABLO CADENA SARMIENTO

22. BOGOTÁ, D.C.

Foda, C
02-05-2011



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-040012-00000-0000

ción

Fecha: 2011-03-31 17:11:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 49

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

SOLICITUD DE:



Patente de Invención.



Patente de Modelo de Utilidad.



Capítulo I.



Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **KOREA RESEARCH INSTITUTE OF
CHEMICAL TECHNOLOGY y DONGBU HITEK CO.,
LTD.**

Dirección: 100 Jang-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-343,
Corea; 891-10 Daechi 4(sa)-dong, Gangnam-gu, Seúl 135-
523, Corea.

Nacionalidad o Domicilio: Corea.

Lugar de Constitución: Corea.

Teléfono:

Fax:

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____
Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO
(74)

Nombre: **JUAN PABLO CADENA SARMIENTO**

Dirección: Calle 70 A #4-41, Bogotá, Colombia.

Teléfono: 744-2200

Fax: 742-2200

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual _____
Número 80.410.337 TP 57492

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de
Propiedad Industrial, sirvase indicar el numero de radicación (del poder). _____

4

INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: **KO, Young Kwan; CHUNG, Kun Hoe; RYU, Jae Wook; WOO, Jae Chun; KOO, Dong Wan;
KIM, Dae Whang; KIM, Tae Joon; CHOI, In Young; KIM, Young Kwon; OH, Tae Hyun; CHOI, Jun
Hyuk; SEOK, Mee Young; KIM, Kyung Sung; CHUNG, Bong Jin.**

Dirección: 102-1702, Hanbit Apt., Eoeun-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-755, Corea; 205-403, Banseok maeul Apt., Jijok-
dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-772, Corea; 102-305, Hanbit Apt., Eoeun-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-755, Corea; 110-608,
Kyungnam Apt., Doma 2-dong, Seo-gu, Daejeon 302-763, Corea; 119-1405, Hanbit Apt., Eoeun-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-
755, Corea; 510-301, Yeolmae Maeul 5-danji, Jijok-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-770, Corea; 305-302, Expo Apt., Jeonmin-
dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-761, Corea; 104-1102, Chonggu Apt., Jeonmin-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-729, Corea; 102-
802, Sejong Apt., Jeonmin-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-728, Corea; 103-106, Sejong Apt., Jeonmin-dong, Yuseong-gu,
Daejeon 305-728, Corea; 111-301, Sejong Apt., Jeonmin-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-728, Corea; 111-301, Sejong
Apt. Jeonmin-dong, Yuseong-gu, Daejeon 305-728, Corea; 2-402, Hanshin Apt., Jammwon-dong, Seocho-gu, Seúl 137-796, Corea;
1102-804, Samsung Raemian Eco Palace Apt., Jungang-dong, Gwacheon-si, Gyeonggi-do 417-737, Corea; respectivamente.

Nacionalidad o Domicilio: Corea

5 PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/KR2009/005471Fecha 24.09.2009Publicación Internacional No. WO 2010/038953 A3Fecha 08.04.2010

6 Título (54):

COMPUESTOS DE URACILO Y HERBICIDAS QUE LOS COMPRENDEN

7 Clasificación Internacional (51):

8 Prioridad

SI ☒NO ☐

(33) Pais de Origen

KR

(32) Fecha

02.10.2008

(31) Número de Solicitud

10-2008-0097108

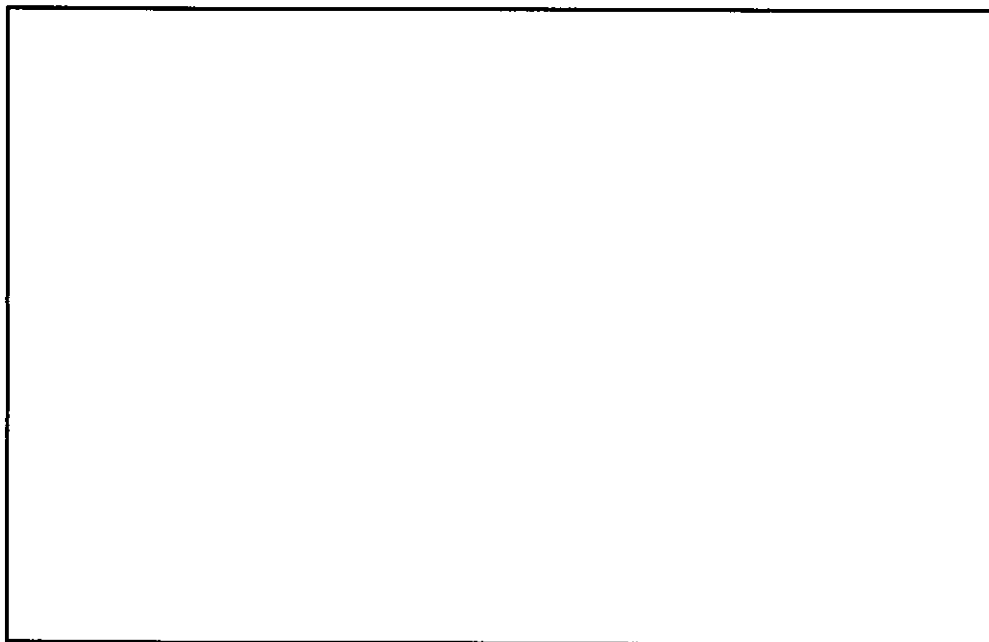
9 Comprobante de pago No. 11-14407; 11-5664; 10-102.879; 10-2197Fecha 31-03-2011

10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud. \$ 571.000
- ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal de la persona jurídica peticionaria, en cuanto no esté inscrita en alguna Cámara de Comercio Colombiana.
- ☐ Poderes, si fuere el caso. Fotocopia autenticada.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. Fotocopia autenticada.
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al español (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción de examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☐ Arte final 12x12.
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional bajo el Art. 19.
- ☒ Otros: - Comprobante(s) de pago de la tasa por concepto de reivindicaciones adicionales \$ 81.000 (3 *\$27.000).

11 FIGURA CARACTERÍSTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: JUAN PABLO CADENA SARMIENTOFIRMA: *Juan Pablo Cadena*

C.C. 80.410.337 de Usaquén TP 57492 del C.S.J.

116.469

3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

- / -

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 0014407

Bogotá D.C., Febrero 16 de 2011 - 16:51:23

RECIBIDO DE : BRIGARD & CASTRO S.A.

NI 860.047.372

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	391765872	16/02/2011	32.257.100.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	7 TRAMITES DE SOL. DE DISENOS INDUSTRIALES	571.000.00	571.000.00
				\$571.000.00

SON: **QUINIENTOS SETENTA Y UN MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-040012- -00000-0000

Fecha: 2011-03-31 17:11:47

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Tra. 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act. 411 PRESENTACION

Folios: 49

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mai: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Linea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Febrero 16 de 2011 - 16:51:28

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -



RECIBO DE CAJA

No. 11 - 005664

Bogotá D.C., Enero 21 de 2011 - 07:50:30

RECIBIDO DE : BRIGARD & CASTRO S.A. NI 860.047.372

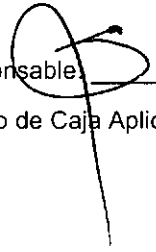
*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	411745946	20/01/2011	26.679.500.00

*** Conceptos Pagados ***

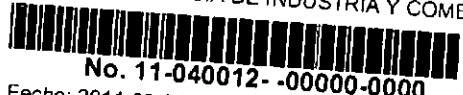
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	54.000.00	54.000.00
				\$54.000.00

SON: **CINCUENTA Y CUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-040012- -00000-0000

Fecha: 2011-03-31 17:11:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 49

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 102,879
FECHA : DICIEMBRE 2 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-040012- -00000-0000

Fecha: 2011-03-31 17:11:47 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eva: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 49

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BRIGARD & CASTRO LYDA	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	382749382	02/12/2010	27,674,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMI
			26,000.00
		TOTAL :	\$ 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

116.469

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 11 - 002197

Bogotá D.C., 12 de 2011 - 16:41:47

RECIBIDO DE : BRIGARD & CASTRO S.A.

NI 860.047.372

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	382749426	11/01/2011	1.138.400.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNIDITARIO	Vr. CONCEPTO
1 50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD INDUSTRIAL	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1.000.00	1.000.00
				\$1.000.00

SON: **MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable:

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-040012-00000-0000

 Fecha: 2011-03-31 17:11:47
 Tra. 11 PATENTE IYII
 Act. 411 PRESENTACION

 Dep. 2020 DIR. NUEVAS CR
 Eve: 378 FASE NACIONAL I
 Folios: 49

(12) 특허협력조약에 의하여 공개된 국제출원

(19) 세계지식재산권기구
국제사무국(43) 국제공개일
2010년 4월 8일 (08.04.2010)

PCT

(10) 국제공개번호
WO 2010/038953 A3(51) 국제특허분류:
C07D 239/54 (2006.01)

(21) 국제출원번호: PCT/KR2009/005471

(22) 국제출원일: 2009년 9월 24일 (24.09.2009)

(25) 출원언어: 한국어

(26) 공개언어: 한국어

(30) 우선권정보:
10-2008-0097108 2008년 10월 2일 (02.10.2008) KR

(71) 출원인 (US 읍(들) 제외한 모든 지정국에 대하여): 한국화학연구원 (KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY) [KR/KR]; 대전 유성구 장동 100, 305-343 Daejeon (KR). 동부하이텍㈜ (DONGBU HITEK CO., LTD.) [KR/KR]; 서울 강남구 대치 4동 891-10, 135-523 Seoul (KR).

(72) 발명자: 겸

(75) 발명자/출원인 (US 에 한하여): 김영관 (KO, Young Kwan) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 어은동 한빛아파트 102-1702, 305-755 Daejeon (KR). 정근희 (CHUNG, Kun Hoe) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 지족동 반석마을아파트 205-403, 305-772 Daejeon (KR). 류재욱 (RYU, Jae Wook) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 어은동 한빛아파트 102-305, 305-755 Daejeon (KR). 우재춘 (WOO, Jae Chun) [KR/KR]; 대전광역시 서구 도마 2동 경남아파트 110-608, 302-763 Daejeon (KR). 구동완 (KOO, Dong Wan) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 어은동 한빛아파트 119-1405, 305-755 Daejeon (KR). 김대황 (KIM, Dae Whang) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 지족동 열매마을 5단지 510-301, 305-770 Daejeon (KR). 김태준 (KIM, Tae Joon) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 엑스포아파트 305-302, 305-761 Daejeon (KR). 최인영 (CHOI, In Young) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 청구아파트 104-1102, 305-729 Daejeon (KR). 김영권 (KIM, Young Kwon) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 세종아파트 102-802, 305-728 Daejeon (KR). 오태현 (OH, Tae Hyun) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 세종아파트 103-106, 305-728 Daejeon (KR). 최준혁 (CHOI, Jun Hyuk) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 세종아파트

트 111-301, 305-728 Daejeon (KR). 석미영 (SEOK, Mee Young) [KR/KR]; 대전광역시 유성구 전민동 세종아파트 111-301, 305-728 Daejeon (KR). 김경성 (KIM, Kyung Sung) [KR/KR]; 서울특별시 서초구 잠원동 한신아파트 2-402, 137-796 Seoul (KR). 정봉진 (CHUNG, Bong Jin) [KR/KR]; 경기도 과천시 중앙동 삼성래미안 에코벨리스아파트 1102-804, 417-737 Gyeonggi-do (KR).

(74) 대리인: 한라특허법인 (HALLA PATENT & LAW FIRM); 서울 강남구 역삼동 826-14KTB 네트워크빌딩 14층, 135-769 Seoul (KR).

(81) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 국내 권리의 보호를 위하여): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 지정국 (별도의 표시가 없는 한, 가능한 모든 종류의 역내 권리의 보호를 위하여): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), 유라시아 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 유럽 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

공개:

- 국제조사보고서와 함께 (조약 제 21 조(3))
- 청구범위 보정 기한 만료 전의 공개이며, 보정서를 접수하는 경우 그에 관하여 별도 공개함 (규칙 48.2(h))

(88) 국제조사보고서 공개일: 2010년 7월 1일

(54) Title: URACIL-BASED COMPOUNDS, AND HERBICIDES COMPRISING SAME

(54) 발명의 명칭: 우라실계 화합물 및 이를 포함하는 제초제

(57) Abstract: The present invention relates to uracil-based compounds, to a method for producing the compounds, and to herbicides comprising the compounds as active ingredients. R1, R2, R3, R4, R5, X, Y, Z, and W are as defined in the detailed description of the invention. [Keywords] uracil, herbicides, pyrimidinone.

(57) 요약서: 본 발명은 우라실계 화합물과 이 화합물의 제조방법, 및 이 화합물을 활성성분으로 포함하는 제초제에 관한 것이다. R1, R2, R3, R4, R5, X, Y, Z, 및 W는 각각 발명의 상세한 설명에서 정의한 바와 같다. [색인어] 우라실, 제초제, 피리미딘다이온



WO 2010/038953 A3

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA BAJO EL TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de Propiedad
Intelectual
Oficina Internacional



(43) Fecha de Publicación Internacional:
8 de abril de 2010 (08.04.2010)

PCT

(10) Número de Publicación Internacional
WO 2010/038953 A3

- (51) Clasificación Internacional de Patentes:
C07D 239/54 (2006.01)
- (21) Numero de Solicitud Internacional:
PCT/KR2009/005471
- (22) Fecha de Presentación Internacional:
24 de septiembre de 2009 (24.09.2009)
- (25) Lenguaje de entrega: Coreano
- (26) Lenguaje de Publicación: Coreano
- (30) Datos de la Prioridad:
10-2008-0097108 2 de octubre de 2008 (02.10.2008) KR
- (71) Solicitante (para todos los Estados designados menos los Estados Unidos): KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY [KR/KR]; 100, 305-343 Daejeon (KR); DONGBU HITEK CO., LTD. [KR/KR]; 4, 891-10, 135-523 Seoul (KR).
- (72) Inventores; e
- (75) Inventores/Solicitantes (solo para los Estados Unidos): KO, Young Kwan [KR/KR]; 102-1702, 305-755 Daejeon (KR); CHUNG, Kun Hoe [KR/KR]; 205-403, 305-772 Daejeon (KR); RYU, Jae Wook [KR/KR]; 102-305, 305-755 Daejeon (KR); WOO, Jae Chun [KR/KR]; 110-608, 302-763 Daejeon (KR); KOO, Dong Wan [KR/KR]; 119-1405, 305-755 Daejeon (KR); KIM, Dae Whang [KR/KR]; 510-301, 305-770 Daejeon (KR); KIM, Tae Joon [KR/KR]; 305-302, 305-761 Daejeon (KR); CHOI, In Young [KR/KR]; 104-1102, 305-729 Daejeon (KR); KIM, Young Kwon [KR/KR]; 102-802, 305-728 Daejeon (KR); OH, Tae Hyun [KR/KR]; 103-106, 305-728 Daejeon (KR); CHOI, Jun Hyuk [KR/KR]; 111-301, 305-728 Daejeon (KR); SEOK, Mee Young [KR/KR]; 111-301, 305-728 Daejeon (KR); KIM, Kyung Sung [KR/KR]; 2-402, 137-796 Seoul (KR); CHUNG, Bong Jin [KR/KR]; 1102-804, 417-737 Gyeonggi-do (KR).
- (74) Agente: HALLA PATENT & LAW FIRM; 9th FL., KAMCO Yangjae Tower, 949-3, Dogok-dong, Gangnam-gu Seoul 135-270 (KR).
- (81) Estados Designados (a menos que se indique lo contrario, para todo tipo de protección nacional disponible): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.
- (84) Estados Designados (a menos que se indique lo contrario, para todo tipo de protección regional disponible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Publicado:
- Con el informe de búsqueda internacional
- antes del vencimiento de la fecha límite para modificar las reivindicaciones y ser publicado nuevamente en el evento de recibir modificaciones (Regla 48.2(h))
- (88) Fecha de publicación del informe de búsqueda internacional: 01 de julio de 2010

(54) Título: COMPUESTOS DE URACILO Y HERBICIDAS QUE LOS COMPRENDEN

(57) Resumen: La presente invención se relaciona con compuestos a base de uracilo, un método para preparar los compuestos y herbicidas que comprenden los compuestos como ingredientes activos. R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, X, Y, Z y W se encuentran definidos en la descripción detallada. [Palabras clave] uracil, herbicidas, pirimidinidinona.

COMPUESTOS DE URACILO Y HERBICIDAS QUE LOS COMPRENDEN

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

1. Campo

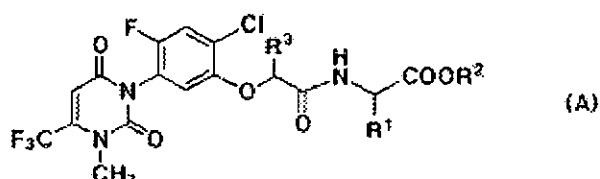
La presente invención se refiere a compuestos de uracilo novedosos, a un método para preparar los mismos, y a herbicidas que los comprenden.

2. Descripción del arte relacionado

El control de malezas es muy importante para mejorar la productividad agrícola. Para este propósito, se ha utilizado toda una variedad de herbicidas. En el cultivo del maíz se han utilizado herbicidas a base de triazina tales como la atrazina o herbicidas a base de anilida tales como alaclor y metolaclor, mientras que para el control total de la vegetación se han utilizado herbicidas no selectivos tales como paracuat o glifosato.

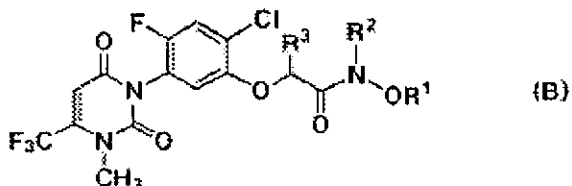
Aún así, las pérdidas agrícolas debidas a diversas clases de malezas son enormes y por lo tanto se están realizando investigaciones para el desarrollo de nuevos herbicidas.

Con respecto a una sustancia activa como herbicida, la patente japonesa abierta a la inspección pública N° 2000-302.764 divulga un compuesto representado por la Fórmula A.



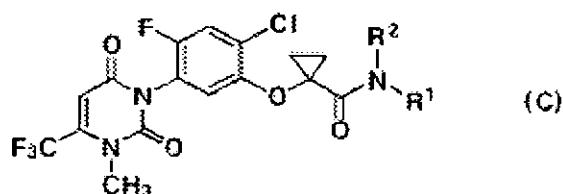
En la Fórmula A, R¹ representa hidrógeno o alquilo sustituido, R² representa alquilo, alquenilo o alquinilo, y R³ representa hidrógeno o metilo.

La patente japonesa abierta a la inspección pública N° 2001-172.265 divulga un compuesto representado por la Fórmula B.



En la Fórmula B, R¹ representa hidrógeno o alquilo sustituido, R² representa hidrógeno o alquilo, y R³ representa hidrógeno o metilo.

Y, la patente de los EE.UU. N° 6.403.534 divulga un compuesto representado por la Fórmula C.



En la Fórmula C, R^1 representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquenilo o alquinilo, y R^2 representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alquinilo, fenilo, bencilo, alcoxi o alquilsulfonilo.

Sin embargo, es necesario utilizar los compuestos representados por las Fórmulas A, B o C en grandes cantidades cuando se los utiliza como herbicidas no selectivos en huertos o áreas no cultivadas. Si se los utiliza como herbicidas selectivos, los mismos pueden dañar el cultivo deseado. Por lo tanto, existe una necesidad urgente de desarrollar herbicidas altamente efectivos para resolver dichos problemas.

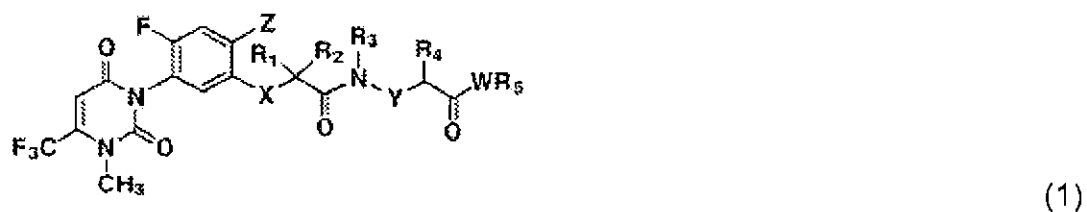
RESUMEN

Un objeto de la presente invención consiste en proveer un novedoso compuesto de uracilo y una sal del mismo agroquímicamente aceptable.

Otro objeto de la presente invención consiste en proveer un herbicida que incluye el compuesto de uracilo, la sal del mismo agroquímicamente aceptable o una mezcla de los mismos como un ingrediente activo.

Otro objeto de la presente invención consiste en proveer un método para preparar el compuesto de uracilo.

La presente invención proporciona un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 o una sal del mismo agroquímicamente aceptable:



donde

R_1 y R_2 , que pueden ser el mismo o diferentes, representan hidrógeno o C_1 - C_6 alquilo; R_3 representa hidrógeno, hidroxilo, C_1 - C_6 alquilo, C_2 - C_6 alquenilo, C_2 - C_6 alquinilo, C_1 - C_8 alcoxi, C_1 - C_6 haloalquilo, C_2 - C_6 haloalquenilo, C_1 - C_6 alcoxi C_1 - C_6 alquilo o C_6 - C_{10} arilo C_1 - C_6 alcoxi; R_4 representa hidrógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo o C_1 - C_6 alcoxycarbonilo C_1 - C_6 alquilo; R_5 representa hidrógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 alcoxi, C_2 - C_6 haloalquilo, C_2 - C_6 alquenilo, C_2 - C_6 haloalquenilo, C_2 - C_6 alquinilo, C_1 - C_6 alcoxycarbonilo C_1 - C_6 alquilo, C_6 - C_{10} arilo C_1 - C_6 alquilo o C_6 - C_{10} arilo C_1 - C_6 alcoxi; X representa O, S, SO, SO₂, NH o N(C_1 - C_6 alquilo); Y representa

C₁-C₆ alquileo o C₁-C₆ haloalquileo; W representa O, S, NH o N(C₁-C₆ alquilo); y Z representa halógeno, ciano, CONH₂ o CSNH₂.

El compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 muestra un efecto herbicida de amplio espectro no solo contra malezas gramíneas sino también malezas de hoja ancha por tratamiento foliar en baja concentración. Por lo tanto, este es muy útil como herbicida no selectivo para el tratamiento foliar en huertos y áreas no cultivadas.

Además, el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 muestra un buen efecto herbicida selectivo por tratamiento del suelo, con una actividad herbicida muy superior contra malezas de hoja ancha y gramíneas sin dañar cultivos útiles tales como trigo o maíz. Por lo tanto, el herbicida de la presente invención es muy útil para utilizar en tierras agrícolas, huertos y áreas no cultivadas.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE FORMAS DE MODALIDADES ESPECÍFICAS

Las ventajas, características y aspectos de la invención se harán evidentes al ver la siguiente descripción de las formas de modalidades con referencia a las figuras adjuntas, que se establecen de aquí en adelante.

En el contexto de la presente invención, el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 incluye una sal agroquímicamente aceptable, un racemato, un enantiómero o un diastereómero del compuesto representado por la Fórmula 1.

El compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 se puede utilizar en la forma de una sal agroquímicamente aceptable. La sal agroquímicamente aceptable puede incluir, por ejemplo, una sal de metal, una sal con una base orgánica, una sal con un ácido inorgánico, una sal con un ácido orgánico, una sal con un aminoácido básico o ácido, u otro compuesto similar. Una sal de metal apropiada puede incluir, por ejemplo, una sal de metal alcalino tal como una sal de sodio o una sal de potasio; una sal de metal alcalino térreo tal como una sal de calcio, una sal de magnesio o una sal de bario; una sal aluminio; u otra similar. La sal con una base orgánica puede incluir, por ejemplo, una sal con trimetilamina, trietilamina, piridina, picolina, 2,6-lutidina, etanolamina, dietanolamina, trietanolamina, ciclohexilamina, dicitclohexilamina, *N,N*-dibenciletilendiamina, u otro compuesto similar. La sal con un ácido inorgánico puede incluir, por ejemplo, una sal con ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, u otro compuesto similar. La sal con un ácido orgánico puede incluir, por

ejemplo, una sal con ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido ftálico, ácido fumárico, ácido oxálico, ácido tartárico, ácido maleico, ácido cítrico, ácido succínico, ácido metansulfónico, ácido bencensulfónico, ácido *p*-toluensulfónico, u otro compuesto similar. La sal con un aminoácido básico puede incluir, por ejemplo, una sal con arginina, lisina, ornitina, u otro compuesto similar. La sal con un aminoácido ácido puede incluir, por ejemplo, una sal con ácido aspártico, ácido glutámico, u otro compuesto similar.

Preferentemente, en el compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, R_1 y R_2 , que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o metilo; R_3 representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *tert*-butilo, vinilo, alilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, *n*-butoxi, *tert*-butoxi, clorometilo, diclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o benciloxi; R_4 representa hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo o *tert*-butilo; R_5 representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *tert*-butilo, vinilo, alilo, propargilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, *n*-butoxi, *tert*-butoxi, bencilo, fenetilo, metoxycarbonilmetilo, metoxycarboniletilo, metoxycarbonilpropilo, etoxycarbonilmetilo, benciloxi o fenetilo; X representa O, S, SO_2 , NH o $N(CH_3)$; Y representa CH_2 , $CH(CH_3)$, CH_2CH_2 , $CH_2CH_2CH_2$, $CH(CF_3)$, $CH(CH_2F)$, $CH(CHF_2)$, CH_2CHF o CH_2CF_2 ; W representa O, NH o $N(CH_3)$; y Z representa cloro, ciano, $CONH_2$ o $CSNH_2$.

Más preferentemente, en el compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, R_1 y R_2 , que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o metilo; R_3 representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, metoxi o benciloxi; R_4 representa hidrógeno o metilo; R_5 representa hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, metoxi, alilo, propargilo, bencilo, benciloxi o metoxycarbonilmetilo; X representa O, S, SO_2 o NH; Y representa CH_2 , $CH(CH_3)$, CH_2CH_2 , $CH_2CH_2CH_2$ o $CH(CH_2F)$; W representa O o NH; y Z representa cloro, ciano o $CSNH_2$.

Más preferentemente, en el compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, R_1 y R_2 , que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o metilo; R_3 representa hidrógeno, hidroxilo, metilo o metoxi; R_4 representa hidrógeno; R_5 representa hidrógeno, metilo, etilo, *n*-butilo, alilo, propargilo o $CH_2CO_2CH_3$; X representa O, S o NH; Y representa CH_2 , CH_2CH_2 o $CH(CH_2F)$; W representa O; y Z representa cloro.

Se dan ejemplos específicos del compuesto de uracilo de acuerdo a la presente invención en la Tabla 1.

12	Me	H	H	H	Me	O	CH ₂ CH ₂ CH ₂	O	Cl	(300 MHz, CDCl ₃) δ 7,40 (d, 1H, J = 11,0 Hz), 6,80 (d, 1H, J = 6,3 Hz), 6,70 (s ancho, 1H), 6,38 (d, 1H, J = 3,7 Hz), δ 4,62 (dq, 1H, J ₁ = 6,7 Hz, J ₂ = 2,3 Hz), 3,68 (s, 3H), 3,57 (d, 3H, J = 4,3 Hz), 3,32 (m, 2H), 2,35 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 1,60 (m, 7H)
13	H	H	H	H	Me	O	CH ₂	O	Cl	(300 MHz, CDCl ₃) δ 7,38 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,28 (s ancho, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 6,39 (s, 1H), 4,50 (s, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,66 (q, 2H, J = 6,1 Hz), 3,58 (s, 3H), 2,62 (t, 2H, J = 6,0 Hz)
14	H	H	H	H	H	O	CH ₂	O	Cl	
15	Me	H	H	H	Me	NH	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,26 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,05-7,20 (m, 1H), 6,35 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 6,32 (s, 1H), 4,45 (s ancho, 1H), 3,41-3,82 (m, 9H), 2,40-2,58 (m, 2H), 1,54 (d, 3H, J = 7 Hz)
16	H	H	Me	H	Me	O	CH ₂	O	Cl	(300 MHz, CDCl ₃) δ 7,33 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,01 (d, 0,4H, J = 6,4 Hz), 6,97 (d, 0,6H, J = 6,4 Hz), 6,37 (s, 1H), 4,85 (s, 0,8H), 4,73 (s, 1,2H), 3,77 (t, 0,8H, J = 7,0 Hz), 3,71 (s, 1,2H), 3,67 (s, 1,8H), 3,65 (t, 1,2H, J = 6,9 Hz), 3,57 (s, 3H), 3,15 (s, 1,8H), 2,93 (s, 1,2H), 2,63 (m, 2H)
17	Me	H	H	H	n-Pr	O	CH ₂	O	Cl	
18	Me	Me	H	H	Me	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,40 (s ancho, 1H), 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 6,90 (d, 1H, J = 6H), 6,35 (s, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,55-3,62 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 2,57 (t, 2H, J = 6H), 1,55 (s, 6H)
19	Me	Me	H	H	Et	O	CH ₂	O	Cl	
20	Me	H	H	H	Bn	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,4 (s ancho, 5H), 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,10-7,25 (s ancho, 1H), 6,80 (d, 1H, J = 6 Hz), 6,36 (d, 1H, J = 3 Hz), 5,13 (s, 2H), 4,6 (q, 1H, J = 6,7 Hz), 3,55-3,62 (m, 5H), 2,62 (t, 2H, J = 6H), 1,60 (d, 3H, J = 7 Hz)
21	Me	H	H	H	n-Pr	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,10-7,25 (m, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,38 (s, 1H), 4,55-4,70 (m, 1H), 4,05-4,15 (m, 2H), 3,45-3,65 (m, 5H), (2,50-2,62 (m, 2H)), 1,55-1,80 (m, 5H), 0,94 (t, 3H, J = 7,2 Hz)
22	Me	H	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,15-7,40 (m, 2H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,37 (s, 1H), 4,60-4,75 (m, 3H), 3,45-3,80 (m, 8H), 2,66 (t, 2H, J = 5,6 Hz), 1,65 (d, 3H, J = 6,8 Hz)
23	Me	H	H	H	n-Bu	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,10-7,25 (m, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,37 (s, 1H), 4,62 (q, 1H, J = 5,4 Hz), 4,15 (q, 2H, J = 7,4 Hz), 3,45-3,65 (m, 5H), 2,56 (t, 2H, J = 5,6 Hz), 1,25-1,75 (m, 7H), 0,94 (t, 3H, J = 7,2 Hz)
24	Me	H	H	H	Et	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,10-7,25 (m, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,37 (s, 1H), 4,62 (q, 1H, J = 5,4 Hz), 4,15 (q, 2H, J = 7,4 Hz), 3,45-3,65 (m, 5H), 2,56 (t, 2H, J = 5,6 Hz), 1,65 (d, 3H, J = 6,8 Hz), 1,26 (t, 3H, J = 7,4 Hz)
25	Me	H	H	H	alilo	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,10-7,25 (m, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,37 (s, 1H), 5,80-6,00 (m, 1H), 5,25-5,38 (m, 2H), 4,55-4,8 (m, 3H), 3,45-3,65 (m, 5H), 2,59 (t, 2H, J = 5,6 Hz), 1,62 (d, 3H, J = 6,2 Hz)
26	Me	H	H	H	propargilo	O	CH ₂	O	Cl	(200 MHz, CDCl ₃) δ 7,35 (d, 1H, J = 9 Hz), 7,05-7,20 (m, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 6,38 (s, 1H), 4,58-4,75 (m, 3H), 3,45-3,70 (m, 5H), 2,62 (t, 2H, J = 5,6 Hz), 2,45-2,50 (m, 1H), 1,62 (d, 3H, J = 5,2 Hz)
27	Me	Me	H	H	alilo	O	CH ₂	O	Cl	
28	Me	H	H	H	Et	O	CH ₂ CH ₂	O	Cl	(300 MHz, CDCl ₃) δ 7,36 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 6,80 (m, 2H), 6,38 (d, 1H, J = 3,7 Hz), 4,62 (dq, 1H, J ₁ = 6,7 Hz, J ₂ = 2,0 Hz), 4,14 (q, 2H, J = 7,2 Hz), 3,57 (d, 3H, J = 4,3), 3,36 (q, 2H, J = 6,6 Hz)

Entre los ejemplos de los compuestos de uracilo representados por la fórmula 1 dados en la Tabla 1, los siguientes son compuestos particularmente preferidos:

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 1);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]metoxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 4);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]benciloxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 5);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]hidroxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 6);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]-4-fluorobutírico (Compuesto Nro. 8);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]butírico (Compuesto Nro. 9);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]-2-metilpropiónico (Compuesto Nro. 10);

metiléster de ácido 4-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]butírico (Compuesto Nro. 11);

metiléster de ácido 5-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]pentanoico (Compuesto Nro. 12);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoetil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 13);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenilamino]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 15);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoetil]metilamino]propiónico
(Compuesto Nro. 16);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoisobutil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 18);

benciléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 20);

n-propiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 21);

3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propioniloxiacético metiléster de ácido
(Compuesto Nro. 22);

n-butiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 23);

etiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 24);

aliléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 25);

propargiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 26);

etiléster de ácido 4-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]butírico
(Compuesto Nro. 28);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofeniltio]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 36);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-ciano-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico
(Compuesto Nro. 46);

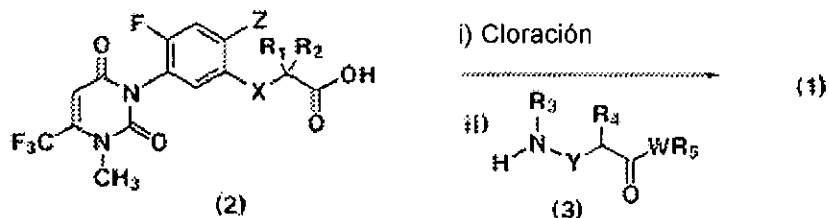
metiléster de ácido 3-[[2-[2-aminotiocarbonil-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 52); y

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenilsulfonil]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 61).

La presente invención también proporciona un método para preparar el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1.

Un primer método para preparar el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 de acuerdo con la presente invención comprende, según se muestra en el Esquema 1, hacer reaccionar un compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 2 con un reactivo clorante para preparar un cloruro de ácido carboxílico, y hacer reaccionar el cloruro de ácido carboxílico resultante con un compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 para obtener el compuesto de uracilo deseado:

Esquema 1



En el Esquema 1, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1.

En el método de preparación del Esquema 1, el compuesto de ácido carboxílico ($Z = Cl$) representado por la Fórmula 2 es un compuesto conocido que se divulga en WO 03/029226 y en la patente japonesa abierta a la inspección pública N° 2000-302764. El compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 se puede obtener comercialmente o es conocido o aquellos con experiencia en el arte lo pueden preparar fácilmente usando métodos conocidos.

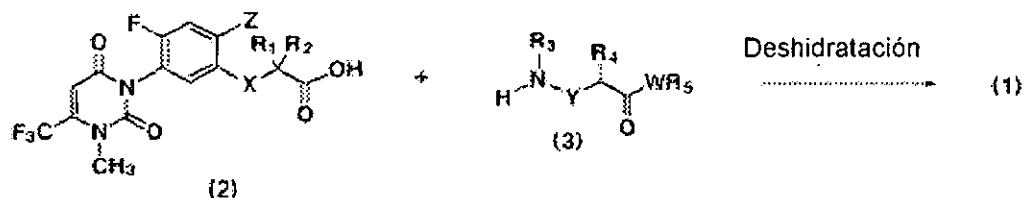
El reactivo clorante que se utiliza en el Esquema 1 puede ser un reactivo clorante que se utiliza comúnmente. Específicamente, se puede utilizar cloruro de tionilo, fosgeno, oxiclورو de fosforilo, cloruro de oxalilo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, u otro compuesto similar. La reacción de cloración se puede llevar a cabo en un solvente o sin un solvente. Cuando la reacción de cloración se lleva a cabo en un solvente, la solvente de reacción puede ser

cualquier solvente orgánico comúnmente se utiliza en el arte. Específicamente, se puede utilizar diclorometano, cloroformo, dicloroetano, acetato de etilo, ciclohexano, benceno, clorobenceno, tolueno, tetrahidrofurano, diisopropil éter, 1,4-dioxano, u otro compuesto similar. Preferiblemente, el reactivo clorante se utiliza en más de 1 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 2, y la reacción se lleva a cabo a entre 20°C y 150°C.

Una vez completa la reacción de cloración, la mezcla de reacción se concentra bajo presión reducida, se disuelve en un solvente y se hace reaccionar con el compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3. Preferiblemente, la reacción se lleva a cabo en condiciones de medio básico. Se puede utilizar una base orgánica tal como trietilamina, piridina, dimetilalanilina, etc. o una base inorgánica tal como Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Li_2CO_3 , etc. Preferiblemente, la temperatura de reacción es de entre 0°C y 100°C. La cantidad del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 que se utilice puede depender de si se utiliza o no una base. En condiciones de reacción donde no se usa una base, se prefiere utilizar 2 moles o más del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico. Y, en condiciones de reacción donde se utiliza una base, se prefiere utilizar 1 mol o más del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 y 1 mol o más de la base por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico. Una vez completa la reacción, la mezcla de reacción se diluye con un solvente orgánico y se lava con un ácido. La fase orgánica que se obtiene de esa manera se seca, se concentra y purifica por cromatografía en columna.

Un segundo método para preparar el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 de acuerdo con la presente invención comprende, según se muestra en el Esquema 2, la reacción de acoplamiento con amidas de un compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 2 y un compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 usando un agente deshidratante para obtener directamente el compuesto de uracilo deseado:

Esquema 2

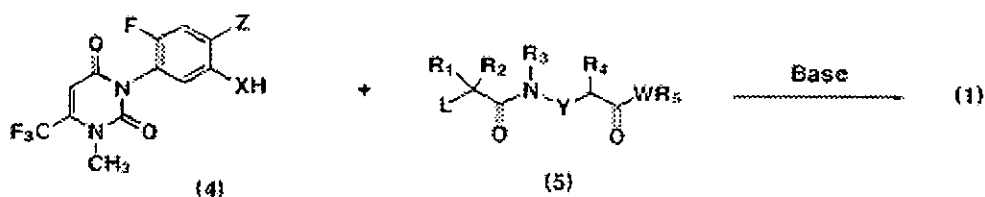


En el Esquema 2, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1.

El agente deshidratante que se utiliza en el Esquema 2 puede ser un agente deshidratante de los que se utilizan comúnmente en las reacciones de acoplamiento con amidas. Este se puede seleccionar entre *N,N*-carbonildiimidazol, *N,N*-ciclohexil carbodiimida, *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida y tetrafluoroborato de (benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio, pero no se limita a los mismos. El agente deshidratante se puede utilizar en una cantidad de entre 1 y 1,5 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 2. De ser necesario, en la deshidratación se puede utilizar *N,N*-dimetilaminopiridina como catalizador. El catalizador se puede utilizar en una cantidad de entre 0,05 y 0,1 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 2. La deshidratación se puede llevar a cabo en un rango de temperaturas de entre 0°C y 80°C, preferiblemente entre 20°C y 50°C. Como solvente de reacción, se puede utilizar un solvente orgánico de los que se utilizan comúnmente en el arte. Específicamente, se puede utilizar diclorometano, dicloroetano, acetato de etilo, acetonitrilo, tolueno, tetrahidrofurano, dietil éter, dimetil formamida, u otro compuesto similar. Una vez completa la reacción, la mezcla de reacción se puede purificar mediante un proceso de separación usual. Por ejemplo, la mezcla de reacción se puede diluir con un solvente orgánico y se puede lavar con una solución acuosa ácida, y luego la fase orgánica se puede concentrar bajo presión reducida. De ser necesario, se puede purificar por cromatografía en columna.

Un tercer método para preparar el compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 de acuerdo con la presente invención comprende, según se muestra en el Esquema 3, sustituir nucleofílicamente un compuesto representado por la Fórmula 4 con un compuesto representado por la Fórmula 5 en condiciones de medio básico.

Esquema 3



En el Esquema 3, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1, L representa un grupo saliente, que puede ser metanosulfonato (-OMs), *p*-toluensulfonato (-OTs), halógeno (por ejemplo, Cl, Br), u otro compuesto similar.

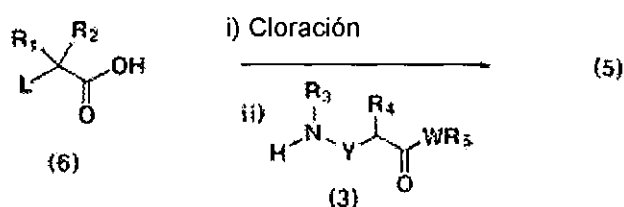
En la reacción de sustitución nucleofílica de acuerdo con el Esquema 3, se puede utilizar como solvente de reacción cualquier solvente orgánico de los que se utilizan comúnmente en el arte. Específicamente, se pueden utilizar diclorometano, cloroformo, dicloroetano, acetato de etilo, ciclohexano, benceno, clorobenceno, tolueno, ciclohexano, tetrahidrofurano, diisopropil éter, 1,4-dioxano y acetonitrilo, u otro compuesto similar. Y , en la sustitución nucleofílica se puede utilizar como a base una base orgánica tal como trietilamina, piridina, dimetilanilina, etc. o una base inorgánica tal como NaHCO_3 , KHCO_3 , Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Li_2CO_3 , etc. Preferiblemente, la base se utiliza en una cantidad de entre 1 y 1,1 mol por cada 1 mol del compuesto representado por la Fórmula 5. La reacción de sustitución nucleofílica se lleva a cabo en un rango de temperaturas de entre 0°C y 100°C .

El compuesto representado por la Fórmula 4 es un compuesto conocido. Específicamente, un compuesto con $Z = \text{Cl}$ y $X = \text{O}$ tiene un número de registro CAS 114136-60-6 y se divulga en la patente de los EE.UU. N° 6.537.948, un compuesto con $Z = \text{Cl}$ y $X = \text{S}$ tiene un número de registro CAS 353292-92-9 y se divulga en la patente de los EE.UU. N° 6.537.948, un compuesto con $Z = \text{Cl}$ y $X = \text{NH}$ tiene un número de registro CAS 114136-76-4 y se divulga en la patente de los EE.UU. N° 4.859.229, y un compuesto con $Z = \text{CN}$ y $X = \text{O}$ tiene un número de registro CAS 367253-28-9 y se divulga en la Patente Europea N° 1.272.478.

El compuesto representado por la Fórmula 5 se puede preparar de acuerdo con el Esquema 4 y el Esquema 5.

De acuerdo con el Esquema 4, un compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6 se clora siguiendo un método común usando un reactivo clorante, y el producto se hace reaccionar con un compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 para preparar el compuesto representado por la Fórmula 5.

Esquema 4



En el Esquema 4, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , Y y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1, y L representa un grupo saliente, que puede ser metanosulfonato (-OMs), *p*-toluensulfonato (-OTs), halógeno (por ejemplo, Cl, Br), u otro compuesto similar.

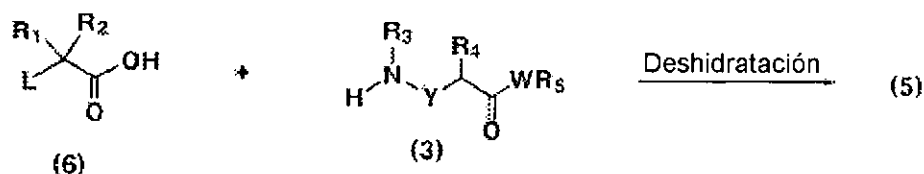
Algunos de los compuestos éster de aminoácido representados por la Fórmula 3 y el compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6 son conocidos, y algunos de ellos se pueden obtener comercialmente. Además, aquellos con experiencia en el arte pueden preparar fácilmente los compuestos de acuerdo con el método conocido de la literatura.

En el Esquema 4, el reactivo clorante puede ser uno que se selecciona entre el reactivo que se utiliza en la reacción de cloración de acuerdo con el Esquema 1, y preferiblemente se utiliza en más de 1 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6. La reacción se lleva a cabo en un rango de temperaturas de entre 20°C y 150°C.

Una vez completa la cloración, la mezcla de reacción se concentra bajo presión reducida, se disuelve en un solvente, y luego se hace reaccionar con el compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3. Preferiblemente, la reacción se lleva a cabo en condiciones de medio básico. Se puede utilizar una base orgánica tal como trietilamina, piridina, dimetilalanilina, etc. o una base inorgánica tal como Na_2CO_3 , K_2CO_3 , Li_2CO_3 , etc. Preferiblemente, la temperatura de reacción es de entre 0°C y 100°C. La cantidad del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 que se utilice puede depender de si se utiliza o no una base. En condiciones de reacción donde no se usa una base, se prefiere utilizar 2 moles o más del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico. Y, en condiciones de reacción donde se utiliza una base, se prefiere utilizar 1 mol o más del compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 y 1 mol o más de una base por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico. Una vez completa la reacción, la mezcla de reacción se diluye con un solvente orgánico y se lava con un ácido. La fase orgánica que se obtiene de esa manera se seca, se concentra y purifica por cromatografía en columna.

Otro método para preparar el compuesto representado por la Fórmula 5 comprende, según se muestra en el Esquema 5, la reacción de acoplamiento con amidas de un compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6 y un compuesto éster de aminoácido representado por la Fórmula 3 usando un agente deshidratante.

Esquema 5

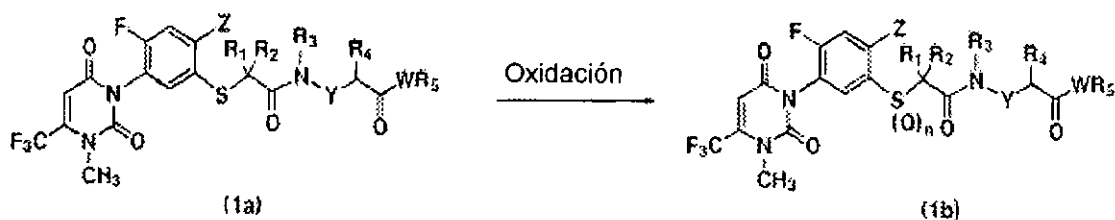


En el Esquema 5, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, Y y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1, y L representa un grupo saliente, que puede ser metanosulfonato (-OMs), *p*-toluensulfonato (-OTs), halógeno (por ejemplo, Cl, Br), u otro compuesto similar.

El agente deshidratante que se utiliza en el Esquema 5 puede ser un agente deshidratante de los que se utilizan comúnmente en las reacciones de acoplamiento con amidas. Este se puede seleccionar entre *N,N*-carbonildiimidazol, *N,N*-ciclohexil carbodiimida, *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida y tetrafluoroborato de (benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio, pero no se limita a los mismos. El agente deshidratante se puede utilizar en una cantidad de entre 1 y 1,5 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6. De ser necesario, en la reacción de deshidratación se puede utilizar *N,N*-dimetilaminopiridina como catalizador. El catalizador se puede utilizar en una cantidad de entre 0,05 y 0,1 mol por cada 1 mol del compuesto de ácido carboxílico representado por la Fórmula 6. La reacción de deshidratación se puede llevar a cabo en un rango de temperaturas de entre 0°C y 80°C, preferiblemente entre 20°C y 50°C. Como solvente de reacción, se puede utilizar un solvente orgánico de los que se utilizan comúnmente en el arte. Específicamente, se puede utilizar diclorometano, dicloroetano, acetato de etilo, acetonitrilo, tolueno, tetrahidrofurano, dietil éter, dimetil formamida, u otro compuesto similar. Una vez completa la reacción, la mezcla de reacción se puede purificar mediante un proceso de separación usual. Por ejemplo, la mezcla de reacción se puede diluir con un solvente orgánico y se puede lavar con una solución acuosa ácida, y luego la fase orgánica se puede concentrar bajo presión reducida. De ser necesario, se puede purificar por cromatografía en columna.

Y, de los compuestos de la presente invención, un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1b, con X = SO o SO₂, se puede preparar, según se muestra en el Esquema 6, oxidando un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1a con X = S.

Esquema 6



En el Esquema 6, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , Y , Z y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1, y n , que representa el número de átomos de oxígeno (O), es un entero igual a 1 ó 2.

La oxidación de acuerdo con el Esquema 6 se puede llevar a cabo usando el método que se divulga en la literatura *Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements*; en inglés; 45; 1989; 31-34; *Synthesis*; en inglés; 7; 1997; 787-791. En la presente invención, como agente oxidante se puede utilizar: Oxona, MCPBA, H_2O_2 , $KMnO_4$, $NaIO_4$, $t\text{-BuOCl}$, $Ca(OCl)_2$, $NaClO_2$, hipoclorito de sodio ($NaOCl$), dioxirano, ácido nítrico (HNO_3), nitrato cérico amónico, u otro compuesto similar.

Y , de los compuestos de la presente invención, se puede preparar un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1d, con $Z = CONH_2$, según se muestra en el Esquema 7, por el método que se divulga en la literatura *Journal of Chemical Research*, Miniprint; en inglés; 12; 1985; 3830-3860 usando como materia prima un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1c con $Z = CN$.

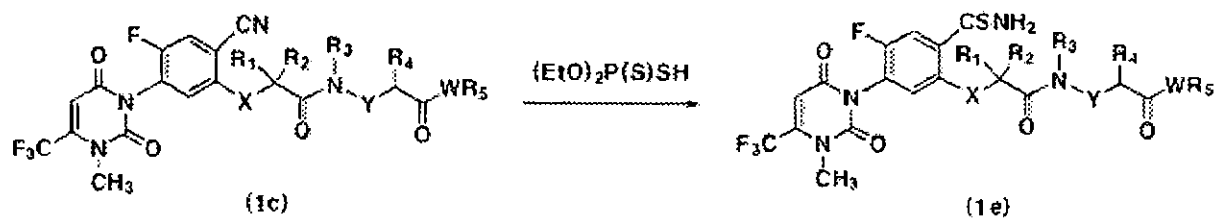
Esquema 7



En el Esquema 7, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1.

Y , de los compuestos de la presente invención, un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1e, con $Z = CSNH_2$, se puede preparar según se muestra en el Esquema 8, por el método que se divulga en la literatura *Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements*; en inglés; 25; 1985; 297-306 usando un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1c con $Z = CN$ como materia prima.

Esquema 8



En el Esquema 8, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y y W tienen los valores que se definen para la Fórmula 1.

EJEMPLOS

Ahora se describirán los ejemplos (y experimentos). Los siguientes ejemplos (y experimentos) solo se dan para propósitos ilustrativos y no para limitar el alcance de la presente divulgación.

Ejemplo de Preparación 1: Síntesis de cloruro de 2-cloropropionilo

Se agregó cloruro de tionilo ($SOCl_2$, 17,8 g) por goteo a 50 °C durante 30 minutos a una solución de ácido 2-cloropropiónico (10,8 g) en dimetilformamida (0,5 ml). Luego de agitar durante 7 horas a la misma temperatura, la mezcla de reacción se destiló a 112 °C para dar un aceite color amarillo pálido (9,4 g).

^1H RMN ($CDCl_3$, 300 MHz) δ 4,68 (q, 1H, $J = 7,0$ Hz), 1,84 (d, 3H, $J = 7,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación 2: Síntesis de metiléster de ácido 3-(2-cloropropionilamino)propiónico

Se agregó trietilamina (1,63 g) a una suspensión de clorhidrato de metiléster de β -alanina (2,25 g) en diclorometano (10 ml) y la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos. Después de la adición de piridina (1,27g) la mezcla de reacción se enfrió a 0 °C. Se agregó una solución de cloruro de 2-cloropropionilo (2,04 g) en diclorometano (10 ml) por goteo durante 20 minutos. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas, se lavó en forma secuencial con agua, ácido clorhídrico 1 N y bicarbonato de sodio saturado, se secó con sulfato de magnesio, se filtró, y se concentró para dar un aceite amarillo (2,9 g, rendimiento 93%).

^1H RMN ($CDCl_3$, 300 MHz) δ 7,15 (s ancho, 1H), 4,41 (q, 1H, $J = 7,0$ Hz), 3,74 (s, 3H), 3,58 (q, 2H, $J = 6,1$ Hz), 2,59 (t, 2H, $J = 6,0$ Hz), 1,74 (d, 3H, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo 1: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 1)

Se disolvieron ácido 2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]propiónico (20 g) y clorhidrato de metiléster de β -alanina (8,2 g) en diclorometano (200 ml). Después de agregar lentamente 4-metilmorfolina (14,8 g) por goteo a la mezcla de la reacción, se agitó durante 1 hora. Después de agregar tetrafluoroborato de (benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (18,5 g) durante 30 minutos, la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1,5 horas. La mezcla de reacción se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (24 g) incluyendo una traza de impurezas, que se recrystalizó dos veces utilizando una mezcla de solventes de acetato de etilo y hexano para dar el compuesto deseado (18,2 g).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,36 (d, 1H, $J = 8,8$ Hz), 7,17 (s ancho, 1H), 6,78 (d, 1H, $J = 6,3$ Hz), 6,37 (s, 1H), 4,63 (q, 1H, $J = 6,7$ Hz), 3,69 (s, 3H), 3,76-3,47 (m, 5H), 2,56 (t, 2H, $J = 5,8$ Hz), 1,62 (d, 3H, $J = 6,7$ Hz).

Ejemplo 2: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 1)

Se agregó cloruro de oxalilo (2 ml) por goteo a ácido 2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]propiónico (1,00 g). Luego de agitar la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 1 hora, y luego concentrar bajo presión reducida, se obtuvo un cloruro de ácido (1,00 g). El cloruro de ácido así obtenido se disolvió en diclorometano (10 ml), y luego de enfriar a 0 °C, se agregaron trietilamina (0,70 ml) y clorhidrato de metiléster de β -alanina (357 mg) en forma secuencial y lentamente por goteo. La mezcla de reacción se agitó a 5 °C o menos durante 2 horas, se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (800 mg).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,36 (d, 1H, $J = 8,8$ Hz), 7,17 (s ancho, 1H), 6,78 (d, 1H, $J = 6,3$ Hz), 6,37 (s, 1H), 4,63 (q, 1H, $J = 6,7$ Hz), 3,69 (s, 3H), 3,76-3,47 (m, 5H), 2,56 (t, 2H, $J = 5,8$ Hz), 1,62 (d, 3H, $J = 6,7$ Hz).

Ejemplo 3: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-

metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}metoxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 4)

Se disolvieron ácido 2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]propiónico (200 mg) y 3-(metoxiamina)propanoato de metilo (66 mg) en diclorometano (2 ml). Se agregó 4-metilmorfolina (162 μ L) lentamente por goteo a la mezcla de la reacción, y se agitó durante 30 minutos. Después de agregar tetrafluoroborato de (benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (186 mg) durante 30 minutos, la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas y 30 minutos. La mezcla de reacción se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (170 mg).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,32 (d, 1H, J = 8,9 Hz), 6,87 (dd, 1H, J_1 = 6,5 Hz, J_2 = 1,2 Hz), 6,35 (s, 1H), 5,05 (q, 1H, J = 6,6 Hz), 3,95 (m, 2H), 3,66 (m, 6H), 3,55 (d, 3H, J = 7,8 Hz), 2,56 (m, 2H), 1,63 (dd, 3H, J_1 = 6,8 Hz, J_2 = 1,9 Hz).

Ejemplo 4: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoetil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 13)

Se suspendieron ácido [2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluoro]fenoxiacético (100 mg) y clorhidrato de metiléster de β -alanina (43 mg) en diclorometano (1 ml). Se agregó 4-metilmorfolina (100 μ L) lentamente por goteo a la mezcla de reacción y se agregó tetrafluoroborato de (benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (97 mg) durante 1 hora. Luego de agitar a temperatura ambiente durante 3 horas, la mezcla de reacción se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (96 mg).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,38 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,28 (s ancho, 1H), 6,79 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 6,39 (s, 1H), 4,50 (s, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,66 (q, 2H, J = 6,1 Hz), 3,58 (s, 3H), 2,62 (t, 2H, J = 6,0 Hz).

Ejemplo 5: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenilamino]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 15)

Se disolvió metiléster de ácido 3-[2-(toluen-4-sulfoniloxi)-propionilamino]propiónico (307 mg) en acetonitrilo (5 ml). Después de la adición de 1-metil-3-(5-amino-4-cloro-2-fluorofenil)-6-trifluorometil-1H-pirimidin-2,4-diona (300

mg) y carbonato de potasio (135 mg), la mezcla de reacción se calentó durante 6 horas bajo reflujo sin enfriamiento. Luego de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo (50 ml) y se lavó con agua (50 ml). La fase orgánica así obtenida se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (170 mg).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,26 (d, 1H, $J = 9$ Hz), 7,05-7,20 (m, 1H), 6,35 (d, 1H, $J = 3,2$ Hz), 6,32 (s, 1H), 4,45 (s ancho, 1H), 3,41-3,82 (m, 9H), 2,40-2,58 (m, 2H), 1,54 (d, 3H, $J = 7$ Hz).

Ejemplo 6: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoisobutil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 18)

Se disolvieron metiléster de ácido 3-(2-bromo-2-metilpropionilamino)propiónico (224 mg) y 3-(4-cloro-2-fluoro-5-hidroxifenil)-1-metil-6-trifluorometil-1H-pirimidin-2,4-diona (250 mg) en 5ml de acetonitrilo. Después de la adición de K_2CO_3 (204 mg), la mezcla de reacción se calentó durante 12 horas bajo reflujo, se enfrió y se diluyó con acetato de etilo (50 ml). Después de lavar con agua (50 ml), la fase orgánica así obtenida se secó con sulfato de magnesio y se concentró. El concentrado se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice para dar el compuesto deseado (240 mg).

^1H RMN(CDCl_3) δ 7,40 (s ancho, 1H), 7.35 (d, 1H, $J = 9$ Hz), 6,90 (d, 1H, $J = 6$ Hz), 6,35 (s, 1H), 3,68 (s, 3H), 3,55-3,62 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 2,57 (t, 2H, $J = 6$ Hz), 1,55 (s, 6H), 1,43 (s, 3H).

Ejemplo 7: Síntesis de metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2H)-pirimidinil)-4-fluorofeniltio]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 36)

A una suspensión de metiléster de ácido 3-(2-cloropropionilamino)propiónico (6,93 g) y carbonato de potasio (4,72 g) en acetonitrilo (150 ml) se agregó por goteo una solución de 3-(4-cloro-2-fluoro-5-mercaptofenil)-1-metil-6-trifluorometil-1H-pirimidin-2,4-diona (11,54 g) en acetonitrilo (75 ml) a entre 45 °C y 50 °C durante 1 hora. La mezcla de reacción se agitó a la misma temperatura durante 2 horas y se neutralizó a 5 °C con ácido clorhídrico 1 N. Se agregaron agua y acetato de etilo para separar la fase orgánica. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó con sulfato de magnesio, se filtró, se

concentró, y se recrystalizó con éter para dar el compuesto deseado (13,00 g, rendimiento 78%, sólido blanco).

¹H RMN (CDCl₃, 300 MHz) δ 7,36 (d, 1H, J = 9,0 Hz), 7,24-7,19 (m, 1H), 7,09-6,92 (m, 1H), 6,36 (s, 1H), 3,82 (q, 0,5H, J = 7,3 Hz), 3,81 (q, 0,5H, J = 7,3 Hz), 3,66 (s, 1,5H), 3,65 (s, 1,5H), 3,56 (s, 3H), 3,59-3,40 (m, 2H), 2,46 (t, 2H, J = 6,0 Hz), 1,59 (d, 3H, J = 7,3 Hz).

Ejemplos de formulación

El compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1 es útil como un herbicida. Cuando se utiliza como herbicida, con el compuesto representado por la Fórmula 1 se puede mezclar un aditivo que se utiliza comúnmente en la preparación de agroquímicos tal como un diluyente, tensioactivo, dispersantes o coadyuvante para preparar diversos tipos de formulaciones, que incluyen polvos para humedecer, concentrado emulsionable, concentrados solubles, u otros compuestos similares. Dichas formulaciones se pueden utilizar directamente o diluidas con un medio adecuado. El volumen del herbicida para rociar puede ser de entre cientos y miles litros por hectárea (ha).

Una composición herbicida de acuerdo con la presente invención comprende entre 0,1 % en peso y 99,9 % en peso del compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1, una sal del mismo agroquímicamente aceptable o una mezcla de los mismos y entre 0,1 % en peso y 99,9 % en peso de un aditivo que se selecciona entre tensioactivos, diluyentes sólidos o líquidos, dispersantes y coadyuvantes. La composición herbicida de acuerdo con la presente invención se puede formular como un polvo para humedecer, suspensión concentrada, concentrado emulsionable, emulsión en agua, microemulsión, líquido, líquido dispersable, gránulo, polvo para humedecer, gránulos dispersables en agua o tabletas.

En la tabla 2 se dan ejemplos típicos de la composición herbicida de la presente invención. Sin embargo, la composición herbicida de la presente invención no se limita a las mismas.

Tabla 2

Formulación	Proporción en peso (% en peso)		
	Ingrediente activo	Diluyente	Tensioactivo
Polvo para humedecer	10-90	0-80	1-10
Concentración de la suspensión	3-50	40-95	0-15
Concentrado emulsionable/ concentrado soluble	3-50	40-95	0-15
Gránulo	0,1-95	5-98,9	1-15

El tensioactivo que se utiliza en la presente invención es un material anfifílico con alta actividad superficial, con unidades tanto hidrofílicas como lipofílicas en las moléculas. Con su mayor detergencia, dispersabilidad, capacidad emulsionante, capacidad solubilizante, capacidad humectante, capacidad esterilizante, capacidad espumante y poder de penetración, el mismo contribuye a humedecer, desintegrar, dispersar y emulsionar el herbicida para facilitar la efectividad de su acción. El tensioactivo puede ser un tensioactivo aniónico tal como una sal de sodio o una sal de potasio de un sulfonato, por ejemplo bencenosulfonato de alquilo (C_8-C_{12}), naftalenosulfonato de alquilo (C_3-C_6), naftalenosulfonato de dialquilo (C_3-C_6), sulfosuccinato de dialquilo (C_8-C_{12}), sulfonato de lignina, condensado de naftalenosulfosuccinato y formalina, condensado de naftalenosulfonato de alquilo (C_8-C_{12}) y formalina y polioxietileno fenilsulfonato de alquilo (C_8-C_{12}), una sal de sodio o una sal de potasio de un sulfato, por ejemplo sulfato de alquilo (C_8-C_{12}), polioxietileno sulfato de alquilo (C_8-C_{12}) y polioxietileno fenilsulfato de alquilo (C_8-C_{12}), y una sal de sodio o una sal de potasio de un succinato, por ejemplo de polioxialquilenosuccinato, un tensioactivo no iónico tal como polioxietileno alquil (C_8-C_{12}) éter, polioxietileno alquil (C_8-C_{12}) fenil éter y polímero de polioxietileno alquil (C_8-C_{12}) fenilo, o una mezcla de los mismos. Sin embargo, este no se limita a los ejemplos de la lista anterior.

El contenido del ingrediente activo se puede variar dependiendo de las aplicaciones. Cuando la ocasión lo demande, se puede utilizar un mayor contenido de tensioactivo que de ingrediente activo. El tensioactivo se puede agregar al ingrediente activo o se puede mezclar con el ingrediente activo usando un tanque.

El diluyente que se utiliza en la presente invención puede ser ya sea un diluyente sólido o un diluyente líquido. Para un diluyente sólido, para preparar un polvo para humedecer es particularmente apropiado uno que tenga una gran capacidad de absorber agua. Para un diluyente líquido, es preferible uno que sea estable sin que haya separación de fases del solvente aún a 0°C . El diluyente líquido puede ser agua, tolueno, xileno, éter de petróleo, aceite vegetal, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídridos de ácidos, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, carbonato de butileno, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, ésteres alquílicos de ácido acético, diacetona alcohol, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, *p*-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol etil éter, dietilenglicol metil éter, *N,N*-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol,

dipropilenglicol metil éter, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, α -pineno, D-limoneno, lactato de etilo, etilenglicol, etilenglicol butil éter, etilenglicol metil éter, γ -butirolactona, glicerol, acetato de glicerilo, diacetato de glicerilo, triacetato de glicerilo, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, *m*-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, *o*-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG 400), ácido propiónico, lactato de propilo, carbonato de propileno, propilenglicol, propilenglicol metil éter, *p*-xileno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilensulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, propilenglicol metil éter, dietilenglicol metil éter, metanol, etanol, isopropanol y alcohol de alto peso molecular, por ejemplo, alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etilenglicol, propilenglicol y glicerol, *N*-metil-2-pirrolidona, u otro compuesto similar. El diluyente sólido puede ser talco, dióxido de titanio, arcilla agalmatolita, sílice, arcilla atapulguita, diatomita, piedra caliza, carbonato de calcio, bentonita, montmorillonita cálcica, cáscaras de semillas de algodón, harina de trigo, soja harina, piedra pómez, harina de madera, cáscaras de nuez, lignina, u otro compuesto similar.

Se agregó una pequeña cantidad de aditivo a todas las formulaciones para impedir la formación de espuma, de tortas, la corrosión y el desarrollo de bacterias.

Dichas composiciones se pueden preparar usando un método que se utiliza comúnmente. Las composiciones líquidas se pueden preparar simplemente mezclando los constituyentes, y las composiciones como sólidos finos se pueden preparar por mezcla con molienda usando un molino de martillos o un molino de flujo. Las suspensiones se pueden preparar por mezcla usando una molienda en estado húmedo, y los gránulos se pueden preparar rociando la sustancia activa sobre un soporte en forma de gránulos.

A continuación se dan ejemplos típicos de formulación usando el compuesto de la presente invención.

Ejemplo de Formulación 1: Polvo para humedecer

Se mezclaron completamente los siguientes componentes. Luego, se llevó

a cabo la mezcla mientras se rociaba un tensioactivo líquido sobre los componentes sólidos. El producto se molió usando un molino de martillos hasta un tamaño de partícula 100 μm o menor.

Compuesto activo, 20 % en peso

Dodecilfenol polietilenglicol éter, 2 % en peso

Lignosulfonato de sodio, 4 % en peso

Silicoaluminato de sodio, 6 % en peso

Montmorillonita, 68 % en peso

Ejemplo de Formulación 2: Polvo para humedecer

Los siguientes componentes se mezclaron y molieron usando un molino de martillos hasta un tamaño de partícula 25 μm o menor.

Compuesto activo, 80 % en peso

Alquilnaftalenosulfonato de sodio, 2 % en peso

Lignosulfonato de sodio, 2 % en peso

Sílice amorfa sintética, 3 % en peso

Caolín, 13 % en peso

Ejemplo de Formulación 3: Concentrado emulsionable

Los siguientes componentes se mezclaron y se disolvieron uniformemente para preparar una emulsión.

Compuesto activo, 30 % en peso

Ciclohexanona, 20 % en peso

Polioxietileno alquil aril éter, 11 % en peso

Ácido alquilbencensulfónico cálcico, 4 % en peso

Metilnaftaleno, 35 % en peso

Ejemplo de Formulación 4: Gránulos

Los siguientes componentes se mezclaron uniformemente por molienda. Luego de agregar 20 % en peso de agua hasta un 100 % en peso de la mezcla, seguido de mezclado, la mezcla se trató para dar gránulos de 14-32 mesh usando una granuladora por extrusión y luego se secó.

Compuesto activo, 5 % en peso

Sal sódica de éster de alcohol laurílico y ácido sulfúrico, 2 % en peso

Lignosulfonato de sodio, 5 % en peso

Carboximetil celulosa, 2 % en peso

Sulfato de potasio, 16 % en peso

Yeso, 70 % en peso

Para su uso práctico, las formulaciones de acuerdo con la presente

invención se rociaron luego de diluirlas hasta una concentración adecuada.

Usos

El compuesto de uracilo de acuerdo con la presente invención muestra un efecto herbicida de amplio espectro no solo contra malezas gramíneas sino también contra malezas de hoja ancha por tratamiento foliar en baja concentración. Por lo tanto, el mismo es muy útil como herbicida no selectivo para el tratamiento foliar en huertos y áreas no cultivadas. Además, el compuesto de uracilo de acuerdo con la presente invención muestra una buena selectividad por cultivos tales como los de trigo o maíz por tratamiento del suelo. Por lo tanto, el mismo es muy útil como herbicida para tratar el suelo para utilizarlo en el cultivo de maíz y trigo.

La composición herbicida de la presente invención se puede utilizar en una cantidad de entre 10 g y 1 kg, preferiblemente entre 10 g y 400 g, por hectárea (ha), en base al ingrediente activo. La cantidad se puede determinar tomando en consideración factores tales como la cantidad de malezas, nivel de crecimiento de las malezas, tipo de formulación, etc.

La composición herbicida de la presente invención también puede comprender, además del compuesto representado por la Fórmula 1, un ingrediente activo que se utiliza comúnmente con una actividad agroquímica como ingrediente activo. Los ingredientes activos conocidos que se pueden utilizar en la composición herbicida de la presente invención pueden ser uno o más compuesto(s) con actividad herbicida que se selecciona(n) entre el grupo que consiste en inhibidor de acetil-CoA carboxilasa (ACC), inhibidor de acetolactato sintasa (ALS), amida, herbicidas derivados de auxina, inhibidor del transporte de auxina, inhibidor de biosíntesis de carotenoides, inhibidor de enolpiruvilshikimato 3-fosfato sintasa (ESPS), inhibidor de glutamina sintetasa, inhibidor de biosíntesis de lípidos, inhibidor de mitosis, inhibidor de protoporfirinógeno IX oxidasa, inhibidor de fotosíntesis, agentes sinérgicos, hormona de crecimiento, inhibidor de biosíntesis de la pared celular y otros herbicida.

El inhibidor de acetil-CoA carboxilasa (ACC) puede ser un ciclohexenona oxima éter tal como aloxidima, cletodima, cloproxidima, cicloxidima, setoxidima, tralcoxidima, butroxidima, clefoxidima o tepraloxidima, o un éster del ácido fenoxifenoxipropiónico tal como metamifop, cihalofop-butilo, diclofop-metilo, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fentiaprop-etilo, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, isoxapirifop, propaquizafop, quizalofop-etilo, quizalofop-P-etilo o quizalofop-tefurilo.

El inhibidor de acetolactato sintasa (ALS) puede ser una imidazolinona tal como imazapir, imazaquin, imazametabenz-metilo, imazamox, imazapic, imazetapir o imazametapir, un pirimidil éter tal como piritiobac-ácido, piritiobac-sodio, bispiribac-sodio o piribenzoxima, una sulfonamida tal como florasulam, flumetsulam o metosulam, o una sulfonilurea tal como amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron-metilo, clorimuron-etilo, clorsulfuron, chinosulfuron, ciclosulfamuron, etametsulfuron-metilo, etoxisulfuron, flazasulfuron, halosulfuron-metilo, imazosulfuron, metsulfuron-metilo, nicosulfuron, primisulfuron-metilo, prosulfuron, pirazosulfuron-etilo, rimsulfuron, sulfometuron-metilo, tifensulfuron-metilo, triasulfuron, tribenuron-metilo, triflusulfuron-metilo, sulfosulfuron, flucetosulfuron o yodosulfuron.

Los herbicidas derivados de auxina pueden ser un ácido piridinacarboxílico tal como clopiralid o picloram, 2,4-D o benazolina.

El inhibidor del transporte de auxina puede ser naptalam o diflufenzopir, y el inhibidor de biosíntesis de carotenoides puede ser benzofenap, clomazona, diflufenican, fluorocloridona, fluridona, pirazolinato, pirazoxifeno, isoxaflutol, isoxaclortol, mesotriona, sulcotriona (clormesulona), ketospiradox, flurtamona, norflurazona o amitrol.

El inhibidor de enolpiruvilshikimato 3-fosfato sintasa (ESPS) puede ser glifosato o sulfosato, y el inhibidor de glutamina sintetasa puede ser bilanafos (bialafos) o glufosinato-amonio.

El inhibidor de biosíntesis de lípidos puede ser una anilida tal como anilofos o mefenacet, una cloroacetanilida tal como dimetenamida, S-dimetenamida, acetoclor, alaclor, butaclor, butenaclor, dietatil-etilo, dimetaclor, metazaclor, metolaclor, S-metolaclor, pretilaclor, propaclor, prinaclor, terbuclor, tenilclor o xilaclor, una tiourea tal como butilato, cicloato, dialato, dimepiperato, EPTC, esprocarb, molinato, pebulato, prosulfocarb, tiobencarb (bentiocarb), trialato o vernolato, benfuresato o perfluidona.

El inhibidor de mitosis puede ser un carbamato tal como asulam, carbetamida, clorprofam, orbencarb, pronamid (propizamida), profam o tiocarbazilo, una dinitroanilina tal como benefin, butralina, dinitramina, etalfluralina, flucloralina, orizalina, pendimetalina, prodiamina o trifluralina, una piridina tal como ditiopir o tiazopir, butamifos, clortal-dimetilo (DCPA) o hidrazida maleica.

El inhibidor de protoporfirinógeno IX oxidasa puede ser un difenil éter tal como acifluorfen, acifluorfen-sodio, aclonifeno, bifenox, clornitrofen (CNP), etoxifeno, fluorodifeno, fluoroglicofeno-etilo, fomesafeno, furiloxifeno, lactofeno,

nitrofenol, nitrofluorfenol u oxifluorfenol, un oxadiazol tal como oxadiargilo o oxadiazona, una imida cíclica tal como azafenidina, butafenacilo, carfentrazona-etilo, cinidon-etilo, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, flumipropino, flupropacilo, flutiacet-metilo, sulfentrazona o tidiazimina, o un pirazol tal como piraflufen-etilo.

El inhibidor de fotosíntesis puede ser propanilo, piridato o piridafol, una benzotiadiazinona tal como bentazona, un dinitrofenol tal como bromofenoxima, dinoseb, dinoseb-acetato, dinoterb o DNOC, un dipiridileno tal como cyperquat-cloruro, difenzoquat-metilsulfato, dicuat o paracuat-dicloruro, una urea tal como clorbromuron, clortoluron, difenoxuron, dimefuron, diuron, etidimuron, fenuron, fluometuron, isoproturon, isouron, linuron, metabenzthiazuron, metazol, metobenzuron, metoxuron, monolinuron, neburon, siduron o tebutiuron, un fenol tal como bromoxinilo o ioxinilo, cloridazon, una triazina tal como ametrina, atrazina, cianazina, desmetrina, dimetametrina, hexazinona, prometon, prometrina, propazina, simazina, simetrina, terbumeton, terbutrina, terbutilazina o trietazina, una triazinona tal como metamitron o metribuzina, un uracilo tal como bromacilo, lenacilo o terbacilo, o un biscarbamato tal como desmedifan o fenmedifan.

Los agentes sinérgicos pueden ser un oxirano tal como tridiphane, la hormona de crecimiento puede ser un ácido ariloxialcanoico tal como 2,4-DB, clomeprop, diclorprop, diclorprop-P (2,4-DP-P), fluoroxipir, MCPA, MCPB, mecoprop, mecoprop-P o triclopir, un ácido benzoico tal como cloramben o dicamba, o un ácido carboxílico tal como quinclorac o quinmerac, y el inhibidor de síntesis de la pared celular puede ser isoxaben o dichlobenilo.

El otro herbicida puede ser un ácido dicloropropiónico tal como dalapon, un dihidrobenzofurano tal como etofumesato, un ácido fenilacético tal como clorfenac (fenac), o aziprotrina, barban, bensulida, benzthiazuron, benzofluor, buminafos, buthidazol, buturon, cafenstrol, clorbufam, clorfenprop-metilo, clorxuron, cinmetilina, cumiluron, cicluron, ciprazina, ciprazol, dibenciluron, dipropetrina, dymron, eglinazina-etilo, endotal, etiozina, flucabazona, fluorbentranilo, flupoxam, isocarbamida, isopropalina, karbutilato, mefluidida, monuron, napropamida, napropanilida, nitalina, oxaciclomefona, fenisofan, piperofos, prociazina, profluralina, piributicarb, sebumeton, sulfalato (CDEC), terbucarb, triaziflam, triazofenamida o trimeturon, o una sal de los mismos que no daña el medio ambiente.

El compuesto de acuerdo con la presente invención tiene una notable actividad herbicida contra monocotiledóneas perjudiciales (malezas gramíneas) y dicotiledóneas (malezas de hoja ancha). El compuesto de acuerdo con la presente

invención puede controlar las plantas de las malezas típicas, pero las mismas no se limitan a ninguna especie en particular.

Los ejemplos específicos de especies de malezas que pueden ser controladas por el herbicida de la presente invención incluyen:

Especies de malezas gramíneas (monocotiledóneas) que se seleccionan entre *Digitaria ciliaris*, *Agropiron tsukushiense* var. *transiens*, *Echinochloa crus-galli*, *Panicum dichotomiflorum*, *Digitaria violascens*, *Eleusine indica*, *Setaria viridis*, *Setaria viridis* var. *gigantea*, *Setaria faberi*, *Leptochloa chinensis*, *Eragrostis multicaulis*, *Eragrostis pilosa*, *Poa sfondilodes*, *Poa pratensis*, u otro compuesto similar; y

Especies de malezas de hoja ancha (dicotiledóneas) que se seleccionan entre malezas Cyperaceae que incluyen *Cyperus amuricus*, *Cyperus microiria*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis acicularis*, *Eleocharis kuroguwai*, *Scirpus fluviatilis*, u otras similares; malezas Asteraceae que incluyen *Eclipta prostrata*, *Siegesbeckia pubescens*, *Centipeda minima*, *Senecio vulgaris*, *Artemisia princeps* var. *orientalis*, *Bidens frondosa*, *Taraxacum officinale*, *Erigeron annuus*, *Conyza canadensis*, *Galinsoga quadriradiata*, *Hemistepta lyrata*, *Youngia japonica*, *Artemisia capillaris*, *Bidens bipinnata*, *Siegesbeckia glabrescens*, *Ambrosia trifida*, *Ixeris dentata*, *Youngia sonchifolia*, *Lactuca indica* var. *laciniata*, *Aster pilosus*, *Breea segeta*, *Taraxacum platycarpum*, *Ambrosia artemisiifolia* var. *elator*, *Helianasí tuberosus*, *Erechtites hieracifolia*, u otras; malezas Lamiaceae que incluyen *Elsholtzia ciliata*, *Stachys riederi* var. *japonica*, *Mosla punctulata*, *Leonurus japonicus*), u otras; malezas Euforbiaceae que incluyen *Acalypha australis*, *Chamaesyce maculata*, *Chamaesyce supina*, u otras; malezas Scrophulariaceae que incluyen *Mazus pumilus*, *Lindernia procumbens*, u otras; malezas Solanaceae que incluyen *Solanum nigrum*, *Solanum americanum*, u otras; malezas Amaranthaceae que incluyen *Amaranasí lividus*, *Amaranasí hybridus* var. *Patulus*, u otras; malezas Oxalidaceae que incluyen *Oxalis maíziculata*, *Oxalis stricta*, u otras; malezas Geraniaceae que incluyen *Erodium moschatum*, *Geranium thunbergii*, u otras; malezas Malvaceae que incluyen *Hibiscus trionum*, *Abutilon theophrasti*, u otras; malezas Cannabinaceae que incluyen *Humulus japonicus*, *Cannabis sativa*, u otras; malezas Onagraceae que incluyen *Ludwigia prostrata*, *Oenothera biennis*, u otras; malezas Portulacaceae que incluyen *Portulaca oleracea*, u otras; malezas Equisetaceae que incluyen *Equisetum arvense*, u otras; malezas Araceae que incluyen *Pinellia ternata*, u otras; malezas Apiaceae que incluyen *Torilis japonica*, u otras; malezas Aizoaceae

que incluyen *Mollugo pentaphylla*, u otras; malezas *Commelinaceae* que incluyen *Commelina communis*, u otras; malezas *Crassulaceae* que incluyen *Sedum sarmentosum*, u otras; malezas *Papaveraceae* que incluyen *Chelidonium majus* var. *asiaticum*, u otras; malezas *Asclepiadaceae* que incluyen *Metaplexis japonica*, u otras; malezas *Violaceae* que incluyen *Viola mandshurica*, u otras; malezas *Caryophyllaceae* que incluyen *Stellaria acutata*, u otras; malezas *Urticaceae* que incluyen *Pilea mongolica*, u otras; malezas *Boraginaceae* que incluyen *Trigonotis peduncularis*, u otras; malezas *Plantaginaceae* que incluyen *Plantago asiatica*, u otras; malezas *Rosaceae* que incluyen *Potentilla supina*, u otras; etc.

Ejemplo de prueba

El efecto herbicida de los compuestos de la presente invención se probó de la siguiente manera.

Ejemplo de prueba: Prueba en tratamiento de suelo y foliar

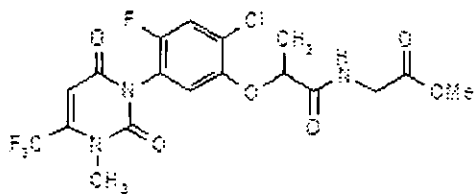
Se mezcló un compuesto fertilizante para horticultura (N:P:K = 11:10:11) con tierra arenosa esterilizada (pH 6,1, sustancias orgánicas 1,0%, arcilla 21%, limo 17%, arena 52%), 1 g por cada maceta (350 cm²). Esa tierra se usó para llenar macetas cuadradas de plástico, y se sembraron plantas de maíz, de *Poaceae* incluyendo *Panicum dichotomiflorum* y *Digitaria ciliaris*, plantas de hoja ancha incluyendo *Solanum nigrum*, *Aeschynomene indica*, *Abutilon theophrasti* y bardana o abrojo (*Xanthium* sp.), o rizomas de *Convolvulus* y se cubrieron con tierra. El tratamiento del suelo se llevó a cabo rociando una formulación de prueba 1 día después de la siembra, y el tratamiento foliar, entre 8 y 12 días después de la siembra. La formulación de prueba se preparó disolviendo un compuesto de prueba en una mezcla de 5 % en peso de acetona y 1 % en peso de un emulsionante, y diluyendo con agua para preparar un polvo para humedecer. Se rociaron 2000 litros de la formulación de prueba por hectárea. La cantidad del compuesto activo se ajustó para que fuese la cantidad deseada.

Luego del tratamiento, las plantas se cultivaron durante 2 semanas en condiciones de invernadero (25-35 °C durante el día y 20-25 °C durante la noche, ciclo de luz de 14 horas). La actividad herbicida se evaluó por comparación con un grupo de control sin tratar de acuerdo con el siguiente estándar: para las malezas, de 0 (sin efecto herbicida) a 100 (destrucción completa); y para los cultivos de 0 (inocuo) a 10 (destrucción completa).

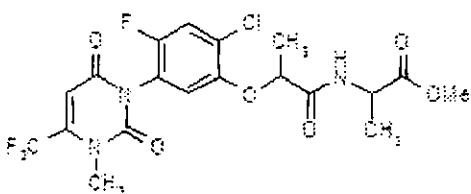
Los resultados de la prueba se muestran en las tablas 3 a 7. Los compuestos representados por la Fórmula 1 mostraron una excelente actividad herbicida contra malezas de hoja ancha y malezas gramíneas por tratamiento

foliar aún a bajas concentraciones. Por tratamiento del suelo, los mismos mostraron una alta selectividad por el trigo y el maíz, y mostraron un poderoso efecto herbicida tanto sobre malezas de hoja ancha como sobre malezas gramíneas.

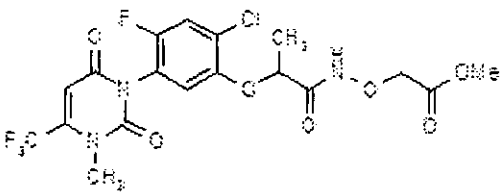
Los compuestos de control fueron aquellos que se divulgan en las Patentes japonesas abiertas a la inspección pública N° 2000-302764 y 2001-172.265, con las siguientes estructuras:



Compuesto comparativo 1



Compuesto comparativo 2



Compuesto comparativo 3

Tabla 3

Prueba comparativa de actividad herbicida para el tratamiento foliar (8 g a.i./ha)			
Sustancia de prueba	Malezas		
	Malezas gramíneas		Malezas de hoja ancha
	<i>Echinochloa crus-galli</i>	<i>Digitaria ciliaris</i>	Bardana o abrojo (<i>Xanthium</i> sp.)
Compuesto comparativo 1	55	30	98
Compuesto comparativo 2	65	25	70
Compuesto comparativo 3	30	10	95
Compuesto N° 1	100	100	100

Tabla 4

Actividad herbicida prueba por tratamiento foliar (I) (8 g a.i./ha)						
Sustancia de prueba	Malezas gramíneas			Malezas de hoja ancha		
	<i>Cyperus serotinus</i>	<i>Digitaria ciliaris</i>	<i>Sorghum bicolor</i>	<i>Aeschynomene indica</i>	<i>Abutilon theophrasti</i>	Bardana o abrojo (<i>Xanthium</i> sp.)
Compuesto N° 1	100	100	97	100	100	100
Compuesto N° 36	100	100	100	100	100	100

Tabla 5

Actividad herbicida prueba por tratamiento foliar (II) (8 g a.i./ha)						
Sustancia de prueba	Malezas gramíneas			Malezas de hoja ancha		
	<i>Echinochloa crus-galli</i>	<i>Digitaria ciliaris</i>	<i>Panicum dichotomiflorum</i>	<i>Solanum nigrum</i>	<i>Abutilon theophrasti</i>	<i>Aeschynomene indica</i>
Compuesto N° 1	100	100	100	100	100	100
Compuesto N° 24	98	99	99	100	100	100

Tabla 6

Actividad herbicida prueba por tratamiento foliar (III) (16 g a.i./ha)						
Sustancia de prueba	Malezas gramíneas			Malezas de hoja ancha		
	<i>Echinochloa crus-galli</i>	<i>Digitaria ciliaris</i>	<i>Panicum dichotomiflorum</i>	<i>Solanum nigrum</i>	<i>Abutilon theophrasti</i>	<i>Aeschynomene indica</i>
Compuesto N° 22	100	85	100	100	100	100
Compuesto N° 23	100	100	100	100	100	100
Compuesto N° 25	90	100	96	100	100	100
Compuesto N° 26	90	95	90	100	100	100

Tabla 7

Actividad herbicida prueba por tratamiento del suelo (32 g a.i./ha)							
Sustancia de prueba	Cultivares		Malezas gramíneas		Malezas de hoja ancha		
	Maíz	Trigo	<i>Sorghum bicolor</i>	<i>Digitaria ciliaris</i>	<i>Solanum nigrum</i>	<i>Abutilon theophrasti</i>	<i>Aeschynomene indica</i>
Compuesto N° 1	2	3	100	100	100	100	100
Compuesto N° 36	0	0	100	100	100	100	100

Como se puede ver en los resultados de la prueba, los Compuestos de control 1, 2 y 3 no mostraron una actividad herbicida perfecta contra "bardana o abrojo" (*Xanthium* sp.), y mostraron una muy baja actividad herbicida contra malezas monocotiledóneas. Por lo tanto, para controlar diversas malezas fue necesario realizar el tratamiento con altas concentraciones.

Al contrario, los compuestos representados por la Fórmula 1, que son compuestos amidas con una estructura de β -aminoácido, mostraron una excelente actividad herbicida por tratamiento foliar contra las malezas gramíneas (monocotiledóneas) y las malezas de hoja ancha (dicotiledóneas). Por lo tanto, los mismos son útiles como herbicidas no selectivos para el tratamiento foliar. Además, los mismos mostraron una actividad herbicida muy superior contra las

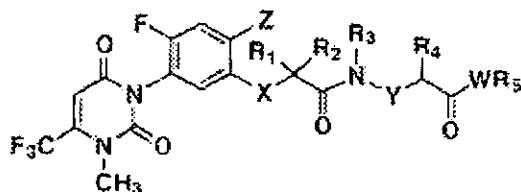
malezas gramíneas y las malezas de hoja ancha por tratamiento del suelo, con poco daño a los cultivos. Por lo tanto, los mismos son útiles como herbicida selectivo para cultivos.

Por lo tanto, el compuesto representado por la Fórmula 1 puede ser útil como herbicida de alta eficiencia, con el que se puede reducir mucho la proporción de aplicación del herbicida que se utiliza y que, por lo tanto, evita la contaminación ambiental.

Aunque la presente invención se ha descrito con respecto a formas de modalidades específicas, será evidente para aquellos con experiencia en el arte que se le pueden realizar diversos cambios y modificaciones sin apartarse del espíritu y el alcance de la invención según se la define en las siguientes reivindicaciones.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de uracilo CARACTERIZADO PORQUE está representado por la fórmula 1 o una sal agroquímicamente permitida del mismo:



(1)

donde

R₁ y R₂, que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o C₁-C₆ alquilo;

R₃ representa hidrógeno, hidroxilo, C₁-C₆ alquilo, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ alquinilo, C₁-C₈ alcoxi, C₁-C₆ haloalquilo, C₂-C₆ haloalquenilo, C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ alquilo o C₆-C₁₀ arilo C₁-C₆ alcoxi;

R₄ representa hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo o C₁-C₆ alcoxycarbonilo C₁-C₆ alquilo;

R₅ representa hidrógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₂-C₆ haloalquilo, C₂-C₆ alquenilo, C₂-C₆ haloalquenilo, C₂-C₆ alquinilo, C₁-C₆ alcoxycarbonilo C₁-C₆ alquilo, C₆-C₁₀ arilo C₁-C₆ alquilo o C₆-C₁₀ arilo C₁-C₆ alcoxi;

X representa O, S, SO, SO₂, NH o N(C₁-C₆ alquilo);

Y representa C₁-C₆ alquilenilo o C₁-C₆ haloalquilenilo; W representa O, S, NH o N(C₁-C₆ alquilo); y

Z representa halógeno, ciano, CONH₂ o CSNH₂.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE

R₁ y R₂, que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o metilo;

R₃ representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *tert*-butilo, vinilo, alilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, *n*-butoxi, *tert*-butoxi, clorometilo, diclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo o benciloxi;

R₄ representa hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo o *tert*-butilo;

R₅ representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *tert*-butilo, vinilo, alilo, propargilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, *n*-butoxi,

tert-butoxi, bencilo, fenetilo, metoxycarbonilmetilo, metoxycarboniletilo, metoxycarbonilpropilo, etoxycarbonilmetilo, benciloxi o fenetiloxi;

X representa O, S, SO₂, NH o N(CH₃);

Y representa CH₂, CH(CH₃), CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂, CH(CF₃), CH(CH₂F), CH(CHF₂), CH₂CHF o CH₂CF₂;

W representa O, NH o N(CH₃); y

Z representa cloro, ciano, CONH₂ o CSNH₂.

3. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE

R₁ y R₂, que pueden ser iguales o diferentes, representan hidrógeno o metilo;

R₃ representa hidrógeno, hidroxilo, metilo, metoxi o benciloxi;

R₄ representa hidrógeno o metilo;

R₅ representa hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, metoxi, alilo, propargilo, bencilo, benciloxi o metoxycarbonilmetilo;

X representa O, S, SO₂ o NH;

Y representa CH₂, CH(CH₃), CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂ o CH(CH₂F);

W representa O o NH; y

Z representa cloro, ciano o CSNH₂.

4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, CARACTERIZADO PORQUE se selecciona entre:

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]amino]propiónico (Compuesto Nro. 1);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]metoxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 4);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]benciloxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 5);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil]hidroxiamino]propiónico (Compuesto Nro. 6);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-

trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]-4-fluorobutírico (Compuesto Nro. 8);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]butírico (Compuesto Nro. 9);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]-2-metilpropiónico (Compuesto Nro. 10);

metiléster de ácido 4-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]butírico (Compuesto Nro. 11);

metiléster de ácido 5-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]pentanoico (Compuesto Nro. 12);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoetil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 13);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenilamino]-1-oxopropil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 15);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoetil}metilamino]propiónico (Compuesto Nro. 16);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxoisobutil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 18);

benciléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 20);

n-propiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 21);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propioniloxiacético (Compuesto Nro. 22);

n-butiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-

trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 23);

etiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 24);

aliléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 25);

propargiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 26);

etiléster de ácido 4-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]butírico
(Compuesto Nro. 28);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofeniltio]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 36);

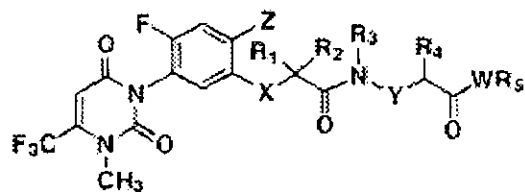
metiléster de ácido 3-[[2-[2-ciano-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico
(Compuesto Nro. 46);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-aminotiocarbonil-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenoxi]-1-oxopropil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 52);

metiléster de ácido 3-[[2-[2-cloro-5-(3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-1(2*H*)-pirimidinil)-4-fluorofenilsulfonil]-1-oxopropil}amino]propiónico (Compuesto Nro. 61); y

una sal agroquímicamente permitida del mismo.

5. Un herbicida CARACTERIZADO PORQUE comprende un compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, una sal agroquímicamente permitida del mismo o una mezcla de los mismos como ingrediente activo:

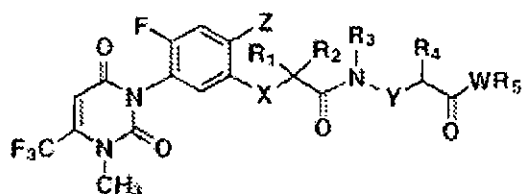


(1)

donde

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W son como se definen en la reivindicación 1.

6. El herbicida de acuerdo con la reivindicación 5, CARACTERIZADO PORQUE es para eliminar malezas gramíneas y malezas de hoja ancha por tratamiento foliar.
7. El herbicida de acuerdo con la reivindicación 5, CARACTERIZADO PORQUE tiene selectividad por los cultivos y se utiliza para tratar el suelo para eliminar malezas gramíneas y malezas de hoja ancha.
8. Una composición herbicida CARACTERIZADA PORQUE comprende:
entre 0,1 % en peso y 99,9 % en peso de ingrediente activo se selecciona entre el grupo que consiste en un compuesto de uracilo representado por la Fórmula 1:



(1)

donde

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W tienen los valores que se definen en la reivindicación 1;

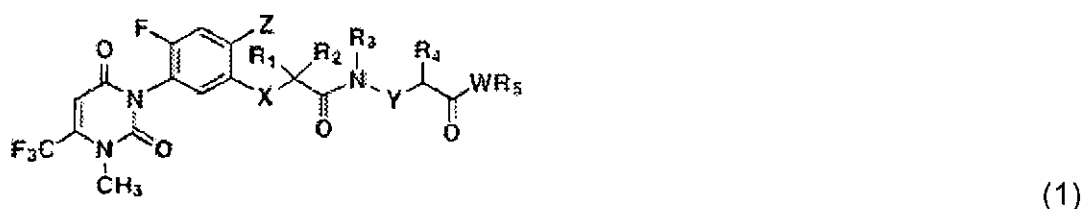
una sal del mismo agroquímicamente aceptable o una mezcla de los mismos; y

entre 0,1 % en peso y 99,9 % en peso de un aditivo que se selecciona entre un tensioactivo y un diluyente sólido o líquido:

9. La composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 8, CARACTERIZADA PORQUE se la formula como un polvo para humedecer, una suspensión concentrada, un concentrado emulsionable, una emulsión aceite en agua, una microemulsión, un concentrado soluble, un líquido dispersable, gránulos dispersables en agua, gránulos o tabletas.
10. La composición herbicida de acuerdo con la reivindicación 8, CARACTERIZADA PORQUE el ingrediente activo también comprende uno

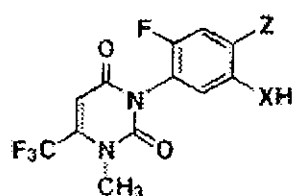
o más compuestos que se seleccionan entre el grupo que consiste en un inhibidor de acetil-CoA carboxilasa (ACC), inhibidor de acetolactato sintasa (ALS), amida, herbicida derivados de auxina, inhibidor del transporte de auxina, inhibidor de biosíntesis de carotenoides, inhibidor de enolpiruvilshikimato 3-fosfato sintasa (ESPS), inhibidor de glutamina sintetasa, inhibidor de biosíntesis de lípidos, inhibidor de mitosis, inhibidor de protoporfirinógeno IX oxidasa, inhibidor de fotosíntesis, agentes sinérgicos, hormona de crecimiento, inhibidor de biosíntesis de la pared celular y un herbicida conocido.

11. Un método para preparar un compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, CARACTERIZADO PORQUE comprende clorar un compuesto de ácido carboxílico representado por la fórmula 2 para dar un cloruro de ácido carboxílico, y hacerlo reaccionar con un compuesto de éster de aminoácido representado por la fórmula 3 para obtener el compuesto de uracilo:

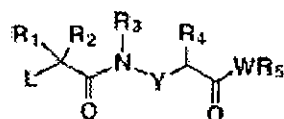


donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W son como se definen en la reivindicación 1.

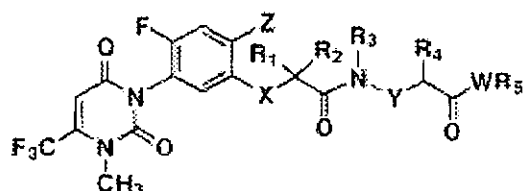
12. Un método para preparar un compuesto de uracilo representado por la fórmula 1, CARACTERIZADO PORQUE comprende realizar una reacción de sustitución nucleofílica de un compuesto representado por la fórmula 4 con un compuesto representado por la fórmula 5 en presencia de una base para obtener el compuesto de uracilo:



(4)



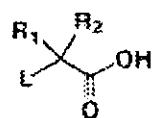
(5)



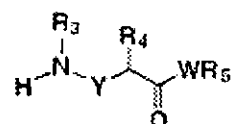
(1)

donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , X , Y , Z y W son como se definen en la reivindicación 1, y L representa un grupo saliente.

13. El método para preparar un compuesto de uracilo representado por la fórmula 1 de acuerdo con la reivindicación 12, CARACTERIZADO PORQUE el compuesto representado por la fórmula 5 se prepara por medio de los pasos de clorar un compuesto de ácido carboxílico representado por la fórmula 6 para dar un cloruro de ácido carboxílico y hacerlo reaccionar con un compuesto de éster de aminoácido representado por la fórmula 3:



(6)



(3)

donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , Y y W son como se definen en la reivindicación 1, y L representa un grupo saliente.



No. 11-040012- -00000-0000

Fecha: 2011-03-31 17:11:47

Tra. 11 PATENTEIYII

Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 DIR.NUEVASCR

Eve: 378 FASENACIONALI

Folios: 49

PATENTE DE INVENCION ☐

MODELO DE U' ☐

- ☐ Indicación que se solicita una patente.
 - ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
 - ☐ Descripción de la invención
 - ☐ Dibujos de ser estos pertinentes
 - ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
- Completa ☐ Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒

MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

- ☒ Indicación que se solicita una PCT
 - ☒ Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
 - ☐ Dibujos de ser estos pertinentes
 - ☒ Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
- Completa ☐ Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita Diseño industrial
 - ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
 - ☐ Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
 - ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas
- Completa ☐ Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

- ☐ Indicación que se solicita un esquema de trazado
 - ☐ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
 - ☐ Representación gráfica de un esquema de trazado
 - ☐ Comprobante de pago de las tasas establecidas
- Completa ☐ Incompleta ☐



Bogotá D.C.,
2020

Doctor(a)
CADENA SARMIENTO JUAN PABLO
Apoderado(a) y/o Representante de
DONGBU HITEK CO., LTD.

REFERENCIA	Radicación No.	11 040012
	Solicitud internacional	PCT/KR2009/5471
	Fecha inicio fase nacional	02/05/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	008135

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.
2. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Continúa en la página siguiente...