



Industria y Comercio

S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

PCT

21. EXPEDIENTE No.

06-98013

54. TÍTULO *Derivados de difluorometanosulfonil anilidas
útiles como herbicidas.*

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

CIN 4307

71. SOLICITANTE

Bayer CropScience AG

DOMICILIO

Monnheim, Alemania

74. APODERADO

Luis Patiño Leyva

22. BOGOTÁ, D. C., *28 de Septiembre de 2006*

*20/11/2006
V. 01-11-2006*

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.

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE AG

Dirección: Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Alemania

Nacionalidad o Domicilio: Monheim, Alemania

Lugar de Constitución: Alemania

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Cual

Número

③
REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: LUIS PATIÑO LEYVA

Dirección Cra. 11ª No. 94-76 - Of. 308

Teléfono: 6161948

Fax: 6163976

E-mail:

IDENTIFICACION

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☒

Cual

Número 2.930.616 TP 2698

④
INVENTOR (ES)
(72)

Nombre: ARAKI Koichi

Dirección: 2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi,

Nacionalidad o Domicilio: Ibaraki 300-1216, Japón

⑤ PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/002952

Fecha Marzo 19 de 2005

Publicación Internacional No. WO 2005/096818 A1

Fecha Octubre 20 de 2005

⑥ Título (54) DERIVADOS DE DIFLUOROMETANOSULFONIL ANILIDAS UTILES COMO HERBICIDAS.

⑦ Clasificación Internacional (51) A01N 43/54

⑧ PRIORIDAD:

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen

Japón

Japón

Japón

(32) Fecha

Abril 1, 2004

Julio 22, 2004

Diciembre 8, 2004

(31) Numero de Solicitud

2004-109197

2004-214777

2004-355616

⑨

Comprobante de pago No. 06 - 74,959

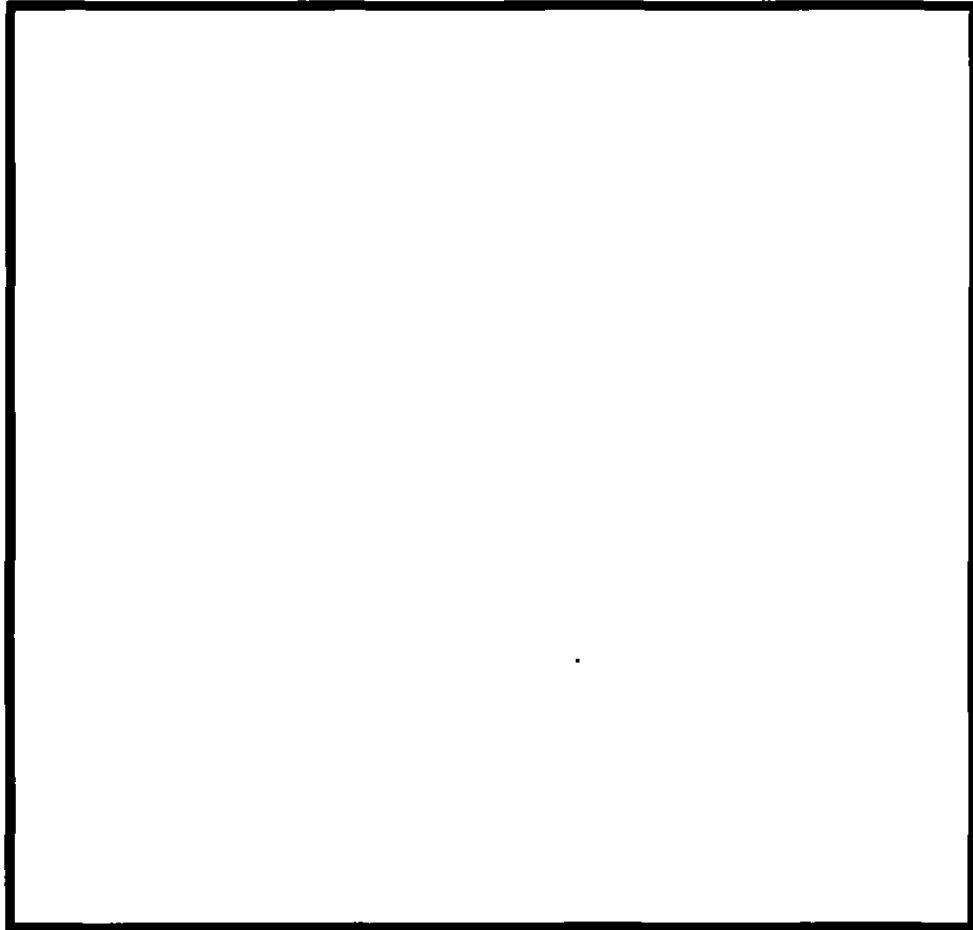
Fecha Septiembre 27 de 2006

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario , ver reverso de esta página.

ANEXOS

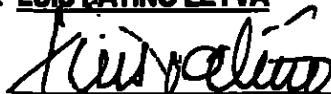
- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredite existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☒ Traducción del 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.
- ☒ Otros Reporte de Búsqueda Internacional.

(11) FIGURA CARACTERISTICA



(12) Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: LUIS PATIÑO LEYVA

FIRMA: 

C.C. 2.930.616 Bogotá T.P. 2898

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario , ver reverso de esta página.

Continuación nombre, dirección y domicilio de inventores:

<u>Nombre</u>	<u>Dirección</u>	<u>Domicilio</u>
KUDO Sachio	3-8-17, Kasuga, Tsukuba-shi,	Ibaraki 305-0821, Japón
SATO Yoshitaka	1-8-12, Hanahata, Tsukuba-shi,	Ibaraki 300-3261, Japón
ENDO Keiji	4233-4, Ami, Ami-machi, Inashiki-gun,	Ibaraki 300-0331, Japón
SHIRAKURA Shinichi	2-6-3, Ekihighashidouri, Oyama-shi,	Tochigi 323-0022, Japón
NAKAMURA Shin	4-4-8, Joto, Oyama-shi,	Tochigi 323-0807, Japón

Otros anexos que se acompañan a la solicitud.

Copia del formato PCT/RO/101 correspondiente a la solicitud internacional.

Copia del formato PCT/IB/304 correspondiente a la notificación relativa al envío o transmisión del documento de prioridad.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 08-098013- -00000-0000
Fee: 2006-09-20 16:35:37 Dep. 2020 NUECREACIONES
Trib. 11 PATENTE/VI
EVE: 379 FASENACIONALII
CALLE 144 BOGOTÁ (C/78) TEL: 379-1000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 ~ 74,959
FECHA : SEPTIEMBRE 27 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
NAMUEL MIRANDA	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	53371884	27/09/2006	2,313,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
		1	TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN
			TOTAL : 6
			463,000.00
			463,000.00

SOL: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

A ef. 58798

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

The undersigned Dr. Rudolf Weißert and Dr. Stephan Müller, acting on behalf of and representing of Bayer CropScience Aktiengesellschaft, domiciled at 40789 Monheim in Germany, hereby appoint(s) LUIS PATIÑO LEYVA and/or GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, domiciled in Bogotá D.C., Republic of Colombia, as our true and legal attorney with the necessary powers:

1) To apply to the administrative, judicial and police authorities of the Republic of Colombia, in any instance or appeal, for obtaining registration of patents, utility models, industrial models, as well as their assignments, extensions and changes of name; 2) To prepare, apply for, obtain, execute and register contracts, licenses, authorizations and registrations of any kind; 3) To intervene as plaintiff or defendant, in any instance or appeal, before any judge, court, tribunal, corporation, public officer or authority in any judicial, administrative or police action, caducity and nullity actions; recovery actions, actions arising from obtainment and working of license agreements; actions dealing with unfair competition; criminal actions; actions claiming indemnity for damages, complaints or remarks on patent matters; the performance of precautionary measures, and in any other similar action, measure or appeal related to patents.

To this effect, I (we) hereby authorize him to file applications, make descriptions, protests, amendments, declarations, oppositions, cancellations, appeals and claims; to pay taxes, quotas and liens as provided by Law; to waive or abandon granted rights or rights in process of being granted, to receive all kind of documents and securities; to issue the respective releases and, in general, to take, before said authorities, pertinent steps to the above mentioned purposes and take all measures they may deem advisable to protect my (our) interests, with all other necessary legal faculties, and I (we) hereby declare as good and valid whatever the attorneys should do to my (our) benefit.

This power comprises the authority to ratify or confirm on my (our) behalf any action, as well as the faculty of receiving, conciliating, desisting, transacting, compromising, substituting and revoking substitutions, taking notifications, and appointing judicial or extra-judicial attorneys.

Signed in Frankfurt on this 30th day of January of 2006.

Bayer CropScience Aktiengesellschaft


ppa. Dr. Rudolf Weißert
Patents and Licensing
Senior Patent Counsel

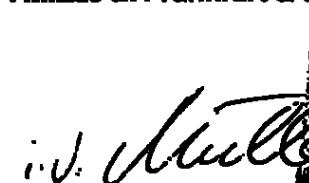
Yo (nosotros) Dr. Rudolf Weißert y Dr. Stephan Müller, obrando en nombre propio y representación de, Bayer CropScience Aktiengesellschaft, con domicilio en, 40789 Monheim, Alemania nombro(amos) a LUIS PATIÑO LEYVA y/o GUSTAVO HOLLMANN RESTREPO, con domicilio en Bogotá D.C., República de Colombia, Cra 11ª No 94-76, Oficina 308, apoderado verdadero y legal, con poder especial, amplio y suficiente:

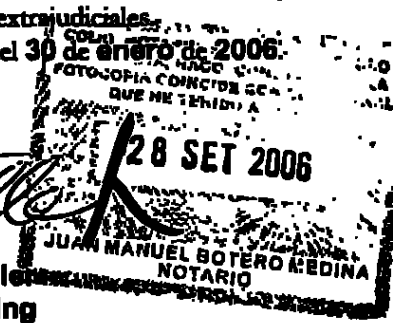
1) Para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, dibujos y modelos industriales, así como sus traspasos, prórrogas y cambios de nombre; 2) Elaborar, tramitar, solicitar, obtener, realizar, ejecutar y registrar contratos, licencias, autorizaciones y registros de cualesquiera clases; 3) Intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso y ante cualquier juez, entidad, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía; acciones reivindicatorias; acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias; acciones de competencia desleal, demandas penales y civiles; acciones de indemnización de perjuicios, reclamos, u observaciones a cualquier asunto sobre patentes; al ejercicio de medidas cautelares y cualesquiera otras acciones, medidas o recursos similares relacionados con patentes.

A este efecto, lo facultamos para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, apelaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la Ley; renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores dando al descargo respectivo, y en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeren conducentes al resguardo de mis (nuestros) intereses, con todas las facultades necesarias, y por este documento desde ahora declaro(amos) válido y bueno todo cuanto los apoderados hicieren en mi (nuestro) beneficio.

Este poder comprende la facultad de ratificar, o confirmar en mi (nuestro) nombre lo actuado, así como la facultad de recibir, conciliar, desistir, transigir, comprometer, sustituir y revocar sustituciones, recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

Firmado en Frankfurt el 30 de enero de 2006.


I.V. Dr. Stephan Müller
Patents and Licensing
Patent Counsel



**CERTIFICATION
COMPANIES**

The undersigned Dr. Norbert Schwenk certifies: that the preceding signature(s) reading **Dr. Rudolf Weißert and Dr. Stephan Müller** is (are) authentic; that the signer(s) at present fill(s) the position of **Prokurist and Authorized Signatory of Bayer CropScience Aktiengesellschaft**; that he (they) is (are) empowered to grant this power; and that said company exists, accomplishes its social object and is organized in **Germany** in accordance with the Laws of **Germany**.

All the foregoing facts are known to me due to my having examined the respective documents to which I attest.

Signed in Frankfurt on this 30th day of January of 2006.



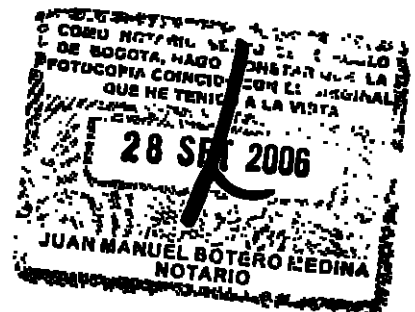
**Dr. Norbert Schwenk
Patents and Licensing
Senior Patent Counsel**

**CERTIFICACIÓN
SOCIEDADES**

El(la) infrascrito(a) **Dr. Norbert Schwenk** certifica: que la(s) firma(s) que antecede(n) y dice(n) **Dr. Rudolf Weißert y Dr. Stephan Müller** es (son) auténtica(s); que el (los) signatario(s) desempeña(n) actualmente el cargo(s) de **Prokurist y Authorized Signatory de Bayer CropScience Aktiengesellschaft**; que tiene(n) facultad para otorgar este poder; y que dicha compañía existe, cumple su objeto social y está organizada en **Alemania** conforme a las **Leyes de Alemania**.

Todos los hechos anteriores le constan, por haber examinado los documentos respectivos y de todo ello da fe.

Firmado en Frankfurt el 30 de enero de 2006.



Nummer 31 der Urkundenrolle für das Jahr 2006

Die vorstehenden, vor mir anerkannten Unterschriften von

- 1.) Herrn Dr. Rudolph Weißert,
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung, 65926 Frankfurt/M.
- 2.) Herrn Dr. Stephan Müller,
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung, 65926 Frankfurt/M

-die Parteien 1.) - 2.) sämtlich von Person bekannt-

beglaubige ich hiermit amtlich.

In meiner Eigenschaft als Notar bestätige ich ferner die Unterschriftsberechtigung der Herren Dr. Müller und Dr. Weißert für die Bereiche Patente und Lizenzen der Firma Bayer CropScience AG, 40789 Monheim, erteilt am 17. November 2004 durch die Firma Bayer CropScience AG, Monheim.

Ferner beglaubige ich hiermit amtlich die vorstehende vor mir anerkannte Unterschrift von

Herrn Dr. Norbert Schwenk,
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung, 65926 Frankfurt/M.

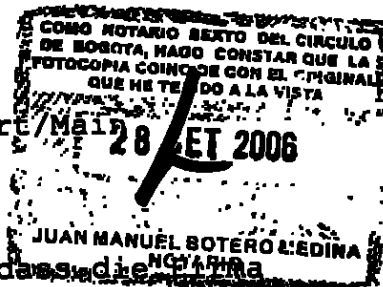
-von Person bekannt-

und bestätige in meiner Eigenschaft als Notar, dass die Firma Bayer CropScience AG, Monheim, mit Sitz in 40789 Monheim im Handelsregister von Düsseldorf unter HRB Nr. 46985 eingetragen ist und Dr. Norbert Schwenk in seiner Eigenschaft als Handlungsbevollmächtigter der Firma Bayer CropScience AG, Monheim, Bevollmächtigung erteilt am 17. November 2004 durch die Firma Bayer CropScience AG, Monheim, als Zeuge vorstehend seine Unterschrift geleistet hat.

Eine Vorbeurteilung im Sinne des § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG liegt nicht vor.

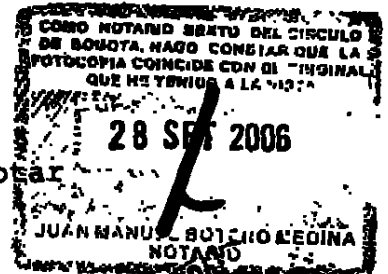
Frankfurt/M. - Höchst, den 02. Februar 2006

Armin Knipfer, Notar



Kostenrechnung-Wert:	€ 5.000,00
Geb. \$ 45 I KostO	€ 10,50
Geb. \$ 150 KostO	€ 13,00
16 % Mehrwertsteuer	€ 3,76
	€ 27,26


Armin Knipfer, Notar



APOSTILLE

(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Armin Knipfer
3. in seiner Eigenschaft als amtlich bestellter Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des(der) Notars

Bestätigt

5. in Frankfurt/Main
6. am 03.02.06
7. durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Ea A 1309
9. Siegel/Stempel
10. Unterschrift

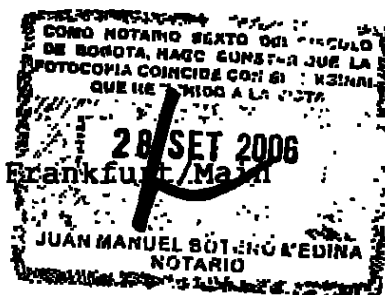



I.V. Franke

Registro Notarial Número 31 para el año 2006

Autentico oficialmente las firmas que aparecen anteriormente, las cuales fueron reconocidas en mi presencia como las suyas propias por

- 1) Señor Doctor Rudolph Weißert,
domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH
Departamento de Patentes y Licencias, 65926 Frankfurt/Main
- 2) Señor Doctor Stephan Müller,
domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH
Departamento de Patentes y Licencias, 65926 Frankfurt/Main



Las personas señaladas en 1) y 2) son conocidas personalmente por el suscrito Notario

En mi calidad de Notario, confirmo además la autorización que tienen los Señores Doctor Müller y Doctor Weißert para firmar en nombre y representación del Departamento de Patentes y Licencias de la compañía Bayer CropScience AG, domiciliada en 40789 Monheim, autorización la cual otorgada el 17 de Noviembre de 2004 por la compañía Bayer CropScience AG, domiciliada en Monheim.

Además autentico oficialmente la firma que aparece anteriormente, reconocida en mi presencia como la suya propia por el

Señor Doctor Norbert Schwenk,
domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH
Departamento de Patentes y Licencias, 65926 Frankfurt/Main

quien es conocido personalmente por el suscrito Notario,

y en mi calidad de Notario confirmo que la compañía Bayer CropScience AG, domiciliada en 40789 Monheim, se encuentra inscrita en el Registro Comercial HRB No. 46985 del Juzgado Municipal de Düsseldorf y que el Señor Doctor Norbert Schwenk como Apoderado de la compañía Bayer CropScience AG, domiciliada en Monheim, mediante poder otorgado el 17 de Noviembre de

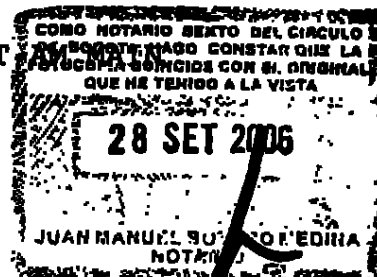
2004 por la compañía Bayer CropScience, domiciliada en Monheim, ejecutó aquí su firma en calidad de testigo.

No existe ningún impedimento en el sentido del Artículo 3 inciso 1 No. 7 de la Ley Federal de Notarización.

Frankfurt am Main-Höchst, 02 de Febrero de 2006

ARMIN KNIPFER, NOTARIO EN FRANKFURT

(Firma y Sello Oficial)



Nota de gastos

Valor del negocio: 5.000,00 EUROS

Impuesto Artículo 45 I Disposición de Impuestos 10,50 EUROS

Impuesto Artículo 150 Disposición de Impuestos 13,00 EUROS

16% I.V.A. 3,76 EUROS

Total: 27,26 EUROS

Armin Knipfer, Notario en Frankfurt am Main (Firma)

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por: Armin Knipfer
3. En su calidad de: Notario nombrado oficialmente
4. Y lleva el sello oficial del: Notario

Confirmado

5. En: Frankfurt am Main
6. El día: 03.02.06
7. Por: El Señor Presidente del Tribunal Regional
8. Bajo el No.: 91 Ea A 1309
9. Sello: EL PRESIDENTE DEL TRIBUNAL REGIONAL EN
FRANKFURT AM MAIN
10. Firma: En representación: Franke

Adolf Watzke

ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

Adolfo Warkke
Nº 16315
FIRMA PARA CANCELAR EL
DOCUMENTO DESEMPENADO
LAS SUCESIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2006 FEB 20 A 11: 53
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
28 SET 2006
JUAN MANUEL...

58798

11

Los suscritos
(We, the undersigned)

1. ARAKI, Koichi, con domiciliado en Ibaraki, Japan
2. KUDO, Sachio, con domiciliado en Ibaraki, Japan
3. SATO, Yoshitaka, con domiciliado en Ibaraki, Japan
4. ENDO, Keiji, con domiciliado en Ibaraki, Japan
5. SHIRAKURA, Shinichi, con domiciliado en Tochigi, Japan
6. NAKAMURA, Shin, con domiciliado en Tochigi, Japan

declaramos que somos los inventores de la invención que lleva el título
(declare that we are the inventors of the invention titled)

"Derivados de difluorometanosulfonil anilidas útiles como herbicidas"
(Difluoromethanesulfonyl anilide derivatives useful as herbicides)

y que hemos cedido el derecho sobre esta invención en Colombia, junto con los privilegios y
(and that we have assigned our rights over this invention in Colombia, together with its privileges and)

anexidades a favor de Bayer CropScience AG, domiciliada en Monheim, Alemania
(attachments, to Bayer CropScience AG, domiciled in Monheim, Germany)

SIGNATURES OF ASSIGNORS

Signed at Ibaraki, Japan
on August 21, 2006

FIRMA DE LOS CEDENTES

Firmado en
el

1. Koichi Araki
ARAKI, Koichi

2. Sachio Kudo
KUDO, Sachio

3. Yoshitaka
SATO, Yoshitaka

4. Keiji
ENDO, Keiji

5. Shinichi
SHIRAKURA, Shinichi

6. Shin Nakamura
NAKAMURA, Shin

Bayer CropScience AG

ppa. Dr. Weißert

SIGNATURE OF ASSIGNEE
Signed at Frankfurt
on August 4, 2006

ppa. Dr. Weißert
Patents & Licensing
Senior Patent Counsel

i.V. Dr. Schwenk

FIRMA DEL CESIONARIO
Firmado en Frankfurt
el Agosto 4, 2006

i.V. Dr. Schwenk
Patents and Licensing
Patent Counsel

To be notarized + legalized (Apostille)



NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Masako Sato, an agent of Koichi Araki, Sachio Kudo, Yoshitaka Sato, Keiji Endo, Shinichi Shirakura and Shin Nakamura, stated in my very presence that said Koichi Araki, Sachio Kudo, Yoshitaka Sato, Keiji Endo, Shinichi Shirakura and Shin Nakamura acknowledge themselves to have signed to the attached ASSIGNMENT DOCUMENT.

Dated this 24th day of August, 2006



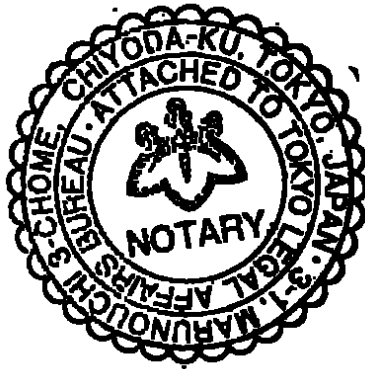
Yukio Goto

YUKIO GOTO

NOTARY

3-1, Marunouchi 3-chome,
Chiyoda-ku, Tokyo, Japan

Attached to
Tokyo Legal Affairs Bureau



同綴の譲渡証における作成名義人荒木恒一、工藤祐夫、佐藤善孝、遠藤恵次、白倉伸一及び中村新の代理人佐藤雅子は、当職の面前で、各本人が作成名義人の署名を自認していると陳述した。以下余白

よって、これを認証する。

平成18年 8月 24日、本公証人役場において

東京都千代田区丸の内三丁目3番1号
東京法務局所属

公 証 人
Notary

五島 幸雄

YUKIO GOTO
明

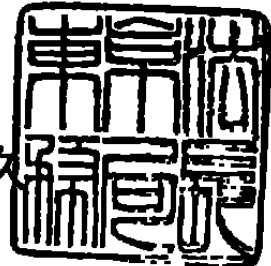
証

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違ないものであり、かつ、その押印は、真実のものであることを証明する。

平成18年 8月 24日

東京法務局長

戸田 信久



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: JAPAN

This public document

2. has been signed by

YUKIO GOTO

3. acting in the capacity of Notary of the Tokyo Legal Affairs Bureau

4. bears the seal/stamp of

Certified

5. at Tokyo

6. AUG. 24, 2006

7. by the Ministry of Foreign Affairs

8. 06- No 024670

9. Seal/stamp:

10. Signature



K. Oyabe

Kazutoyo OYABE

For the Minister for Foreign Affairs

Nummer 438 der Urkundenrolle für das Jahr 2006

Die vorstehenden, vor mir anerkannten Unterschriften von

- 1.) Herrn Dr. Rudolf Weißert
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung, 65926 Frankfurt/M.
- 2.) Herrn Dr. Norbert Schwenk
dienstansässig: Bayer CropScience GmbH
Patent- und Lizenzabteilung, 65926 Frankfurt/M.

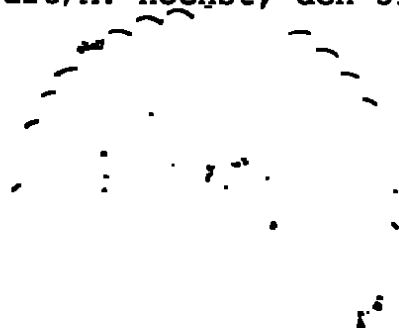
-die Parteien 1.) und 2.) von Person bekannt-

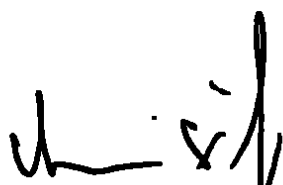
beglaubige ich hiermit amtlich.

In meiner Eigenschaft als Notar bestätige ich ferner die Unterschriftsberechtigung der Herren Dr. Schwenk und Dr. Weißert für die Bereiche Patente und Lizenzen der Firma Bayer CropScience AG, 40789 Monheim, erteilt am 17. November 2004 durch die Firma Bayer CropScience AG, Monheim.

Eine Vorbefassung im Sinne des § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG liegt nicht vor.

Frankfurt/M.-Höchst, den 31. August 2006




Armin Knipfer, Notar

Kostenrechnung-Wert:	€ 5.000,00
Geb. \$ 45 I KostO	€ 10,50
Geb. \$ 150 I KostO	€ 13,00
16 % Mehrwertsteuer	€ 3,76
	€ 27,26
	=====


Armin Knipfer, Notar

APOSTILLE

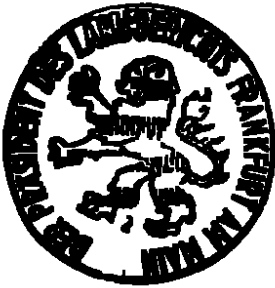
(Convention de la Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
2. ist unterschrieben von Armin Knipfer
3. in seiner Eigenschaft als amtlich bestellter Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stempel des(der)
Notars



Bestätigt

5. in Frankfurt/Main
6. am 04.09.06
7. durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts
8. unter Nr. 91 Ea A 7850
9. Siegel/Stempel
10. Unterschrift



franke
i.V. Franke

[Traducción Oficial del Alemán]

Registro Notarial Número 438 para el año 2006

Autentico oficialmente mediante este documento las firmas que aparecen anteriormente, reconocidas en mi presencia como las suyas propias por

- 1) Señor Doctor Rudolf Weißert,
domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH
Departamento de Patentes y Licencias, 65926 Frankfurt/Main
- 2) Señor Doctor Norbert Schwenk,
domicilio comercial: Bayer CropScience GmbH
Departamento de Patentes y Licencias, 65926 Frankfurt/Main

Las personas mencionadas en los numerales 1) y 2) son conocidas personalmente por el suscrito Notario.

En mi calidad de Notario confirmo además que los Señores Doctor Schwenk y Doctor Weißert se encuentran autorizados para firmar en nombre y representación del Departamento de Patentes y Licencias de la compañía Bayer CropScience AG, domiciliada en 40789 Monheim, de conformidad con la autorización otorgada el 17 de Noviembre de 2004 por la compañía Bayer CropScience AG domiciliada en Monheim.

No existe impedimento alguno en el sentido del Artículo 3 inciso 1 No. 7 de la Ley de Notarización.

Frankfurt/Main-Höchst, 31 de Agosto de 2006

ARMIN KNIPFER, NOTARIO EN FRANKFURT AM MAIN

(Firma y Sello Oficial)

Nota de gastos:

Valor del negocio: 5.000,00 EUROS

Impuesto Artículo 45 Disposición Impuestos 10,50 EUROS

Impuesto Artículo 150 Disposición Impuestos 13,00 EUROS

16% I.V.A. 3,76 EUROS

Total: 27,26 EUROS

Armin Knipfer, Notario en Frankfurt am Main

(Firma)

APOSTILLA

(Convención de La Haya del 5 de Octubre de 1961)

1. País: República Federal de Alemania
Este documento público
2. Ha sido firmado por: Armin Knipfer
3. En su calidad de: Notario nombrado oficialmente
4. Y lleva el sello oficial: Del Notario

Confirmado

5. En: Frankfurt am Main
6. El día: 04.09.06
7. Por: El Señor Presidente del Tribunal Regional
8. Bajo el No.: 91 Ea A 7850
9. Sello: El Presidente del Tribunal Regional en
Frankfurt am Main
10. Firma: En representación: Franke



ADOLF WATZKE
Traductor Oficial
Res. 2433 Minjusticia

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
Adolfo A. A. 34e.
490513

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2006 SET 25 P 12:45

UCS
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
20 October 2005 (20.10.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/096818 A1

(51) International Patent Classification⁷: A01N 43/54,
C07D 239/52, A01N 43/60, C07D 251/20

Tochigi 323-0022 (JP). NAKAMURA, Shin [JP/JP];
4-4-8, Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0807 (JP).

(21) International Application Number:
PCT/EP2005/002952

(74) Agent: SCHWENK, Norbert; c/o Bayer CropScience
GmbH Law and Patents, Building K 607, 65926 Frankfurt
(DE).

(22) International Filing Date: 19 March 2005 (19.03.2005)

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA,
ZM, ZW.

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
2004-109197 1 April 2004 (01.04.2004) JP
2004-214777 22 July 2004 (22.07.2004) JP
2004-355616 8 December 2004 (08.12.2004) JP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER
CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): ARAKI,
Koichi [JP/JP]; 2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi, Ibaraki
300-1216 (JP). KUDO, Sachio [JP/JP]; 3-8-17, Kasuga,
Tsukuba-shi, Ibaraki 305-0821 (JP). SATO, Yoshitaka
[JP/JP]; 1-8-12, Hanahata, Tsukuba-shi, Ibaraki 300-3261
(JP). ENDO, Keiji [JP/JP]; 4233-4, Ami, Ami-machi,
Inashiki-gun, Ibaraki 300-0331 (JP). SHIRAKURA,
Shinichi [JP/JP]; 2-6-3, Ekihigashidouri, Oyama-shi,

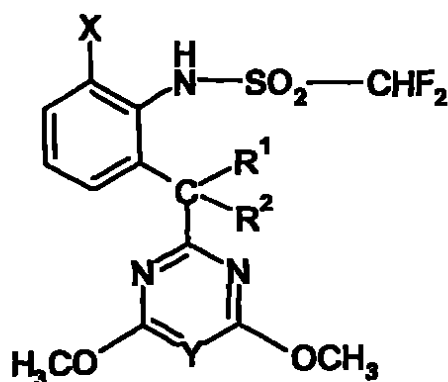
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,
SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

— with international search report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(54) Title: DIFLUOROMETHANESULFONYL ANILIDE DERIVATIVES USEFUL AS HERBICIDES



(1)

(57) Abstract: Novel difluoromethanesulfonamide derivatives of the formula (I) Difluoromethanesulfonamide derivatives represented by the formula wherein X represents halogen, Y represents CH or N, R¹ represents hydrogen, and R² represents hydrogen or hydroxy, or R¹ and R² together may form C≡O with the carbon atom to which they are bonded, and their use as herbicide for paddy field weeds.

DIFLUOROMETHANESULFONYL ANILIDE DERIVATIVES USEFUL AS HERBICIDES

The present invention relates to novel difluoromethanesulfonamide derivatives, to process for their preparation and to their use as herbicides.

It has been already known that certain sulfonamide derivatives show an action as herbicide (for example, WO 93/09099, WO 96/41799, Japanese Laid-open Patent Application No. 60562/1999 and Japanese Laid-open Patent Application No. 44546 /2000).

In developing a herbicide, a problem of controlling weeds which express resistance against existing herbicides, for example, SU resistant weeds (sulfonyleurea resistant weeds) has been recently taken up as one of the important subjects. The development of an herbicide, that can control these resistant weeds and other annual and perennial weeds at the same time with a single ingredient, has been requested.

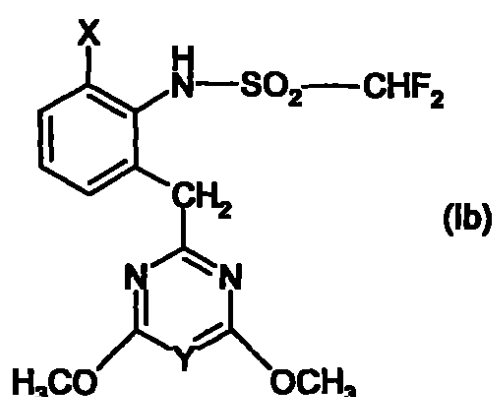
According to the invention there have been found the following compounds of formula (I)

wherein

X, Y, R¹ and R² have the same definition as aforementioned,
are reacted with difluoromethanesulfonyl chloride in the presence of inert solvents,
and if appropriate, in the presence of an acid binding agent,
or

b) In case that R¹ and R² together with the carbon atom to which they are
bonded form C=O:

compounds of the formula (Ib)

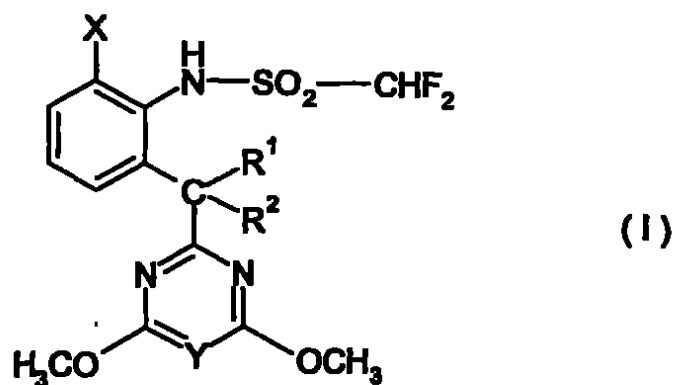


wherein

X and Y have the same definition as aforementioned,
are reacted with an oxidizing agent in the presence of inert solvents, and if
appropriate, in the presence of an acid catalyst,

or

c) In case that R¹ represents hydrogen, and R² represents hydroxy:
compounds of the formula (Ic)



wherein

X represents halogen,

Y represents CH or N,

R¹ represents hydrogen, and

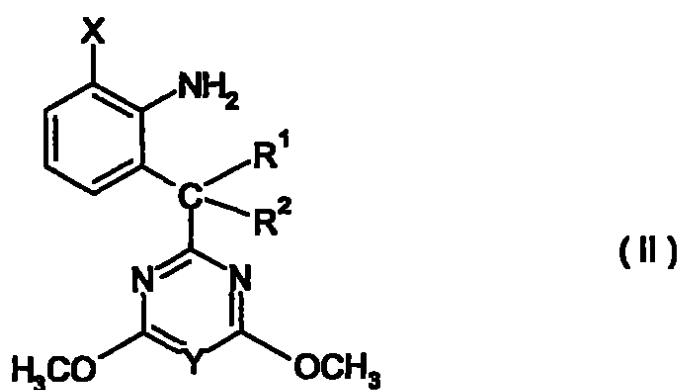
R² represents hydrogen or hydroxy, or

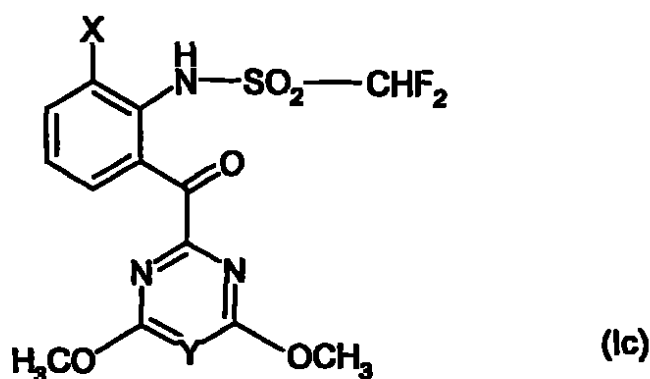
R¹ and R² together with the carbon atom to which they are bonded may form

C=O.

The compounds of the formula (I), according to the invention, can be obtained by a process in which

a) compounds of the formula (II)





wherein

X and Y have the same definition as aforementioned,
are reacted with an alkali metal hydride complex compound or a borane complex
in the presence of inert solvents.

The difluoromethanesulfonamide derivatives of the formula (I), according to the
present invention show strong herbicidal activities.

Though the difluoromethanesulfonamide derivatives of the formula (I) are
included conceptually in the compounds of the general formula described in
WO 96/41799, the compounds of the formula (I) are novel compounds, which are
not specifically disclosed in said reference. And the compounds of the formula (I)
unexpectedly show an extremely strong herbicidal action, compared with known
compounds with similar structure described specifically in WO 96/41799. They
show remarkably excellent herbicidal action particularly against paddy field weeds
and at the same time show excellent herbicidal effect against sulfonylurea resistant
weeds, which is a biological effect that is not described in WO 96/41799.

The difluoromethanesulfonamide derivatives of the formula (I), according to

present invention are, therefore, useful particularly as herbicides for paddy field.

In the present specification, "halogen" represents fluorine, chlorine, bromine or iodine, preferably represents fluorine or chlorine.

In the compounds of the aforementioned formula (I), preferably,

X represents fluorine or chlorine,

Y represents CH or N,

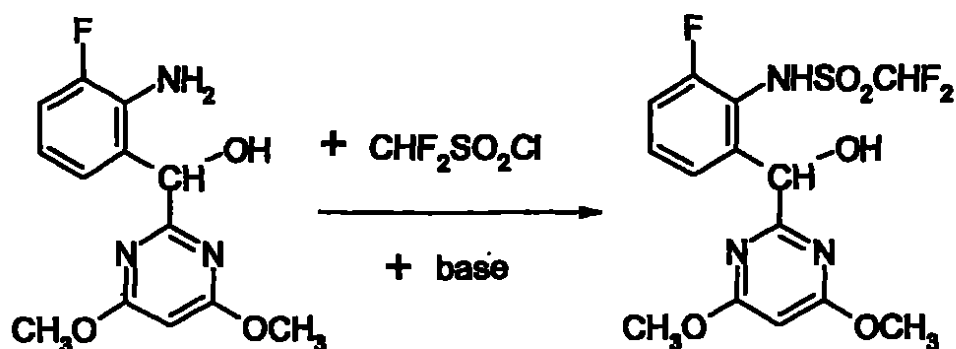
R¹ represents hydrogen, and

R² represents hydrogen or hydroxy, or

R¹ and R² together may form C=O with the carbon atom to which they are bonded.

The aforementioned preparation process (a) can be illustrated by the following reaction scheme in case that, for example,

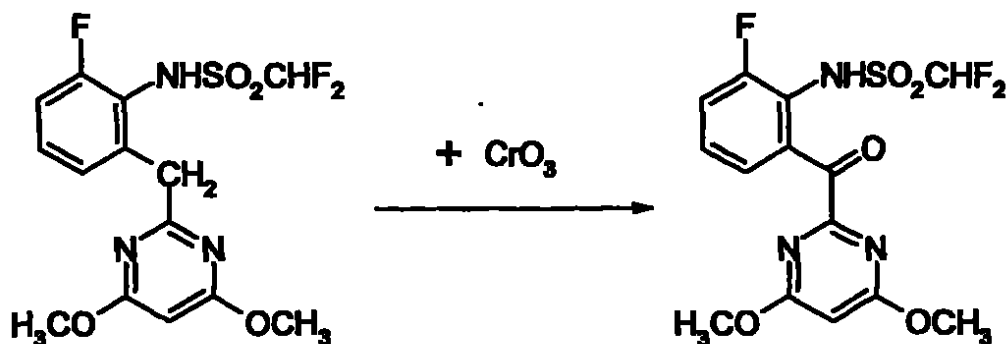
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-hydroxymethyl]aniline and difluoromethanesulfonyl chloride are used as the starting materials.



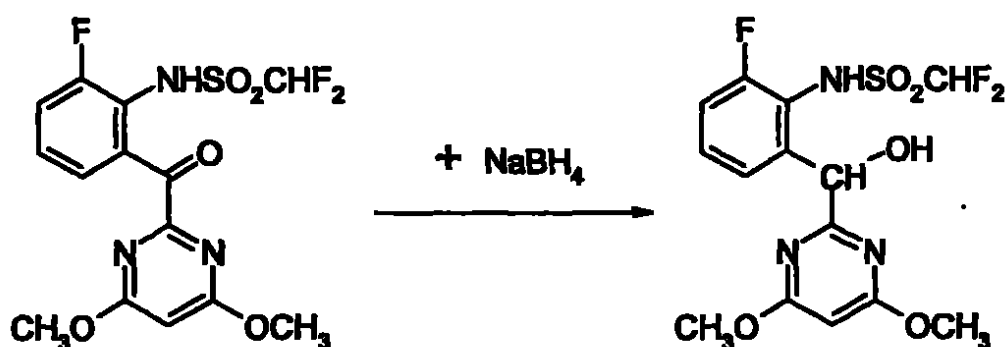
The aforementioned preparation process (b) can be illustrated by the following reaction scheme in case that, for example

2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide is

used as the starting material and chromium (VI) oxide is used as oxidizing agent.



The aforementioned preparation process (c) can be illustrated by the following reaction scheme in case that, for example 2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-carbonyl]-N-difluoromethanesulfonamide is used as the starting material and sodium borohydride is used as alkali metal hydride complex compound.

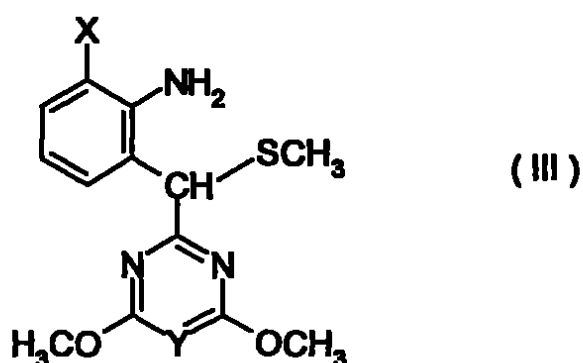


The compounds, in case that R¹ and R² together form C=O with the carbon atom to which they are bonded, in the compounds of the formula (II) used as the starting materials in the aforementioned preparation process (a), include the known compounds described in WO 96 /41799 and can be easily prepared, for

example, according to the process described in said reference.

Further, the compounds, in case that R^1 represents hydrogen and R^2 represents hydroxy in the compounds of the aforementioned formula (II), include known compounds described in Japanese Laid-open Patent Application No. 60562/1999 and can be easily prepared, for example, by reacting the compounds, in case that R^1 and R^2 together with the carbon atom to which they are bonded form $C=O$, in the aforementioned formula (II), with a metal hydride complex compound, for example, sodium borohydride, lithium aluminium hydride, etc., according to the process described in the same reference.

The compounds, in case that R^1 and R^2 both represent hydrogen in the compounds of the aforementioned formula (II), include known compounds described in WO 96/41799 and can be easily prepared, for example, by reacting a compound of the formula



wherein

X and Y have the same definition as aforementioned,

with a reducing agent, for example, sodium borohydride in the presence of nickel

(II) chloride, or by reacting with Raney nickel, according to the process described in the same literature.

The compounds of the above-mentioned formula (III) include the known compounds described in the aforementioned patent references and can be easily prepared, for example, according to the process described in the same literature.

As specific examples of the compounds of the formula (II), used as the starting materials in the aforementioned preparation process (a), the following can be mentioned:

2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]aniline,

2-iodo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]aniline,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)hydroxymethyl]aniline,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]aniline,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]aniline, and so on.

The compounds of the formula (Ib), used as the starting materials in the aforementioned preparation process (b), correspond to a part of the compounds of the formula (I) of the present invention which can be prepared by the aforementioned preparation process (a) and as their specific examples the following can be mentioned:

2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
and so on.

As oxidizing agent used for the oxidation of the compounds of the above-mentioned formula (Ib) in the aforementioned preparation process (b) there can be mentioned, for example, chromium (VI) oxide, manganese dioxide, selenium dioxide, selenium dioxide and so on.

The compounds of the formula (Ic), used as starting materials in the aforementioned preparation process (c), correspond to a part of the compounds of the formula (I) of the present invention which can be prepared by the aforementioned preparation processes (a) or (b) and as their specific examples the following can be mentioned:

2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-bromo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-iodo-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonanilide,
etc.

As alkali metal hydride complex compounds used for the hydrogenation of the compounds of the formula (Ic) in the aforementioned preparation process (c) there can be mentioned, for example, sodium borohydride, lithium aluminium hydride, etc., and as borane complex there can be mentioned, for example, dimethyl sulfide borane, pyridine-borane, and so on.

The reaction of the above-mentioned preparation process (a) can be conducted in an appropriate diluent. As examples of the diluent used in that case there can be mentioned aliphatic, alicyclic and aromatic hydrocarbons (may be optionally chlorinated), for example, pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, ligroine, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, 1,2-dichloroethane, chlorobenzene, dichlorobenzene, etc.; ethers, for example, ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane,

dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), diethylene glycol dimethyl ether (DGM), etc.; ketones, for example, acetone, methyl ethyl ketone (MEK), methyl isopropyl ketone, methyl isobutyl ketone (MIBK), etc.; nitriles, for example, acetonitrile, propionitrile, etc.; esters, for example, ethyl acetate, amyl acetate, etc.; bases, for example, pyridine etc.

The preparation process (a) can be conducted in the presence of an acid binding agent. As said acid binder there can be mentioned, as inorganic base, hydrides, hydroxides, carbonates, bicarbonates, etc. of alkali metals and alkaline earth metals, for example, sodium hydride, lithium hydride, sodium hydrogen carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium carbonate, potassium carbonate, lithium hydroxide, sodium hydroxide, potassium hydroxide, calcium hydroxide, etc.; inorganic alkali metal amides, for example, lithium amide, sodium amide, potassium amide, etc.; as organic base, tertiary amines, dialkylaminoanilines and pyridines, for example, triethylamine, 1,1,4,4-tetramethylethylenediamine (TMEDA), N,N-dimethylaniline, N,N-diethylaniline, pyridine, 4-dimethylaminopyridine (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octane (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-ene (DBU), etc.

The preparation process (a) can be conducted in a substantially wide range of temperature. It is preferable, however, to conduct it at the temperatures in the range of generally about -100 to about 60°C, particularly about -80 to about 40°C. Although said reaction is conducted desirably under normal pressure, it can be operated optionally under elevated pressure or under reduced pressure.

In conducting the preparation process (a), the aimed compound can be

obtained, for example, by reacting 1 to 5 moles of difluoromethanesulfonyl chloride to 1 mole of the compound of the formula (II) in a diluent, for example, dichloromethane, in the presence of 1 to 5 moles of pyridine.

The reaction of the above-mentioned preparation process (b) can be conducted in an appropriate diluent. As examples of the diluent used in that case there can be mentioned water; aliphatic, alicyclic and aromatic hydrocarbons (may be optionally chlorinated), for example, hexane, cyclohexane, ligroine, toluene, xylene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, 1,2-dichloroethane, chlorobenzene, etc.; ethers, for example, ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), diethylene glycol dimethyl ether (DGM), etc.; ketones, for example, acetone, methyl ethyl ketone (MEK), methyl isopropyl ketone, methyl isobutyl ketone (MIBK), etc.; nitriles, for example, acetonitrile, propionitrile, acrylonitrile, etc.; esters, for example, ethyl acetate, amyl acetate, etc.; acid amides, for example, dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide (DMA), N-methylpyrrolidone, 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone, hexamethyl phosphoric triamide (HMPA), etc.; sulfones and sulfoxides, for example, dimethyl sulfoxide (DMSO), sulfolane, etc.; bases, for example, pyridine etc.; acids, for example, acetic acid etc.

The preparation process (b) can be conducted in the presence of an acid catalyst and as examples of said acid catalyst there can be mentioned mineral acids, for example, hydrochloric acid, sulfuric acid, nitric acid, hydrobromic acid, sodium hydrogen sulfite, etc.; organic acids, for example, formic acid, acetic acid, trifluoroacetic acid, propionic acid, methanesulfonic acid, benzenesulfonic acid,

p-toluenesulfonic acid, etc.

The preparation process (b) can be conducted in a substantially wide range of temperature. It is preferable, however, to conduct it at the temperatures in the range of generally about -100 to about 150°C, particularly about 20 to about 120°C. Although said reaction is conducted desirably under normal pressure, it can be operated optionally under elevated pressure or under reduced pressure.

In conducting the preparation process (b), the aimed compound can be obtained, for example, by reacting 1 to 10 moles of chromium (VI) oxide to 1 mole of the compound of the formula (Ib) in a diluent, for example, acetic acid.

The reaction of the above-mentioned preparation process (c) can be conducted in an appropriate diluent. As examples of the diluent used in that case there can be mentioned water, aliphatic, alicyclic and aromatic hydrocarbons (may be optionally chlorinated), for example, pentane, hexane, cyclohexane, petroleum ether, ligroine, benzene, toluene, xylene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, 1,2-dichloroethane, chlorobenzene, dichlorobenzene, etc.; ethers, for example, ethyl ether, methyl ethyl ether, isopropyl ether, butyl ether, dioxane, dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF), diethylene glycol dimethyl ether (DGM), etc.; nitriles, for example, acetonitrile, propionitrile, etc.; alcohols, for example, methanol, ethanol, isopropanol, butanol, ethylene glycol, etc.; esters, for example, ethyl acetate, amyl acetate, etc.; acid amides, for example, dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide (DMA), N-methylpymoldone, 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone, hexamethyl phosphoric triamide (HMPA), etc.; sulfones and sulfoxides, for example, dimethyl sulfoxide (DMSO), sulfolane, etc.;

bases, for example, pyridine etc.

The preparation process (c) can be conducted in a substantially wide range of temperature. It is preferable, however, to conduct it at the temperatures in the range of generally about -100 to about 60°C , particularly about -80 to about 40°C . Although said reaction is conducted desirably under normal pressure, it can be operated optionally under elevated pressure or under reduced pressure.

In conducting the preparation process (c), the aimed compound can be obtained, for example, by reacting 0.25 to 2 moles of sodium borohydride to 1 mole of the compound of the formula (III) in a diluent, for example, methanol.

All plants and plant parts can be treated in accordance with the invention. Plants are to be understood as meaning in the present context all plants and plant populations such as desired and undesired wild plants or crop plants (including naturally occurring crop plants). Crop plants can be plants which can be obtained by conventional plant breeding and optimization methods or by biotechnological and recombinant methods or by combinations of these methods, including the transgenic plants and inclusive of the cultivars protectable or not protectable by plant breeders' rights. Plant parts are to be understood as meaning all parts and organs of plants above and below the ground, such as shoot, leaf, flower and root, examples which may be mentioned being leaves, needles, stalks, stems, flowers, fruit bodies, fruits, seeds, roots, tubers and rhizomes. The plant parts also include harvested material, and vegetative and generative propagation material, for example cuttings, tubers, rhizomes, offsets and seeds.

Treatment according to the invention of the plants and plant parts with the active compounds is carried out directly or by allowing the compounds to act on their surroundings, environment or storage space by the customary treatment methods, for example by immersion, spraying, evaporation, fogging, scattering, painting on and, in the case of propagation material, in particular in the case of seeds, also by applying one or more coats.

The active compounds of the aforementioned formula (I), according to the present invention, can be used particularly against paddy field weeds. As examples of the paddy field weeds that can be controlled by using the active compounds, according to the present invention, there can be mentioned the following:

Dicotyledonous plants of the following genera: *Polygonum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Bidens, Dapatrium, Eclipta, Elatine, Gratiola, Lindernia, Ludwigia, Oenanthë, Ranunculus, Deinostema, etc.*

Monocotyledonous plants of the following genera: *Echinochloa, Panicum, Poa, Cyperus, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Alisma, Anellema, Blyxa, Eriocaulon, Potamogeton, etc.*

The active compounds of the aforementioned formula (I), according to the present invention, can be used specifically relating to, for example, the following representative paddy field weeds:

Plant name in Latin

Dicotyledonous plants:

Rotala indica Koehne

Lindernia procumbens Philcox

Lindernia dubia L. Penn.

Lindernia angustifolia

Ludwigia prostrata Roxburgh

Potamogeton distinctus A. Benn

Elatine triandra Schk

Oenanthë javanica

Monocotyledonous plants:

Echinochloa oryzicola Vasing

Eleocharis acicularis L.

Eleocharis kuroguwai Ohwi

Cyperus difformis L.

Cyperus serotinus Rottboel

Scirpus juncoides Roxburgh

Monochoria vaginalis Presl

Sagittaria pygmaea Miq

Alisma canaliculatum A. Br. Et Bouche

Sagittaria trifolia

Monochoria korsakowii

Moreover, the active compounds of the aforementioned formula (I), according to the present invention, can be effectively used also against, for example, the aforementioned weeds that show resistance against sulfonylurea type herbicides.

The use of the active compounds of the aforementioned formula (I), according to the present invention, however, is not restricted to the use against these kinds of weeds but can be applied against other kinds of paddy field weeds and other weeds than the sulfonylurea type herbicide resistant weeds in a similar manner.

The active compounds, according to the present invention, can be formulated into customary formulation forms on actual application. As such formulation forms there can be mentioned, for example, solutions, wettable powders, emulsions, suspensions, powders, water dispersible granules, tablets, granules, suspo-emulsion concentrates, microcapsules in polymer substance, jumbo formulations, etc.

These formulations can be prepared by per se known methods, for example, by mixing the active compounds with extenders, namely liquid or solid diluents or carriers, and optionally with surface-active agents, namely emulsifiers and/or dispersants and/or foam-forming agents.

As liquid diluents or carriers there can be mentioned, for example, aromatic hydrocarbons (for example, xylene, toluene, alkyl-naphthalene, etc.), chlorinated aromatic or chlorinated aliphatic hydrocarbons (for example, chlorobenzenes, ethylene chlorides, methylene chloride, etc.), aliphatic hydrocarbons [for example, cyclohexane etc. or paraffins (for example, mineral oil fractions etc.)], alcohols (for example, butanol, glycols, etc.) and their ethers, esters, etc., ketones (for example, acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, cyclohexanone, etc.), strongly polar solvents (for example, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, etc.), water, etc.

In case that water is used as extender, for example, organic solvents can be used as auxiliary solvents.

As solid diluents or carriers there can be mentioned, for example, ground natural minerals (for example, kaolin, clay, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite, diatomaceous earth, etc.), ground synthetic minerals (for example, highly dispersed silicic acid, alumina, silicates, etc.), etc. As solid carriers for granules there can be mentioned crushed and fractionated rocks (for example, calcite, marble, pumice, sepiolite, dolomite, etc.) synthetic granules of inorganic and organic meals, particles of organic materials (for example, saw dust, coconut shells, maize cobs, tobacco stalks, etc.), etc.

As emulsifiers and/or foam-forming agents there can be mentioned, for example, nonionic and anionic emulsifiers [for example, polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty acid alcohol ethers (for example, alkylaryl polyglycol ethers, alkylsulfonates, alkylsulfates, arylsulfonates, etc.)], albumin hydrolysis products, etc.

Dispersants include, for example, lignin sulfite waste liquor, methyl cellulose, etc.

Tackifiers can also be used in formulations (powders, granules, emulsifiable concentrates). As said tackifiers there can be mentioned, for example, carboxymethyl cellulose, natural and synthetic polymers (for example, gum Arabic, polyvinyl alcohol, polyvinyl acetate, etc.).

Colorants can also be used. As said colorants there can be mentioned inorganic pigments (for example, iron oxide, titanium oxide, Prussian Blue, etc.), organic dyestuffs such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs or metal phthalocyanine

dyestuffs, and further traces nutrients such as salts of metals such as iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum, zinc, etc.

Said formulations can contain the active compounds of the formula (I) in the range of generally 0.01 to 95% by weight, preferably 0.1 to 90% by weight.

The active compounds of the formula (I), according to the present invention, can be used for weed control as themselves or in their formulation forms. And the active compounds of the formula (I) can be used also in combination with known herbicides. Mixed herbicidal compositions with known herbicides can be previously prepared in the final formulation forms or can be prepared by tank mixing when they are used. As the herbicides that can be used as mixed herbicidal compositions in combination with the compounds of the formula (I) there can be mentioned, for example, the following herbicides represented by generic names as typical examples:

acetamide type herbicides: for example, pretilachlor, butachlor, thenylchlor, alachlor, etc.;

amide type herbicides: for example, clomeprop, etobenzanid, etc.;

benzofuran type herbicides: for example, benfuresate etc.;

indandione type herbicides: for example, indanofan etc.;

pyrazole type herbicides: for example, pyrazolate, benzofenap, pyrazoxifen, etc.;

oxazinone type herbicides: for example, oxaziclomefone etc.;

sulfonylurea type herbicides: for example, bensulfuron-methyl, azimsulfuron,

lmazosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl, cyclosulfamuron, ethoxysulfuron,

halosulfuron-methyl, etc.;

thiocarbamate type herbicides: for example, thiobencarb, molinate, pyributycarb, etc.;

triazine type herbicides: for example, dimethametryn, simetryn, etc.;

triazole type herbicides: for example, cafenstrole etc.;

quinoline type herbicides: for example, quinclorac etc.;

isoxazole type herbicides: for example, isoxaflutole etc.;

dithiophosphate type herbicides: for example, anillofos etc.;

oxyacetamide type herbicides: for example, mefenacet, flufenacet, etc.;

tetrazolinone type herbicides: for example, fentrazamide etc.;

dicarboxyimide type herbicides: for example, pentoxazone etc.;

oxadiazolon type herbicides: for example, oxadiazyl, oxadiazon, etc.

trione type herbicides: for example, sulcotrione, benzobicyclon, etc.;

phenoxypropionate type herbicides: for example, cyhalofop-butyl etc.;

benzoic acid type herbicides: for example, pyriminobac-methyl, bispyribac-sodium etc.;

diphenyl ether type herbicides: for example, chlomethoxynil, oxyfluorfen, etc.;

pyridine dicarbothioate type herbicides: for example, dithiopyr etc.;

phenoxy type herbicides: for example, MCPA, MCPB, etc.;

urea type herbicides: for example, dymron, cumyluron, etc.;

naphthalenedione type herbicides: for example, quinclamine etc.;

isoxazolidinone type herbicides: for example, clomazone etc.

The above-mentioned active compounds are known herbicides described in "Pesticide Manual" published in 2000 by British Crop Protect Council.

Further, when the active compounds of the formula (I), according to the present invention, are mixed with safeners, phytotoxicity is reduced by the mixing and a broader weed controlling spectrum is provided and the application as a selective herbicide can be broadened.

As said safeners there can be mentioned, for example, the following compounds represented by generic names or development codes:

AD-67, BAS-145138, benoxacor, cloquintocet-mexyl, cyometrinil, 2,4-D, DKA-24, dichlormid, dymron, fencloilm, fenchlorazole-ethyl, flurazole, fluxofenim, flurazole, isoxadifen-ethyl, mefenpyr-diethyl, MG-191, naphthalic anhydride, oxavetrinil, PPG-1292, R-29148, etc.

The above-mentioned safeners are also described in "Pesticide Manual" published in 2000 by British Crop Protection Council.

Moreover, it is possible to further mix the above-mentioned safeners to a mixed herbicide composition consisting of the compounds of the formula (I), according to the present invention and an above-mentioned herbicide. By the mixing phytotoxicity is reduced and a broader weed controlling spectrum is provided and the application as a selective herbicide can be broadened.

Surprisingly, some of the mixed herbicide compositions consisting of a compound of the present invention and a known herbicide and/or safener can show synergistic effects.

In case of using the active compounds of the formula (I) they can be directly used as such or used in formulation forms such as ready-to-use solutions, emulsifiable concentrates, tablets, suspensions, powders, pastes or granules, or

used in use forms prepared by further dilution. The active compounds of the present invention can be applied by means of, for example, watering, spraying, atomizing, granule application, etc.

The active compounds of the formula (I) can be used at any stages before and after germination of plants. They can be also mixed into the soil before sowing.

The application amount of the active compounds of the formula (I) can be varied in a substantial range. It is fundamentally different depending upon the properties of effects to be desired. In case of using as herbicide, there can be mentioned application amounts in the range of, for example, about 0.0001 to about 4 kg, preferably about 0.01 to about 3 kg as active compound per hectare.

As already mentioned above, it is possible to treat all plants and their parts according to the invention. In a preferred embodiment, wild plant species and cultivars, or those obtained by conventional biological breeding, such as crossing or protoplast fusion, and parts thereof, are treated. In a further preferred embodiment, transgenic plants and cultivars obtained by genetic engineering, if appropriate in combination with conventional methods (Genetically Modified Organisms), and parts thereof are treated. The term "parts" or "parts of plants" or "plant parts" has been explained above.

Particularly preferably, plants of the cultivars which are in each case commercially available or in use are treated according to the invention. Cultivars are to be understood as meaning plants having certain properties ("traits") and which have been obtained by conventional breeding, by mutagenesis or by

recombinant DNA techniques. They can be varieties, bio- or genotypes.

Depending on the plant species or cultivars, their location and growth conditions (soils, climate, vegetation period, diet), the treatment according to the invention may also result in superadditive ("synergistic") effects. Thus, for example, reduced application rates and/or a widening of the activity spectrum and/or an increase in the activity of the substances and compositions which can be used according to the invention also in combination with other agrochemically active compounds, better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, better quality and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products are possible which exceed the effects which were actually to be expected.

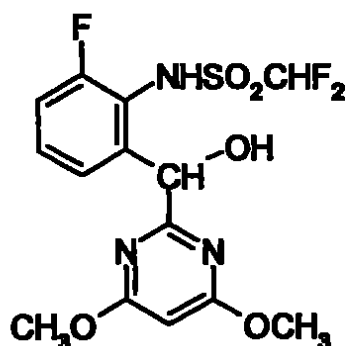
The transgenic plants or cultivars (i.e. those obtained by genetic engineering) which are preferably treated according to the invention include all plants which, in the genetic modification, received genetic material which imparted particularly advantageous useful properties ("traits") to these plants. Examples of such properties are better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, better quality and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products. Further and particularly emphasized examples of such properties are a better

defence of the plants against animal and microbial pests, such as against insects, mites, phytopathogenic fungi, bacteria and/or viruses, and also increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds. Examples of transgenic plants which may be mentioned are the important crop plants, such as cereals (wheat, rice), maize, soya beans, potatoes, cotton, oilseed rape and also fruit plants (with the fruits apples, pears, citrus fruits and grapes), and particular emphasis is given to maize, soya beans, potatoes, cotton and oilseed rape. Traits that are emphasized are in particular increased defence of the plants against insects by toxins formed in the plants, in particular those formed in the plants by the genetic material from *Bacillus thuringiensis* (for example by the genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF and also combinations thereof) (hereinbelow referred to as "Bt plants"). Traits that are also particularly emphasized are the increased defence of the plants to fungi, bacteria and viruses by systemic acquired resistance (SAR), systemin, phytoalexins, elicitors and resistance genes and correspondingly expressed proteins and toxins. Traits that are furthermore particularly emphasized are the increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds, for example imidazolinones, sulphonylureas, glyphosate or phosphinotricin (for example the "PAT" gene). The genes which impart the desired traits in question can also be present in combination with one another in the transgenic plants. Examples of "Bt plants" which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties, soya bean varieties and potato varieties which are sold under the trade names YIELD GARD® (for example maize, cotton, soya beans), KnockOut® (for example maize), StarLink®

(for example maize), Bollgard® (cotton), Nucoat® (cotton) and NewLeaf® (potato). Examples of herbicide-tolerant plants which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties and soya bean varieties which are sold under the trade names Roundup Ready® (tolerance to glyphosate, for example maize, cotton, soya bean), Liberty Link® (tolerance to phosphinotricin, for example oilseed rape), IMI® (tolerance to imidazolinones) and STS® (tolerance to sulphonylurea, for example maize). Herbicide-resistant plants (plants bred in a conventional manner for herbicide tolerance) which may be mentioned include the varieties sold under the name Clearfield® (for example maize). Of course, these statements also apply to cultivars having these genetic traits or genetic traits still to be developed, which plants will be developed and/or marketed in the future.

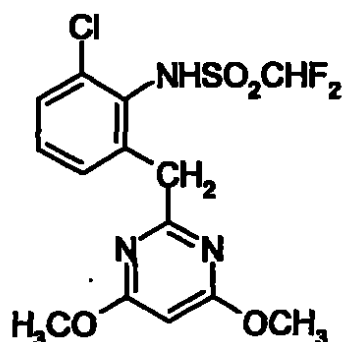
The plants listed can be treated according to the invention in a particularly advantageous manner with the compounds of the formula (I) or the active compound mixtures according to the invention where in addition to the effective control of the weeds, the above-mentioned synergistic effects with the transgenic plants or plant cultivators occur. The preferred ranges stated above for the active compounds or mixtures also apply to the treatment of these plants. Particular emphasis is given to the treatment of plants with the compounds or mixtures specifically mentioned in the present text.

Then further specific examples of the preparation and application of the compounds of the formula (I) according to present invention, will be shown by the following examples. The present invention, however, should not be restricted only to them in any way.

Synthesis Example 1

2-Fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline 1.6 g (5.28 mmol) was dissolved in dichloromethane (13 ml) and pyridine 0.91 g (11.46 mmol) was added thereto. The solution was cooled to -5°C and a solution of difluoromethanesulfonyl chloride 1.73 g (11.46 mmol) in dichloromethane (2 ml) was added thereto. The reaction solution was stirred at room temperature for 4 days and after addition of water it was extracted three times with dichloromethane. The organic layer was washed with 1N hydrochloric acid and water. After drying, dichloromethane was distilled off under reduced pressure and the obtained oily substance was purified by column chromatography using 1:3 mixed solvent of ethyl acetate and hexane as eluent to obtain the objective 2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]-N-difluoromethanesulfonanilide 0.94 g (yield 42%) as pale yellow crystals.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.99(6H,s), 4.97(1H,d), 5.99(1H,s), 6.13(1H,d), 6.61(1H,t), 7.07-7.13(1H,m), 7.23-7.29(1H,m), 7.51-7.53(1H,m), 10.57(1H,br).

Synthesis Example 2

2-Chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline 1.54 g (5.51 mmol) was dissolved in dichloromethane (12 ml) and pyridine 0.87 g (11.01 mmol) was added thereto. The solution was cooled to -5°C and a solution of difluoromethanesulfonyl chloride 1.66 g (11.01 mmol) in dichloromethane (2 ml) was added thereto. The reaction solution was stirred at room temperature for 4 days and after addition of water it was extracted three times with dichloromethane. After the organic layer had been washed with water and dried, dichloromethane was distilled off under reduced pressure and the objective 2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide 1.2 g (yield 55%) was obtained as white crystals from the obtained oily substance by column chromatography using 1:6 mixed solvent of ethyl acetate and hexane as eluent.

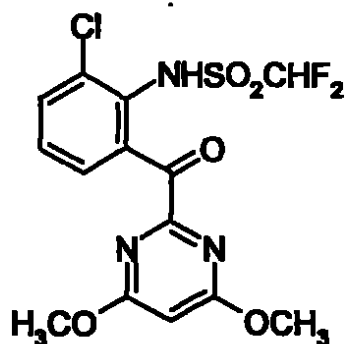
$^1\text{H NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.94(6H,s), 4.30(2H,s), 5.92(1H,s), 6.74(1H,t), 7.18-7.21(1H,m), 7.33-7.38(2H,m), 11.09(1H,br).

The following compound was obtained by the same process as the above-mentioned Synthesis Example 2:

2-Fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonanilide.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 4.05(6H,s), 4.22(2H,s), 6.56(1H,t),
7.07-7.28(3H,m), 10.16(1H,s).

Synthesis Example 3



2-Chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]-N-difluoromethanesulfonamide 0.4 g (1.02 mmol) was dissolved in acetic acid (6 ml) and chromium (VI) oxide 0.31g (3.05 mmol) was added thereto. The solution was heated to 30°C and stirred for 6 hours. After stirring further 12 hours at room temperature, the reaction solution was diluted with water and extracted three times with diethyl ether. The organic layer was washed with water. After drying, diethyl ether was distilled off under reduced pressure and the objective 2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonamide 0.28 g (yield 67%) was obtained as white crystals from the obtained oily substance by column chromatography using 1:3 mixed solvent of ethyl acetate and hexane as eluent.

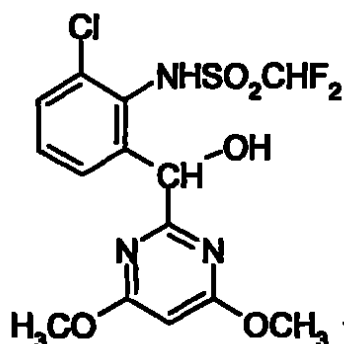
$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.93(6H,s), 6.19(1H,s), 6.34(1H,t),
7.37-7.43(1H,m), 7.63-7.69(2H,m).

The following compound was obtained by the same process as the above-mentioned Synthesis Example 3:

2-Fluoro-6-[(4,6-dimethoxytriazin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonamide.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 4.10(6H,s), 6.48(1H,t), 7.36(1H,m),
7.45(1H,t), 7.55(1H,d), 9.08(1H,s).

Synthesis Example 4



2-Chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]-N-difluoromethanesulfonamide 0.83 g (2.04 mmol) was dissolved in methanol 30 ml and, after cooling it to 5°C, sodium borohydride 0.15 g (4.07 mmol) was added thereto while stirring. Then the solution was stirred at room temperature for 2 hours. The reaction solution was distilled off under reduced pressure and the obtained crystals were dissolved in water and dichloromethane and neutralized with citric acid. The organic layer was separated and the water layer was further extracted three times with dichloromethane. After the organic layer had been washed with water and dried, dichloromethane was distilled off under reduced pressure to obtain the objective

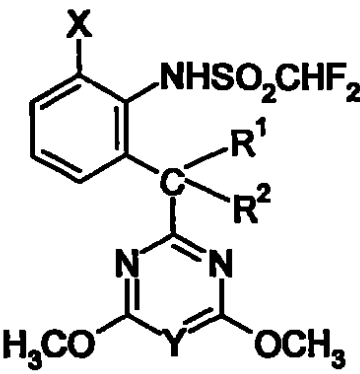
2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]-N-difluoromethanesulfonamide 0.79 g (yield 95%) as white crystals.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.99(6H,s), 4.99(1H,br), 5.99(1H,s),

6.24(1H,s),6.76(1H,t),7.27-7.30(1H,m),7.39-7.42(1H,m),
7.64-7.67(1H,m),10.62(1H,br).

The compounds obtained in the same manner as the above-mentioned Synthesis Examples 1-4, are shown, together with the compounds synthesized in Synthesis Examples 1-4, in the following Table 1 and their physical and chemical properties are shown in Table 2.

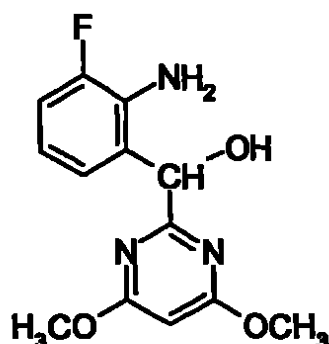
Table 1



compound. No.	X	Y	R ¹	R ²
1	F	CH	H	OH
2	F	N	H	OH
3	Cl	CH	H	OH
4	Cl	N	H	OH
5	Br	CH	H	OH
6	Br	N	H	OH
7	I	CH	H	OH
8	I	N	H	OH
9	F	CH	H	H
10	F	N	H	H
11	Cl	CH	H	H
12	Cl	N	H	H
13	Br	CH	H	H
14	Br	N	H	H
15	I	CH	H	H
16	I	N	H	H
17	F	CH	C=O	
18	F	N	C=O	
19	Cl	CH	C=O	
20	Br	CH	C=O	
21	Br	N	C=O	
22	I	CH	C=O	
23	I	N	C=O	

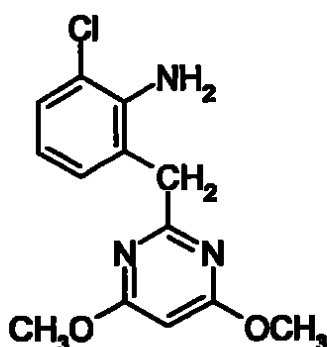
Table 2

Compound No.	Physical & Chemical Properties (¹ H-NMR(300MHz, CDC ₃)δ)
1	3.99(6H,s), 4.97(1H,d), 5.99(1H,s), 6.13 (1H,d), 6.61(1H,t), 7.07-7.13(1H,m), 7.23-7.29(1H,m), 7.51-7.53(1H,m), 10.57(1H,br).
2	4.08(6H,s),6.10(1H,s),6.58(1H,t),7.13(1H,t),7.28-7.33(1H,m), 7.47(1H,d),9.60(1H,s).
3	3.99(6H,s),4.99(1H,br), 5.99(1H,s), 6.24 (1H,s), 6.76(1H,t), 7.27-7.30(1H,m), 7.39-7.42(1H,m), 7.64-7.67(1H,m), 10.62(1H,br).
9	3.97(6H,s), 4.26(2H,s), 5.94(1H,s), 6.59(1H,t),7.05-7.13(1H,m), 7.16-7.23(2H,m),11.14(1H,br).
10	4.05(6H,s), 4.22(2H,s), 6.58(1H,t), 7.07-7.28(3H,m), 10.16(1H,s).
11	3.94(6H, s), 4.30(2H, s), 5.92(1H,s), 6.74(1H,t), 7.18-7.21(1H,m), 7.33-7.38(2H,m), 11.09(1H,br).
12	4.02(6H,s) 4.34(2H,s) 6.68(1H,t) 7.22(1H) 7.32(1H) 7.41(1H) 9.98(1H,br).
17	3.97(6H,s),6.20(1H,s),6.51(1H,t),7.29-7.34(1H,m),7.39-7.46(1H,m), 7.55-7.58(1H,m),11.14(1H,br).
18	4.10(6H,s),6.48(1H,t),7.36(1H,m),7.45(1H,t),7.55(1H,d),9.08(1H,s),
19	3.93(6H,s),6.19(1H,s),6.34(1H,t),7.37-7.43(1H,m),7.63-7.69(2H,m).

Reference Example 1

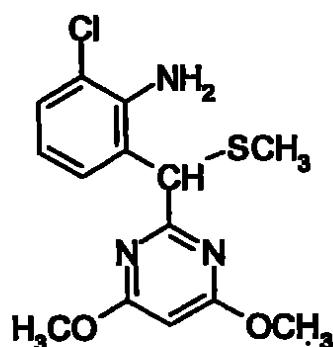
2-Fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)carbonyl]aniline 2.68 g (9.67 mmol) was dissolved in methanol 80 ml and, after cooling it to 5°C, sodium borohydride 0.73 g (19.33 mmol) was added thereto while stirring. Then the solution was stirred at room temperature for 2 hours. The reaction solution was distilled off under reduced pressure and the obtained crystals were dissolved in water and dichloromethane. The organic layer was separated and the water layer was further extracted three times with dichloromethane. After the organic layer had been washed with water and dried, dichloromethane was distilled off under reduced pressure to obtain the objective 2-fluoro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)hydroxymethyl]aniline 2.66 g (yield 98%) as white crystals.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.94(6H,s), 4.74(3H,m), 5.84(1H,d), 5.94(1H,s), 6.66-6.73(1H,m), 6.88-6.95(1H,m), 7.13-7.15(1H,m).

Reference Example 2

To 10ml of a methanol solution of 2-chloro-6-[1-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-methylthiomethyl]aniline 0.6g (1.84 mmol) and 0.88g (3.68mmol) of nickel (II) chloride hexahydrate, 0.28g (7.37mmol) of sodium borohydride was added at 0-10°C and the reaction solution was stirred at room temperature for 2 hours. After the reaction solution was distilled off under reduced pressure, aqueous ammonia and dichloromethane were added and the insoluble matter was filtered off. The organic layer was separated and the water layer was further extracted three times with dichloromethane. After the organic layer had been washed with water and dried, dichloromethane was distilled off under reduced pressure and the obtained crystals were washed with n-hexane to obtain the objective 2-chloro-6-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)methyl]aniline 0.48 g (yield 93%) as white crystals.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 3.91(6H,s), 4.01(2H,s), 5.18(2H,s), 5.81(1H,s), 6.62-6.67(1H,m), 7.14-7.17(2H,m).

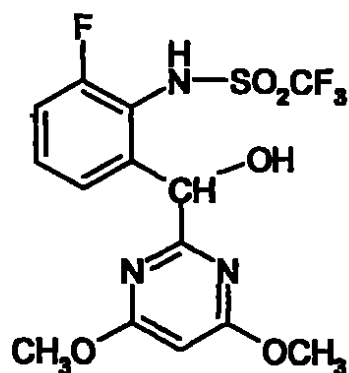
Reference Example 3

2-Chloroaniline 5.2g (26.0mmol) was dissolved in dichloromethane (200ml) and the solution was cooled to -70°C. To the cooled solution a dichloromethane (10ml) solution of tert-butyl hypochlorite 2.82g (26.0mmol) was added dropwise and the solution was stirred at -70°C for 10 minutes. To the obtained reaction solution a dichloromethane (20ml) solution of 2-methylthiomethyl-4,6-dimethoxypyrimidine 3.38g (26.0mmol) was added dropwise and the solution was stirred at -70°C for 40 minutes. To the obtained reaction solution 28% sodium methoxide methanol solution (9ml) was added and the solution was stirred until it came to room temperature. Water was added to the reaction solution and the organic layer was separated. The water layer was further extracted twice with dichloromethane. After the organic layer had been washed with water and dried, dichloromethane was distilled off under reduced pressure and the objective 2-chloro-6-[1-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-methylthiomethyl]aniline 7.00 g (yield 83%) was obtained as oily substance from the obtained oily substance by column chromatography using 1:8 mixed solvent of ethyl acetate and hexane as eluent.

$^1\text{H-NMR}$ (300MHz, CDCl_3) δ 2.04(3H,s), 3.93(6H,s), 5.07(1H,br),
5.14(1H,s), 5.90(1H,s), 6.67(1H,t), 7.19(1H,dd), 7.42(1H,dd).

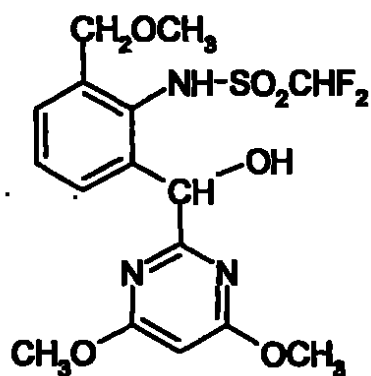
Comparative compound

C-1



(C-1 is a similar compound disclosed in WO 96/41799)

C-2



(C-2 is a similar compound disclosed in Japanese Laid-open Patent Publication
No. 44546/2000)

Test Example 1: Test for herbicidal effect against paddy field weeds**Preparation of formulation of the active compound**

Carrier: DMF 5 parts by weight

Emulsifier: Benzyloxy polyglycol ether 1 part by weight

A formulation of an active compound is obtained as an emulsifiable concentrate by mixing 1 part by weight of the active compound with the above-mentioned amount of the carrier and emulsifier. A prescribed amount of the formulation is diluted with water.

In a green house seeds or tubers of *Scirpus juncoides* Roxburgh, *Monochoria vaginalis* Presl, annual broad-leaved weeds (*Lindernia procumbens* Philcox, *Rotala indica* Koehne, *Elatine triandra* Schk, *Ammannia multiflora* Roxb., etc.), *Cyperus serotinus* Rottboel were inoculated in a 500 cm² pot filled with paddy field soil. Then water was poured to a depth of about 2-3 cm. Five days and 13 days after inoculation, a prescribed, diluted solution of the formulation of each active compound, prepared according to the aforementioned preparation method, was applied to the surface of water. After the treatment the water depth of 3 cm was maintained and the herbicidal effect was examined after 3 weeks from the treatment.

The herbicidal effect was rated 100% in the case of complete death and as 0% in the case of no herbicidal effect. In case of showing higher than 80% herbicidal effect, it is evaluated as practical as herbicide.

The study results with the compounds No. 1, 3, 11 and 17 and the comparative compound No. C-1 as specific examples are shown in the following Table 3 and Table 4.

Table 3: Application 5 days after inoculation

compound. No.	amount (g ai/ha)	herbicidal effect			
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginalls</i>	broad- leaved weeds	<i>Cyperus serotinus</i>
1	30	100	100	100	100
	15	100	100	100	100
3	30	100	100	100	100
11	60	100	100	100	100
17	30	100	100	100	100
comparative C-1	30	80	80	80	80
	15	70	60	50	70

Table 4: Application 13 days after inoculation

compound. No.	amount (g ai/ha)	herbicidal effect			
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginalls</i>	broad- leaved weeds	<i>Cyperus serotinus</i>
1	30	100	100	100	100
	15	100	100	95	95
3	30	100	100	100	100
11	60	100	100	100	95
17	30	100	100	100	100
comparative C-1	30	70	60	60	60
	15	60	50	40	60

Test Example 2: Test for residual effectiveness against paddy field weeds

In a green house a 1000 cm² pot was filled with paddy field soil and water was poured to a depth of about 2 to 3 cm. A prescribed, diluted solution of the above-mentioned Test Example 1, was applied to the surface of water. After the prescribed time after the treatment (just after treatment, 1 week, 2 weeks, 3 weeks, 4 weeks, 5 weeks, 6 weeks and 7 weeks after treatment), seeds or

tubers of the weeds to be tested *Scirpus juncoides* Roxburgh, *Monochoria vaginalis* Presl, annual broad-leaved weeds (*Lindernia procumbens* Philcox, *Rotala indica* Koehne, *Elatine triandra* Schk, *Ammannia multiflora* Roxb., etc.), *Cyperus serotinus* Rottboel and *Sagittaria pygmaea* Miq. were inoculated. Three weeks after the inoculation each herbicidal effect was examined.

The evaluation of the residual effectiveness was shown as the period (number of weeks) of maintaining herbicidal effect of higher than 80%, after the evaluation of herbicidal effect had been conducted in the similar manner as the above-mentioned Test Example 1.

The study results with the compounds No. 1 and No. 11, and the comparative compounds No. C-1 and No. C-2 as specific examples are shown in the following Table 5.

Table 5:

compound. No.	amount (g a/ha)	period showing sufficient residual herbicidal effectiveness (week)				
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginalis</i>	broad- leaved weeds	<i>Cyperus serotinus</i>	<i>Sagittaria pygmaea</i>
1	60	6	4	3	3	3
11	60	4	3	4	-	4
comparative C-1	60	2	<1	<1	1	1
comparative C-2	60	2	2	2	-	3

Test Example 3: Test for herbicidal effect against sulfonylurea resistant weeds

In a green house seeds of *Scirpus juncoides* Roxburgh (collected in Iwamizawa area, Hokkaido), *Lindernia procumbens* Philcox (collected in Kazo area, Saitama Pref.), *Lindernia procumbens* Philcox (collected in Higashi-Hiroshima area, Hiroshima Pref.), *Elatine triandra* Schk (collected in Kazo area, Saitama Pref.), all of which were confirmed as sulfonylurea resistant, were inoculated in a 20 cm² cup filled with paddy field soil. Then water was poured to a depth of about 2 to 3 cm. At the beginning of emergence of each weed, a prescribed, diluted solution of the formulation of each active compound prepared in the same manner as the above-mentioned Test Example 1 was applied to the surface of water. After the treatment the water depth of 3 cm was maintained and the herbicidal effect was examined after 3 weeks from the treatment. The evaluation of the herbicidal effect was conducted in the same manner as the above-mentioned Test Example 1. In case of showing higher than 80% herbicidal effect, it is evaluated as practical as herbicide. In consideration of the possibility that the biological properties including herbicide resistance of the plants grown in different areas might be different, sulfonylurea resistant *Lindernia procumbens* Philcox collected in two different areas were used in the present tests. The study results with the compounds No. 1, 3, 11 and 17 and the comparative compound No. C-1 as specific examples are shown in the following Table 6.

Table 6:

compound. No.	amount (g ai/ha)	herbicidal effect against sulfonylurea resistant weeds			
		<i>Scirpus juncoides</i> (collected in Iwamizawa area, Hokkaido)	<i>Lindernia procumbens</i> (collected in Kazo area, Saitama Pref.)	<i>Lindernia procumbens</i> (collected in Higashi- Hiroshima area, Hiroshima Pref.)	<i>Elatine triandra</i> (collected in Kazo area, Saitama Pref.)
1	60	100	100	100	100
	30	100	95	100	100
3	60	100	100	—	—
	30	100	100	—	—
11	60	100	100	—	—
	30	100	100	—	—
17	60	100	100	—	—
	30	100	95	—	—
comparative C-1	60	70	60	80	70
	30	60	40	50	60

Test Example 4: Test for phytotoxicity to transplanted rice

The phytotoxicity to transplanted rice was evaluated under the conditions with more shallow planting depths than usual depth of 2cm, simulating the severe condition for herbicides to cause rice injury in the paddy. In a greenhouse 2 to 2.5 leaf-stage of rice (var. Nipponbare) was transplanted at three different depths, in a 1000cm² pot filled with paddy field soil. Then water was poured to a depth of about 2 to about 3cm. Five days after transplanting, a prescribed, diluted solution of the formulation of each active compound, prepared in the same manner as the above-mentioned Test Example 1, was applied to the surface of water. After the treatment the water depth of 3cm was maintained and the rice injury was examined after 2 weeks from the treatment.

The rice injury was rated 100% in the case of complete death and as 0% in the case of no injury. In case of showing less than 20% injury, it is evaluated as practical as rice herbicide.

The study results with the compound No. 11, and the comparative compounds No. C-1 and C-2 a specific examples are shown in the following Table 7.

Table 7: Application 5 days after transplanting

compound No.	amount (g ai / ha)	phytotoxicity to transplanted rice		
		depth 2cm	depth 0.5cm	depth 0cm
11	60	10	15	15
comparative C-1	60	20	35	-
comparative C-2	60	30	30	40

Test Example 5: Test for phytotoxicity to direct-seedling rice and herbicidal effect against paddy field weeds

In a greenhouse seeds of *Scirpus Juncoides* Roxburgh, *Monochoria vaginalis* Presl, *Cyperus difformis* L., annual broad-leaved weeds (*Lindernia procumbens* Philcox, *Rotala Indica* Koehne, *Elatine triandra* Schk, *Ammannia multiflora* Roxb.) and rice (var.: Nipponbare and RD-23) were inoculated in a 500cm² pot filled with paddy field soil. Then water was poured to a depth of about 0 to about 0.5cm, to be a wet condition. At two leaf-stage of rice, a prescribed, diluted solution of the formulation of each active compound,

prepared in the same manner as the above-mentioned Test Example 1, was sprayed over the pots with plants. At 2 days after the treatment, the water depth of 3cm was maintained and the herbicidal effect and rice injury was evaluated at 3 weeks and 2 weeks after the treatment, respectively.

The herbicidal effect and rice injury were rated 100% in the case of complete death and as 0% in the case of no effect or injury. In case of showing higher than 80% herbicidal effect and less than 20% injury, it is evaluated as practical as rice herbicide.

The study results with the compound No.3 and No. 11 and the comparative compound No. C-2 as specific examples are shown in the following Table 8.

Table 8: Application at two leaf-stage of rice (spray)

compound No.	amount (g ai/ha)	herbicidal effect				Phytotoxicity to direct-seedling rice	
		Cyperus difformis L.	Scirpus juncoides	Monochoria vaginalls	broad-le aved weeds	Nippon- bare	RD-23
3	50	100	100	100	100	20	10
11	50	100	90	100	100	10	10
comparative C-2	50	100	90	100	100	50	30

Formulation Example 1 (Granule)

To a mixture of the compound of the present invention No. 1 (0.4 parts), bentonite (montmorillonite) (39.6 parts), talc (58 parts) and ligninsulfonate salt (2 parts), water (25 parts) were added, well kneaded, made into granules of 10 to 40 mesh by an extrusion granulator and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 2 (Granules)

Clay mineral particles (99.8 parts) having particle diameter distribution in the range of 0.2 to 2 mm are put in a rotary mixer. While rotating it, the compound of the present invention No. 1 (0.2 parts) are sprayed together with a liquid diluent, wetted uniformly and dried at 40 to 50°C to obtain granules.

Formulation Example 3 (Emulsifiable concentrate)

The compound of the present invention No. 1 (30 parts), xylene (55 parts), polyoxyethylene alkyl phenyl ether (8 parts) and calcium alkylbenzenesulfonate (7 parts) are mixed and stirred to obtain an emulsifiable concentrate.

Formulation Example 4 (Wettable powder)

The compound of the present invention No. 1 (15 Parts), a mixture of white carbon (hydrous amorphous silicon oxide fine powders) and powder clay (1:5) (80 parts), sodium alkylbenzenesulfonate (2 parts) and sodium alkyl-naphthalenesulfonate-formalin-condensate (3 parts) are mixed in powder to obtain a wettable powder.

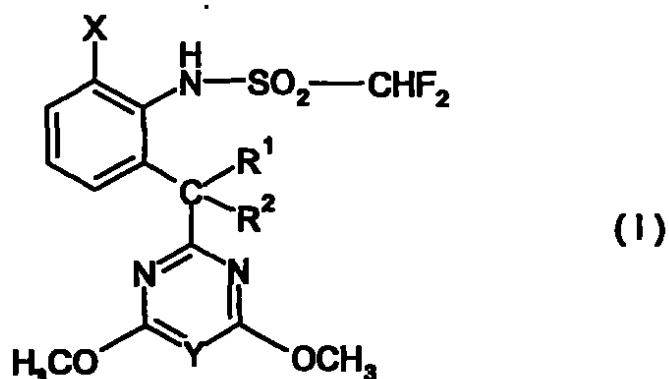
Formulation Example 5 (Water dispersible granule)

The compound of the present invention No. 1 (20 Parts), sodium

ligninsulfonate (30 parts), bentonite (15 parts) and calcined diatomaceous earth powder (35 parts) are well mixed, added with water, extruded with 0.3 mm screen and dried to obtain water dispersible granules.

Claims

- 1) Novel difluoromethanesulfonamide derivatives represented by the formula



wherein

X represents halogen,

Y represents CH or N,

R¹ represents hydrogen, and

R² represents hydrogen or hydroxy; or

R¹ and R² together with the carbon atom to which they are bonded may form C=O.

- 2) Compounds set forth in Claim 1 wherein

X represents fluorine or chlorine,

Y represents CH or N,

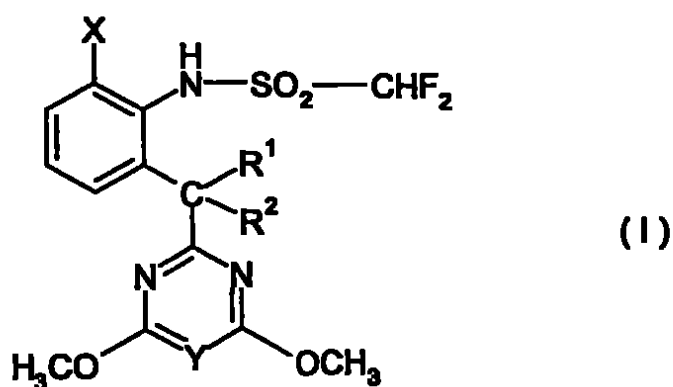
R¹ represents hydrogen, and

R² represents hydrogen or hydroxy, or

R¹ and R² together with the carbon atom to which they are bonded may form C=O.

- 3) A process for preparing the compounds of the formula (I) according to

claim 1

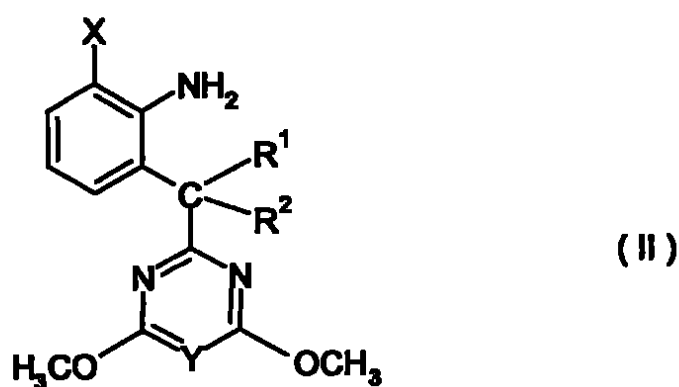


wherein

X, Y, R¹ and R² are defined as in claim 1,

characterized in that

a) compounds of the formula (II)

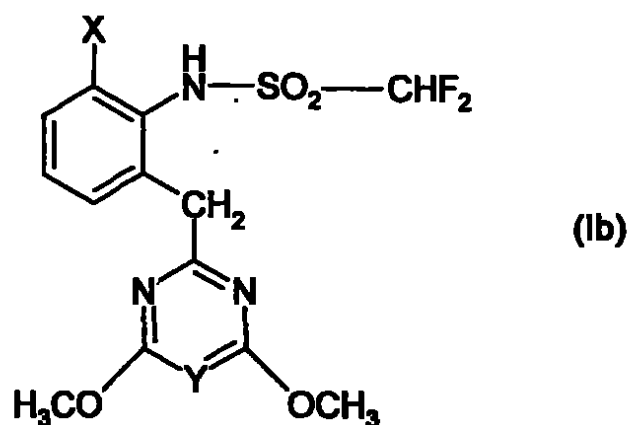


wherein

X, Y, R¹ and R² have the same definition as aforementioned,
are reacted with difluoromethanesulfonyl chloride in the presence of inert
solvents, and if appropriate, in the presence of an acid binding agent,
or

b) in case that R¹ and R² together form C=O with the carbon atom to
which they are bonded:

compounds of the formula (Ib)

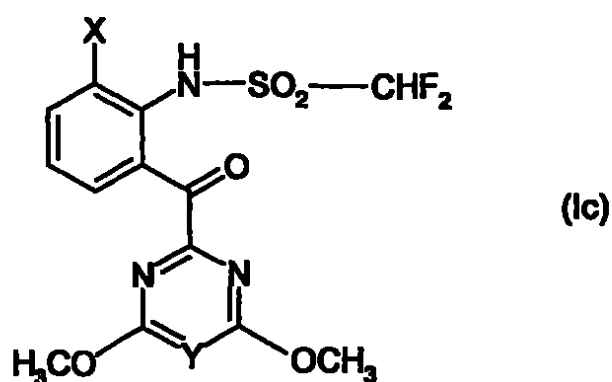


wherein

X and Y have the same definition as aforementioned,
are reacted with an oxidizing agent in the presence of inert solvents, and if
appropriate, in the presence of an acid catalyst,

or

- c) In case that R^1 represents hydrogen, and R^2 represents hydroxy:
compounds of the formula (1c)



wherein

X and Y have the same definition as aforementioned,
are reacted with an alkali metal hydride complex compound or a borane
complex

in the presence of inert solvents.

- 4) Herbicidal compositions, characterized in that they contain at least one compound of the formula (I) according to claim 1.
- 5) Process for combating paddy field weeds, characterized in that at least one compound of formula (I) according to claim 1 is allowed to act on paddy field weeds and / or their habitat.
- 6) Use of a compound of the formula (I) according to claim 1 for combating paddy field weeds.
- 7) Process for the preparation of herbicidal compositions, characterized in that a compound of the formula (I) according to claim 1 is mixed with extenders and / or surface active agents.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP2005/002952

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N43/54 C07D239/52 A01N43/60 C07D251/20

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP 1 101 760 A (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD) 23 May 2001 (2001-05-23) cited in the application the whole document	1-7
A	WO 96/41799 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 27 December 1996 (1996-12-27) cited in the application page 100 - page 103; table 10	1-7
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 08, 30 June 1999 (1999-06-30) & JP 11 060562 A (KUMIAI CHEM IND CO LTD; IHARA CHEM IND CO LTD), 2 March 1999 (1999-03-02) abstract	1-7



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- *S* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

23 June 2005

Date of mailing of the international search report

11/07/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 6818 Patentplan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-8040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-8016

Authorized officer

Gavriliu, D

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2005/002952

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 1101760	A	23-05-2001	JP 3632947 B2	30-03-2005
			JP 2000044546 A	15-02-2000
			JP 2000063360 A	29-02-2000
			AT 252088 T	15-11-2003
			AU 750129 B2	11-07-2002
			AU 4928999 A	21-02-2000
			BR 9912494 A	09-04-2002
			DE 69912134 D1	20-11-2003
			DE 69912134 T2	29-04-2004
			EP 1101760 A1	23-05-2001
			US 6458748 B1	01-10-2002
			CN 1309646 A ,C	22-08-2001
			EP 1361218 A1	12-11-2003
			ES 2209466 T3	16-06-2004
			ID 28214 A	10-05-2001
			WO 0006553 A1	10-02-2000
			RU 2225861 C2	20-03-2004
			TW 221471 B	01-10-2004
WO 9641799	A	27-12-1996	DE 19521355 A1	19-12-1996
			AU 6355096 A	09-01-1997
			WO 9641799 A1	27-12-1996
			ID 20511 A	07-01-1999
			ZA 9604943 A	12-12-1996
JP 11060562	A	02-03-1999	NONE	

BCS047003-WO

1/5

PCT REQUEST

Original (for SUBMISSION)

0	For receiving Office use only	
0-1	International Application No.	PCT/EP 2005 / 0 0 2 9 5 2
0-2	International Filing Date	(19. 03. 2005) 19 MAR 2005
0-3	Name of receiving Office and "PCT International Application"	EUROPEAN PATENT OFFICE PCT INTERNATIONAL APPLICATION
0-4	Form PCT/RO/101 PCT Request	
0-4-1	Prepared Using	PCT-SAFE [EASY mode] Version 3.50 (Build 0002.169)
0-5	Petition The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty	
0-6	Receiving Office (specified by the applicant)	European Patent Office (EPO) (RO/EP)
0-7	Applicant's or agent's file reference	BCS047003-WO
I	Title of invention	NOVEL DIFLUOROMETHANESULFONAMIDE DERIVATIVES
II	Applicant	
II-1	This person is	applicant only
II-2	Applicant for	all designated States except US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AG
II-5	Address	Alfred-Nobel-Str. 50 40789 Monheim Germany
II-6	State of nationality	DE
II-7	State of residence	DE
II-8	Telephone No.	02143028663
II-9	Facsimile No.	02143053482
III-1	Applicant and/or inventor	
III-1-1	This person is	applicant and inventor
III-1-2	Applicant for	US only
III-1-4	Name (LAST, First)	ARAKI, Koichi
III-1-5	Address	2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi, Ibaraki, 300-1216 Japan
III-1-6	State of nationality	JP
III-1-7	State of residence	JP

BCS047003-WO

2/5

PCT REQUEST

Original (for SUBMISSION)

III-2	Applicant and/or Inventor	
III-2-1	This person is	applicant and inventor
III-2-2	Applicant for	US only
III-2-4	Name (LAST, First)	KUDO, Sachio
III-2-5	Address	3-8-17, Kasuga, Tsukuba-shi, Ibaraki, 305-0821 Japan
III-2-6	State of nationality	JP
III-2-7	State of residence	JP
III-3	Applicant and/or Inventor	
III-3-1	This person is	applicant and inventor
III-3-2	Applicant for	US only
III-3-4	Name (LAST, First)	SATO, Yoshitaka
III-3-5	Address	1-8-12, Hanahata, Tsukuba-shi, Ibaraki, 300-3261 Japan
III-3-6	State of nationality	JP
III-3-7	State of residence	JP
III-4	Applicant and/or Inventor	
III-4-1	This person is	applicant and inventor
III-4-2	Applicant for	US only
III-4-4	Name (LAST, First)	ENDO, Keiji
III-4-5	Address	4233-4, Ami, Ami-machi, Inashiki-gun, Ibaraki, 300-0331 Japan
III-4-6	State of nationality	JP
III-4-7	State of residence	JP
III-5	Applicant and/or Inventor	
III-5-1	This person is	applicant and inventor
III-5-2	Applicant for	US only
III-5-4	Name (LAST, First)	SHIRAKURA, Shinichi
III-5-5	Address	2-6-3, Ekihigashidouri, Oyama-shi, Tochigi, 323-0022 Japan
III-5-6	State of nationality	JP
III-5-7	State of residence	JP

BCS047003-WO

3/5

PCT REQUEST

Original (for SUBMISSION)

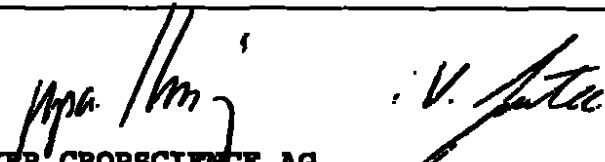
III-8	Applicant and/or inventor	
III-8-1	This person is	applicant and inventor
III-8-2	Applicant for	US only
III-8-4	Name (LAST, First)	NAKAMURA, Shin
III-8-5	Address	4-4-8, Joto, Oyama-shi, Tochigi, 323-0807 Japan
III-8-6	State of nationality	JP
III-8-7	State of residence	JP
IV-1	Agent or common representative; or address for correspondence The person identified below is hereby/ has been appointed to act on behalf of the applicant(s) before the competent International Authorities as:	agent
IV-1-1	Name (LAST, First)	SCHWENK, Norbert
IV-1-2	Address	c/o Bayer CropScience GmbH, Law and Patents, Building K 607 65926 Frankfurt Germany
V	DESIGNATIONS	
V-1	The filing of this request constitutes under Rule 4.9(a), the designation of all Contracting States bound by the PCT on the international filing date, for the grant of every kind of protection available and, where applicable, for the grant of both regional and national patents.	
VI-1	Priority claim of earlier national application	
VI-1-1	Filing date	01 April 2004 (01.04.2004)
VI-1-2	Number	2004-109197
VI-1-3	Country	JP
VI-2	Priority claim of earlier national application	
VI-2-1	Filing date	22 July 2004 (22.07.2004)
VI-2-2	Number	2004-214777
VI-2-3	Country	JP
VI-3	Priority claim of earlier national application	
VI-3-1	Filing date	08 December 2004 (08.12.2004)
VI-3-2	Number	2004-355616
VI-3-3	Country	JP
VII-1	International Searching Authority Chosen	European Patent Office (EPO) (ISA/EP)

BCS047003-WO

4/5

PCT REQUEST

Original (for SUBMISSION)

VIII	Declarations	Number of declarations	
VIII-1	Declaration as to the identity of the inventor	-	
VIII-2	Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent	-	
VIII-3	Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application	-	
VIII-4	Declaration of inventorship (only for the purposes of the designation of the United States of America)	-	
VIII-5	Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty	-	
IX	Check list	number of sheets	electronic file(s) attached
IX-1	Request (including declaration sheets)	5	✓
IX-2	Description	45	-
IX-3	Claims	4	-
IX-4	Abstract	1	✓
IX-5	Drawings	0	-
IX-7	TOTAL	55	
	Accompanying items	paper document(s) attached	electronic file(s) attached
IX-8	Fee calculation sheet	✓	-
IX-9	Original separate power of attorney	EA	-
IX-13	Priority document(s)	Item(s) VI-1 VI-2 VI-3	-
IX-17	PCT-SAFE physical media	-	✓
IX-19	Figure of the drawings which should accompany the abstract		
IX-20	Language of filing of the international application	English	
X-1	Signature of applicant, agent or common representative		
X-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AG	
X-1-2	Name of signatory	ppa. Dr. Robert Krieg i. V. Dr. Oliver Lutze	
X-1-3	Capacity		

ROYEP(-)

Q

BCS047003-WO

5/5

PCT REQUEST

Original (for SUBMISSION)

FOR RECEIVING OFFICE USE ONLY

10-1	Date of actual receipt of the purported international application	19 MAR 2005 (19.03.05)
10-2	Drawings:	
10-2-1	Received	
10-2-2	Not received	
10-3	Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application	
10-4	Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2)	
10-5	International Searching Authority	ISA/EP
10-6	Transmittal of search copy delayed until search fee is paid	

FOR INTERNATIONAL BUREAU USE ONLY

11-1	Date of receipt of the record copy by the International Bureau	
------	--	--

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

SCHWENK, Norbert
c/o Bayer CropScience GmbH
and Patente, Building K 807
85928 Frankfurt
ALLEMAGNE

Law

Date of mailing (day/month/year) 27 April 2005 (27.04.2005)	
Applicant's or agent's file reference BCS047003-WO	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP05/002952	International filing date (day/month/year) 19 March 2005 (19.03.2005)
International publication date (day/month/year)	Priority date (day/month/year) 01 April 2004 (01.04.2004)
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG et al	

1. By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(e) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
3. (If applicable) An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(e) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
01 April 2004 (01.04.2004)	2004-108197	JP	13 April 2005 (13.04.2005)
22 July 2004 (22.07.2004)	2004-214777	JP	13 April 2005 (13.04.2005)
08 December 2004 (08.12.2004)	2004-355818	JP	13 April 2005 (13.04.2005)

Bayer CropScience GmbH
Patent- u. Lizenzabteilung K 807
Vorg.

Empf. - 6. Mai 2005

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

☐ WV☐ ablegen☐ Vert. wie Vorg.

angegeb.

Castillo Kathy

Facsimile No. +41 22 740 14 35

Facsimile No. +41 22 338 89 70

Telephone No. +41 22 338 9223

(12) Solicitud Internacional publicada según el Tratado de Cooperación Internacional en Materia de Patentes (PCT)

**(19) Organización Mundial para la Propiedad Intelectual
Oficina Internacional**

(43) Fecha de Publicación Internacional:
20 Octubre 2005 (20.10.2005)

(10) Número de publicación Internacional:
WO 2005/096818 A1

PCT

(51) Clasificación Internacional de Patentes⁷: A01N 43/54, C07D 239/52, A01N 43/80, C07D 251/20

(21) Expediente Internacional: PCT/EP2005/002952

(22) Fecha de solicitud internacional:
19 Marzo 2005 (19.03.2005)

(25) Idioma de solicitud: inglés

(28) Idioma de publicación: inglés

(30) Datos de prioridad:

2004-109197	01 abril 2004 (01.04.2004)	JP
2004-214777	22 julio 2004 (22.07.2004)	JP
2004-355616	8 diciembre 2004 (08.12.2004)	JP

(71) Solicitante (para todos los estados designados excepto US): BAYER CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str.50, 40789 Monheim (DE)

(72) Inventor, y

(75) Inventor/Solicitante (sólo para US) ARAKI, Koichi (JP/JP); 2-4-39, Kamiya, Ushiku-shi, Ibaraki 300-1218 (JP), KUDO, Sachio (JP/JP); 3-8-17, Kasuga, Tsukuba-shi, Ibaraki 305-0821 (JP), SATO, Yoshitaka (JP/JP); 1-8-12, Hanahata, Tsukuba-shi, Ibaraki 300-3281 (JP). ENDO, Koiji (JP/JP); 4233-4, Ami, Ami-machi, Inashiki-gun, Ibaraki 300-0331 (JP). SHIRAKURA, Shinichi (JP/JP); 2-8-3, Ekihigashidouri, Oyama-shi, Tochigi 323-0022 (JP). NAKAMURA, Shin (JP/JP); 4-4-8, Joto, Oyama-shi, Tochigi 323-0807 (JP).

(74)Agentes: SCHWENK, Norbert; por encargo de Bayer CropScience GMBH, Law and Patentes, Building K 607, 65926 Frankfurt (DE)

(81) Estados designados (nacional): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

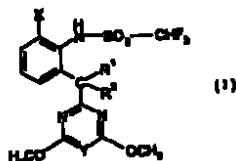
(84) Estados designados (regional): patentes ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), patentes euroasiáticas (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), patentes europeas (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), patentes OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publicado:

- con informe internacional de Búsqueda.

Para códigos con dos letras y otras abreviaturas consulte las "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparece al principio de cada edición regular del boletín PCT.

(54) Enunciado: Título:DERIVADOS DE DIFLUOROMETANOSULFONIL ANILIDAS UTILES COMO HERBICIDAS



(57) Resumen: Nuevos derivados de difluorometanosulfonamida de la fórmula (I).

Los derivados de difluorometanosulfonamida representados por la fórmula, en la que X representa halógeno, Y representa CH o N, R¹ representa hidrógeno y R² representa hidrógeno o hidroxilo, o R¹ y R² en común con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar C=O, y su uso como herbicidas para malezas en campos de arroz.

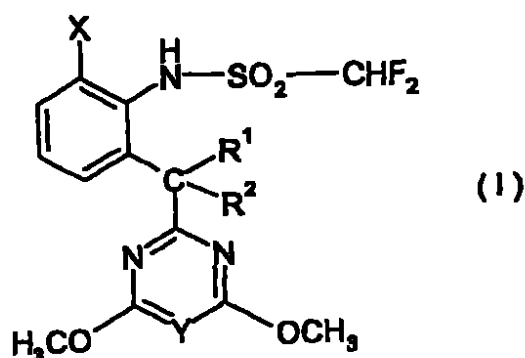
DERIVADOS DE DIFLUOROMETANOSULFONIL ANILIDAS UTILES COMO HERBICIDAS

5 El presente invento se refiere a nuevos derivados de difluorometanosulfonamidas, a un procedimiento para su preparación y a su uso como herbicidas.

Ya se ha conocido que ciertos derivados de sulfonamidas muestran una acción como herbicidas (véanse, por ejemplo, los documentos de solicitudes de patentes internacionales WO 93/09099, WO 96/41799, de solicitud de patente japonesa abierta a
10 inspección del público N° 60562/1999 y de solicitud de patente japonesa abierta a inspección del público N° 44546/2000).

Para desarrollar un herbicida, el problema de reprimir malezas que expresan una resistencia contra los herbicidas existentes, por ejemplo, malezas resistentes a SU (= malezas resistentes a sulfonilureas) ha sido considerado recientemente como uno de los
15 importantes objetivos. Se ha solicitado el desarrollo de un herbicida, que pueda reprimir estas malezas resistentes y otras malezas anuales y perennes, al mismo tiempo, con un único ingrediente.

De acuerdo con el invento se han encontrado los siguientes compuestos de
20 fórmula (I)



en la que

X representa halógeno,

Y representa CH ó N,

25 R¹ representa hidrógeno, y

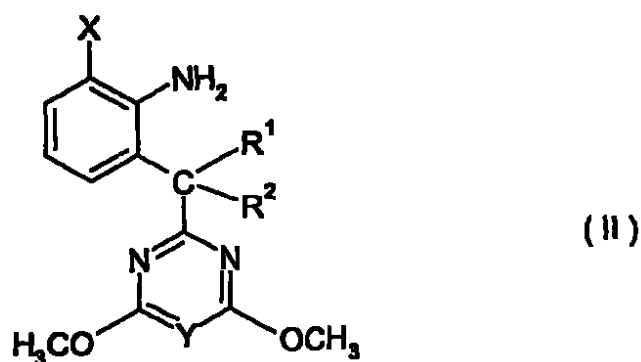
R² representa hidrógeno o hidroxí, o

R¹ y R², en común con el átomo de carbono al que están unidos, pueden formar

C=O.

Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con el invento, se pueden obtener por un procedimiento en el que

5 a) compuestos de la fórmula (II)

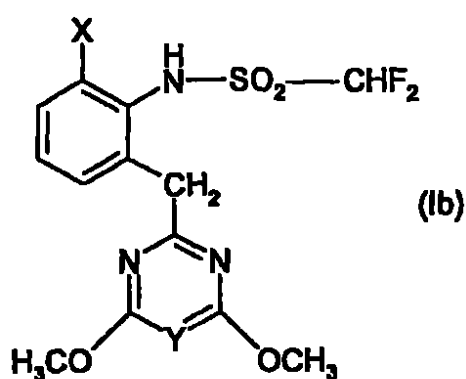


en la que

X, Y, R¹ y R² tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado, se hacen reaccionar con cloruro de difluorometanosulfonilo, en la presencia de disolventes inertes, y, si fuese apropiado, en la presencia de un agente fijador de ácidos, o

b) en el caso de que R¹ y R², en común con el átomo de carbono al que están unidos, formen C=O;

compuestos de la fórmula (Ib)

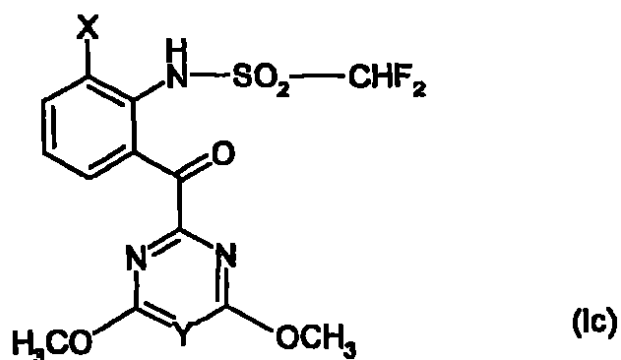


15

en la que X e Y tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado, se hacen reaccionar con un agente oxidante en la presencia de disolventes inertes, y, si fuese apropiado, en la presencia de un catalizador ácido, o

- 3 -

- c) en el caso de que R^1 represente hidrógeno y R^2 represente hidroxilo, compuestos de la fórmula (Ic)



en la que

- 5 X e Y tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado, se hacen reaccionar con un compuesto complejo con un hidruro de metal alcalino o con un complejo con un borano, en la presencia de disolventes inertes.

Los derivados de difluorometanosulfonamidas de la fórmula (I) de acuerdo con el presente invento, muestran fuertes actividades herbicidas.

- 10 Aunque los derivados de difluorometanosulfonamidas de la fórmula (I) están incluidos conceptualmente en los compuestos de la fórmula general que se describe en el documento WO 96/41799, los compuestos de la fórmula (I) son nuevos compuestos, que no se divulgan específicamente en dicha cita de referencia. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) muestran inesperadamente una acción herbicida
- 15 extremadamente fuerte, en comparación con la de compuestos conocidos que tienen una estructura similar, descritos específicamente en el documento WO 96/41799. Ellos muestran una acción herbicida notablemente excelente, en particular contra malezas en campos de arroz, y al mismo tiempo muestran un excelente efecto herbicida contra malezas resistentes a sulfonilureas, lo que constituye un efecto biológico que no se
- 20 describe en el documento WO 96/41799.

Los derivados de difluorometanosulfonamidas de la fórmula (I), de acuerdo con el presente invento, son, por lo tanto, útiles particularmente como herbicidas para campos de arroz.

- 25 En la presente memoria descriptiva, "halógeno" representa flúor, cloro, bromo o yodo, preferiblemente representa flúor o cloro.

En los compuestos de la fórmula (I) antes mencionada, preferiblemente,

X representa flúor o cloro,

Y representa CH ó N,

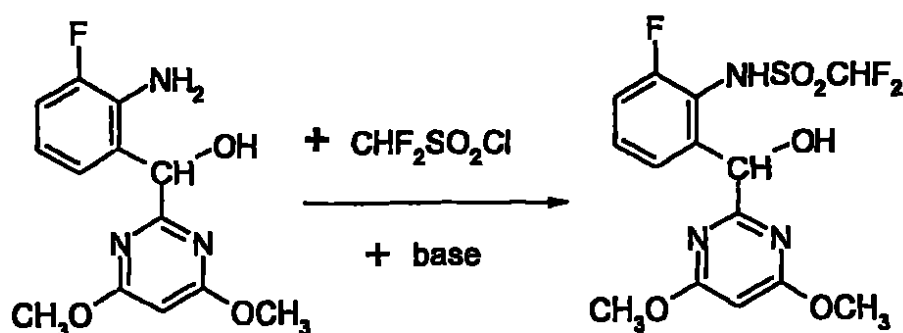
R¹ representa hidrógeno, y

5 R² representa hidrógeno o hidroxilo, o

R¹ y R², en común con el átomo de carbono al que están unidos, pueden formar C=O..

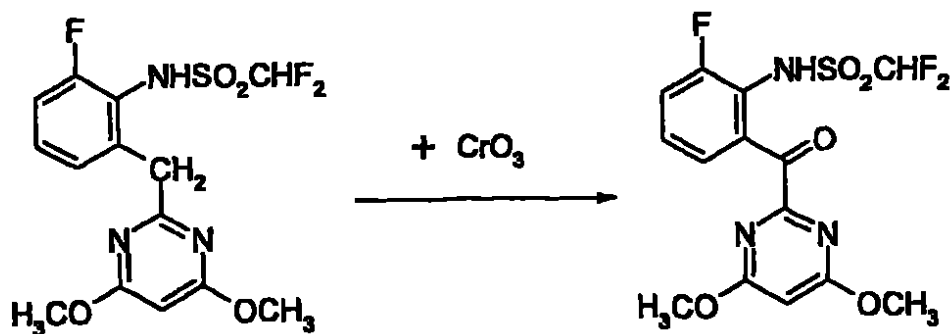
El procedimiento de preparación (a), antes mencionado, se puede ilustrar por el siguiente esquema de reacción, en el caso de que, por ejemplo,

10 se usen como materiales de partida la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-hidroximetil]-anilina y el cloruro de difluorometanosulfonilo.



El procedimiento de preparación (b), antes mencionado, se puede ilustrar por el siguiente esquema de reacción, en el caso de que, por ejemplo,

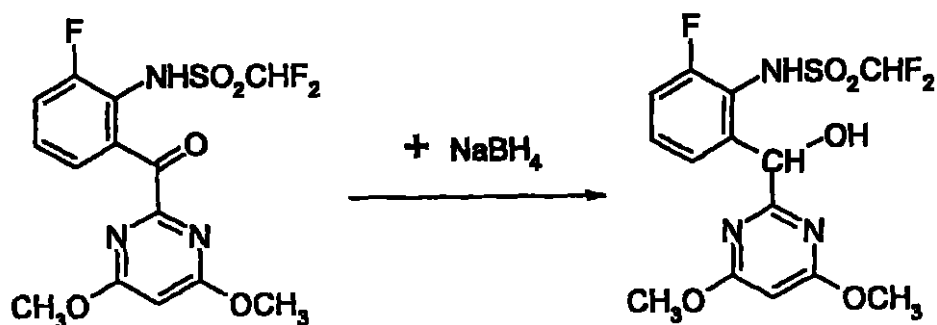
15 se use como material de partida la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-metil)-N-difluorometanosulfonanilida y se use como agente oxidante el óxido de cromo (VI)



El procedimiento de preparación (c), antes mencionado, se puede ilustrar por el siguiente esquema de reacción, en el caso de que, por ejemplo,

20 se use como material de partida la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida y se use el borohidruro de sodio como compuesto complejo

con un hidruro de metal alcalino.

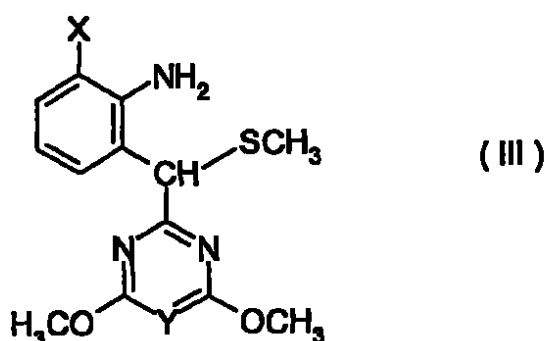


5 Los compuestos, en el caso de que R^1 y R^2 , en común con el átomo de carbono al que están unidos, formen $C=O$, en los compuestos de la fórmula (II) que se usan como materiales de partida en el procedimiento de preparación (a) antes mencionado, incluyen los compuestos conocidos, descritos en el documento WO 96/41799 y se pueden preparar con facilidad, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento descrito en dicha cita de referencia.

10 Además, los compuestos, en el caso de que R^1 represente hidrógeno y R^2 represente hidroxilo en los compuestos de la fórmula (II) antes mencionada, incluyen compuestos conocidos descritos en la solicitud de patente japonesa abierta a inspección del público N° 60562/1999 y se pueden preparar con facilidad, por ejemplo, haciendo reaccionar los compuestos, en el caso de que R^1 y R^2 , en común con el átomo de carbono al que están unidos, formen $C=O$, en la fórmula (II) antes mencionada, con un
15 compuesto complejo con un hidruro metálico, por ejemplo, borohidruro de sodio, aluminio hidruro de litio, etc. de acuerdo con el procedimiento descrito en la misma cita de referencia.

Los compuestos, en el caso de que ambos R^1 y R^2 representen hidrógeno en los compuestos de la fórmula (II) antes mencionada, incluyen compuestos conocidos que se
20 describen en el documento WO 96/41792, y se pueden preparar con facilidad, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula

- 6 -



en la que

X e Y tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado, con un agente reductor, por ejemplo borohidruro de sodio, en la presencia de cloruro de níquel (II), o haciendo reaccionar con níquel Raney de acuerdo con el procedimiento descrito en la misma bibliografía.

Los compuestos de la fórmula (III) antes mencionada incluyen los compuestos conocidos descritos en las citas de referencia de patentes antes mencionadas y se pueden preparar con facilidad, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento descrito en la misma bibliografía.

Como ejemplos específicos de los compuestos de la fórmula (II), usados como materiales de partida en el procedimiento de preparación (a) antes mencionado, se pueden mencionar los siguientes:

- 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina,
- 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina,
- 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina,
- 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina,
- 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]anilina,
- 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]anilina,
- 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]anilina,
- 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]anilina,
- 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,
- 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,
- 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,
- 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]anilina,
- 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,
- 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,

- 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,
 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]anilina,
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)hidroximetil]anilina,
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)hidroximetil]anilina,
 5 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)hidroximetil]anilina,
 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)hidroximetil]anilina,
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,
 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina,
 10 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]anilina, etc.

Los compuestos de la fórmula (Ib), usados como materiales de partida en el procedimiento de preparación (b) antes mencionado, corresponden a una parte de los compuestos de la fórmula (I) del presente invento, que se pueden preparar por el procedimiento de preparación (a) antes mencionado, y como sus ejemplos específicos se pueden mencionar los siguientes:

- 15 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida, etc.

20 Como agente oxidante, usado para la oxidación de los compuestos de la fórmula (Ib) antes mencionada y en el procedimiento de preparación (b) antes mencionado, se pueden mencionar, por ejemplo, óxido de cromo (VI), dióxido de manganeso, dióxido de selenio, dióxido de selenio, etc.

Los compuestos de la fórmula (Ic), usados como materiales de partida en el procedimiento de preparación (c) antes mencionado, corresponden a una parte de los compuestos de la fórmula (I) del presente invento, que se pueden preparar por los procedimientos de preparación (a) o (b) antes mencionados, y como sus ejemplos específicos se pueden mencionar los siguientes:

- 25 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 30 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-bromo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-yodo-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida,
 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida, etc.

Como compuestos complejos con hidruros de metales alcalinos, usados para la

hidrogenación de los compuestos de la fórmula (Ic) en el procedimiento de preparación (c) antes mencionado, se pueden mencionar, por ejemplo, borohidruro de sodio, aluminio hidruro de litio, etc., y como compuesto complejo con un borano se pueden mencionar, por ejemplo, sulfuro de dimetilo borano, piridina-borano, etc..

5 La reacción del procedimiento de preparación (a), antes mencionado, se puede realizar en el seno de un apropiado diluyente. Como ejemplos del diluyente usado en este caso se pueden mencionar hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados), por ejemplo, pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, dietil
10 éter, metil etil éter, diisopropil éter, dibutil éter, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), di(etilen glicol) dimetil éter (DGM), etc.; cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo acetato de etilo,
15 acetato de amilo, etc.; bases, por ejemplo, piridina, etc.

El procedimiento de preparación (a) se puede realizar en la presencia de un agente fijador de ácidos. Como dicho agente fijador de ácidos se pueden mencionar, como base inorgánica, hidruros, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos, etc., de metales alcalinos y metales alcalino-térreos, por ejemplo, hidruro de sodio, hidruro de litio,
20 hidrógeno carbonato de sodio, hidrógeno carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de calcio, etc.; amiduros inorgánicos de metales alcalinos, por ejemplo, amiduro de litio, amiduro de sodio, amiduro de potasio, etc.; como base orgánica, aminas terciarias, dialquilamino-anilinas y piridinas, por ejemplo, trietilamina, 1,1,4,4-
25 tetrametiletilendiamina (TMEDA), N,N-dimetilanilina, N,N-diétilanilina, piridina, 4-dimetilaminopiridina (DMAP), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU), etc.

El procedimiento de preparación (a) se puede realizar en un intervalo sustancialmente amplio de temperaturas. Es preferible, sin embargo, realizarlo a las
30 temperaturas situadas en el intervalo, en general, de aproximadamente -100 a aproximadamente 60°C, en particular de aproximadamente -80 a aproximadamente 40°C. Aunque dicha reacción se realiza, de manera deseable, bajo una presión normal, se puede realizar opcionalmente bajo una presión elevada o bajo una presión reducida.

Para realizar el procedimiento de preparación (a), el compuesto buscado se

puede obtener, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 5 moles de cloruro de difluorometano-sulfonilo con 1 mol del compuesto de la fórmula (II) en el seno de un diluyente, por ejemplo, diclorometano, en la presencia de 1 a 5 moles de piridina.

La reacción del procedimiento de preparación (b), antes mencionado, se puede
5 realizar en el seno de un apropiado diluyente. Como ejemplos del diluyente usado en este caso se pueden mencionar agua; hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados), por ejemplo, hexano, ciclohexano, ligroína, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, dietil éter, metil etil éter, diisopropil éter, dibutil
10 éter, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), di(etilen glicol) dimetil éter (DGM), etc.; cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; amidas de ácidos, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-
15 metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, hexametil triamida de ácido fosfórico (HMPA), etc.; sulfonas y sulfóxidos, por ejemplo, dimetil sulfóxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina, etc.; ácidos, por ejemplo, ácido acético, etc..

El procedimiento de preparación (b) se puede realizar en la presencia de un catalizador ácido y como ejemplos de dicho catalizador ácido se pueden mencionar
20 ácidos inorgánicos, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido bromhídrico, hidrógeno sulfito de sodio, etc.; ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido propiónico, ácido metanosulfónico, ácido bencenosulfónico, ácido p-toluenosulfónico, etc.

El procedimiento de preparación (b) se puede realizar en un intervalo
25 sustancialmente amplio de temperaturas. Es preferible, sin embargo, realizarlo a las temperaturas situadas en el intervalo, en general, de aproximadamente -100 a aproximadamente 150°C, en particular de aproximadamente 20 a aproximadamente 120°C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente bajo una presión normal, se puede realizar opcionalmente bajo una presión elevada o bajo una presión reducida.

30 Para realizar el procedimiento de preparación (b), el compuesto buscado se puede obtener, por ejemplo, haciendo reaccionar de 1 a 10 moles de óxido de cromo (VI) por 1 mol del compuesto de la fórmula (Ib) en el seno de un diluyente, por ejemplo, ácido acético.

La reacción del procedimiento de preparación (c) antes mencionado se puede

realizar en el seno de un apropiado diluyente. Como ejemplos del diluyente usado en este caso, se pueden mencionar agua; hidrocarburos alifáticos, alicíclicos y aromáticos (que opcionalmente pueden estar clorados), por ejemplo, pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno, etc.; éteres, por ejemplo, dietil éter, metil etil éter, diisopropil éter, dibutil éter, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF), di(etilen glicol) dimetil éter (DGM), etc.; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, etc.; alcoholes, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilen glicol, etc.; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo, etc.; amidas de ácidos, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, hexametil triamida de ácido fosfórico (HMPA), etc.; sulfonas y sulfóxidos, por ejemplo, dimetil sulfóxido (DMSO), sulfolano, etc.; bases, por ejemplo, piridina, etc.

El procedimiento de preparación (c) se puede realizar en un intervalo sustancialmente amplio de temperaturas. Es preferible, sin embargo, realizarlo a las temperaturas situadas en el intervalo, en general, de aproximadamente -100 a aproximadamente 60°C, en particular de aproximadamente -80 a aproximadamente 40°C. Aunque dicha reacción se realiza deseablemente bajo una presión normal, se puede realizar opcionalmente bajo una presión elevada o bajo una presión reducida.

Para realizar el procedimiento de preparación (c), el compuesto buscado se puede obtener, por ejemplo, haciendo reaccionar de 0,25 a 2 moles de borohidruro de sodio con 1 mol del compuesto de la fórmula (III) en el seno de un diluyente, por ejemplo, metanol.

Se pueden tratar de acuerdo con el invento todas las plantas y partes de plantas. Se ha de entender que el término "plantas" significa en el presente contexto todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas e indeseadas o plantas cultivadas (incluyendo plantas cultivadas que aparecen en la naturaleza). Las plantas cultivadas pueden ser plantas que se pueden obtener por métodos convencionales de cultivación y optimización de plantas o mediante métodos biotecnológicos y recombinantes o por combinaciones de estos métodos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las cultivares (variantes de cultivo) protegibles o no protegibles por derechos de cultivadores de plantas. Se ha de entender que el término "partes de plantas" significa todas las partes y todos los órganos de plantas por encima y por debajo del suelo tales como vástagos, hojas, flores y raíces, siendo ejemplos que se

pueden mencionar hojas, agujas, tallos, peciolo, flores, cuerpos de frutas, frutas, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas incluyen también materiales cosechados y materiales de propagación vegetativos y generativos, por ejemplo, recortes, tubérculos, rizomas, pimpollos y semillas.

- 5 El tratamiento de acuerdo con el invento de las plantas y de las partes de plantas con los compuestos activos se lleva a cabo directamente o dejando que los compuestos actúen sobre sus alrededores, su entorno o su espacio de almacenamiento mediante los acostumbrados métodos de tratamiento, por ejemplo, por inmersión, proyección, evaporación, nebulización, diseminación, aplicación con brocha, y, en el caso de un
- 10 material de propagación, en particular en el caso de semillas, también mediante aplicación de uno o más revestimientos.

- Los compuestos activos de la fórmula (I) antes mencionada, de acuerdo con el invento, se pueden usar particularmente contra malezas en campos de arroz. Como ejemplos de las malezas en campos de arroz, que se pueden reprimir usando los
- 15 compuestos activos, de acuerdo con el presente invento, se pueden mencionar los siguientes:

Plantas dicotiledóneas de los siguientes géneros: *Polygonum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Bidens, Dopatrium, Eclipta, Elatine, Gratiola, Lindernia, Ludwigia, Oenantho, Ranunculus, Deinostema, etc.*

- 20 Plantas monocotiledóneas de los siguientes géneros: *Echinochloa, Panicum, Poa, Cyperus, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Alisma, Aneilema, Blyxa, Eriocaulon, Potamogeton, etc.*

- Los compuestos activos de la fórmula (I) antes mencionada, de acuerdo con el presente invento, se pueden usar específicamente en relación, por ejemplo, con las
- 25 siguientes malezas representativas en campos de arroz:

Nombre de planta en latín

Plantas dicotiledóneas:

Rotala indica Koehne

Lindernia procumbens Philcox

- 30 *Lindernia dubia L. Penn.*

Lindernia angustifolia

Ludwigia prostrata Roxburgh

Potamogeton distinctus A. Benn

Elatine triandra Schk

Oenanthé javanica

Plantas monocotiledóneas:

Echinochloa oryzicola Vasing

Eleocharis acicularis L.

5 *Eleocharis kuoroguwai* Ohwi

Cyperus difformis L.

Cyperus serotinus Rottboel

Scirpus juncoides Roxburgh

Monochoria vaginalis Presl

10 *Sagittaria pygmaea* Miq

Alisma canaliculatum A. Br. Et Bouche

Sagittaria trifolia

Monochoria korsakowii

Además, los compuestos activos de la fórmula (I) antes mencionada, de acuerdo con el presente invento, se pueden usar efectivamente también contra, por ejemplo, las malezas antes mencionadas que muestran resistencia contra herbicidas del tipo de las sulfonilureas.

El uso de los compuestos activos de la fórmula (I) antes mencionada, de acuerdo con el presente invento, sin embargo, no está restringido al uso contra estas clases de malezas, sino que se puede aplicar de una manera similar contra otras clases de malezas en campos de arroz y otras malezas distintas de las malezas resistentes a herbicidas del tipo de las sulfonilureas.

Los compuestos activos, de acuerdo con el presente invento, se pueden formular como formas de formulación acostumbradas en la aplicación real. Como tales formas de formulación se pueden mencionar, por ejemplo, soluciones, polvos humectables, emulsiones, suspensiones, polvos, granulados dispersables en agua, tabletas, granulados, concentrados para suspo-emulsiones, microcápsulas en una sustancia polimérica, formulaciones jumbo, etc.

Estas formulaciones se pueden preparar por métodos conocidos de por sí, por ejemplo, mezclando los compuestos activos con agentes extendedores, a saber diluyentes o vehículos o sólidos, y opcionalmente con agentes activos superficialmente, a saber emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma.

Como diluyentes o vehículos líquidos se pueden mencionar, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno, alquilnaftalenos, etc.),

hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobencenos, cloruros de etileno, cloruro de metileno, etc.), hidrocarburos alifáticos [por ejemplo, ciclohexano, etc., o parafinas (por ejemplo, fracciones de aceites minerales, etc.)], alcoholes (por ejemplo, butanol, glicoles, etc.) y sus éteres, ésteres, etc., cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, ciclohexanona, etc.), disolventes fuertemente polares (por ejemplo, dimetilformamida, dimetil sulfóxido, etc.), agua, etc.. En el caso de que se use agua como agente extendedor, se pueden usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares.

Como diluyentes o vehículos sólidos se pueden mencionar, por ejemplo, minerales naturales triturados (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, greda, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, tierra de diatomeas, etc.), minerales sintéticos triturados (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersado, alúmina, silicatos, etc.), etc. Como soportes sólidos para granulados se pueden mencionar rocas machacadas y fraccionadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, etc.), granulados sintéticos de polvos finos inorgánicos y orgánicos, partículas de materiales orgánicos (por ejemplo, polvo de aserrín, cáscaras de nuez de coco, mazorcas de maíz, tallos de tabaco, etc.), etc.

Como agentes emulsionantes y/o formadores de espumas se pueden mencionar, por ejemplo, emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo, poli(oxietilén) ésteres de ácidos grasos, poli(oxietilén) (ácido graso) alcohol éteres (por ejemplo, alquilaril poliglicol éteres, alquil-sulfonatos, alquil-sulfatos, aril-sulfonatos, etc.)], productos de hidrólisis de albúminas, etc.

Los dispersantes incluyen, por ejemplo, un líquido residual del procedimiento al sulfito de obtención de lignina, metil celulosa, etc.

Se pueden usar también adhesivos en formulaciones (polvos, granulados, concentrados emulsionables). Como tales adhesivos se pueden mencionar, por ejemplo, carboximetil celulosa, polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo, goma arábiga, un poli(alcohol vinílico), un poli(acetato de vinilo), etc.).

Se pueden usar también colorantes. Como dichos colorantes se pueden mencionar pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxidos de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia, etc.), colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos o colorantes de metal - ftalocianinas y otros nutrientes trazas (oligoelementos), tales como sales de metales tales como hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno, zinc, etc.

Dichas formulaciones pueden contener los compuestos activos de la fórmula (I) en el intervalo, en general, de 0,01 a 95 % en peso, de manera preferible, de 0,1 a 90 % en peso.

- Los compuestos activos de la fórmula (I), de acuerdo con el presente invento, se
- 5 pueden usar para la represión de malezas, tal como están o en sus formas de formulación. Asimismo los compuestos activos de la fórmula (I) se pueden usar también en combinación con herbicidas conocidos. Composiciones herbicidas mixtas con herbicidas conocidos se pueden preparar previamente en las formas de formulación finales, o se pueden preparar por mezcla en depósito cuando se usan. Como los
- 10 herbicidas que se pueden usar como composiciones herbicidas mixtas en combinación con los compuestos de la fórmula (I) se pueden mencionar, por ejemplo, los siguientes herbicidas representados por nombres genéricos como ejemplos típicos:
- herbicidas del tipo de acetamidas: por ejemplo, pretilaclo, butaclo, tenilclo, alaclo, etc.;
- 15 herbicidas del tipo de amidas: por ejemplo, clomeprop, etobenzanida, etc.;
- herbicidas del tipo de benzofuranos: por ejemplo, benfuresato, etc.;
- herbicidas del tipo de indanodionas: por ejemplo, indanofán, etc.;
- herbicidas del tipo de pirazoles: por ejemplo, pirazolato, benzofenap, pirazoxifeno, etc.;
- herbicidas del tipo de oxazinonas: por ejemplo, oxaziclomefona, etc.;
- 20 herbicidas del tipo de sulfonilureas: por ejemplo, bensulfurón-metilo, azimsulfurón, imazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, ciclosulfamurón, etoxisulfurón, halosulfurón-metilo, etc.;
- herbicidas del tipo de tiocarbamatos: por ejemplo, tiobencarb, molinato, piributicarb, etc.;
- herbicidas del tipo de triazinas: por ejemplo, dimetametrín, simetrín, etc.;
- 25 herbicidas del tipo de triazoles: por ejemplo, cafenstrole, etc.;
- herbicidas del tipo de quinolinas: por ejemplo, quinclo, etc.;
- herbicidas del tipo de isoxazoles: por ejemplo, isoxaflutol, etc.;
- herbicidas del tipo de ditiósfatos: por ejemplo, anilofos, etc.;
- herbicidas del tipo de oxiacetamidas: por ejemplo, mefenacet, flufenacet, etc.;
- 30 herbicidas del tipo de tetrazolinonas: por ejemplo, fentrazamida, etc.;
- herbicidas del tipo de dicarboxiimidas: por ejemplo, pentoxazona, etc.;
- herbicidas del tipo de oxadiazolonas: por ejemplo, oxadiazol, oxadiazona, etc.;
- herbicidas del tipo de trionas: por ejemplo, sulcotriona, benzobicidón, etc.;
- herbicidas del tipo de fenoxipropionatos: por ejemplo, cihalofop-butilo, etc.;

herbicidas del tipo de ácidos benzoicos: por ejemplo, piriminobaco-metilo, bispiribaco-sodio, etc.;

herbicidas del tipo de difenil éteres: por ejemplo, clometoxinilo, oxifluorfenilo, etc.;

herbicidas del tipo de piridina dicarbotioatos: por ejemplo, ditiopir, etc.;

5 herbicidas del tipo de fenoxi: por ejemplo, MCPA, MCPB, etc.;

herbicidas del tipo de ureas: por ejemplo, dimrón, cumilurón, etc.;

herbicidas del tipo de naftalenodionas: por ejemplo, quinoclamina, etc.;

herbicidas del tipo de isoxazolidinonas: por ejemplo, clomazona, etc.;

Los compuestos activos antes mencionados son herbicidas conocidos, descritos
10 en el "Pesticide Manual" (Manual de los plaguicidas) publicado en el 2000 por el British Crop Protect Council.

Además, cuando los compuestos activos de la fórmula (I), de acuerdo con el
presente invento, se mezclan con antidotos, la fitotoxicidad es reducida mediante la
mezcladura y se proporciona un espectro más amplio de represión de malezas, y se
15 puede ampliar la aplicación como herbicidas selectivos.

Como tales antidotos, se pueden mencionar, por ejemplo, los siguientes
compuestos representados por nombres genéricos o códigos desarrollados:

AD-67, BAS-145138, benoxacor, cloquintocet-mexilo, ciometrinilo, 2,4-D, DKA-
24, dicloromida, dimrón, fendlorima, fendlorazol-etilo, flurazol, fluxofenima, flurazol,
20 isoxadifeno-etilo, menfenpir-dietilo, MG-191, anhídrido naftálico, oxavetrinilo, PPG-1292,
R-29148, etc.

Los antidotos antes mencionados se describen también en el "Pesticide Manual"
publicado en el 2000 por el British Crop Protect Council.

Además, es posible mezclar adicionalmente los antidotos antes mencionados
25 con una composición herbicida mixta que consiste en los compuestos de la fórmula (I)
de acuerdo con el presente invento y en uno de los herbicidas antes mencionados.
Mediante la mezcladura se reduce la fitotoxicidad y se proporciona un más amplio
espectro de represión de malezas y se puede ampliar la aplicación como herbicidas
selectivos.

30 Sorprendentemente, algunas de las composiciones herbicidas mixtas que
consisten en un compuesto del presente invento y en un herbicida conocido y/o un
antidoto, pueden mostrar efectos sinérgicos.

En el caso de usarse los compuestos activos de la fórmula (I), éstos se pueden
usar directamente tal como están o se pueden usar en formas de formulación tales

como soluciones listas para el uso, concentrados emulsionables, tabletas, suspensiones, polvos, pastas o granulados, o se pueden usar en formas de uso preparadas por dilución adicional. Los compuestos activos del presente invento se pueden aplicar, por ejemplo, por medio de riego, proyección, atomización, aplicación de
5 granulados, etc.

Los compuestos aditivos de la fórmula (I) se pueden usar en cualesquiera estadios antes y después de la germinación de las plantas. Se pueden mezclar también dentro de la tierra antes de la siembra.

La cantidad aplicada de los compuestos aditivos de la fórmula (I) se puede hacer
10 variar en un intervalo sustancial. Es fundamentalmente diferente dependiendo de las propiedades y de los efectos que se deseen. En el caso de usarse como herbicidas, se pueden mencionar unas cantidades aplicadas situadas en el intervalo de, por ejemplo, aproximadamente 0,0001 a aproximadamente 4 kg, de manera preferible de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 3 kg de compuesto activo por hectárea.

15 Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con el invento. En una realización preferida, se tratan especies de plantas silvestres y cultivares, o las obtenidas por cultivación biológica convencional, tal como cruce o fusión de protoplastos, y partes de las mismas. En una realización adicionalmente preferida, se tratan plantas y cultivares transgénicas obtenidas por
20 ingeniería genética, si fuese apropiado en combinación con métodos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente) y partes de las mismas. Los términos "partes" o "partes de plantas" o "partes en plantas" se han explicado anteriormente.

De manera preferida particularmente, plantas de las cultivares que se usan en cada caso, comercialmente disponibles o en uso se tratan de acuerdo con el invento. Se
25 ha de entender que el término cultivares significa plantas que tienen ciertas propiedades ("rasgos") y que se han obtenido por cultivación convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades biotipos o genotipos.

Dependiendo de las especies o cultivares de plantas, de su situación y de sus condiciones de crecimiento (tierras, climas, período de vegetación, dieta), el tratamiento
30 de acuerdo con el invento puede dar también como resultado efectos superiores a los aditivos ("sinérgicos"). Así, por ejemplo, son posibles unos regímenes de aplicación reducidos y/o una ampliación del espectro de actividades y/o un aumento en la actividad de las sustancias y de las composiciones que se pueden usar de acuerdo con el invento, también en combinación con otros compuestos activos agroquímicamente, un mejor

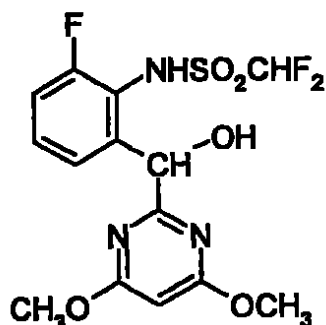
crecimiento de las plantas, una tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, una tolerancia aumentada a la sequía o al contenido de sales en el agua o en la tierra, un rendimiento de florecimiento aumentado, una cosecha más fácil, una maduración acelerada, unos rendimientos más altos de las cosechas, una mejor calidad y/o un valor nutritivo más alto de los productos cosechados, una mejor estabilidad en almacenamiento y/o una mejor elaborabilidad de los productos cosechados, que superan a los efectos que actualmente se podían esperar.

Las plantas o cultivos transgénicos (es decir las obtenidas por ingeniería genética) que son tratadas preferiblemente de acuerdo con el invento, incluyen todas las plantas que, en la modificación genética, han recibido un material genético que confiere propiedades ("rasgos") particularmente ventajosas a estas plantas. Ejemplos de tales propiedades son un mejor crecimiento de las plantas, una tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, una tolerancia aumentada a la sequía o al contenido de sales en el agua o en la tierra, un rendimiento de florecimiento aumentado, una cosecha más fácil, una maduración acelerada, unos rendimientos más altos de las cosechas, una mejor calidad y/o un valor nutritivo más alto de los productos cosechados, una mejor estabilidad en almacenamiento y/o una mejor elaborabilidad de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente resaltados de estas propiedades son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatogénicos, bacterias y/o virus, y también una tolerancia aumentada de las plantas para ciertos compuestos activos como herbicidas. Ejemplos de plantas transgénicas que se pueden mencionar son las importantes plantas cultivadas, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, algodón, colza oleaginosa y también plantas con frutas (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), y se da una énfasis particular a maíz, soja, patatas, algodón y colza oleaginosa. Los rasgos que se resaltan son en particular una defensa aumentada de las plantas contra insectos por medio de toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de ellos) (seguidamente mencionadas como "plantas Bt"). Rasgos, que también se resaltan particularmente, son la defensa aumentada de las plantas contra hongos, bacterias y virus por una resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, genes elicitores (provocadores) y genes de resistencia, y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas. Unos rasgos que

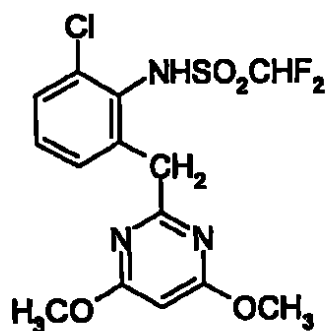
se resaltan además particularmente, son la tolerancia aumentada de las plantas frente a ciertos compuestos activos como herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que confieren los deseados rasgos en cuestión, pueden estar presentes también en combinación unos con otros en las plantas transgénicas. Ejemplos de "plantas Bt" que se pueden mencionar, son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se venden bajo los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas, que se pueden mencionar, son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden bajo los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza oleaginosa), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Plantas resistentes a los herbicidas (plantas cultivadas de una manera convencional para obtener tolerancia a herbicidas) que se pueden mencionar, incluyen las variedades vendidas bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Desde luego, estas manifestaciones se aplican también a cultivares que tienen estos rasgos genéticos, o que tienen unos rasgos genéticos que todavía se han de desarrollar, cuyas plantas serán desarrolladas y/o vendidas en el futuro.

Las plantas enumeradas se pueden tratar de acuerdo con el invento de una manera particularmente ventajosa con los compuestos de la fórmula (I) o con las mezclas de compuestos activos de acuerdo con el invento, en las que además de la represión efectiva de las malezas, se presentan los efectos sinérgicos antes mencionados con las plantas transgénicas o cultivares de plantas. Los intervalos preferidos antes señalados para los compuestos activos o sus mezclas se aplican también al tratamiento de estas plantas. Se da énfasis particular al tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas que se mencionan específicamente en el presente texto.

A continuación se mostrarán mediante los siguientes ejemplos otros ejemplos específicos adicionales de la preparación y aplicación de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con el presente invento. Sin embargo, el presente invento no deberá ser restringido sólo a éstos de ninguna de las maneras.

Ejemplo de Síntesis 1

- Se disolvieron 1,6 g (5,28 mmol) de 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-hidroximetil]anilina en diclorometano (13 ml) y se añadieron a esto 0,91 g (11,46 mmol) de piridina. La solución se enfrió a -5°C y se añadió a esto una solución de 1,73 g (11,46 mmol) de cloruro de difluorometanosulfonilo en diclorometano (2 ml). La solución de reacción se agitó a la temperatura ambiente durante 4 días y después de la adición de agua, se extrajo tres veces con diclorometano. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico 1 N y con agua. Después de haber secado, el diclorometano se separó por destilación bajo presión reducida y la sustancia oleosa obtenida se purificó por cromatografía en columna usando un disolvente mixto 1:3 de acetato de etilo y hexano como eluyente, para obtener 0,94 g de la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-hidroximetil]-N-difluorometanosulfonanilida buscada (rendimiento 42 %) en forma de cristales de color amarillo pálido.
- ¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,99 (6H, s), 4,97 (1H, d), 5,99 (1H, s), 6,13 (1H, d), 6,61 (1H, t), 7,07-7,13 (1H, m), 7,23-7,29 (1H, m), 7,51-7,53 (1H, m), 10,57 (1H, br).

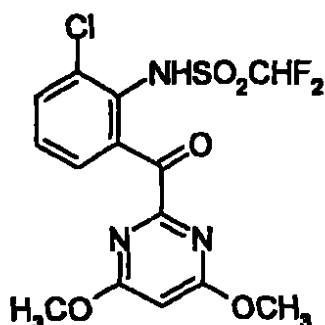
Ejemplo de Síntesis 2

- Se disolvieron 1,54 g (5,51 mmol) de 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-

il)metil]anilina en diclorometano (12 ml) y se añadieron a esto 0,87 g (11,01 mmol) de piridina. La solución se enfrió a -5°C y se añadió a esto una solución de 1,66 g (11,01 mmol) de cloruro de difluorometanosulfonilo en diclorometano (2 ml). La solución de reacción se agitó a la temperatura ambiente durante 4 días y después de la adición de
 5 agua, se extrajo tres veces con diclorometano. Después de que la capa orgánica hubo sido lavada con agua y secada, el diclorometano se separó por destilación bajo presión reducida y los 1,2 g de la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida buscada (rendimiento de 55 %) se obtuvieron en forma de cristales blancos a partir de la sustancia oleosa obtenida, mediante cromatografía en columna usando un
 10 disolvente mixto 1 : 6 de acetato de etilo y hexano como eluyente.
¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,94 (6H, s), 4,30 (2H, s), 5,92 (1H, s), 6,74 (1H, t), 7,18-7,21 (1H, m), 7,33-7,38 (2H, m), 11,09 (1H, br).

El siguiente compuesto se obtuvo por el mismo procedimiento que el del Ejemplo de Síntesis 2 antes mencionado
 15 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida.
¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 4,05 (6H, s), 4,22 (2H, s), 6,56 (1H, t), 7,07-7,28 (3H, m), 10,16 (1H, s).

Ejemplo de Síntesis 3



20

Se disolvieron 0,4 g (1,02 mmol) de 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]-N-difluorometanosulfonanilida en ácido acético (6 ml) y se añadieron a esto 0,31 g (3,05 mmol) de óxido de cromo (VI). La solución se calentó a 30°C y se agitó durante 6 horas. Después de haber agitado durante 12 horas adicionales a la temperatura ambiente, la
 25 solución de reacción se diluyó con agua y se extrajo tres veces con dietil éter. La capa orgánica se lavó con agua. Después de haber secado, el dietil éter se separó por destilación bajo presión reducida y los 0,28 g de la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida buscada (rendimiento 67 %), se obtuvieron en

forma de cristales de color blanco a partir de la sustancia oleosa obtenida, mediante cromatografía en columna usando un disolvente mixto 1 : 3 de acetato de etilo y hexano como eluyente.

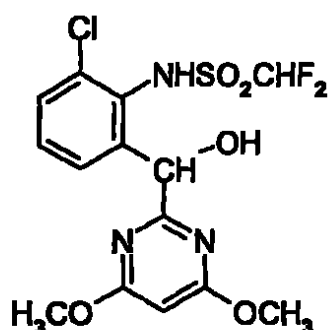
¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,93 (6H, s), 6,19 (1H, s), 6,34 (1H, t), 7,37-7,43 (1H, m),
5 7,63-7,69 (2H, m).

El siguiente compuesto se obtuvo por el mismo procedimiento que el del Ejemplo de Síntesis 3 antes mencionado:

2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxitriazin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 4,10 (6H, s), 6,48 (1H, t), 7,36 (1H, m), 7,45 (1H, t), 7,55
10 (1H, d), 9,08 (1H, s).

Ejemplo de Síntesis 4



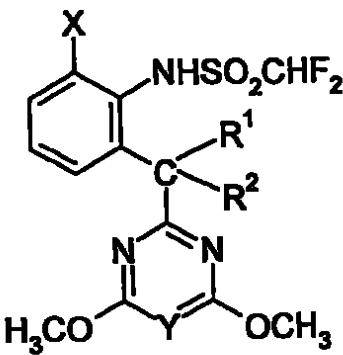
Se disolvieron 0,83 g (2,04 mmol) de 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)carbonil]-N-difluorometanosulfonanilida en 30 ml de metanol y, después de haberla
15 enfriado a 5°C, se le añadieron, mientras que se agitaba, 0,15 g (4,07 mmol) de borohidruro de sodio. Luego la solución se agitó a la temperatura ambiente durante 2 horas. La solución de reacción se separó por destilación bajo presión reducida y los cristales obtenidos se disolvieron en agua y en diclorometano, y se neutralizaron con
20 ácido cítrico. La capa orgánica se separó y la capa de agua se extrajo adicionalmente tres veces con diclorometano. Después de que la capa orgánica hubo sido lavada con agua y secada, el diclorometano se separó por destilación bajo presión reducida para obtener los 0,79 g (rendimiento 95 %) de la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)hidroximetil]-N-difluoro-metanosulfonanilida buscada en forma de cristales de color
25 blanco.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,99 (6H, s), 4,99 (1H, br), 5,99 (1H, s), 6,24 (1H, s), 6,76 (1H, t), 7,27-7,30 (1H, m), 7,39-7,42 (1H, m), 7,64-7,67 (1H, m), 10,62 (1H, br).

Los compuestos obtenidos de la misma manera que en los Ejemplos de Síntesis

1-4 antes mencionados se muestran, conjuntamente con los compuestos sintetizados en los Ejemplos de Síntesis 1-4, en la siguiente Tabla 1, y sus propiedades físicas y químicas se muestran en la Tabla 2.

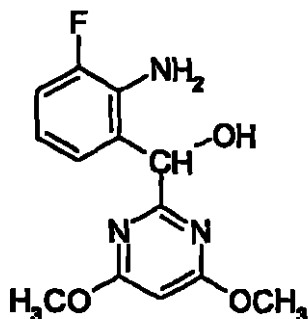
5 Tabla 1



Compuesto N°	X	Y	R ¹	R ²
1	F	CH	H	OH
2	F	N	H	OH
3	Cl	CH	H	OH
4	Cl	N	H	OH
5	Br	CH	H	OH
6	Br	N	H	OH
7	I	CH	H	OH
8	I	N	H	OH
9	F	CH	H	H
10	F	N	H	H
11	Cl	CH	H	H
12	Cl	N	H	H
13	Br	CH	H	H
14	Br	N	H	H
15	I	CH	H	H
16	I	N	H	H
17	F	CH	C=O	
18	F	N	C=O	
19	Cl	CH	C=O	
20	Br	CH	C=O	
21	Br	N	C=O	
22	I	CH	C=O	
23	I	N	C=O	

Tabla 2

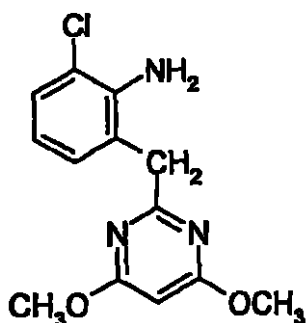
Compuesto N°	Propiedades químicas y físicas (¹ H-NMR(300MHz, CDC ₃)δ)
1	3.99(6H,s), 4.97(1H,d), 5.99(1H,s), 6.13 (1H,d), 6.61(1H,t), 7.07-7.13(1H,m), 7.23-7.29(1H,m), 7.51-7.53(1H,m), 10.57(1H,br).
2	4.08(6H,s),6.10(1H,s),6.58(1H,t),7.13(1H,t),7.26-7.33(1H,m), 7.47(1H,d),9.60(1H,s).
3	3.99(6H,s),4.99(1H,br), 5.99(1H,s), 6.24 (1H,s), 6.76(1H,t), 7.27-7.30(1H,m), 7.39-7.42(1H,m), 7.64-7.67(1H,m), 10.62(1H,br).
9	3.97(6H,s), 4.26(2H,s), 5.94(1H,s), 6.59(1H,t),7.05-7.13(1H,m), 7.16-7.23(2H,m),11.14(1H,br).
10	4.05(6H,s), 4.22(2H,s), 6.56(1H,t), 7.07-7.28(3H,m), 10.16(1H,s).
11	3.94(6H, s), 4.30(2H, s), 5.92(1H,s), 6.74(1H,t), 7.18-7.21(1H,m), 7.33-7.38(2H,m), 11.09(1H,br).
12	4.02(6H,s) 4.34(2H,s) 6.68(1H,t) 7.22(1H) 7.32(1H) 7.41(1H) 9.98(1H,br).
17	3.97(6H,s),6.20(1H,s),6.51(1H,t),7.29-7.34(1H,m),7.39-7.46(1H,m), 7.55-7.58(1H,m),11.14(1H,br).
18	4.10(6H,s),6.48(1H,t),7.36(1H,m),7.45(1H,t),7.55(1H,d),9.08(1H,s),
19	3.93(6H,s),6.19(1H,s),6.34(1H,t),7.37-7.43(1H,m),7.63-7.69(2H,m).

Ejemplo de Referencia 1

Se disolvieron 2,68 g (9,67 mmol) de 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)-
 5 carbonil]anilina en metanol (80 ml) y, después de haber enfriado a 5°C, se añadieron a
 esto mientras que se agitaba 0,73 g (19,33 mmol) de borohidruro de sodio. Luego, la
 solución se agitó a la temperatura ambiente durante 2 horas. La solución de reacción se
 separó por destilación bajo presión reducida y los cristales obtenidos se disolvieron en
 agua y en diclorometano. La capa orgánica se separó y la capa de agua se extrajo
 adicionalmente tres veces con diclorometano. Después de que la capa orgánica hubo
 10 sido lavada con agua y secada, el diclorometano se separó por destilación bajo presión
 reducida para obtener 2,66 g (rendimiento 98 %) de la 2-fluoro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-
 2-il)hidroximetil]anilina buscada, en forma de cristales de color blanco.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,94 (6H, s), 4,74 (3H, m), 5,84 (1H, d), 5,94 (1H, s), 6,66-
 6,73 (1H, m), 6,88-6,95 (1H, m), 7,13-7,15 (1H, m).

15

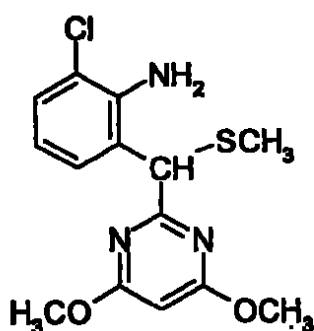
Ejemplo de Referencia 2

A 10 ml de una solución en metanol de 0,6 g (1,84 mmol) de 2-cloro-6-[1-(4,6-
 dimetoxipirimidin-2-il)-1-metiltiometil]anilina y 0,88 g (3,68 mmol) de cloruro de níquel (II)
 20 hexahidrato, se les añadieron 0,28 g (7,37 mmol) de borohidruro de sodio a 0-10°C y la
 solución de reacción se agitó a la temperatura ambiente durante 2 horas. Después de

que la solución de reacción hubo sido separada por destilación bajo presión reducida, se añadieron amoníaco acuoso y diclorometano, y el material insoluble se separó por filtración. La capa orgánica se separó y la capa de agua se extrajo adicionalmente tres veces con diclorometano. Después de que la capa orgánica hubo sido lavada con agua y secada, el diclorometano se separó por destilación bajo presión reducida y los cristales obtenidos se lavaron con n-hexano para obtener 0,48 g (rendimiento 93 %) de la 2-cloro-6-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)metil]anilina buscada, en forma de cristales de color blanco. ¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 3,91 (6H, s), 4,01 (2H, s), 5,18 (2H, s), 5,81 (1H, s), 6,62-6,67 (1H, m), 7,14-7,17 (2H, m).

10

Ejemplo de Referencia 3



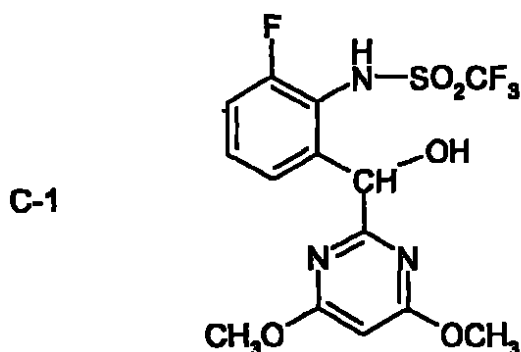
Se disolvieron 5,2 g (26,0 mmol) de 2-cloro-anilina en diclorometano (200 ml) y la solución se enfrió a -70°C. A la solución enfriada se le añadió gota a gota una solución en diclorometano (10 ml) de 2,82 g (26,0 mmol) de hipoclorito de terc.-butilo, y la solución se agitó a -70°C durante 10 minutos. A la solución de reacción obtenida se le añadió gota a gota una solución en diclorometano (20 ml) de 3,38 g (26,0 mmol) de 2-metiltiometil-4,6-dimetoxipirimidina, y la solución se agitó a -70°C durante 40 minutos. A la solución de reacción obtenida se le añadió una solución al 28 % de metóxido de sodio en metanol (9 ml) y la solución se agitó hasta que llegó a temperatura ambiente. Se añadió agua a la solución de reacción y la capa orgánica se separó. La capa de agua se extrajo adicionalmente dos veces con diclorometano. Después de que la capa orgánica hubo sido lavada con agua y secada, el diclorometano se separó por destilación bajo presión reducida y se obtuvieron 7,00 g (rendimiento 83 %) de la 2-cloro-6-[1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-metiltiometil]anilina buscada, en forma de una sustancia oleosa, a partir de la sustancia oleosa obtenida, por cromatografía en columna usando un disolvente mixto 1 : 8 de acetato de etilo y hexano como eluyente.

25

- 26 -

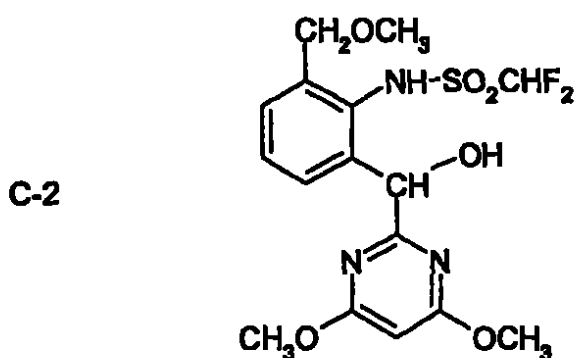
^1H -RMN (300 MHz, CDCl_3) δ 2,04 (3H, s), 3,93 (6H, s), 5,07 (1H, br), 5,14 (1H, s), 5,90 (1H, s), 6,67 (1H, t), 7,19 (1H, dd), 7,42 (1H, dd).

Compuestos comparativos



5

(C-1 es un compuesto similar descrito en el documento WO 98/41799)



(C-2 es un compuesto similar descrito en la publicación de patente japonesa abierta a la inspección del público N° 44546/2000)

10

Ejemplo de Ensayo 1: Ensayo en cuanto al efecto herbicida contra malezas en campos de arroz

Preparación de la formulación del compuesto activo

Vehículo: DMF 5 partes en peso

15 Emulsionante: Benciloxi poliglicol éter 1 parte en peso

Una formulación de un compuesto activo se obtiene en forma de un concentrado emulsionable mezclando 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad antes mencionada del vehículo y del emulsionante. Una cantidad prescrita de la formulación es diluida con agua.

20

En un invernadero, semillas o tubérculos de *Scirpus juncoides* Roxburgh, *Monochorua vaginalis* Presl, malezas de hoja ancha anuales (*Lindernia procumbens*

Philcox, Rotala indica Koehne, Elatine triandra Schk, Ammannia multiflora Roxb., etc.), Cyperus serotinus Rottboel se inocularon en una maceta de 500 cm² llena con tierra de campo de arroz. Luego se vertió agua hasta una profundidad de aproximadamente 2 - 3 cm. A los cinco días y 13 días después de la inoculación, se aplicó a la superficie del agua una solución diluida prescrita de la formulación de cada uno de los compuestos activos, preparados de acuerdo con los anteriores métodos de preparación. Después del tratamiento, se mantuvo la profundidad del agua de 3 cm, y se examinó el efecto herbicida después de 3 semanas a partir del tratamiento.

El efecto herbicida se calificó como de 100 % en el caso de una muerte completa y como de 0 % en el caso de ningún efecto herbicida. En el caso de mostrarse un efecto herbicida de más de 80 %, éste se evalúa como práctico como herbicida.

Los resultados de los estudios con los compuestos N^{os} 1, 3, 11 y 17 y con el compuesto comparativo N^o C-1 como ejemplos específicos, se muestran en las siguientes Tabla 3 y Tabla 4.

15

Tabla 3: Aplicación a los 5 días después de la inoculación

Compuesto N°	Cantidad (g de la/ha)	Efecto herbicida			
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginalis</i>	Malezas de hoja ancha	<i>Cyperus serotinus</i>
1	30	100	100	100	100
	15	100	100	100	100
3	30	100	100	100	100
11	80	100	100	100	100
17	30	100	100	100	100
Comparativo C-1	30	80	80	80	80
	15	70	60	50	70

Tabla 4: Aplicación a los 13 días después de la inoculación

Compuesto Nº	Cantidad (g de la/ha)	Efecto herbicida			
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginalis</i>	Malezas de hoja ancha	<i>Cyperus serotinus</i>
1	30	100	100	100	100
	15	100	100	95	95
3	30	100	100	100	100
11	60	100	100	100	95
17	30	100	100	100	100
Comparativo C-1	30	70	80	60	80
	15	60	50	40	60

Ejemplo de Ensayo 2: Ensayo en cuanto a eficacia residual contra malezas en
5 campos de arroz

En un invernadero, una maceta de 1.000 cm² se llenó con tierra de campo de
arroz y se vertió agua hasta una profundidad de aproximadamente 2 a 3 cm. Una
solución diluida prescrita del Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado, se aplicó a la
superficie del agua. Después del período de tiempo prescrito tras el tratamiento (justo
10 después del tratamiento, 1 semana, 2 semanas, 3 semanas, 4 semanas, 5 semanas,
6 semanas y 7 semanas después del tratamiento) se inocularon semillas o tubérculos
de las malezas *Scirpus juncoides* Roxburgh, *Monochoria vaginalis* Presl, malezas de
hoja ancha anuales (*Lindernia procumbens* Philcox, *Rotala indica* Koehne, *Elatine*
triandra Schk, *Ammannia multiflora* Roxb., etc.), *Cyperus serotinus* Rottboel y
15 *Sagittaria Pygmaea* Miq, que se habían de ensayar. Tres semanas después de la
inoculación, se examinó cada uno de los efectos herbicidas.

La evaluación de la eficacia residual se mostró como el período de tiempo
(número de semanas) en el que el efecto herbicida se mantenía más alto que 80 %,
después de que la evaluación del efecto herbicida se había realizado de una manera
20 similar a la del Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado.

Los resultados de los estudios con los compuestos Nº 1 y Nº 11, y con los
compuestos comparativos Nº C-1 y Nº C-2 como ejemplos específicos, se muestran

en la siguiente Tabla 5.

Tabla 5:

Compuesto N°	Cantidad (g de la/ ha)	Período en el que se muestra una suficiente eficacia herbicida residual (semanas)				
		<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginata</i>	Malezas de hoja ancha	<i>Cyperus aerolatus</i>	<i>Sagittaria pygmaea</i>
1	60	6	4	3	3	3
11	60	4	3	4	-	4
Comparati- vo C-1	60	2	<1	<1	1	1
Comparati- vo C-2	60	2	2	2	-	3

5 **Ejemplo de Ensayo 3:** Ensayo en cuanto al efecto herbicida contra malezas resistentes a sulfonilureas

En un invernadero, se inocularon semillas de *Scirpus juncoides* Roxburgh (recogida en la zona de Iwamizawa, Hokkaido), *Lindernia procumbens* Philcox (recogida en la zona de Higashi-Hiroshima, Hiroshima Pref.), *Elatine triandra* Schk
10 (recogida en la zona de Kazo, Saitama Pref.), todas las cuales se habían confirmado como resistentes a sulfonilureas, en un vaso de 20 cm² lleno con tierra de campo de arroz. Luego se vertió agua hasta una profundidad de aproximadamente 2 a 3 cm. Al comienzo del brote de cada maleza, se aplicó a la superficie del agua una solución diluida prescrita de la formulación de cada uno de los compuestos activos, preparados
15 de la misma manera que en el Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado. Después del tratamiento, se mantuvo la profundidad del agua de 3 cm y se examinó el efecto herbicida después de 3 semanas a partir del tratamiento. La evaluación del efecto herbicida se realizó de la misma manera que la del Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado. En el caso de mostrarse más de un 80 % del efecto herbicida, éste se
20 evalúa como práctico como herbicida. Tomando en consideración la posibilidad de que pueden ser diferentes las propiedades biológicas, incluyendo la resistencia a los herbicidas de las plantas crecidas en diferentes zonas, se usaron en los presentes ensayos plantas de *Lindernia procumbens* Philcox resistentes a sulfonilureas,

recogidas en dos zonas diferentes. Los resultados de los estudios con los compuestos N^o 1, 3, 11 y 17 y con el compuesto comparativo N^o C-1 como ejemplos específicos, se muestran en la siguiente Tabla 6.

5 **Tabla 6:**

Compuesto N ^o	Cantidad (g de la/ha)	Efecto herbicida contra malezas resistentes a sulfonilureas			
		<i>Scirpus juncoides</i> (recogida en la zona de Iwamizawa, Hokkaido)	<i>Lindernia procumbens</i> (recogida en la zona de Saitama Pref.)	<i>Lindernia procumbens</i> (recogida en la zona de Higashi- Hiroshima Pref.)	<i>Elatine triandra</i> (recogida en la zona de Kazo, Saitama Pref.)
1	60	100	100	100	100
	30	100	95	100	100
3	60	100	100	-	-
	30	100	100	-	-
11	60	100	100	-	-
	30	100	100	-	-
17	60	100	100	-	-
	30	100	95	-	-
Comparativo C-1	60	70	60	60	70
	30	60	40	50	60

Ejemplo de Ensayo 4: Ensayo en cuanto a fitotoxicidad para arroz trasplantado

La fitotoxicidad para arroz trasplantado se evaluó en unas condiciones con profundidades de plantación más pequeñas que la usual profundidad de 2 cm, simulando la condición severa para que los herbicidas causen un daño para el arroz en el arrozal. En un invernadero un estadio de 2 a 2,5 hojas de arroz (variedad Nipponbare) se trasplantó a tres diferentes profundidades, en una maceta de 1.000 cm² llena con tierra de campo de arroz. Luego se vertió agua a una profundidad de aproximadamente 2 a aproximadamente 3 cm. A los cinco días después del trasplante, se aplicó a la superficie del agua una solución diluida prescrita de la formulación de cada uno de los compuestos activos, preparados de la misma manera que en el Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado. Después del tratamiento, se mantuvo la profundidad de agua a 3 cm y se examinó el daño para el arroz después

de 2 semanas del tratamiento.

El daño para el arroz se calificó como de 100 % en el caso de una muerte completa y como de 0 % en el caso de ningún daño. En el caso de mostrarse un daño de menos de 20 %, éste se evalúa como práctico como herbicida para el arroz.

- 5 Los resultados de los estudios con el compuesto N° 11 y con los compuestos comparativos N^{oa} C-1 y C-2 como ejemplos específicos se muestran en la siguiente Tabla 7.

Tabla 7: Aplicación a los 5 días después del trasplante

Compuesto N°	Cantidad (g de ia/ha)	Fitotoxicidad para arroz trasplantado		
		Profundidad 2 cm	Profundidad 0,5 cm	Profundidad 0 cm
11	60	10	15	15
Comparativo C-1	60	20	35	-
Comparativo C-2	60	30	30	40

10

Ejemplo de Ensayo 5: Ensayo en cuanto a fitotoxicidad para arroz de plántulas directas y efecto herbicida contra malezas en campos de arroz

- En un invernadero, se inocularon semillas de *Scirpus juncoides* Roxburgh,
- 15 *Monochoria vaginalis* Presl, *Cyperus diformis* L., malezas de hoja ancha anuales (*Lindernia procumbens* Philcox, *Rotala indica* Koehne, *Elatine triandra* Schk, *Ammannia multiflora* Roxb.) y arroz (variedades: Nipponbare y RD-23) en una maceta de 500 cm² llena con tierra de campo de arroz. Luego se vertió agua hasta una profundidad de aproximadamente 0 a aproximadamente 0,5 cm, para quedar en un
- 20 estado húmedo. En el estadio de dos hojas del arroz, se proyectó sobre las macetas con plantas una solución prescrita de la formulación de cada uno de los compuestos activos, preparados de la misma manera que en el Ejemplo de Ensayo 1 antes mencionado. A los 2 días después del tratamiento, se mantuvo la profundidad del

agua de 3 cm y se evaluaron el efecto herbicida y el daño para el arroz a las 3 semanas y 2 semanas después del tratamiento, respectivamente.

El efecto herbicida y el daño para el arroz se calificaron como de 100 % en el caso de una muerte completa y como de 0 % en el caso de ningún efecto o daño. En el caso de mostrarse más de un 80 % del efecto herbicida y menos de 20 % del daño, éste se evalúa como práctico como herbicida para el arroz.

Los resultados de los estudios con los compuestos N° 3 y N° 11 y con el compuesto comparativo N° C-2 como ejemplos específicos, se muestran en la siguiente Tabla 8.

10 **Tabla 8:** Aplicación en el estadio de dos hojas de arroz (por proyección)

Compuesto N°	Cantidad (g de la/ ha)	Efecto herbicida				Fitotoxicidad para arroz de plántulas directas	
		<i>Cyperus difformis</i> L.	<i>Scirpus juncoides</i>	<i>Monochoria vaginella</i>	Malezas de hoja ancha	Nipponbar e	RD-23
3	50	100	100	100	100	20	10
11	50	100	90	100	100	10	10
Comparati- vo C-2	50	100	90	100	100	50	30

Ejemplo de Formulación 1 (granulados)

15 A una mezcla del compuesto N° 1 del presente invento (0,4 partes) se le añadieron bentonita (montmorillonita) (30,6 partes), talco (58 partes) y una sal lignina-sulfonato (2 partes) y agua (25 partes), se amasaron bien y se convirtieron en granulados de mallas 10 a 40 mediante un granulador de extrusión, y se secaron a 40 hasta 50°C para obtener granulados.

Ejemplo de Formulación 2 (granulados)

20 Partículas de un mineral arcilloso (99,8 partes) que tenían una distribución de tamaños de partículas situadas en el intervalo de 0,2 a 2 mm, se colocan en un mezclador rotatorio. Mientras que se le hace girar, el compuesto N° 1 del presente invento (0,2 partes) se proyecta junto con un diluyente líquido, se moja uniformemente y se seca a 40 hasta 50°C para obtener granulados.

Ejemplo de Formulación 3 (concentrado emulsionable)

El compuesto N° 1 del presente invento (30 partes), xileno (55 partes), un poli(oxietilen)alquil fenil éter (8 partes) y un alquilbencenosulfonato de calcio (7 partes) se mezclan y agitan para obtener un concentrado emulsionable.

5

Ejemplo de Formulación 4 (polvo humectable)

El compuesto N° 1 del presente invento (15 partes), una mezcla de carbón blanco (polvos finos de óxido de silicio amorfo hidratado) y una arcilla en polvo (1 : 5) (80 partes), un alquilbencenosulfonato de sodio (2 partes) y un condensado de un alquilnaftalenosulfonato de sodio y formalina (3 partes) se mezclan en forma de polvo para obtener un polvo humectable.

10

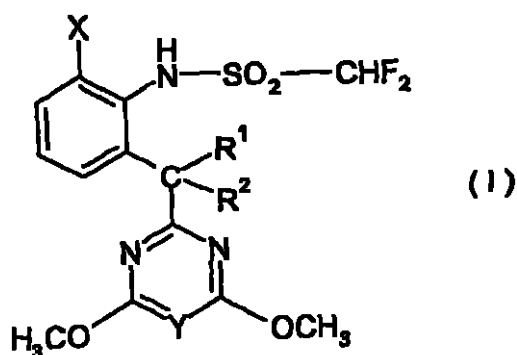
Ejemplo de Formulación 5 (granulado dispersable en agua)

El compuesto N° 1 del presente invento (20 partes), ligninasulfonato de sodio (30 partes), bentonita (15 partes) y un polvo de tierra de diatomeas calcinada (35 partes) se mezclan bien y luego se les añaden agua, se extruden con un tamiz de 0,3 mm y se secan para obtener granulados dispersables en agua.

15

Reivindicaciones

- 1) Nuevos derivados de difluorometanosulfonamida representados por la fórmula



- 5 en la que

X representa halógeno,

Y representa CH ó N,

R¹ representa hidrógeno, y

R² representa hidrógeno o hidroxilo, o

- 10 R¹ y R², en común con el átomo de carbono al que están unidos, pueden formar C=O.

- 2) Compuestos expuestos en la reivindicación 1, en los que

X representa flúor o cloro,

- 15 Y representa CH ó N

R¹ representa hidrógeno, y

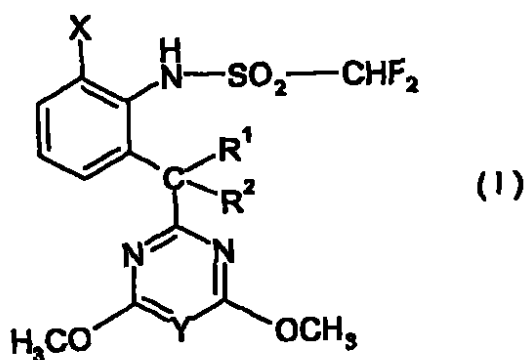
R² representa hidrógeno o hidroxilo, o

R¹ y R² en común con el átomo de carbono al que están unidos, pueden formar C=O.

- 20

- 3) Un procedimiento para preparar los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1

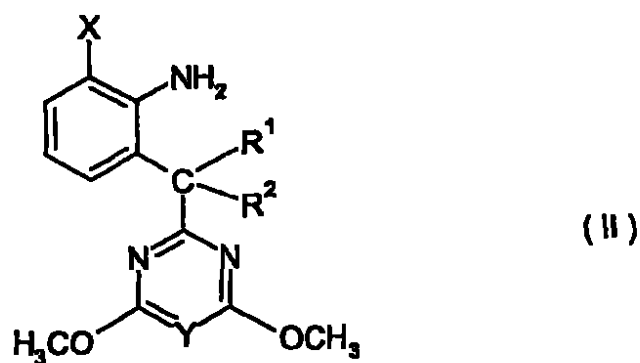
- 34 -



en la que

X, Y, R¹ y R² se definen como en la reivindicación 1, caracterizado porque

- 5 a) compuestos de la fórmula (II)



en la que

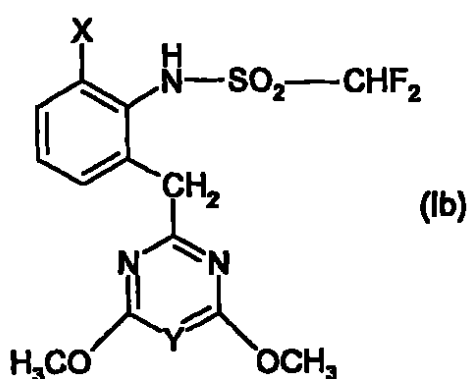
X, Y, R¹ y R² tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado,

- se hacen reaccionar con cloruro de difluorometanosulfonilo en la presencia de
 10 disolventes inertes y, si fuese apropiado, en la presencia de un agente fijador de ácidos, o

b) en el caso de que R¹ y R² en común con el átomo de carbono al que están unidos, formen C=O:

compuestos de la fórmula (Ib)

- 36 -



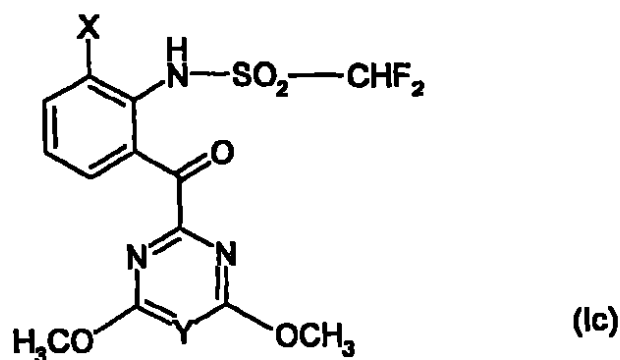
en la que

X e Y tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado,

se hacen reaccionar con un agente oxidante en la presencia de disolventes inertes y,

5 si fuese apropiado, en la presencia de un catalizador ácido, o

c) en el caso de que R^1 represente hidrógeno, y R^2 represente hidroxilo:
compuestos de la fórmula (Ic)



en la que

10 **X e Y** tienen las mismas definiciones que antes se han mencionado,

se hacen reaccionar con un complejo de un hidruro de metal alcalino o con un complejo de un borano, en la presencia de disolventes inertes.

4) Composiciones herbicidas, caracterizadas porque contienen por lo menos un
15 compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1.

5) Procedimiento para combatir malezas en campos de arroz, caracterizado porque por lo menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 se hace actuar sobre malezas en campos de arroz y/o sobre su hábitat.

20

- 37 -

- 6) **Uso de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 para combatir malezas en campos de arroz.**
- 5 7) **Procedimiento para la preparación de composiciones herbicidas, caracterizado porque un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 se mezcla con agentes extendedores y/o agentes activos superficialmente.**

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud internacional n°
PCT/EP/2005/002952

A. CLASIFICACIÓN DEL OBJETO DE LA SOLICITUD IPC 7 A01N43/54 C07D239/52 A01N43/60 C07D251/20 De acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP) o según la clasificación nacional y la CIP		
B. SECTORES COMPRENDIDOS POR LA BÚSQUEDA Documentación mínima buscada (sistema de clasificación seguido de los símbolos de clasificación) IPC 7 A01N C07D Otra documentación consultada, además de la documentación mínima, en la medida en que tales documentos forman parte de los sectores comprendidos por la búsqueda, Base de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda internacional (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizado) EPO-internal, BEI, STEIN, Data, CHEM, ABS, Data, WPI, Data, PAJ		
C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES		
Categoría*	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones n°
A	EP 1 101 760 A (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD) 23 Mayo 2001 (23.05.2001) Citado en la solicitud En todo el documento	1-7
A	WO 96/41799 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 27 diciembre 1996 (27.12.1996) Citado en la solicitud Página 100 – Página 103; tabla 10	1-7
A	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN Vol. 1999, n° 08, 30 junio 1999 (30.06.1999) & JP 11 060562 A (KUMIAI CHEM IND CO. LTD; IHARA CHEM IND CO LTD), 2 marzo 1999 (02.03.1999) Resumen	1-7
☐ En la continuación del recuadro C se relacionan otros documentos ☒ Los documentos de familias de patentes se indican en el		
ANEXO		
* Categoría especiales de documentos citados "A" documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante "E" solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior. "L" documento que puede plantear dudas sobre una reivindicación de prioridad o que se cita para determinar la fecha de publicación de otra cita o por una razón especial (como la indicada) "O" documento que se refiere a una divulgación oral, a una utilización, a una exposición o a cualquier otro medio, "P" documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada.	"T" documento ulterior publicado con posterioridad a la fecha de presentación internacional o de prioridad que no pertenece al estado de la técnica pertinente pero que se cita por permitir la comprensión al principio o teoría que constituye la base de la invención. "X" documento particularmente relevante, la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado "Y" documento particularmente relevante, la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otro u otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia "&" documento que forma parte de la misma familia de patentes	
Fecha en que se ha concluido efectivamente la búsqueda internacional 23 Junio 2005	Fecha de expedición del informe de búsqueda internacional 11/07/2005	
Nombre y dirección postal de la Administración encargada de la búsqueda internacional European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl, N° de fax(+31-70)340-3016	Funcionario autorizado Gavrilu, D	

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL
 Información relativa a miembros de familias de patentes

			Solicitud internacional n° PCT/EP2005/002952			
Documento de patente citado en el informe de búsqueda	Fecha de publicación	Miembro(s) de la familia de patentes	Fecha de publicación			
EP 1101760	A	23-05-2001	JP	3632947	B2	30-03-2005
			JP	2000044346	A	15-02-2000
			JP	2000063360	A	29-02-2000
			AT	252088	T	15-11-2003
			AU	750129	B2	11-07-2002
			AU	4928999	A	21-02-2000
			BR	9912494	A	09-04-2002
			DE	69912134	D1	20-11-2003
			DE	69912134	T2	29-04-2004
			EP	1101760	A1	23-05-2001
			US	6458748	B1	01-10-2002
			CN	1309646	A,C	22-08-2001
			EP	1361218	A1	12-11-2003
			ES	2209466	T3	16-06-2004
			ID	28214	A	10-05-2001
			WO	0006553	A1	10-02-2000
			RU	2225861	C2	20-03-2004
			TW	221471	B	01-10-2004
WO 9641799	A	27-12-1996	DE	19521355	A1	19-12-1996
			AU	6355096	A	09-01-1997
			WO	9641799	A1	27-12-1996
			ID	20511	A	07-01-1999
			ZA	9604943	A	12-12-1996
JP 11060562	A	02-03-199	NINGUNO			

PATENT COOPERATION TREATY

90

WE

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

PCT

To: SCHWENK, Norbert; c/o Bayer CropScience GmbH Law and Patents, Building K 607 65926 Frankfurt ALLEMAGNE		<table border="1"> <tr><td colspan="2">Bayer CropScience GmbH</td></tr> <tr><td>Patent- u. Lizenzabteilung K 607</td><td></td></tr> <tr><td>Vorg.</td><td></td></tr> <tr><td>Eing. d. Mst. 2006</td><td></td></tr> <tr><td>☐ Wv</td><td></td></tr> <tr><td>☐ ablegen</td><td></td></tr> <tr><td>☐ Ver. wie Vorg. / angegeb.</td><td></td></tr> </table>	Bayer CropScience GmbH		Patent- u. Lizenzabteilung K 607		Vorg.		Eing. d. Mst. 2006		☐ Wv		☐ ablegen		☐ Ver. wie Vorg. / angegeb.		NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF THE INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (PCT Rule 71.1)
Bayer CropScience GmbH																	
Patent- u. Lizenzabteilung K 607																	
Vorg.																	
Eing. d. Mst. 2006																	
☐ Wv																	
☐ ablegen																	
☐ Ver. wie Vorg. / angegeb.																	
		Date of mailing (day/month/year)	15.05.2006														
Applicant's or agent's file reference BCS047003-WO		IMPORTANT NOTIFICATION															
International application No. PCT/EP2005/002952	International filing date (day/month/year) 19.03.2005	Priority date (day/month/year) 01.04.2004															
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG																	

1. The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary report on patentability and its annexes, if any, established on the international application.
2. A copy of the report and its annexes, if any, is being transmitted to the International Bureau for communication to all the elected Offices.
3. Where required by any of the elected Offices, the International Bureau will prepare an English translation of the report (but not of any annexes) and will transmit such translation to those Offices.

4. REMINDER

The applicant must enter the national phase before each elected Office by performing certain acts (filing translations and paying national fees) within 30 months from the priority date (or later in some Offices) (Article 39(1)) (see also the reminder sent by the International Bureau with Form PCT/IB/301).

Where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary report on patentability. It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned.

For further details on the applicable time limits and requirements of the elected Offices, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The applicant's attention is drawn to Article 33(5), which provides that the criteria of novelty, inventive step and industrial applicability described in Article 33(2) to (4) merely serve the purposes of international preliminary examination and that "any Contracting State may apply additional or different criteria for the purposes of deciding whether, in that State, the claimed inventions is patentable or not" (see also Article 27(5)). Such additional criteria may relate, for example, to exemptions from patentability, requirements for enabling disclosure, clarity and support for the claims.

Name and mailing address of the International preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2369 - 0 Tx: 523656 apmu d Fax +49 89 2369 - 4465	Authorized Officer Krage, D Tel. +49 89 2369-7530	
---	--	---

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference BCS047003-WO	FOR FURTHER ACTION	See Form PCT/PEAA16
International application No. PCT/EP2005/002952	International filing date (day/month/year) 19.03.2005	Priority date (day/month/year) 01.04.2004
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC INV. A01N43/54 C07D239/52 A01N43/60 C07D251/20		
Applicant BAYER CROPSCIENCE AG		
1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36. 2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet. 3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising: a. ☐ sent to the applicant and to the International Bureau a total of sheets, as follows: ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 807 of the Administrative Instructions). ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in Item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in electronic form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).		
4. This report contains indications relating to the following items: ☒ Box No. I Basis of the report ☐ Box No. II Priority ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability ☐ Box No. IV Lack of unity of invention ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement ☐ Box No. VI Certain documents cited ☐ Box No. VII Certain defects in the international application ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application		
Date of submission of the demand 30.12.2005	Date of completion of this report 15.05.2006	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority:  European Patent Office D-80289 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Authorized officer Gavriliu, D Telephone No. +49 89 2399-	



INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.
PCT/EP2005/002952

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.
 - ☐ This report is based on translations from the original language into the following language, which is the language of a translation furnished for the purposes of:
 - ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
2. With regard to the elements* of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

Description, Pages

1-45 as originally filed

Claims, Numbers

1-7 as originally filed

☐ a sequence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing *(specify)*:
 - ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify)*:
4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).
 - ☐ the description, pages
 - ☐ the claims, Nos.
 - ☐ the drawings, sheets/figs
 - ☐ the sequence listing *(specify)*:
 - ☐ any table(s) related to sequence listing *(specify)*:

* If item 4 applies, some or all of these sheets may be marked "superseded."

**INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT
ON PATENTABILITY**

International application No.
PCT/EP2005/002952

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	1-7
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	1-7
	No: Claims	
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-7
	No: Claims	

2. Citations and explanations (Rule 70.7):

see separate sheet

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
REPORT ON PATENTABILITY
(SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2005/002952

Re Item V

Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Reference is made to the following documents:

- D1: EP-A-1 101 760 (IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD) 23 May 2001 (2001-05-23)
D2: WO 96/41799 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 27 December 1996 (1996-12-27)
D3: PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, no. 08, 30 June 1999 (1999-06-30) & JP 11 060562 A (KUMIAI CHEM IND CO LTD; IHARA CHEM IND CO LTD), 2 March 1999 (1999-03-02)

2. Novelty (Article 33(1) and 33(2)PCT)

The present subject-matter relates to compounds of formula (I)(see present Claim 1), their preparation and their use as herbicides. The present compounds are novel over the D1 compounds on the account of the halogen atom from position 6 of the phenyl moiety and over the D2-D3 compounds on the account of the present difluoromethanesulfoamide moiety. Consequently, the novelty of the present claimed subject-matter is acknowledged.

3. Inventive step (Article 33(1) AND 33(3) PCT)

The present subject-matter relates to pyrimidines or 1,3,5-triazines of formula (I) (see present Claims 1 and 4) useful as herbicides.

D1 and D2 can be considered equally as being the closest prior art documents.

D1 discloses pyrimidine sulfonamides, useful also as herbicides (see Claims 1, 9 and 11). The single difference between the present claimed compounds and the compounds disclosed by D1 is the substituent from the 6-th position of the phenyl moiety (substituent which in the present case is halogen and for D1 compounds is hydrogen, alkyl or an alkoxyalkyl group).

D2 discloses sulfonamides of formula (I)(see present Claim 1 and pages 100-102)

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
REPORT ON PATENTABILITY
(SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2005/002952

as herbicides. The single difference between the present claimed compounds and the D2 compounds is that the present compounds bear a difluoromethane-sulfonamide moiety instead of a trifluoromethanesulfonamide moiety as for D2 compounds (see compounds 10-57 and 10-58 from table 10-D2 and the present compounds of formula (I)).

The problem underlying the present application should thus be seen in providing of novel fluoromethanasulfonyl anilides with unexpected or surprising effects compared to those of the closest prior art.

The applicant provides comparative tests between the present compounds and the compounds C1(similar to those disclosed in D2) and C2(similar to those disclosed in D1)(see present description pages 36-43). Since, the above-mentioned comparative tests demonstrate a better herbicidal effect and less phytotoxicity for the present compounds(see tables 5-8), an inventive step can be acknowledged for the present claimed subject-matter.

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

De: LA ADMINISTRACIÓN DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL

Destinatario:
SCHWENK, Norbert
c/o Bayer Cropscience GmbH
Law and Patents, Building K 607
65926 Frankfurt
ALEMANIA

PCT

NOTIFICACIÓN DE TRANSMISIÓN DEL
INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD
(Capítulo II del Tratado de Cooperación
en materia de Patentes)
(Regla 71.1 del PCT)

Fecha de expedición (día/mes/año)		15.05.2006
Referencia del expediente del solicitante o del mandatario BCS047003-WO		NOTIFICACIÓN IMPORTANTE
Solicitud internacional nº PCT/EP2005/002952	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 19.03.2005	Fecha de prioridad (día/mes/año) 01.04.2004
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AG		

1. Se notifica al solicitante que la Administración encargada del examen preliminar internacional ha emitido el informe de examen preliminar internacional para la solicitud internacional y se lo transmite adjunto, acompañado, si procede, de sus anexos.
2. Se transmite una copia del presente informe y, si procede, de sus anexos, a la Oficina internacional para comunicación a todas las Oficinas elegidas.
3. Si alguna Oficina elegida lo exige, la Oficina internacional realizará una traducción en inglés del informe (con exclusión de sus anexos) y la transmitirá a las Oficinas interesadas.

4. RECORDATORIO

Para iniciar la fase nacional ante cada Oficina elegida, el solicitante debe cumplir ciertos actos (presentación de traducción y pago de las tasas nacionales) en el plazo de 30 meses desde la fecha de prioridad (o más tarde por lo que respecta a ciertas Oficinas) (Artículo 39.1)) (véase también el recordatorio enviado por la Oficina internacional en el formulario PCT/IB/301).

Cuando deba entregarse una traducción de la solicitud internacional a una Oficina elegida, se incluirá la traducción de cualquier anexo del informe de examen preliminar internacional. Corresponde al solicitante preparar la traducción en cuestión y entregarla directamente a cada Oficina elegida interesada.

Para más amplios detalles en lo relativo a los plazos aplicables y las exigencias de las Oficinas elegidas, véase el Volumen II de la Guía del Solicitante PCT.

Se llama la atención del solicitante sobre el Artículo 33.5 que prevé que los criterios de novedad, actividad inventiva y de aplicación industrial definidos en el Artículo 33.2 a 4 sólo servirán a los efectos del examen preliminar internacional, y que "todo Estado contratante puede aplicar criterios adicionales o diferentes al objeto de decidir, en ese Estado, si la invención es patentable o no" (véase también el artículo 27.5). Tales criterios adicionales pueden afectar, por ejemplo, a las excepciones de patentabilidad, requisitos específicos relativos a la divulgación, la claridad de las reivindicaciones o sobre la cuestión de si las reivindicaciones se fundan en la descripción.

Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tlx 523656 epmu d Nº de fax: +49 89 2399 - 4485	Funcionario autorizado Krage, D Nº de teléfono: +49 89 2399-7530
---	--

Formulario PCT/PEA/416 (Enero 2004)

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD
 (Capítulo II del Tratado de Cooperación en materia de Patentes)

(Artículo 38 y Regla 70 del PCT)

Referencia del expediente del solicitante o del mandatario BCS047003-WO	PARA ACCIÓN	Véase formulario PCT/IPEA/418
Solicitud Internacional n° PCT/EP2005/002952	Fecha de presentación Internacional (Día/mes/año) 19.03.2005	Fecha de prioridad (día/mes/año) 01.04.2004
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o a la vez clasificación nacional e IPC INV.A01N43/54 C07D239/52 A01N43/60 C07D25 1/20		
Solicitante BAYER CROPSCIENCE AG.		

1. El presente informe preliminar internacional sobre patentabilidad, se establece por esta Administración encargada del examen preliminar internacional según el Artículo 35 y se transmite al solicitante conforme al Artículo 38. 2. Este INFORME comprende 5 hojas, incluida la presente hoja de portada. 3. Este informe también contiene ANEXOS, que comprenden a. ☐ (remitido al solicitante y a la Oficina Internacional) un total de _____ hojas, descritas a continuación ☐ hojas de la descripción, las reivindicaciones y/o los dibujos que han sido modificadas y que sirven de base al presente informe, y/o de hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Administración (véase la Regla 70.16 y la Instrucción Administrativa 807 del PCT) ☐ hojas que reemplazan a otras hojas anteriores, pero que esta Administración considera que contienen modificaciones que se extienden más allá de la divulgación de la invención tal como fue originalmente presentada, según se indica en el punto 4 del Recuadro I y en el Recuadro Suplementario b. ☐ (remitido únicamente a la Oficina Internacional) un total de (indicar tipo y número de soporte(s) electrónico(s)) _____, que contiene una lista de secuencias y/o tabla(s) relativas(s), sólo en formato legible por ordenador, como se indica en el Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias (ver Instrucción Administrativa 802).
4. El presente informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes: ☒ Recuadro I Base de este informe ☐ Recuadro II Prioridad ☐ Recuadro III No formulación de opinión sobre la novedad la actividad inventiva y la aplicación industrial ☐ Recuadro IV Falta de unidad de invención ☒ Recuadro V Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración ☐ Recuadro VI Ciertos documentos citados ☐ Recuadro VII Defectos en la solicitud internacional ☐ Recuadro VIII Observaciones relativas a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la solicitud de examen preliminar internacional 30.12.2005	Fecha de finalización del presente informe 15.05.2006
Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2369 - 0 Tlx 523858 epmu d Nº de fax +49 89 2369 - 4465	Funcionario autorizado Gavrillu, D Nº de teléfono: +49 89 2369-

Formulario PCT/IPEA/409 (hoja de portada) (Abril 2005)

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD**

 Solicitud Internacional N°
PCT/EP2005/002952
Recuadro I. Base de este informe

1. Por lo que respecta al idioma, este informe se ha establecido sobre la base de la solicitud internacional en el idioma en el cual se depositó, salvo indicación en contra señalada a continuación.
 - ☐ Este informe está basada en una traducción del idioma original al siguiente idioma _____, que es el de una traducción proporcionada a los fines de:
 - ☐ búsqueda internacional (según (Reglas 12.3 y 23.1. b))
 - ☐ publicación de la solicitud internacional (según Regla 12.4)
 - ☐ examen preliminar internacional (según Reglas 55.2 y/o 55.3)
2. Por lo que respecta a los elementos de la solicitud internacional, esta opinión se ha establecido sobre la base de (las hojas de reemplazo que hayan sido enviadas a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento según el artículo 14 se las denomina en este informe como "inicialmente presentadas" y no se anexan al informe):
 - ☐ La solicitud internacional tal y como fue inicialmente presentada/enviada
 - ☐ La descripción:
 - Páginas _____ 1-45 _____, tal como se presentaron/enviaron inicialmente
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - ☐ Las reivindicaciones:
 - Páginas _____ 1-7 _____, tal como se presentaron/enviaron inicialmente
 - Páginas* _____, modificadas (acompañadas de una declaración) según el artículo 19
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - ☐ Los dibujos:
 - Páginas _____, tal como se presentaron/enviaron inicialmente
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - Páginas* _____ recibidas por esta Administración en fecha _____
 - ☐ Una lista de secuencias y/o tabla(s) relativa(s) – ver Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias
3. ☐ Las modificaciones ha ocasionado la anulación de:
 - ☐ la descripción, páginas _____
 - ☐ las reivindicaciones, N°s _____
 - ☐ los dibujos, hojas/fig. _____
 - ☐ la lista de secuencias (precisar) _____
 - ☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (precisar) _____
4. ☐ El presente Informe ha sido establecido como si no se hubiesen presentado (algunas de) las modificaciones anexadas a este Informe y listadas abajo, ya que se ha considerado que iban más allá de la divulgación de la invención tal como fue presentada, como se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2.c)).
 - ☐ La descripción, páginas _____
 - ☐ Las reivindicaciones, N°s _____
 - ☐ Los dibujos, hojas/fig. _____
 - ☐ La lista de secuencias (precisar) _____
 - ☐ Tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (precisar) _____

* Si se utiliza el punto 4, algunas o todas estas páginas pueden llevar el sello de "sustituida"

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD

Solicitud Internacional N°
PCT/EP2005/002962

Recuadro V. Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración

1. Declaración			
Novedad	Reivindicaciones	<u>1-7</u>	SÍ
	Reivindicaciones		NO
Actividad inventiva	Reivindicaciones	<u>1-7</u>	SÍ
	Reivindicaciones		NO
Aplicación Industrial	Reivindicaciones	<u>1-7</u>	SÍ
	Reivindicaciones		NO
2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)			
Ver hoja separada			

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL
SOBRE PATENTABILIDAD
(HOJA SEPARADA)**

Solicitud Internacional N°

PCT/EP2005/002952

Re. apartado V

Exposición razonada con respecto a la novedad, el nivel inventivo o la aplicabilidad industrial; citas y explicaciones que apoyan a esta exposición

1. Se hace referencia a los siguientes documentos:

- D1: EP-A-1 101 760 (de IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD; KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO. LTD) 23 de Mayo de 2001 (23-05-2001)
- D2: WO 96/41799 A (de HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 27 de Diciembre de 1996 (27-12-1996)
- D3: PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 1999, n° 08, 30 de Junio de 1999 (30-06-1999) & JP 11 060562 A (de KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO. LTD; IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD), 2 de Marzo de 1999 (02-03-1999)

2. Novedad (Artículos 33(1) y 33(2) del PCT)

La presente materia objetivo se refiere a compuestos de la fórmula (I) (véase la actual Reivindicación 1), a su preparación y a su uso como herbicidas. Los presentes compuestos son nuevos con respecto a los compuestos de D1 teniendo en cuenta el átomo de halógeno de la posición 8 del resto fenilo, y con respecto a los compuestos de D2-D3 teniendo en cuenta el presente resto de difluorometanosulfonamida. Consiguientemente, se reconoce la novedad de la presente materia objetivo reivindicada.

3. Nivel inventivo (Artículos 33(1) y 33(3) del PCT)

La presente materia objetivo se refiere a pirimidinas o 1,3,5-triazinas de fórmula (I) (véanse las presentes Reivindicaciones 1 y 4) útiles como herbicidas.

Se puede considerar igualmente que D1 y D2 son los documentos más próximos de la técnica anterior.

D1 describe pirimidina - sulfonamidas, útiles como herbicidas (véanse las Reivindicaciones 1, 9 y 11). La única diferencia entre los presentes compuestos reivindicados y los compuestos divulgados por D1, es el sustituyente de la posición 8 del resto fenilo (sustituyente que en el presente caso es halógeno y que para los compuestos de D1 es un grupo hidrógeno, alquilo o alcoxiálquilo)

D2 describe sulfonamidas de fórmula (I) (véanse la presente Reivindicación 1 y las páginas 100-102) como herbicidas. La única diferencia entre los presentes compuestos reivindicados y los compuestos de D2 consiste en que los presentes compuestos llevan un resto de difluorometanosulfonamida, en vez de un resto de de trifluorometanosulfonamida como para los compuestos de D2 (véanse los compuestos 10-57 y 10-58 de la tabla 10 de D2 y los presentes compuestos de fórmula (I)).

El problema que subyace en la presente solicitud debería ser visto en el hecho de proporcionar nuevas fluorometanosulfonil anilidas con efectos inesperados o sorprendentes en comparación con los de la técnica anterior más próxima.

La solicitante proporciona ensayos comparativos entre los presentes compuestos y los compuestos C1 (similar a los descritos en D2) y C2 (similar a los descritos en D1 (véase la presente memoria descriptiva en las páginas 36-43). Puesto que los ensayos comparativos antes mencionados demuestran un mejor efecto herbicida y menos fitotoxicidad para los presentes compuestos (véanse las tablas 5-8), se puede reconocer un nivel inventivo para la presente materia objetivo reivindicada.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Red: 06-098013-00000-0000
Fec: 2006-09-28 16:38:37 Dep. 2020 NUECREACIONES
TÍT. 11 PATENTES Y
DISE: 379 FABRICACIONAL

101

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

PATENTE DE INVENCION ()	MODELO DE UTILIDAD ()	USUARIO ()	RADICADOR ()
-Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()	()
-Descripción de la invención.	()	()	()
-Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()			
-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se 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 ()			
-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()	()
-Representación gráfica del Esquema Trazado.	()	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()	()

Firma Responsable:

Edwin Naranjo

Fecha:

28-04-06

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

102
~~Folio 102~~

2020
Bogotá D.C.,

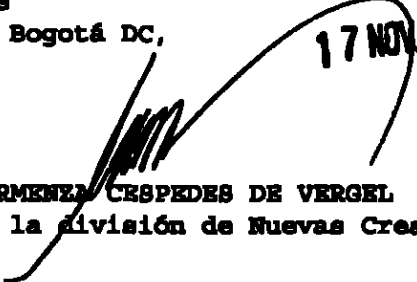
Doctor(a)
PATIÑO LEYVA LUIS
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE AG.

REFERENCIA	Radicación No.	06 98013
	Solicitud internacional	PCT/EP2005/002952
	Fecha inicio fase nacional	01/11/2006
	Trámite	11
	Evento	379
	Actuación	416
	Oficio No.	1834
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

17 NOV. 2006


ALIX CARMEN CRESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

adpa11