



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Compañía CSA Ltda.

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones



SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

00-24215

54. TÍTULO

"Componentes del azo1 y composiciones Habbecidas"

Ver tipo nuevo en folio 33

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

A01N 43/56

71. SOLICITANTE

Idemitsu Kosan co., Ltd

DOMICILIO

Tokio, Japon

74. APODERADO

Humberto Rubio Camacho

22. BOGOTÁ, D. C.,

Abril 3 2000

202038

Handwritten signature



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

00-24215

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO "COMPONENTES DEL AZOL Y COMPOSICIONES
HERBIDAS"

Ver título nuevo en folio 53

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL A01N 43/56

71. SOLICITANTE IDEMITSU KOSAH CO., LTD

DOMICILIO TOKYO, JAPON

74. APODERADO HUBERTO RUBIO CAMACHO

22. SANTAFE DE BOGOTA, D.C. ABRIL 03 DEL 2000

201038



DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

IDEMITSU KOSAN CO., LTD.

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

JAPON

Departamento o Estado

Dirección

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

Ciudad

TOKYO

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

HUMBERTO RUBIO CAMACHO

Dirección y Domicilio

CARRERA 7a No. 74 - 64, Oficina 506

Ciudad

Santafé de Bogotá, D.C.

Teléfono 3 13 24 23

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

Masatoshi SAITOU, Hiroki SEKIGUCHI, Shin-ichiro
OGAWA

Identificación

Dirección

JAPON

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

"COMPONENTES DEL AZOL Y COMPOSICIONES HERBICIDAS"

PRIORIDAD REIVINDICADA
CONVENIO DE PARIS Art. 4

SI ☒

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☐

(33) País JAPON

(32) Fecha Mayo 13 de 1.999

(31) No. Solicitud 132791/1999

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

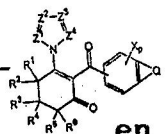
☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

A01N 43/56

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCIÓN

Los compuestos Azol se representan mediante la fórmula siguiente (I)



En donde, Q, X, p, R1 a R6 y Z1 a Z4 son como se define

en la divulgación, las composiciones herbicidas contienen los compuestos azol de la fórmula (I) en cantidades herbicidalmente efectivas.

Los compuestos de la fórmula (I) son menos dañinos para las cosechas cultivadas y tienen un espectro amplio de control de malezas con menos tasas de aplicación.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica

☐

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC

☐

Recibo de la tasa respectiva

☒

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

☐

Si se reivindica prioridad Andina:

Copia de la primera solicitud

☐

Traducción oficial

☐

Si se reivindica prioridad Unionista:

Copia certificada de la primera solicitud:

☐

Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior

Traducción simple

☐

Capítulo descriptivo

☒

Dibujos, planos necesarios

☒

Capítulo reivindicatorio

☒

Tarjeta archivo propietarios según formato

☒

Tarjeta archivo temático según formato

☒

Extracto para publicación según formato

☒

Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms

☒

Otros Documentos

☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE INVENCIÓN Y DECLARO QUE LA INVENCIÓN ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA

[Signature]

NOMBRE HUMBERTO RUBIO CAMACHO

CC. 17.192.062 de Bogotá

T.P.No.50007 C.S.J



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA
PATENTE DE INVENCION
"COMPONENTES DEL AZOL Y
COMPOSICIONES HERBICIDAS"

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicacion : 88324215 88323833

Folios: 46

Fecha (AMD): 2803-04-04 11:03:09

Tramite : 322 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2320 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 000174009 2

RECIBO ORIGINAL DE CASH : 00 - 5,723
FECHA : ENERO 25 DE 2000

CONSIGNACION

REPRESENTANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VAL. PAGO
ANGELA MARIA RUBIO	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00024-9	045591	25/01/2000	3,322,000.00

CONCEPTO

CANT. CONCEPTO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	5000000.01 SOLICITUDES	1
	TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	330,000.00
	TOTAL :	330,000.00

SON: SEISCIENTOS CERO MIL PESOS

RESPONSABLE :



RECIBO DE CASH APLICADO AL EXPEDIENTE No.

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

DESCRIPCION

COMPONENTES DEL AZOL Y COMPOSICIONES HERBICIDAS

Campo Técnico

5

La presente invención se refiere a compuestos nuevos de azol y composiciones herbicidas que contienen compuestos de azol como componentes efectivos. Más particularmente, la presente invención se refiere a los componentes de azol útiles para controlar la maleza indeseada en los cultivos y las malezas en los sembrados de arroz que son perjudiciales para las plantas cultivadas y composiciones herbicidas que contienen los compuestos de azol como sus componente efectivos.

Antecedentes del Arte

15

Hasta ahora, como los compuestos con estructuras químicas similares a las de los compuestos del azol, los componentes heterocíclicos con una porción de benzoil monocíclico y un N- saturado conteniendo un anillo heterocíclico, tal como un anillo de morfolina, un anillo de pirrolidina y un anillo de piperidina se conocían (Aplicación de Patente Japonesa abierta Nos. 62-298563 y 7-196585). Sin embargo, ningún compuesto azol con estructuras de anillos condensado de benzoil se habían conocido hasta la fecha. En los artes previos anteriores, ninguna descripción se puede encontrar sobre compuestos de azol que tengan una porción de benzoil con anillo condensado aún cuando se ha enseñado que los compuestos que tengan una porción de benzoil monocíclica son activos herbicidalmente.

20

Los Herbicidas son químicos importantes para ahorrar el trabajo de controlar las malezas que son perjudiciales para el crecimiento de las plantas cultivadas y para lograr una alta productividad de los cultivos en la agricultura y la horticultura. En consecuencia, el desarrollo de nuevos herbicidas que sean seguros para los seres humanos y para el ganado, menos perjudiciales para los cultivos debido a su excelente control selectivo de las malezas únicamente y un amplio espectro de control de la maleza hasta ahora siempre se habían deseado.

30

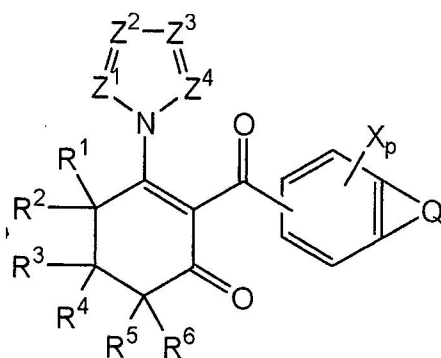
Revelación de la Invención

Un objeto de la presente invención es proveer nuevos compuestos de azol que sean menos lesivos para los cultivos, particularmente los de maíz, trigo y arroz y muestran un alto espectro de control de la maleza aún en aplicaciones de bajo porcentaje. Otro objeto de la presente invención es proveer composiciones herbicidas que contienen compuestos de azol como sus componentes efectivos.

Como resultado de amplios estudios por los presentes inventores para lograr los objetos mencionados se ha encontrado que los compuestos de azol con estructuras específicas son menos perjudiciales para los cultivos de maíz, trigo y de arroz y muy efectivos para controlar varias especies de maleza con porcentajes bajos de aplicación. La presente invención se ha llevado a cabo basándose en este descubrimiento.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se dirige a:

(1) un compuesto de azol representado por la siguiente fórmula (I):



en donde, Q es un grupo divalente que tiene 3 a 5 átomos formadores de anillos que forman un anillo condensado no saturado o un anillo saturado con de 5 a 7 miembros junto con dos anillos de carbonos benceno a los cuales Q está enlazado, uno o dos de los átomos que forman anillos siendo un átomo o átomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y sulfuroso, los átomos que forman anillos que constituyen Q pueden tener uno o más sustitutos seleccionados del grupo consistentes en C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alkoxi, C₁-C₆ haloalkoxi, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino, C₁-C₆ alkoxiimino, hidrazono, C₁-C₆

- monoalquilhidrazono y C₁-C₆ dialquilhidrazono; el átomo que forma anillo que constituye a Q o a un par de átomos que forman anillos adyacente puede ser sustituido por un sustituto divalente seleccionado del grupo que consiste en etilenodioxo, etilenoditio, propilenodioxo y propilenoditio, el sustituto divalente
- 5 siendo opcionalmente sustituido por un halógeno o por C₁-C₆ alquilo; X es halógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxio, C₁-C₆ haloalcoxio, C₁-C₆ alquiltio, C₁-C₆ alquilsulfinilo, C₁-C₆ alquilsulfonilo, amino, C₁-C₆ monoalquilamino, C₁-C₆ dialquilamino, ciano o nitro; p es 1 o 2 R¹ a R⁶ cada uno hidrógeno, halógeno, C₁-C₆ alquilo o C₁-C₆ haloalquilo; y Z¹ a Z⁴ son cada uno nitrógeno o CR⁷
- 10 en donde R⁷ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, nitro o fenil que pueden ser sustituidos y un par de CR⁷ adyacente, si existiese, pueden juntos formar un anillo de benceno que puede ser sustituido por halógeno C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo o nitro;
- (2) Un compuesto azol descrito en (1), en donde Z¹ de la fórmula (I) es nitrógeno
- 15 (3) Un compuesto de azol descrito en (1), en donde por lo menos uno de los dos átomos que forman un anillo constituyen Q de la fórmula (I) enlazada al anillo de benceno es sulfuro
- (4) Un compuesto de azol descrito en (1), en donde Z¹ de la fórmula (I) es nitrógeno y por lo menos uno de los dos átomos que forman anillos constituye a Q
- 20 de la fórmula (I) enlazado al anillo de benceno es sulfuro, y
- (5) Una composición herbicida que contiene una cantidad efectiva de un compuesto azol descrito en cualquiera de las | (1) a (4).

Mejor Manera para llevar a cabo la Invención

25

Los compuestos de azol de la presente invención tienen las estructuras químicas representadas por la fórmula (I) descrita anteriormente.

En la fórmula (I), Q es un grupo divalente que tiene de 3 a 5 átomos que forman anillos que forman un anillo saturado que forma de 5 a 7 miembros o un anillo

?

condensado no saturado junto con dos carbonos de anillo de a los cuales Q está enlazado.

Uno o dos de los átomos que forman anillos son átomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y sulfuro, y el otro de los átomos que forman anillos es

ozone

5 carbono. El sulfuro que forma anillos puede formar SO o -SO₂-. Los átomos que forman anillos constituyentes de Q pueden tener uno o más sustitutos seleccionados del grupo que consiste en C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcolxi, C₁-C₆ haloalcolxi, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino, C₁-C₆ alcolximino, hidrazono, C₁-C₆ monoalquilhidrazono y C₁-C₆ dialquilhidrazono. El

10 átomo que forma anillo de Q o un par de átomos que forman anillos adyacente puede ser sustituido por un sustituto divalente seleccionado del grupo que consiste en etilenodioxi, etilenoditio, propilenodioxi y propilenoditio. El sustituto divalente puede ser opcionalmente sustituido por halógeno o C₁-C₆ alquilo.

El C₁-C₆ Alquilo puede incluir metilo, etilo y diferentes isómeros de propil, butil, pentil y hexil. Los diferentes isómeros de propil, butil, pentil y hexil incluyen grupos

15 lineales, ramificados o cíclicos y éstos pueden contener un enlace no saturado. El C₁-C₆ Haloalquilo puede ser haloalquilo obtenido por átomos que reemplazan parcial o totalmente el hidrógeno de los anteriores alquilos con un halógeno tal como cloro, fluoro, bromo y yodo. Ejemplos específicos del haloalquilo incluyen

20 clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, 2cloroetilo, 2-fluoroetilo, 3-cloropropil y 3-fluoropropil.

El C₁-C₆ Alcolxi puede incluir metoxi, etoxi y diferentes isómeros de propoxi, butoxi, pentiloxi y hexiloxi. Los diferentes isómeros de propiloxi, butiloxi, pentiloxi y hexiloxi incluyen grupos lineales ramificados y cíclicos, y aquellos pueden contener

25 un enlace no saturado. El C₁-C₆ Haloalcolxi puede incluir clorometiloxi, difluorometiloxi, triclorometiloxi, trifluorometiloxi, 2cloroetiloxi, 2-fluoroetiloxi, 3-cloropropiloxi y 3-fluoropropiloxi.

El C₁-C₆ Alcolximino puede incluir metoximino, etoximino y diferentes isómeros de propoximino, butoximino, pentiloximino y hexiloximino. El C₁-C₆ monoalquilhidrazono puede incluir metilohidrazono, etilohidrazano y varios isómeros

30

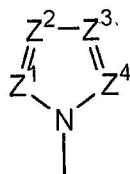
de propilhidrazono, butilhidrazono; pentyhidrazono y hexilhidrazono. El C₁-C₆ Dialquilhidrazono incluyen dimetilohidrazono, metiloetilohidrazono, dietilohidrazono, di-n-propilhidrazono y di-isopropilhidrazono.

- El Halógeno para X en la fórmula (I) puede ser fluoro , cloro , bromo o yodo. Los
- 5 C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi y C₁-C₆ haloalcoxi para X son respectivamente los mismos que aquellos para Q. El C₁-C₆ alquiltio puede incluir alquiltio tal como metiltio, etiltio y diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. Los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio pueden ser lineales, ramificados o grupos cíclicos y aquellos pueden contener un
- 10 enlace no saturado. El C₁-C₆ alquilosulfinilo puede incluir metilosulfinilo, etilosulfinilo y diferentes isómeros de propilsulfinilo, butilsulfinilo, pentilsulfinilo y hexilsulfinilo. C₁-C₆ alquilosulfonilo puede incluir metilosulfonilo; etilosulfonilo y diferentes isómeros de propilsulfonilo, butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilosulfonilo. C₁-C₆ monoalquiloamino puede incluir metiloamino, etiloamino y diferentes
- 15 isómeros de propilamino, butilamino, pentilamino y hexilamino. El C₁-C₆ dialquiloamino puede incluir dimetilamino, metiletiloamino, dietilamino, di-n-propilamino y di-isopropilamino.

- El C₁-C₆ alquilo y C₁-C₆ haloalquilo para R¹ a R⁷ ya para el sustituto en el anillo de benceno que puede ser formado por un par de CR⁷ adyacente son los mismos que
- 20 aquellos para Q. Fenilo que puede tener un sustituto representado por R⁷ puede incluir fenilo, toliilo, m-clorofenilo, p-metoxifenilo, p-nitrofenilo y p-cianofenilo.

En la fórmula (I), la estructura azol representada por la siguiente fórmula (II) :

25

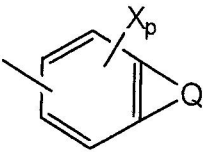


30

Es preferiblemente una forma de residuo deriva de pirrol, pirazol, imidazol, triazol, tetrazol, indole, indazol y benzimidazol.

En la fórmula (I), la estructura de anillo condensado representada por la siguiente fórmula (III):

5

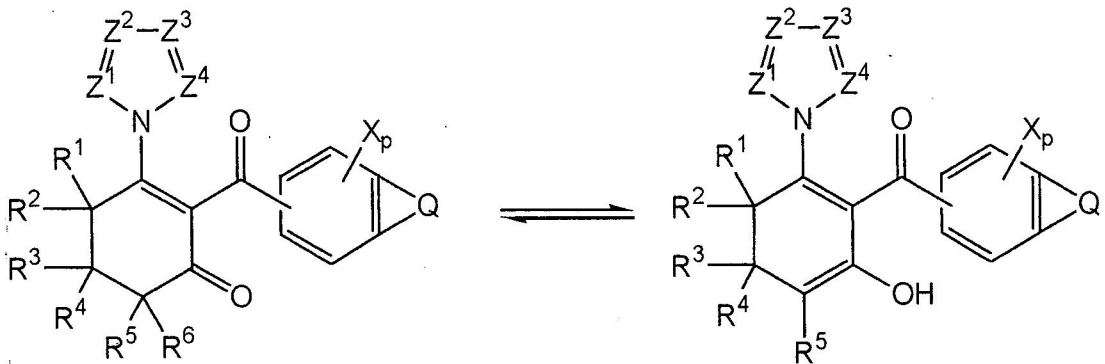


Es preferiblemente una forma de residuo derivada de indeno, benzofurano, benzotiofeno, indole, naftaleno, cromeno, tiocromeno, quinoline, benzotiazol, benzisotiazol, benzoxazol, benzisoxazol, benzimidazol, indazol y componentes saturados de éstos.

10

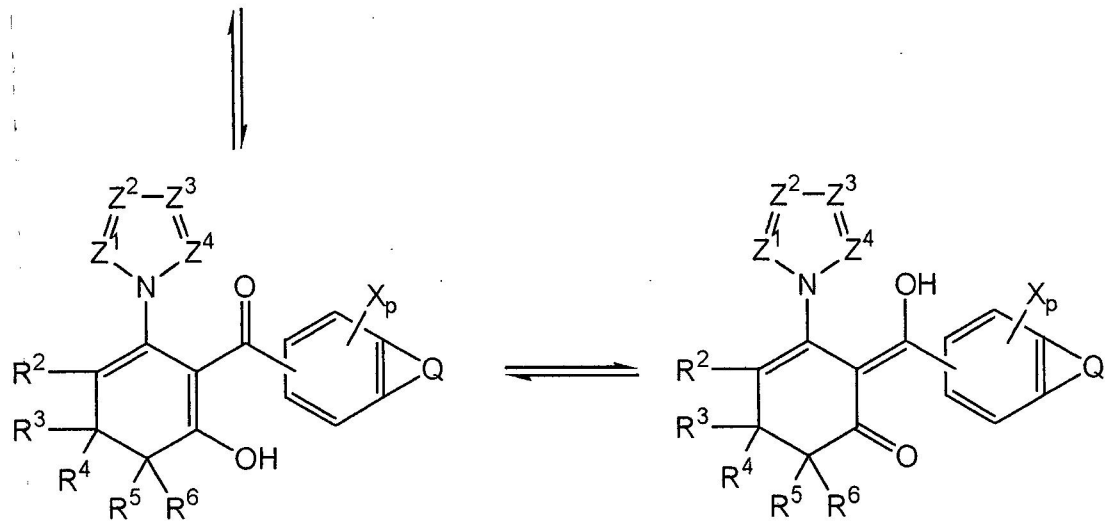
Cuando R¹ y/o R⁶ es hidrógeno, los compuestos azol representados por la fórmula (I) puede ser tautomerizados como se muestra a continuación:

15



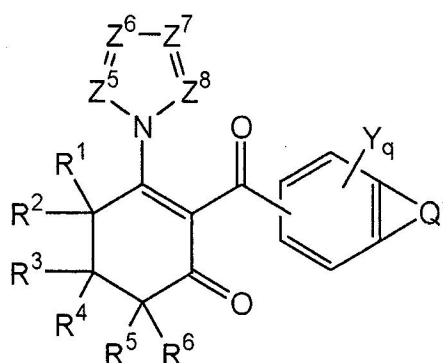
20

25



En donde R^1 a R^6 , Q , X , Z^1 a Z^4 y p son los mismos que en la fórmula, (I). Los tautómeros se incluyen en los compuestos azol de la presente invención.

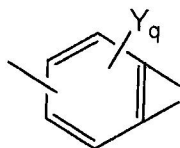
Los compuestos de azol de la presente invención pueden también representarse por la siguiente fórmula (VI) :



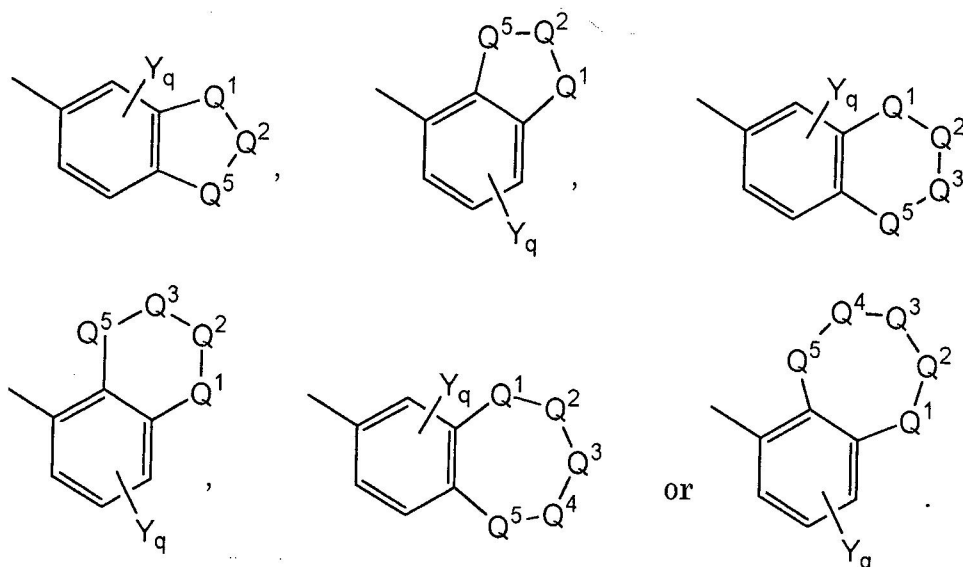
En la fórmula (VI), R^1 a R^6 son como se describe anteriormente cada uno hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 alquilo o C_1 - C_6 haloalquilo

Z^5 a Z^8 son cada uno nitrógeno o CR^{11} don de R^{11} es hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo, nitro, ciano o fenilo que puede ser sustituido.

Cuando Z^i y Z^{i+1} adyacentes en donde i es 5, 6 ó 7 son ambos CR^{11} , los ustitutos en los átomos de carbono forman juntos un anillo de benceno que pude ser sustituido por halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo o nitro. El C_1 - C_6 alquilo y el C_1 - C_6 haloalquilo para R^{11} y el sustituto del anillo de benceno y el fenilo por que puede ser sustituido son los mismos que aquellos para Q antes mencionada.



Q es un anillo condensado no saturado o un anillo de 5 a 7 miembros saturado representado por la siguiente fórmula:



5

La fórmulas anteriores hasta dos de los átomos que forman anillos Q^1 a Q^5 son átomos seleccionados de nitrógeno, oxígeno y sulfuro, siempre que Q^1 no sea sulfuro. El sulfuro que forma el anillo puede formar $-SO-$ o $-SO_2-$. Los átomos que forman anillos Q^1 a Q^5 pueden tener uno o más sustitutos, los cuales son los mismos que aquellos para Q antes mencionado, por ejemplo, sustitutos seleccionados del grupo que consiste de C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 haloalquilo, C_1-C_6 alcoli, C_1-C_6 haloalcoli, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino; C_1-C_6 alcolximino, hidrazono, C_1-C_6 monoalquilhidrazono y C_1-C_6 dialquilhidrazono. El átomo que forma un anillo de Q o un par de átomo que forman anillos adyacentes pueden ser sustituidos por un sustituto divalente seleccionado del grupo que consiste en etilenedioxi, etileneditio, propilenedioxi y propileneditio para formar una estructura de anillo que puede ser sustituida por halógeno o por C_1-C_6 alquilo. Y es un halógeno tal como fluoro, cloro, bromo y yodo, nitro, amino, ciano, hidroxi, mercapto, R^8 , OR^8 , SR^8 , SO_2R^8 , NR^9R^{10} o $NHCOR^8$. R^8 es un alquilo C_1-C_6 lineal, ramificado o cíclico C_1-C_6 que puede contener un enlace no saturado, lineal, un haloalquilo C_1-C_6 cíclico o ramificado, lineal que puede contener un enlace no saturado, un fenilo que puede ser sustituido o un benzil que puede ser sustituido. R^9 y R^{10} son cada uno hidrógeno, un alquilo C_1-C_6 lineal, ramificado o cíclico que puede contener un enlace no saturado, un haloalquilo C_1-C_6 , lineal ramificado o cíclico que puede contener un enlace no saturado, un fenilo que puede ser sustituido o un benzilo que puede ser sustituido. R^9 y R^{10} pueden estar enlazados entre sí para formar una estructura de anillo. Específicamente, R^8 es un metilo, etilo, diferentes isómeros de propilo, butilo, pentilo y hexilo, clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo; 2-cloroetilo, 2-fluoroetilo, 3-cloropropilo, 3-fluorapropil, etc., y and NR^9R^{10} es un metilamino, etilamino,

30

1)

diferentes isómeros de propilamino, butilamino, pentilamio y hexilamino, dimetilamino, metiletilamino, dietilamino, di-n-propilamino, di-i-propilamino, etc.

El sufijo "q" para Y es 0, 1 ó 2.

5

Los componentes de azol de la presente invención pueden sintetizarse por ejemplo como se muestra a continuación:

10 En donde un compuesto monoclorado de la fórmula (IV) se reacciona con un azol de la fórmula (V) para obtener.

15 En este método, el compuesto del azol es preferiblemente hecho en forma de sal por un compuesto de metal alcali tal como el hidruro de sodio antes de la reacción con el compuesto monoclorado. Un solvente inerte tal como el tetrahidrofuran se usa preferiblemente como solvente para la reacción. La temperatura de la reacción puede pasar de la temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente y es preferible mezclarlo hasta que se finalice la reacción.

20 Alternativamente, el compuesto monoclorado anterior y el azol pueden reaccionarse sin usar un solvente o en un solvente tal como el cloruro de metileno, 1;2-dicloroetano y cloroformo a la temperatura de la temperatura ambiente hasta el punto de ebullición del solvente que se ha revuelto. En esta reacción, una base orgánica tal como la trietilamina puede utilizarse como catalizador.

25 Los compuestos de azol representados por la fórmula (VI) pueden sintetizarse de la misma manera que se mencionó anteriormente.

30 Las composiciones herbicidas de la presente invención incluyen los compuesto de azol representados por la fórmula (I) o (VI) obtenida de la manera descrita anteriormente como los componentes efectivos. Los compuestos de azol pueden

utilizarse como una fórmula con un líquido diluyente tal como un solvente o un sólido diluyente tal como un polvo mineral fino. Las formulaciones útiles incluyen polvos que se pueden humedecer, concentrados emulsificables, polvos y gránulos.

- 5 Las fórmulas pueden contener además un surfactante para hacer las composiciones más emulsificables, más fáciles de dispersar y de esparcir. Los polvos humedecibles preferiblemente comprendidos de 5 a 55% por peso del compuesto de 40 a 93% por peso de un diluyente sólido y 2 a 5% por peso de un surfactante. Los concentrados emulsificables preferiblemente comprenden de 10 a
- 10 50% por peso del compuesto de azol, 35 a 85% por peso de un solvente y 5 a 15% por peso de un surfactante. Los polvos preferiblemente comprenden 1 a 15% por peso del compuesto azol, 80 a 97% por peso de un sólido diluyente y 2 a 5% por peso de un surfactante. Los Gránulos pueden prepararse granulando una composición que preferiblemente comprenda de 1 a 15% por peso del compuesto
- 15 azol, 80 a 97% por peso de un diluyente sólido y 2 a 5% por peso de un surfactante.

El diluyente sólido preferido puede incluir óxido tales como tierra diatomácea y cal muerta, fosfatos tales como apatita, sulfatos tales como sulfato de calcio, y finos

20 polvos minerales tales como talco, pirofilita, arcilla, caolín, bentnita, arcilla ácida, carbón blanco, polvo de cuarzo y polvo de sílica.

Los solventes orgánicos se prefieren para el solvente en los cuales pueden incluir hidrocarburos aromáticos tales como el benceno, el tolueno y el xileno;

25 hidrocarburos clorinados tales como el o-clorotolueno, el tricloroetano y el tricloroetileno; alcoholes tales como el ciclohexanol, amilalcohol y el etileneglicol, cetonas tales como isoforona, Ciclohexanona y ciclohexenilciclohexano; éteres tales como el butilcelosolve, dietilo éter y metiletilo éter; ésteres tales como el acetato isopropil, el benzil acetato y el metiloftalato; amidos tales como el

30 dimetilformamido y mezclas de éstos.

Cualquiera de los surfactantes aniónicos, surfactantes no iónicos, surfactantes catiónicos y surfactantes anfotéricos tales como los aminoácidos y la betaina se pueden usar.

5

Las composiciones herbicidas de la presente invención pueden además contener si es necesario otros componentes activos herbicidas en combinación con los compuestos azol representados por la fórmula (I) o (VI). Ejemplos de los demás componentes activos herbicidas pueden ser seleccionados adecuadamente de los herbicidas difenilo éter, los herbicidas triacina, herbicidas urea, herbicidas carbamato, herbicidas tiocarbamate, herbicidas ácido anélido, herbicidas pirazol, herbicidas de ácido fosfórico, herbicidas sulfonilurea y herbicidas de oxadiazona.

10

Las composiciones herbicidas de la presente invención pueden además contener insecticidas, antibióticos reguladores del crecimiento de las plantas y fertilizantes, si es necesario.

15

Las composiciones herbicidas de la presente invención se aplican a las malezas antes y/o después de la germinación de sus ambientes. Los modos de aplicación varían dependiendo el tipo de las plantas cultivadas y de los factores ambientales, por ejemplo, las composiciones herbicidas pueden aplicarse por medio de un rociador, dispersador, regador o irrigándolas.

20

Un porcentaje de aplicación de los compuestos del azol de la presente invención se determina por un número de factores tales como la selección de la formulación, el modo de aplicación, la cantidad y el tipo de especies de malezas, las condiciones de crecimiento, etc. En general, la tasa de aplicación es de 0.001 a 10 kg/ha, preferiblemente 0.01 a 5 kg/ha. Una persona hábil en el arte puede determinar fácilmente la tasa de aplicación necesaria para el nivel deseado del control de la maleza.

25

30

Los compuestos herbicidas de la presente invención son efectivos para controlar las malezas en plantas útiles cultivadas tales como los cultivos de gramináceas tales como el arroz, el trigo, cebada, maíz, avena y sorgo; cultivos de hojas anchas
 5 tales como la soya, el algodón, la remolacha, el girasol y la semilla de colza; árboles frutales, vegetales tales como frutas vegetales, vegetales de raíz y vegetales de hojas; y céspedes.

Los herbicidas de la presente invención son efectivos para controlar las malezas
 10 del arroz y las malezas de los cultivos. Las malezas del arroz incluyen las malezas Alismataceas tales como el *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria trifolia* y *Sagittaria pygmaea*; malezas Ciperáceas tales como *Cyperus difformis*, *Cyperus serotinus*, *Scirpus juncoide*s and *Eleocharis kuroguwai*, malezas escrofulareáceas tales como *Lindernia pyxidaria*; malezas Pontenderáceas tales como *Monochoria vaginalis*,
 15 malezas Potamogetonáceas tales como *Potamogeton distinctus*; malezas Litráceas tales como *Rotala indica* y malezas-graminosas tales como *Echinochloa crus-galli*.

Las malezas de los cultivos incluyen malezas de hojas anchas y de hojas estrechas.

20 Las malezas de hoja ancha pueden ser Solanáceas tales como *Solanum nigrum* y *Datura stramonium*; las malezas malváceas tales como *Abutilon theophrasti* y *Sida spinosa*; malezas Convulvuláceas tales como *Ipomoea purpurea*; malezas Amarantáceas tales como *Amaranthus lividus*; malezas Compuestas tales como *Xanthium*, *strumarium*, *Ambrosia artemisifolia*, *Galinsoga ciliata*, *Cirsium arvense*,
 25 *Senecio vulgaris* y *Erigeron annuus*; malezas Brasisáceas tales como *Rorippa indica*, *Sinapis arvensis* y malezas Poligonáceas tales como *Polygonum bulumei* y *Polygonum convolvulus*; malezas Portuláceas tales como *Portulaca oleracea*; malezas Quenopodiáceas tales como *Chenopodium alubum*, *Chenopodium ficiolium* y *Kochia scoparia*; malezas Cariofiláceas tales como *Stellaria media*; malezas
 30 Escrofulariáceas tales como *veronica persica*; malezas Comelináceas tales como

Commelina communis; malezas Euforbiáceas tales como *Lamium amplexicaule*, *Euphorbia supina* y *Euphorbia maculata*; malezas Rubiáceas tales como *Galium spurium*, *Galium aparine* y *Rubia akane*; malezas Violáceas tales como *Viola arvensis*; y malezas Leguminosas tales como *Sesbania exaltata* y *Cassia obtusifolia*.

5

Las Malezas de hoja estrecha pueden ser malezas gramíneas tales como *Sorghum bicolor*, *Panicum dichotomiflorum*, *Sorghum haepense*, *Echinochloa crus-galli*, *Digitaria adscendens*, *Avena fatua*, *Eleusine indica*, *Sataria virides* y *Alopecurus aequalis*; y malezas ciperáceas tales como *Cyperus rotundus* y *Cyperus esculentus*.

10

La presente invención describirá más específicamente con referencia a los siguientes ejemplos.

Ejemplo 1

15

(1) Síntesis de 4-cloro-5-oxicarbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido

(1) Síntesis del etilo 4-carboximetilosulfenilo-2-clorobenzoato

una mezcla de 10.0 g de etilo 2,4 de clorobenzoato, 9.44 g de carbonato de potasio, 50 ml de dimetiloformamido y 3.8 ml de ácido mercaptoacético y se calentó a 80°C por 4 horas.

20

Entonces, la mezcla resultante de la reacción se virtió en agua helada y fue extraída con acetato de etilo. El extracto se secó sobre el sulfato de sodio y se filtró. Al concentrar el filtrado, 12.3 g de un producto crudo se obtuvieron.

25

(2) Síntesis de 4-cloro-5-etoxicarbonilo-3-oxo-2,3 dihidrobenzotiofeno.

Una mezcla de 12.3 g de etilo 4-carboximetilosulfenilo-2-clorobenzoato se obtuvieron en (1), 36 ml de 1,2-di-cloroetano y 3.9 ml de cloruro de tionilo se calentaron al reflujo por una hora.

La mezcla de la reacción se concentró para obtener cloruro ácido el cual se disolvió en 36 ml de diclorometano. La solución resultante se agregó gota a gota a una solución preparada con anticipación de 14.3 g (107 mmol de cloruro de aluminio en 150 ml de diclorometano durante una hora a una temperatura de congelación y la reacción entonces se continuó a la temperatura ambiente por dos horas. El producto de la reacción resultante se vertió en agua helada y fue extraído con diclorometano. El extracto se secó sobre sulfato de sodio seguido por filtración y concentración para dar 12.3 g de un producto crudo como aceite café oscuro.

- 10 Después de la purificación del producto crudo por una columna de cromatografía, 5.3 g (rendimiento 46%) del compuesto título se obtuvieron, aceite café.

(3) Síntesis de 4-cloro-5-etoxicarbonil-3-hidroxi-2,3-dihidrobenzotiofeno

- Una solución de 5.3 g de 4-cloro-5-etoxicarbonilo-3-oxo-2,3-dihidrobenzotiofeno obtenido (2) en 25 ml de diclorometano y 25 ml de etanol que se enfriaron en baño de hielo. A la solución, 0.26 g de sodio boron hídrido se agregaron y la mezcla resultante se dejó en reposo durante la noche. Entonces la solución de la reacción se vertió en agua helada y fue extraída con diclorometano. El extracto se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró para dar 5.3 g (rendimiento: 98%) del compuesto título.

20

- (4) Síntesis de 4-cloro-5-etoxicarbonilbenzotiofeno 4-Cloro-5-etoxicarbonilo-3-hidroxi-2,3-dihidrobenzotiofeno obtenidos en (3) (5.3 g) que fueron deshidratados azeotropicalmente calentándolos con 50 ml de tolueno y 0.2 g de ácido p-toluenosulfónico por una hora. La solución resultante se diluyó con tolueno se lavó con solución saturada de hidrógenocarbonato de sodio, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró para obtener 4.6 g (rendimiento: 95%) del compuesto título como aceite café.

25

(5) Síntesis de 4-cloro-5-etoxicarbonilbenzotiofeno 1.1-dioxide

una mezcla de 4.6 g de 4-cloro-5-etoxicarbonilobenzotiofeno obtenidos en (4), 30 ml de ácido acético y 5.4 ml de peróxido de hidrógeno acuoso por peso se calentaron a 80°C por dos horas revolviéndolos. Después de enfriarla a la temperatura ambiente, la solución de la reacción se diluyó con agua y se filtró para
5 recoger un producto sólido el cual se secó y se purificó por columna de cromatografía para obtener 3.7 g (Rendimiento: 95%) del compuesto título como cristales sin color.

(6) Síntesis de 4-cloro-5-etoxicarbonilo-2;3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido 4-
10 Cloro-5-etoxicarbonilobenzotiofeno-1,1-dióxido (3.7 g) obtenidos en (5) se hidrogenaron en 40 ml de tetrahidrofuran en la presencia de 5% de paladio/carbono en atmósfera de gas hidrógeno a la temperatura ambiente y la presión atmosférica por 8 horas. La mezcla de la reacción se filtró y se concentró para obtener 3.44 g (rendimiento: 91%) del compuesto título como un aceite
15 amarillo pálido.

(7) Síntesis de 4-cloro-5-oxicarbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1dióxido
A una solución de 3.44 g de 4-cloro-5-etoxicarbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-
clioxido obtenidos en (6) en 35 ml de etanol, fueron agregados a 5 ml de 20% por
20 peso de hidróxido de sodio solución acuosa y la mezcla resultante se mantuvo en reposo durante la noche.

Después de la concentración, la mezcla se acidificó con ácido hidrocórico al 5% por peso y los precipitados se recogieron por filtrado y se secaron para obtener 2.6
25 g (rendimiento: 84%) del compuesto título como cristales sin color.

El espectro $^1\text{H-NMR}$, (acetona- d^6 , TMS) de los cristales sin color mostraron picos de absorción a 3.4-3.8 (m, 4H), 7.85 (1H, d) y 8.06 (1H, d). El espectro infrarrojo mostró picos de absorción a 3080 cm^{-1} , 3010 cm^{-1} , 1690 cm^{-1} , 1410 cm^{-1} , 1400 cm^{-1} ,
30 $^{1310 \text{ cm}^{-1}}$, 1290 cm^{-1} , 1250 cm^{-1} , 1190 cm^{-1} y 1130 cm^{-1} . De estos resultados,

Obtenida en [3] en 2 ml de tetrahidrofurano como el solvente de la reacción, y la mezcla resultante fue agitada a temperatura ambiente durante 5 horas.

Luego de que la reacción fuera completada, se agregó la solución de reacción con 5% en peso de solución acuosa de ácido hidroclicórico y extractado con acetato de etilo. Se lavó el extracto con solución acuosa saturada de cloruro de sodio y secada sobre sulfato de sodio anhidroso. El producto crudo obtenido mediante la remoción del solvente por evaporación a presión reducida fue purificado mediante cromatografía de columna para obtener 0.45 g (producido: 83%) de producto. [4']

10 Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil
2,3-dihidrobencotiofeno 1,1-dióxido

El compuesto del título fue sintetizado por un proceso diferente del proceso de [4].

El 4-Cloro-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3

15 dihidrobencotiofeno 1,1-dióxido (0.50 g) obtenido en [3] y 0.19 g de pirazol fueron disueltos en 5 ml de cloruro de metileno como solvente. Se adicionó la solución con trietilamina como catalista a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a a temperatura ambiente durante 5 horas para permitir que la reacción procediera.

Luego de que la reacción se completó, se removi6 el solvente por evaporación a
20 presión reducida para obtener un producto crudo, que luego se purific6 por cromatografía de columna para obtener 0.45 g (producto: 83%) de producto. Los resultados de los análisis ¹H-NMR y IR, la estructura química y el punto de fusión del producto obtenido en [4] y [4'] se muestran en la Tabla 1. A partir de los resultados, se confirm6 que el producto obtenido arriba 4-cloro-5[1-oxo-3-(1-
25 pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobencotiofeno 1,1-dióxido
(Compuesto No. 1).

Ejemplo 2

La Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(3-metil-1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2il]carbonil-2,3-dihidrobencotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 2). El compuesto del título fue

los cristales obtenidos se confirmaron como siendo 4-cloro-5-oxicarbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno I; 1-dióxido fundido de 232 a 233°C.

[2] Síntesis de 4-cloro-5-(1,3-dioxociclohex-2-yl)carbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido.

5

Una mezcla de 1,0 g de 4-cloro-5-oxicarbonilo-2,3-dihidrobenzotiofeno I,1-dióxido se obtuvieron en [1] y 4 ml de suspensión de 0.54 g de cloruro tionilo en 1,2-dicloroetano que se calentaron por una hora a reflujo y de ahí en adelante el solvente se removió por evaporación a una presión reducida para obtener cloruro ácido.

10

El cloruro ácido y 0.47 g de 1,3-ciclohexanediona se disolvieron en 10 ml de acetonitrilo como el solvente para preparar una solución a la cual una solución de 0.82 g de trietilamina en 5 ml de acetonitrilo was added dropwise.

15

Entonces, después de revolver a la temperatura ambiente por dos horas la mezcla se trató con 0.01 g de acetona cianohidrina y se revolvieron a la temperatura ambiente por 20 horas.

20

La mezcla de la reacción se diluyó con acetato de etilo y se extrajo con una solución acuosa saturada de carbonato de sodio. La capa acuosa se ajustó a un pH de 1 con ácido hidroclicórico al 10% y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con agua y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El solvente se removió de la mezcla de la reacción por evaporación a una presión reducida para obtener 1.24 g (rendimiento = 90%) del producto.

25

El espectro $^1\text{H-NMR}$ del producto mostró picos de absorción de 1.9-2.3 (m, 2H), 2.3-2.7 (m, 2H), 2.6 a 3.0 (m, 2H), 3.1 a 3.8 (m, 4H), 7.32 (1H, d) y 7.69 (1H, d.). el espectro Infrarrojo mostró picos de absorción a 1675 cm^{-1} , 1575 cm^{-1} , 1550

30

cm^{-1} , 1400 cm^{-1} , 1295 cm^{-1} y 1125 cm^{-1} . De estos resultados, el producto se confirmó como siendo 4-cloro-5- (1,3-dioxociclohexa-2-yl) carbonilo-2,3-dihidrobentotiofeno 1,1-dióxido fundiéndose a $156,0\text{-}159,7^\circ\text{C}$.

(3) Síntesis de 4- cloro - 5-(3 - cloro - 1 - oxo - 2 - ciclohexeno - 2 - yl) carbonilo-2,3-dihidrobentotiofeno 1,1 dióxido

4-Cloro-5-(1,3-dioxociclohexo-2-yl)carbonil-2,3-dihidrobentotiofeno 1,1-dióxido (1.00 g) obtenidos en [2] se disolvieron en 5 ml de 1,2-dicloroetano como el solvente. La solución se agregó con 0.36 g de cloruro de oxalil y 0.01 g de dimetilformamido a la temperatura ambiente y se calentaron a reflujo por una hora.

El solvente se removió por evaporación a una presión reducida para obtener un producto crudo el cual se purificó entonces por columna cromatográfica para obtener 0.99 g (rendimiento: 94%) del producto.

El espectro $^1\text{H-NMR}$ del producto mostró picos de absorción de 2.0-2.4 (m, 2H), 2.4-2.7 (m, 2H), 2.8-3.0 (m, 2H), 3.3-3.7 (m, 4H), 7.70 (1H, d) y 7.82 (1H, d). El espectro infrarrojo mostró picos de absorción de 1683 cm^{-1} , 1605 cm^{-1} , 1390 cm^{-1} , 1300 cm^{-1} , 1175 cm^{-1} y 1125 cm^{-1} . De estos resultados, el producto obtenido se confirmó como siendo 4-cloro-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2yl) carbonilo-2,3-dihydrobenzothiofeno 1,1-dióxido fundiéndose $83,8\text{-}85,4^\circ\text{C}$.

[4] Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-yl]carbonil-2,3-dihidrobentotiofeno 1,1-dióxido

en una suspensión de 0.11 g de hídrido de sodio en 3 ml de tetrahidrofuran, se agregaron 0.19 g de pirazol a 0°C y la mezcla resultante se revolvió por 30 minutos.

A la solución a 0°C , se agregó una solución de 0.50 g de 4-cloro-5-(3cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-yl)carbonilo-2,3-dihidrobentotiofeno 1,1-dióxido

producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 3-metilpirazol en vez de pirazol.

Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto se muestran en la Tabla I.

5 Ejemplo 3

La síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(4-metil-1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 3)

El compuesto del título fue producido de la misma manera de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 4-metilpirazol en lugar de pirazol.

10 $^1\text{H-NMR}$, IR, data, IR data, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

Ejemplo 4

La síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(4-bromo-1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 4)

15 El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 3. excepto que se usó 4-bromopirazol en lugar de pirazol.

Los datos de $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran in Tabla 1.

Ejemplo 5

20 Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(3-metil-4-bromo-1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 5)

El compuesto del título fue producido de la misma manera as en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 3-metil-4-bromopirazol en lugar de pirazol.

25 Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título compuesto se muestran en la Tabla 1.

Ejemplo 6

Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(3-metil-4-fenil-1-pirazolil)-2ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 6)

30 El compuesto del título fue producido de la misma manera que en el [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 3-metil-4-fenilpirazol en lugar de pirazol.

Los datos de $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

Ejemplo 7

Síntesis de 4-cloro-5-[1-oxo-3-(1,2,5-triazol-1-il)-2-ciclohexeno-2-il]

5 Carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 7)

El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 1,2,6-triazol en lugar de pirazol.

Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

10 Ejemplo 8

Síntesis de 4-cloro-5-[3-(1,2,4-triazol-1-il)-2-ciclohexeno-1-oxo-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 8)

El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 1,2,4-triazol en lugar de pirazol.

15 Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

Ejemplo 9

Síntesis de 4-cloro-5-[3-(1-indazolil)-2-ciclohexeno-1-one-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 9)

20 El compuesto del título se produjo de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó indazol en lugar de la pirazol usada en [4] del Ejemplo 1

Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y punto de fusión del compuesto del título se muestran in Tabla 1.

Ejemplo 10

25 Síntesis de 4-metil-5-[1-oxo-3-(1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil 2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 10)

El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 4-metil-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil

2,3-dihidrobenzotiofeno 1-1-dióxido en lugar de 4-cloro-5-(3-

30 cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido.

Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran in Tabla 1.

Ejemplo 11

Síntesis de 5-cloro-6-(1-oxo-3-il-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-

5 II)3carboniltiocroman 1,1-dióxido (Compuesto No. 11).

El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 5-cloro-6-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carboniltiocroman 1,1-dióxido en lugar de 4-cloro-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido.

10 Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

Ejemplo 12

Síntesis de 4-ciano-5-(1-oxo-3-(1-pirazolil) 2 ciclohexeno-2-il]carbonil 2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 12)

15 El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 4-ciano-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido en lugar de 4-cloro-5-(3cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1 -dióxido.

20 Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en Tabla 1.

Ejemplo 13

Síntesis de 4-cloro-3-metoxi-5-[1-oxo-3-(1-pirazolil)-2-ciclohexeno-2-il]carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido (Compuesto No. 13)

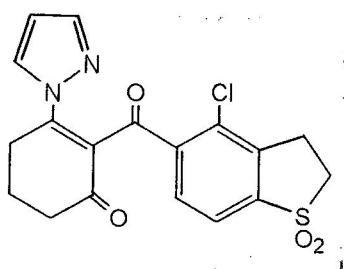
25 El compuesto del título fue producido de la misma manera que en [4] del Ejemplo 1 excepto que se usó 4-cloro-3-metoxi-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido en lugar de 4-cloro-5-(3-cloro-1-oxo-2-ciclohexeno-2-il)carbonil-2,3-dihidrobenzotiofeno 1,1-dióxido.

Los datos $^1\text{H-NMR}$, los datos IR, la estructura química y el punto de fusión del compuesto del título se muestran en la Tabla 1.

30 Tabla 1

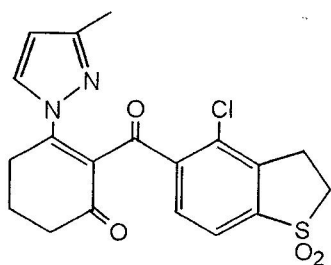
Compuesto No	Estructura química	NMR Ppm (CDCL ₃) TMS	IR cm ⁻¹	Punto de fusión (°C)
-----------------	--------------------	--	------------------------	-------------------------

1



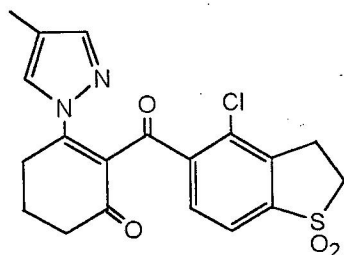
2.2- 1660 209.1-
 2.5(2H,m) 213.7
 2.5- 1615
 2.8(2H,m)
 2.9- 1400
 3.2(2H,m)
 3.3- 1380
 3.6(4H,m)
 6.44(1H,dd) 1300
 7.52(1H,d) 1180
 7.63(1H,d) 1120
 7.77(1H,d)
 7.79 (1H,d)

2



2.06(3H,s) 1690 213.1-
 213.2
 2.2- 1615
 2.4(2H,m)
 2.5- 1545
 2.7(2H,m)
 2.9- 1410
 3.1(2H,m)
 3.3- 1305
 3.7(4H,m)
 6.20(1H,d) 1185
 7.62(1H,d) 1135

3



7.64(1H,d)

7.96(1H,d)

2.05(3H,s)

1690

106.2-

109.0

2.2-

1655

2.4(2H,m)

2.5-

1615

2.7(2H,m)

2.9-

1415

3.1(2H,m)

3.3-

1300

3.7(4H,m)

7.34(1H,s)

1180

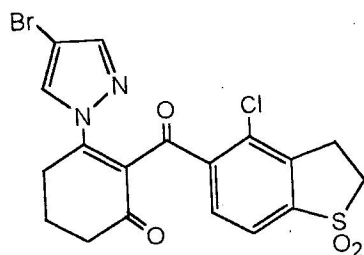
7.51(1H,s)

1135

7.61(1H,d)

7.94(1H,d)

4



2.2-

1695

166.0-

2.5(2H,m)

167.2

2.5-

1620

2.8(2H,m)

2.9-

1410

3.1(2H,m)

3.2-

1295

3.8(4H,m)

7.47(1H,s)

1185

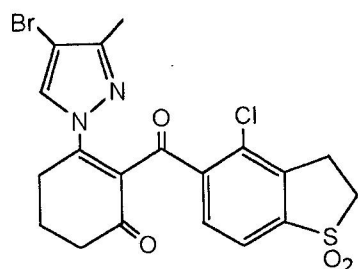
7.64(1H,d)

1140

7.80(1H,s)

1120

5



7.95(1H,s)

2.04(3H,s) 1695 212.7-
215.9

2.2- 1650

2.4(2H,m)

2.5- 1615

2.7(2H,m)

2.9- 1410

3.1(2H,m)

3.3- 1800

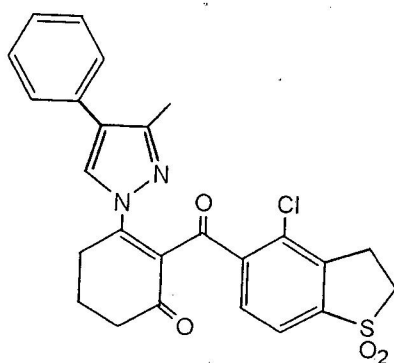
3.7(4H,m)

7.64(1H,d) 1140

7.71(1H,s) 1120

7.96(1H,d)

6

2.15(3H,s) 1695 229.8-
232.1

2.2- 1645

2.5(2H,m)

2.5- 1605

2.7(2H,m)

2.9- 1410

3.2(2H,m)

3.3- 1295

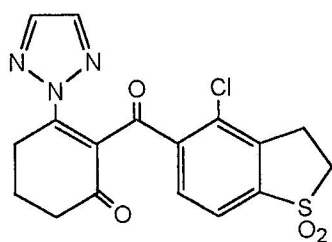
3.7(4H,m)

7.2- 1190

7.4(5H,m)

7.64(1H,d) 1130

7



7.76(1H,s)

8.01(1H,d)

2.2-

1695

88.3-92.5

2.5(2H,m)

2.5-

1660

2.8(2H,m)

3.2-

1625

3.3(6H,m)

7.65(1H,d)

1390

7.75(2H,s)

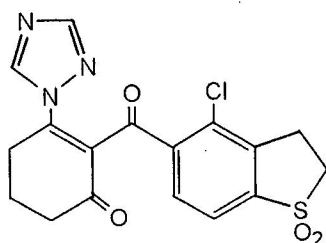
1310

8.02(1H,d)

1270

1135

8



2.2-

1685

90.6-101.6

2.5(2H,m)

2.5-

1655

2.8(2H,m)

3.0-

1510

3.2(2H,m)

3.3-

1410

3.7(4H,m)

7.67(1H,d)

1305

7.89(1H,s)

1185

7.99(1H,d)

1135

8.50(1H,s)

9

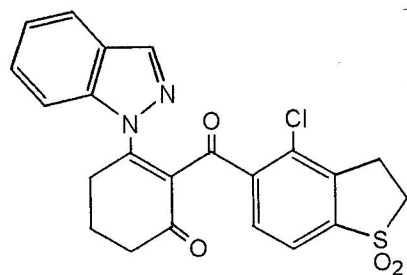
2.3-

1690

103.9-

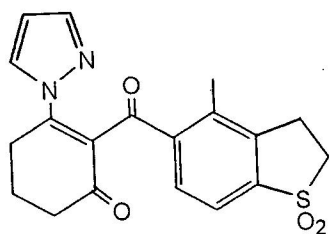
2.5(2H,m)

109.3



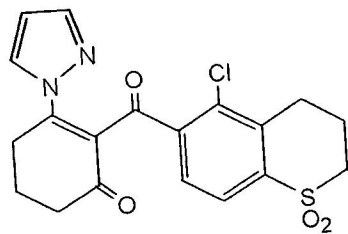
2.6-	1655
2.8(2H,m)	
3.1-	1615
3.7(6H,m)	
7.59(1H,d)	1300
7.97(1H,d)	1185
8.23(1H,d)	1135

10



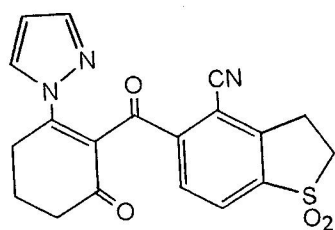
2.2-	1690	265.6-
2.4(2H,m)		288.2
2.5-	1655	
2.7(2H,m)		
2.65(3H,s)	1615	
3.0-	1375	
3.2(2H,m)		
3.3-	1290	
3.6()4H,m		
6.42(1H,dd)	1185	
7.47(1H,d)	1120	
7.51(1H,d)	760	
7.62(1H,d)		
7.76(1H,d)		

11



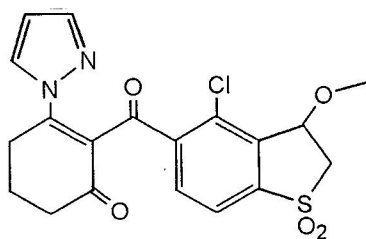
2.2-	1695	Jarabe
3.5(12H,m)		
6.42(1H,dd)	1615	
7.53(1H,d)	1375	
7.75(1H,d)	1295	
7.86(2H,s)	1190	

12



	1125	
2.2-	2960	Jarabe
2.5(2H,m)		
2.6-	1690	
2.8(2H,m)		
3.0-	1615	
3.2(2H,m)		
3.60(4H,s)	1375	
6.45(1H,dd)	1300	
7.50(1H,d)	1185	
7.83(1H,d)	1120	
7.98(1H,d)		
8.16(1H,d)		

13



2.2-	1695	Jarabe
2.4(2H,m)		
2.5-	1655	
2.7(2H,m)		
3.0-	1615	
3.2(2H,m)		
3.50(3H,s)	1395	
3.6-	1375	
3.7(2H,m)		
5.24(1H,dd)	1305	
6.41(1H,dd)	1200	
7.51(1H,d)	1185	
7.63(1H,d)	1150	
7.76(1H,d)		

8.05(1H,d)

Ejemplo 14

5 [1] Preparación de la Composición Herbicida

Talco (57 partes en peso), bentonita (40 partes en peso), ambos como portadores, y a alquilbenzenosulfonato de sodio (3 partes en peso) como surfactante se mezclaron uniformemente mediante pulverización para obtener un portador para la formulación de polvo humedecible. Luego, se mezclaron 10 partes en peso del compuesto azol obtenido en el Ejemplo 1 y 90 partes en peso del transportador obtenido arriba mediante pulverización para una composición herbicida.

[2] prueba Herbicida

(1) tratamiento del suelo de los cultivos

Se sembraron semillas de seis especies diferentes de maleza y dos especies diferentes de cultivos en tierra en pots individuales Wagner de 1/5000 áreas, y se cubrieron con tierra. Las malezas de los cultivos usadas fueron *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Alopecurus myosuroides*, *Abutilon theophrasti*, *Ambrosia artemisiifolia* y *Stellaria media*, y los cultivos utilizados fueron maíz y trigo. Luego, una cantidad de la composición herbicida preparada en [1] se suspendió en agua y la suspensión fue esparcida uniformemente en la superficie de la tierra.

Los pots tratados así fueron colocados en un invernadero para permitir que las semillas crecieran. Se determinó el efecto herbicida y los daños a los cultivos 20 días después del tratamiento con la composición herbicida. Los resultados se muestran en la Tabla 2.

25 (2) tratamiento al follaje del cultivo

Se sembraron semillas de seis especies diferentes de maleza de los cultivos y dos especies diferentes de cultivos en tierra de cultivo en pots individuales Wagner de 1/5000 áreas, y se cubrieron con tierra. Las malezas de los cultivos usadas fueron *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Alopecurus miosuroides*, *Abutilon*

theophrasti, *Ambrosia artemisifolia* y *stellaria media*, y los cultivos usados fueron maíz y trigo. Los se colocaron entonces en un invernadero para permitir el crecimiento de las semillas.

Cuando las plantas alcanzaron una etapa de tres a cuatro hojas, se roció uniformemente una suspensión de agua que contenía una cantidad de la composición herbicida preparada en [1] en el follaje a una tasa de 2,000 litros/ha. Las plantas tratadas se mantuvieron luego en un invernadero para su vegetación. Se determinaron el efecto herbicida y el daño a los cultivos 30 días después del tratamiento con la composición herbicida. Los resultados se muestran en la Tabla

3.

(3) tratamiento de irrigación 3 días después del transplante

Se sembraron semillas de *Echinochloa oryzicola* y *Scirpus*, juncoides en la superficie de la tierra de un campo de arroz en un pote Wagner de 1/2000. Luego, se transplantaron las semillas de arroz de en una etapa de 2.5 de hoja en la tierra.

Luego de suministrar agua al pote de manera que tuviera una profundidad de agua irrigación de 3 cm, se colocó el pote en un invernadero 20 a 25°C para su vegetación.

Tres días después de este transplante, se agregó una cantidad de la composición herbicida preparada en [1] al agua de irrigación. Se determinaron el efecto herbicida y el daño al cultivo de arroz 30 días después del tratamiento con la composición herbicida. Los resultados se muestran en la Tabla 4. (4) tratamiento de irrigación (tratamiento 10 días después del transplante)

Se sembraron semillas de *Echinochloa oryzicola* y *Scirpus juncoides* en la superficie de la tierra de un cultivo de arroz en un pote Wagner de 1/2000. Luego, se transplantaron las plantas de arroz en una etapa de 2.5 de hoja en la tierra.

Se ajustó la profundidad del agua mantenida en el pote a 3 cm y se colocó el pote en un invernadero ajustado a temperaturas de 20 a 25°C. Se permitió que las plantas crecieran en la condición para el crecimiento de plantas.

Tres días después del transplante de las plantas de arroz, se agregó una cantidad de la composición herbicida preparada en [1] al agua de irrigación. Se

determinaron el efecto herbicida y el daño al cultivo de arroz 30 días después del tratamiento con la composición herbicida. Los resultados se muestran en la Tabla 4.

- 5 El grado de control, el efecto herbicida y el grado del daño a los cultivos en las pruebas herbicidas (1) a (4) se determinaron de la manera siguiente.

(a) grado de control

el grado de control (%) se calculó a partir de los pesos de las partes por encima de la tierra de las malezas frescas en el área tratada y el área no tratada usando la ecuación siguiente:

- 10 $\text{Grado de control (\%)} = [1 - (\text{peso de las malezas en el área tratada}) / (\text{peso de las malezas en el área sin tratar})] \times 100$

(b) efecto Herbicida

se determinó el efecto herbicida con base en las evaluaciones siguientes:

[efectos Herbicidas]	[grado de control]
0	Menor que 5% (casi ningún efecto)
1	5% a menor que 20%
2	20% a menor que 40%
3	40% a menor que 70%
4	70% a menor que 90%
5	90% o más (casi control completo)

15

(c) daño a las cosechas

se evaluó el daño a las cosechas con base en las siguientes evaluaciones:

[daño a las cosechas]	[daño Observado]
0	Ningún daño
1	Casi ningún daño
2	Daños leves

3	Daños significativos
4	Daños marcados
5	Muerte casi completa

Ejemplos 15 a 26

[1] Preparación de composiciones herbicidas

Las composiciones herbicidas se prepararon de las misma manera que en [1] del Ejemplo 14 excepto que la compuesto azol fue reemplazado por los compuestos azol de los Ejemplos 2 a 13.

[2] pruebas Herbicida

Las pruebas herbicidas fueron realizadas de la misma manera que en [2] del Ejemplo 14 excepto que se reemplazó la composición herbicida por las composiciones herbicidas preparadas en [1] arriba.

Los resultados de las pruebas herbicidas se muestran en Tablas 2 a 4.

Tabla 2

Ejemplo No	Compuesto No	Tasa de Aplicación (g/ha)	Efecto Herbicida						Daño	
			A*	B*	C*	D*	E*	F*	I*	II*
14	1	3000	5	4	3	5	5	4	0	1
15	2	3000	5	4	3	5	5	3	0	1
16	3	3000	5	5	3	5	4	4	0	1
17	4	3000	5	4	3	5	5	4	0	0
18	5	3000	4	3	3	5	5	3	0	0
19	6	3000	4	3	2	4	4	3	0	0
20	7	3000	5	3	3	5	5	3	0	0
21	8	3000	5	4	3	5	5	4	0	1
22	9	3000	5	3	3	5	5	3	0	0
23	10	3000	5	4	3	5	5	4	0	0
24	11	3000	5	4	3	5	5	4	0	0

25	12	3000	5	4	3	5	4	3	0	0
26	13	3000	5	5	3	5	5	5	0	1

A* es Echinochloa crus-galli, B* es Setaria Viridis, C* es Alopecurus myosuroides, D* es Abutilon Theophrasti, E* es Ambrosia Artemisifolia, F* es Stellaria media, I* es maíz y II* es trigo

5 **Tabla 3**

Ejemplo No	Compuesto No	Tasa de Aplicación (g/ha)	Efecto Herbicidas						Daños	
			A*	B*	C*	D*	E*	F*	I*	II*
14	1	3000	5	4	3	5	5	4	0	1
15	2	3000	5	3	4	5	5	5	0	2
16	3	3000	5	4	3	5	5	4	0	2
17	4	3000	5	5	4	5	5	5	0	2
18	5	3000	5	3	3	5	5	4	0	1
19	6	3000	4	2	2	5	4	3	0	0
20	7	3000	5	5	4	5	5	5	0	2
21	8	3000	5	5	4	5	5	5	0	1
22	9	3000	5	3	3	5	5	4	0	0
23	10	3000	5	5	4	5	5	5	0	1
24	11	3000	5	5	3	5	5	5	0	1
25	12	3000	5	4	3	5	5	4	0	0
26	13	3000	5	5	4	5	5	5	1	2

A* es Echinochloa crus-galli, B* es Setaria Viridis, C* es Alopecurus myosuroides, D* es Abutilon Theophrasti, E* es Ambrosia Artemisifolia, F* es Stellaria media, I* es maíz y II* es trigo.

10

Tabla 4

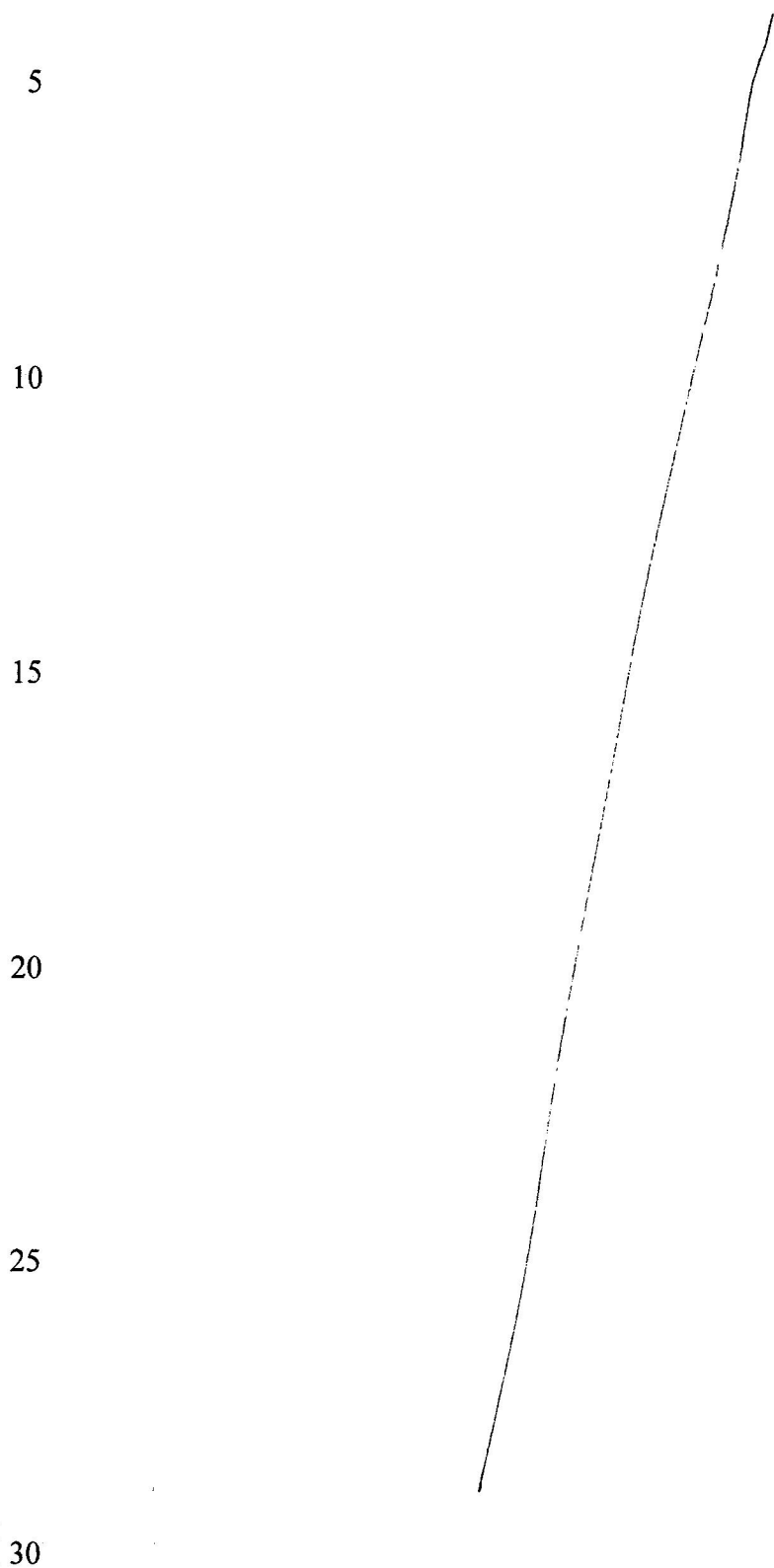
			Tratamiento 3 días después del transplante			Tratamiento 10 Días después del transplante	
Ejemplo No	Compuesto No	Tasa de Aplicación (g/ha)	Efecto Herbicida		Daños	Efecto Herbicida	
			G*	H*		G*	H*
14	1	300	5	5	0	5	5
15	2	300	5	5	0	5	4
16	3	300	5	5	0	4	5
17	4	300	5	5	0	5	5
18	5	300	5	5	0	4	5
19	6	300	1	3	0	2	3
20	7	300	5	5	0	2	5
21	8	300	5	5	0	5	5
22	9	300	5	5	0	1	4
23	10	300	5	5	0	4	4
24	11	300	5	5	0	5	5
25	12	300	5	5	0	4	5
26	13	300	5	4	1	5	3

G* es Echinochloa oryzicola, H* es Scirpus juncoides y III* son los cultivos de arroz .

Aplicabilidad industrial

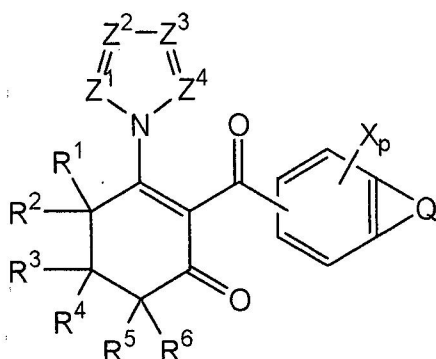
- 5 Los compuestos azol de la presente invención son útiles como componentes efectivos de las composiciones herbicidas y menos perjudiciales para cultivos tales

como campos cultivados y cultivos de arroz, y tienen un amplio espectro del control de la maleza con una tasa de aplicación baja



REIVINDICACIONES

1. Un compuesto azol representado por la fórmula siguiente (I)



en donde :

Q es un grupo divalente que tiene de 3 a 5 átomos en forma de anillo que forman un anillo condensado de cinco a siete miembros saturado o insaturado junto con dos anillos de carbonos de átomos de benceno a los cuales Q está enlazado, uno o dos de dichos átomos que forman un anillo son uno o más átomos seleccionados entre nitrógeno, oxígeno y sulfuro.

Dichos átomos que forman un anillo que constituyen Q pueden tener uno o más sustitutos seleccionados del grupo que consiste en C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino, C₁-C₆ alcoxiimino, hidrazono, C₁-C₆ monoalquilhidrazono y C₁-C₆ dialquilhidrazono.

Los átomos que forman el anillo que constituye Q o un par de átomos que forman un anillo adyacente pueden ser sustituidos por un sustituto divalente seleccionado entre el grupo consistente en dioxietileno, ditioetileno, dioxipropileno y ditio propileno, dicho sustituto divalente siendo opcionalmente sustituido por halógeno o C₁-C₆ alquilo.

X es halógeno, C₁-C₆, alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁-C₆ alquiltio, C₁-C₆ alquilsulfinil, C₁-C₆ alquilsulfonil, amino, C₁-C₆ monoalquilamino, C₁-C₆ dialquilamino, ciano o nitro;

p es 1 o 2;

R^1 a R^6 son cada uno hidrógeno, halógeno, C^1 - C^6 alquilo o C^1 - C^6 haloalquilo; y

Z^1 a Z^4 son cada uno nitrógeno o CR^7 en donde R^7 es hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 , haloalquilo, nitro, fenilo que pueden ser substituidos, y un par de CR^7 adyacentes, si pueden juntos formar un anillo de benceno que puede ser substituido por halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo o nitro.

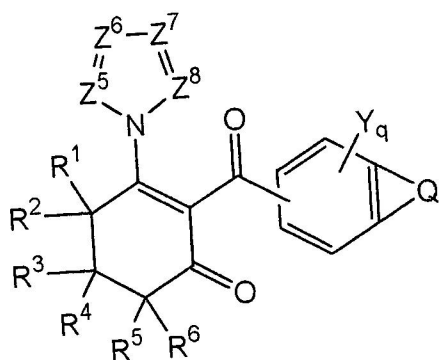
2. El compuesto azol de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el Z^1 de la formula (I) es nitrógeno.

3. El compuesto azol de acuerdo con la reivindicación 1, en donde por lo menos uno de dos átomos que forman un anillo enlazados al anillo de benceno es sulfuro.

4. El compuesto azol de acuerdo con la reivindicación 1, en donde Z^1 es nitrógeno y por lo menos uno de dos átomos que forman un anillo enlazados al anillo de benceno es sulfuro.

5. Una composición herbicida que comprende una cantidad efectiva del compuesto azol descrito en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.

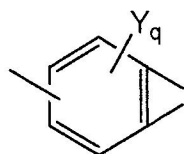
6. Un compuesto azol representado por la fórmula siguiente (VI):



En donde :

R^1 a R^6 son cada uno hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 alquilo o C_1 - C_6 haloalquilo

Z^5 a Z^8 son cada uno nitrógeno o CR^{11} en donde R^{11} es hidrógeno, halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo, nitro, ciano o fenil que pueden ser substituidos, y cuando el Z^i y Z^{i-1} adyacente, en donde i es 5, 6 o 7, son ambos CR^{11} , los substitutos en los átomos de carbono pueden formar en conjunto un anillo de benceno que puede ser substituido por halógeno, C_1 - C_6 alquilo, C_1 - C_6 haloalquilo o nitro:

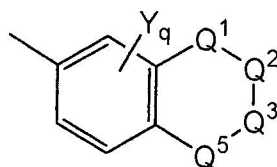
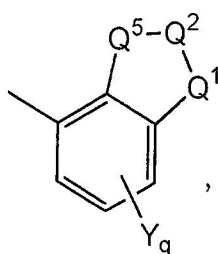
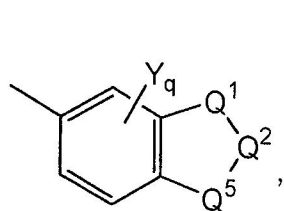


?

5

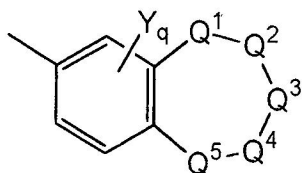
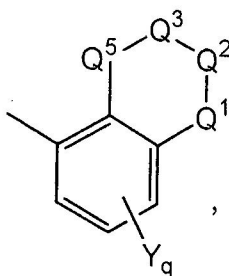
Q es un anillo condensado de 5 a 7 miembros, saturado o insaturado condensado representado por la formula siguiente:

10

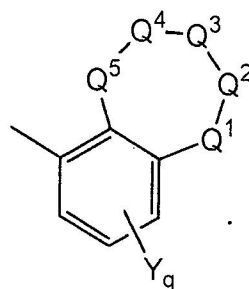


?

15



or



20

En donde hasta dos átomos que forman un anillo Q^1 a Q^5 son átomos seleccionados entre nitrógeno, oxígeno y sulfuro, con la condición de que Q^5 no es sulfuro, dichos átomos que forman un anillo Q^1 a Q^5 tienen opcionalmente uno o más sustitutos seleccionados entre el grupo que consiste en C_1-C_6 alquilo, C_1-C_6 , haloalquilo, C_1-C_6 alcoxi, C_1-C_6 haloalcoxi, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino, C_1-C_6 alcoximino, hidrazono, C_1-C_6 monoalquilhidrazono y C_1-C_6 , dialquilhidrazono, y dichos átomos que forman un anillo de Q' o un par de átomos que forman un anillo adyacente están opcionalmente sustituidos por un sustituto

30

divalente seleccionado entre el grupo que consiste en dioxietileno, ditioetileno, dioxipropileno y ditio propileno para formar una estructura de anillo que puede ser sustituida por halógeno o C₁-C₆ alquilo;

Y es halógeno, nitro, amino, ciano, hidróxido, mercapto, R⁸, OR⁸, SR⁸,

- 5 SO₂R⁸, NR⁹R¹⁰ o NHCOR⁸ en donde R⁸ es C₁-C₆ alquil lineal, ramificado o cíclico que puede contener un enlace de haloalquilo C₁-C₆ insaturado, lineal, ramificado o cíclico que puede contener un enlace insaturado, fenil que puede ser sustituido o bencil que puede ser sustituido, y R⁹ y R¹⁰ son cada uno C₁-C₆ alquil hidrógeno, lineal, ramificado o cíclico que puede contener un enlace insaturado, C₁-C₆ haloalquil lineal, ramificado o cíclico que puede contener un enlace insaturado, fenil que puede ser sustituido o bencil que puede ser sustituido, dicho R⁹ a R¹⁰ estando enlazado opcionalmente entre sí para formar una estructura de anillo y q es 0, 1 o 2.

- 15 7. El compuesto azol de acuerdo con la Reivindicación 6, en donde dichos átomos que forman un anillo Q⁵ es sulfuro.

8. El compuesto azol de acuerdo con la Reivindicación 7, en donde dichos átomos que forman un anillo Q¹ es carbono.

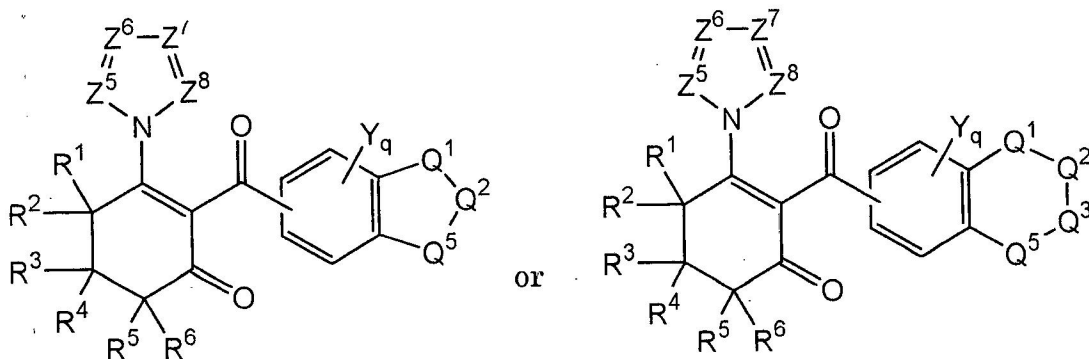
9. El compuesto azol de acuerdo con la Reivindicación 7 u 8, en donde dichos átomos Q² a Q⁴ que forman un anillo son carbonos,

- 20 10. El compuesto azol de acuerdo con la Reivindicación 8 o 9, en donde los sultitutos en dichos átomos Q¹ que forman un anillo es hidrógeno, C₁-C₆ alquil, C₁-C₆ alcoxi, oxo o C₁-C₆ alcoxiimino.

11. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 10, representado por la fórmula siguiente:

25

30



c/v 2^{da} m
anillo

7
5071-123

12. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 11, en donde Y es hidrógeno, nitro; ciano, R^8 , OR^8 , SR^8 o SO_2R^8 en donde R^8 es como se definió en la Reivindicación 6.

5 13. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 12, en donde R^1 a R^6 son hidrógenos.

14. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 13, en donde Q^1 es CH_2 .

10 15. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 13, en donde cada uno entre Q^1 a Q^4 es CH_2 .

16. El compuesto azol de acuerdo con cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 15, en donde Z^5 es nitrógeno.

17. Una composición herbicida que comprende, como un componente efectivo, un compuesto azol descrito en cualquiera de las Reivindicaciones 6 a 16.

15 18. Una composición herbicida para uso en campos de cultivo de arroz, que comprende, como un componente efectivo, un compuesto de azol descrito por cualquiera de las reivindicaciones 6 a 16.

20

25

30

RESUMEN

Los compuestos Azol se representan mediante la fórmula siguiente (I)

5

Retirada la
fórmula para
publicación
2002-07-30
202043

10

En donde, Q, X, p, R¹ a R⁶ y Z¹ a Z⁴ son como se define en la divulgación, y las
15 composiciones herbicidas contienen los compuestos azol de la fórmula (I) en
cantidades herbicidalmente efectivas. Los compuestos de la fórmula (I) son menos
dañinos para las cosechas cultivadas y tienen un espectro amplio de control de
malezas con menos tasas de aplicación.

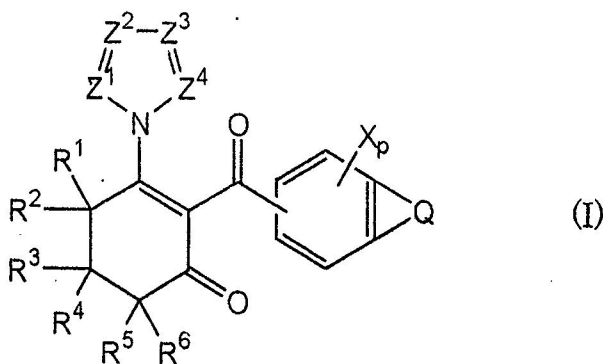
**EXTRACTO PARA PUBLICACION
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

(21) No.SOLICITUD: (51) INT.CL.:
(22) FECHA DE PRESENTACIÓN: (71) SOLICITANTE: IDEMITSU KOSAN CO., LTD.
(30) PRIORIDAD: JAPONESA
(31) No.DE SOLICITUD: 132791/1999 (72) INVENTOR(ES): Masatoshi SAITOU
Hiroki SEKIGUCHI
Shin-ichiro OGAWA
(32) FECHA DE PRESENTACIÓN: Mayo 13 de 1.999
(33) PAÍS: JAPON (74) APODERADO: Humberto RUBIO CAMACHO

(54) TÍTULO:
COMPONENTES DEL AZOL Y COMPOSICIONES HERBICIDAS"

(57) RESUMEN:

Un compuesto azol representado por la fórmula siguiente (I)



en donde :

Q es un grupo divalente que tiene de 3 a 5 átomos en forma de anillo que forman un anillo condensado de cinco a siete miembros saturado o insaturado junto con dos anillos de carbonos de átomos de benceno a los cuales Q está enlazado, uno o dos de dichos átomos que forman un anillo son uno o más átomos seleccionados entre nitrógeno, oxígeno y sulfuro.

Dichos átomos que forman un anillo que constituyen Q pueden tener uno o más sustitutos seleccionados del grupo que consiste en C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, hidroxilo, mercapto, oxo, tioxo, hidroximino, C₁-C₆ alcoximino, hidrazono, C₁-C₆ monoalquilhidrazono y C₁-C₆ dialquilhidrazono.

Los átomos que forman el anillo que constituye Q o un par de átomos que forman un anillo adyacente pueden ser sustituidos por un sustituto divalente seleccionado entre el grupo consistente en dioxietileno, ditioetileno, dioxipropileno y ditio propileno, dicho sustituto divalente siendo opcionalmente sustituido por halógeno o C₁-C₆ alquilo.

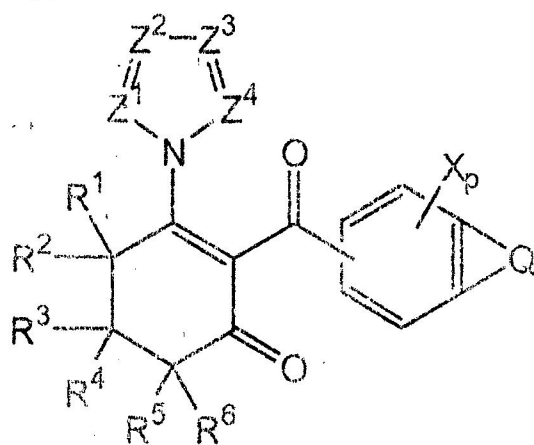
X es halógeno, C₁-C₆, alquilo, C₁-C₆ haloalquilo, C₁-C₆ alcoxi, C₁-C₆ haloalcoxi, C₁ C₆ alquiltio, C₁-C₆ alquilsulfinil, C₁-C₆ alquilsulfonyl, amino, C₁-C₆ monoalquilamino, C₁-C₆ dialquilamino, ciano o nitro;

p es 1 o 2;

R¹ a R⁶ son cada uno hidrógeno, halógeno, C₁-C₆ alquilo o C₁-C₆ haloalquilo; y

Z¹ a Z⁴ son cada uno nitrógeno o CR⁷ en donde R⁷ es hidrógeno, halógeno, C₁-C₆

alquilo, C₁-C₆, haloalquilo, nitro, fenilo que pueden ser substituidos, y un par de CR⁷ adyacentes, si pueden juntos formar un anillo de benceno que puede ser substituido por halogeno, C₁-C₆ alquilo, C₁-C₆ haloalquilo o nitro.



Retirado arte
2002-07-30
202043



45

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

A7

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

Expediente 00-024215

PATENTE DE INVENCION ☒**MODELO DE UTILIDAD** ☐

- Nombre e identificación del Solicitante ☐
- Nombre e identificación del Inventor ☐
- Título o nombre de la Invención ☐
- Descripción 3 ☐
- Reivindicaciones 37 ☐
- Resumen 1 ☐
- Comprobante de Pago 2 ☐

COMPLETA ☐INCOMPLETA ☐**DISEÑO INDUSTRIAL** ☐

- Nombre e identificación del peticionario ☐
- Nombre e identificación del inventor o diseñador ☐
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse ☐
- Representación gráfica ☐
- Comprobante de pago ☐

COMPLETA ☐INCOMPLETA ☐

Firma Responsable

Fecha: 2000-04-04

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

2000-04-05
435

EXPEDIENTE 00-024215

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | | |
|----------|----------|--|
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94). |
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000). |
| SI [x] | NO [] | EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de Paris. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI [] | NO [x] | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

- | | | |
|--------|----------|--|
| SI [] | NO [x] | Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto, |
| SI [] | NO [x] | Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente. |

Santafé de Bogotá, D.C., 5 de abril del 2000.

EXAMINADOR JURIDICO: Código 202002

DIVISIÓN NUEVAS CREACIONES

Primer EXAMEN DE FORMA2000-05-05
430RADICACIÓN N° D-24215CONCEPTO TÉCNICO N° 659 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL DE PATENTES AOIN 43/56

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | |
|--|--|
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c). |
| SI ☐ NO ☐ | Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94. |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94. |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☐ NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 05-V-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES

1er examen de forma

CONCEPTO TÉCNICO No. 659

EXPEDIENTE No. 0-24215

IPC: A01N43/56

Para mayor claridad se solicita modificar el título indicando que se trata de **compuestos de azol y composiciones herbicidas que los contienen**.

La descripción no es clara en el folio 5 cuando dice " Q es un grupo divalente que tiene de 3 a 5 átomos que forman anillos que forman un anillo saturado que forma de 5 a 7 miembros". Así mismo a lo largo de toda la descripción y reivindicaciones, el término **sulfuro** se emplea en lugar de **azufre** lo cual no es técnicamente correcto.

La reivindicación 1 presenta defectos de redacción y/o traducción respecto del significado de Q, ya que no es claro lo que se quiere dar a entender con *un anillo condensado junto con dos anillos de carbonos de átomos de benceno* .

La reivindicación 5 no define realmente la composición puesto que la expresión "cantidad efectiva", resulta ambigua y le resta precisión a la reivindicación, además no se indican los demás componentes que hacen parte de la composición, por lo tanto se solicita indicar en forma precisa la proporción en que se encuentra el principio activo.

En la reivindicación 6 no se encuentra la relación entre los significados de Z y la estructura que se presenta en el folio 39 del anillo bencénico, además, cuando se presenta el significado de Q tampoco es claro, puesto que en primer lugar se debe referir es a **Q'** y en segundo lugar, dice que está representado por las fórmulas siguientes, las cuales no solamente está representada Q sino el anillo de benceno condensado por lo tanto se debe aclarar cuál es la parte de la estructura en la fórmula que verdaderamente corresponde a **Q'** ? .

En las reivindicaciones 7 y 8 de acuerdo a como están redactadas se entiende que hay un anillo Q5 y un anillo Q1, siendo el anillo Q5 sulfuro y el otro carbono, lo cual no es claro técnicamente.

Para mayor claridad se deben indicar los significados de los sustituyentes en la reivindicación 11.

La reivindicación 12 no es coherente con las reivindicaciones de las cuales depende ya que Y no es en ninguna de ellas hidrógeno.

Las reivindicaciones 17 y 18 no definen realmente la composición puesto que no se indica en forma precisa la proporción en la que se encuentra el principio activo, además no se indican los demás componentes que hacen parte de la composición.

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

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

202001

Examinador Técnico de Patentes

Santa Fe de Bogotá, D.C. 5 de mayo de 2000

2000-05-11
430

EXPEDIENTE 00-024215

AUTO 0965

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

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

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

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los 19 MAY 2000

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 11 MAY 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI _____ NO _____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA