



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

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21 EXPEDIENTE No. 03-67451

54 TÍTULO PIRROLCARBOXAMIDAS PARA USO COMO
FUNGICIDAS

51 CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL C07D 227/34 A01N 93/36

71 SOLICITANTE SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO Basel, Suiza

74 APODERADO Emilio Ferrero
Código No. 1092

22 BOGOTÁ, D. C., 20099

PETITORIO

03 067451 00

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radiación 03067451 00000000 Folios: 114 ón
Fecha (MM) 2003-08-06 17 01 49
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NDCI 411 PRESENTAC
Dependencia 2030 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 SOLICITUD DE			
☒ Patente de Invención		☐ Patente de Modelo de Utilidad	
☐ Capítulo I		☒ Capítulo II	
2 SOLICITANTE (71)	Nombre SYNGENTA PARTICIPATIONS AG sociedad constituida y existente bajo las leyes de Suiza Dirección Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basilea Suiza Domicilio Basilea, Suiza	IDENTIFICACION C C ☐ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Cual _____ Numero _____	
3 REPRESENTANTE O APODERADO	Nombre EMILIO FERRERO Dirección Carrera 4ª No 72-35 Teléfono 347 36 11 Fax 217 92 11 E-mail clientes@camyp.com Domicilio Bogotá, Colombia	IDENTIFICACION C C ☒ NIT ☐ C E ☐ Otro ☐ Cual _____ Numero 438 019 T P. 31 929	
4 INVENTOR (ES) (72)	Harald WALTER Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basilea, Suiza		
5 PCT (88) Solicitud Internacional No <u>PCT/EP02/01344</u> Fecha <u>8 de febrero de 2002</u> Publicación Internacional No <u>WO 02/064562 A1</u> Fecha <u>22 de agosto de 2002</u>			
6	TITULO PIRROLCARBOXAMIDAS PARA USO COMO FUNGICIDAS		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 207/34</u> <i>A O I N 43/36</i>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>GB</u>	(32) Fecha <u>9 de febrero de 2001</u>
		(31) Número de Solicitud <u>0103258 0</u>	

9

Comprobante de pago No 03 - 52 533 Fecha, 28 de julio de 2003

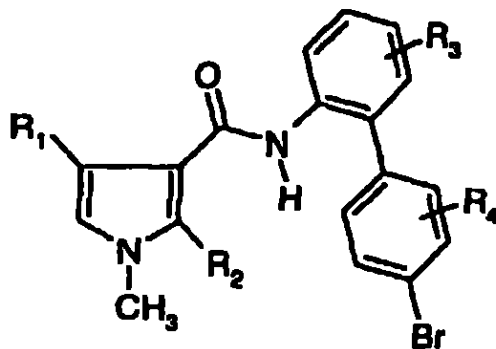
10

Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 400 000 oo
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad
- ☒ Documento que acredita la 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 efectuado por la IPEA
- ☒ Traducción del examen preliminar 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
- ☐ Otros

11

FIGURA CARACTERISTICA.



(I)

12

Solicito la concesión de la patente

NOMBRE EMILIO FERRERO

FIRMA 
C C 438 019 de Usaquén T P 31 929

2012

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



INTERNATIONAL PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(43) International Publication Date
22 August 2002 (22 08 2002)

PCT

(10) International Publication Number
WO 02/064562 A1

(51) International Patent Classification⁷ C07D 207/34
A01N 43/36

(21) International Application Number PCT/EP02/01344

(22) International Filing Date 8 February 2002 (08 02 2002)

(25) Filing Language English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data
0103258.0 9 February 2001 (09 02 2001) GB

(71) Applicant (for all designated States except US) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH] Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basel (CH).

(72) Inventor, and
(75) Inventor/Applicant (for US only) WALTER, Harald [CH/CH] Syngenta Crop Protection AG Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basel (CH).

(74) Agent BASTIAN, Werner Syngenta Participations AG Intellectual Property PO Box, CH-4002 Basel (CH)

(81) Designated States (national) AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, 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, NO, NZ, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW

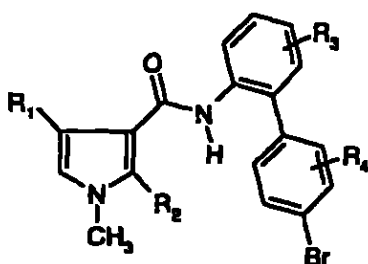
(84) Designated States (regional) ARIPO patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published

- with international search report
- before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments

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 PYRROLECARBOXAMIDES FOR THE USE AS FUNGICIDES



(1)

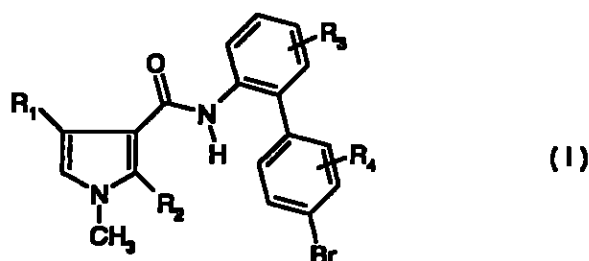
(57) Abstract The invention concerns novel pyrrolocarboxamide of formula (I) wherein R₁ is CF₃, CF₂H or CFH₂, R₂ is hydrogen or fluoro, R₃ is hydrogen or fluoro; and R₄ is hydrogen, fluoro, chloro, bromo, methyl, CF₃, OCF₃ or SCF₃. The compounds of formula (I) have plant-protective properties and are suitable for protecting plants against infestations by phytopathogenic microorganisms.

WO 02/064562 A1

PYRROLECARBOXAMIDES FOR THE USE AS FUNGICIDES

The present invention relates to novel pyrrolecarboxamides which have microbiocidal activity, in particular fungicidal activity. The invention also relates to the preparation of these substances, to agrochemical compositions which comprise at least one of the novel compounds as active ingredient, to the preparation of the compositions mentioned and to the use of the active ingredients or compositions in agriculture and horticulture for controlling or preventing infestation of plants by phytopathogenic microorganisms, preferably fungi.

The pyrrolecarboxamides of the present invention have the general formula I



wherein

R₁ is CF₃, CF₂H or CFH₂,

R₂ is hydrogen or fluoro,

R₃ is hydrogen or fluoro, and

R₄ is hydrogen, fluoro, chloro, bromo, methyl, CF₃, OCF₃ or SCF₃

Surprisingly, it has now been found that the compounds of formula I exhibit improved biological properties which render them more suitable for the practical use in agriculture and horticulture.

Where asymmetrical carbon atoms are present in the compounds of formula I, these compounds are in optically active form. The invention relates to the pure isomers, such as enantiomers and diastereomers, as well as to all possible mixtures of isomers, e.g. mixtures of diastereomers, racemates or mixture of racemates.

Preferred embodiments of compounds of formula I are those wherein

- 2 -

R_1 is CF_3 , CF_2H or CFH_2 , or

R_1 is CF_3 , or

R_2 is hydrogen or fluoro, or

R_2 is hydrogen, or

R_2 is fluoro, or

R_3 is hydrogen or fluoro, or

R_3 is hydrogen, or

R_3 is fluoro, or

R_4 is hydrogen, chloro, methyl, CF_3 or OCF_3 , or

R_4 is hydrogen or methyl, or

R_4 is hydrogen, or

R_2 , R_3 and R_4 are all hydrogen

Within the group of compounds of formula 1 those compounds are preferred wherein

R_1 is CF_3 , CF_2H or CFH_2 ,

R_2 is hydrogen or fluoro,

R_3 is hydrogen or fluoro, and

R_4 is hydrogen, chloro, methyl, CF_3 or OCF_3 (subgroup A)

Within the subgroup A are those compounds preferred wherein

R_1 is CF_3 , CF_2H or CFH_2 ,

R_2 is hydrogen,

R_3 is hydrogen or fluoro, and

R_4 is hydrogen, chloro, methyl, CF_3 or OCF_3 (subgroup A1)

Another group of compounds of formula 1 within the subgroup A are those wherein

R_1 is CF_3 , CF_2H or CFH_2 ,

R_2 is fluoro,

R_3 is hydrogen or fluoro, and

R_4 is hydrogen, chloro, methyl, CF_3 or OCF_3 (subgroup A2)

Among these subgroups, those compounds are preferred wherein R_2 , R_3 and R_4 are all hydrogen

Preferred individual compounds are

1-methyl-4-trifluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide,

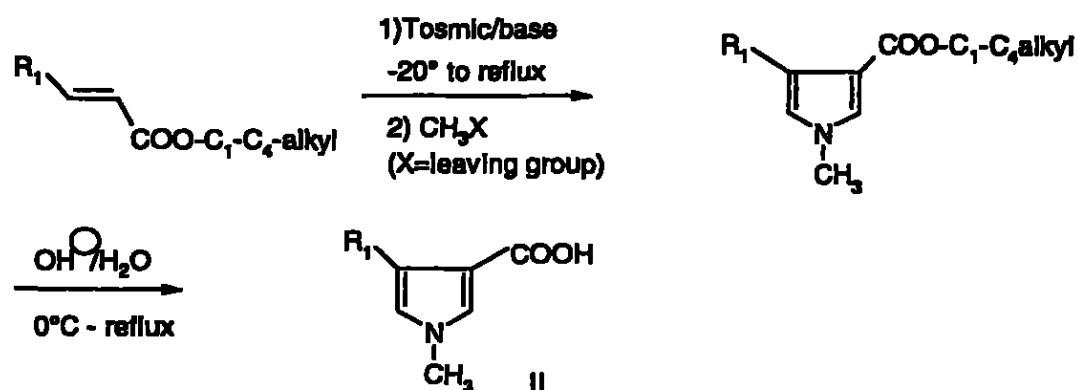
1-methyl-4-difluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide

The compounds according to formula I may be prepared according to the following reaction in schemes (Ac designates an acetyl group)

A) Synthesis of the pyrrole carboxylic acids

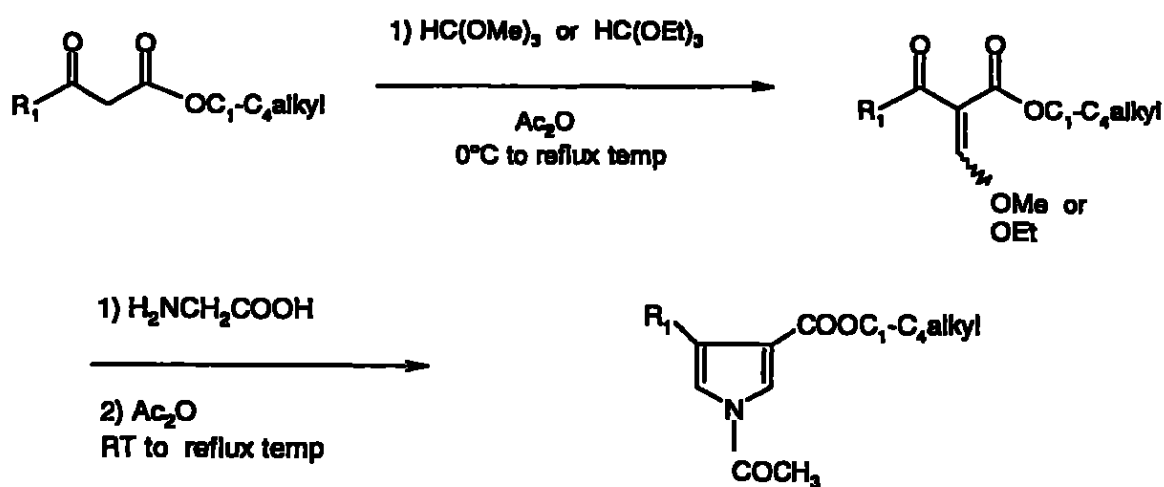
Route 1 (Tosmic-route)

Scheme 1

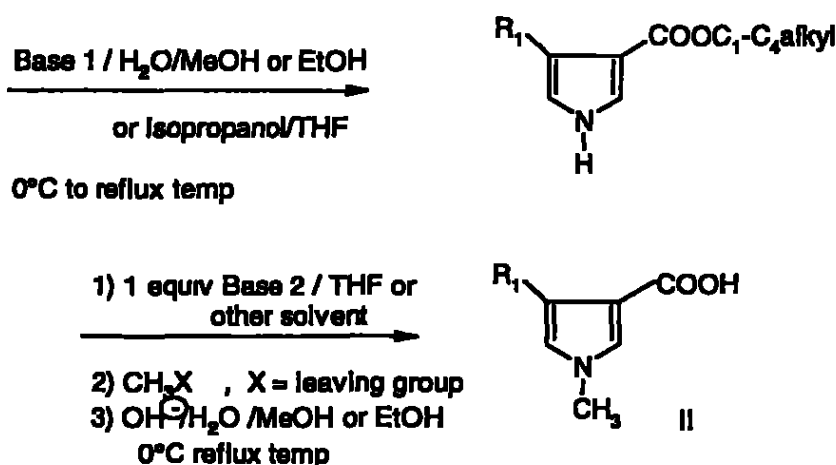


Route 2 (Trifluoroacetoacetic acid-route, analogous to JP-07157466)

Scheme 2



- 4 -



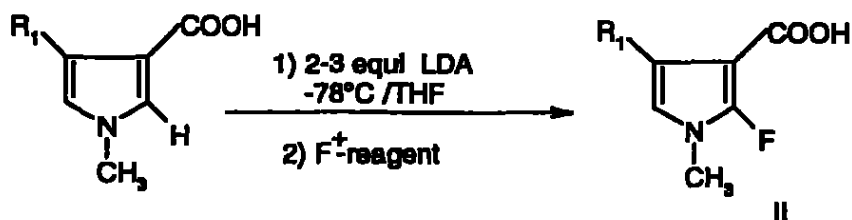
Base 1 = NaHCO_3 , Na_2CO_3 , KHCO_3 , K_2CO_3 , CaCO_3 and other bases

Base 2 = NaOH , KOH , NaH , KH , $n\text{-BuLi}$ and others

The synthesis of the pyrrole carboxylic acids of formula II wherein $\text{R}_2 = \text{H}$ is described in WO-00/09482

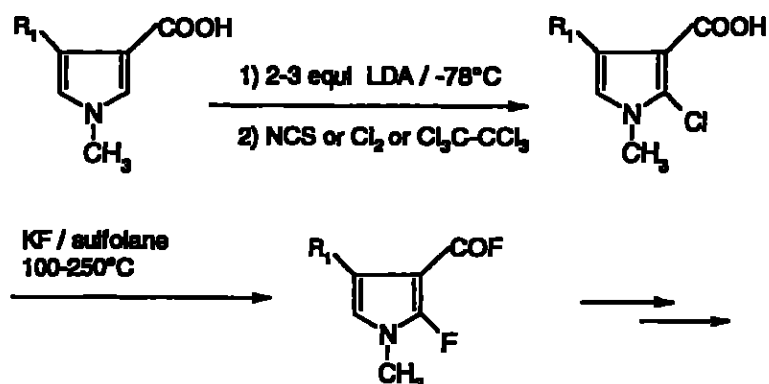
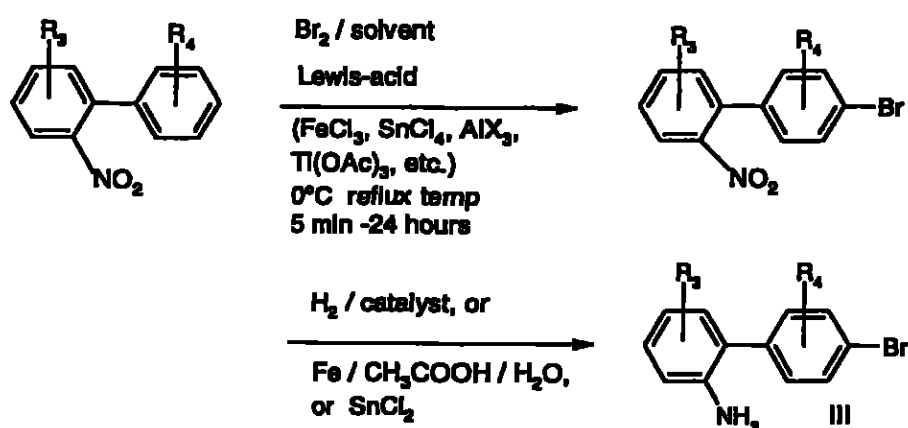
The synthesis of the pyrrole carboxylic acids of formula II wherein R_2 is fluoro may be conducted according to the Schemes 2A or 2B

Scheme 2A

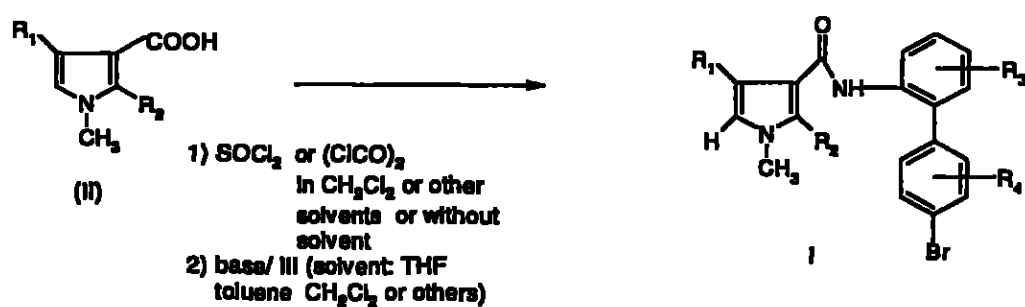


F^+ -reagents = N-fluoro-bis(phenylsulfonyl)amine, N-fluoro-N-methyl-toluene-4-sulfonamide, 2-fluoro-3,3-dimethyl-2,3-dihydro-1,2-benzisothiazole-1,1-dioxide, 1-fluoro-sym-collidinumtetrafluoroborate

LDA = Lithiumdiisopropylamide

Scheme 2B**B) synthesis of the amine III****Scheme 3**

(AlX₃ is preferably AlCl₃, solvent: water, DMF, THF, CH₂Cl₂, CHCl₃, ClCH₂CH₂Cl, etc.)

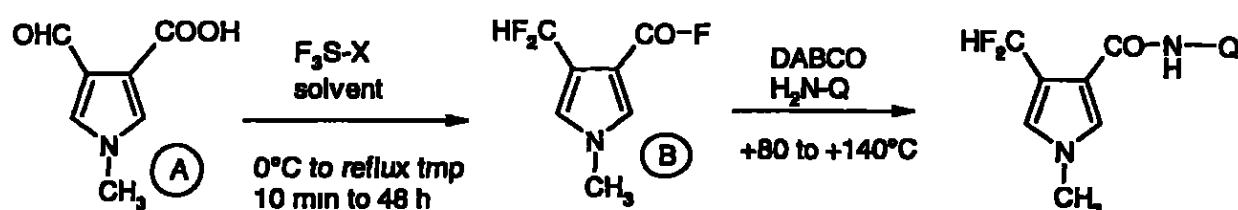
C) Synthesis of the amides**Scheme 4**

Base = N(C₂H₅)₃ Hünig-base Na₂CO₃ K₂CO₃ and others

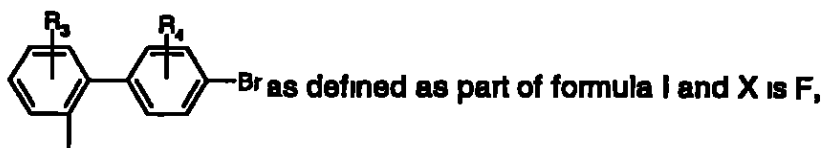
The pyrrole carboxylic acid II reacts with an activating agent such as thionyl chloride, phosphorous pentachloride or oxalic acid (or oxalyl) chloride in the presence of a solvent at a temperature between 0°C and reflux temperature and a reaction time of 30 minutes to 24 hours to give the corresponding acid chloride. Representative solvents are toluene, benzene, xylene, hexane, cyclohexane, chloroform or methylenechloride. The obtained acyl chloride are normally not isolated. The new carboxamides of formula I are preferably obtained by reacting the activated pyrrolecarboxylic acid with an aromatic amine of formula III in the presence of a solvent like toluene, benzene, xylene, hexane, cyclohexane, chloroform or methylenechloride and in the presence of an acid binding agent like triethylamine, Hünig base, sodium carbonate, potassium carbonate or sodium hydrogen carbonate at a temperature between 0°C and reflux temperature. Preferably the entire reaction sequence of scheme 4 is conducted as a single-vessel reaction.

The carboxylic acid fluoride intermediates of formula II wherein R₁ is CHF₂ may be obtained according to the following reaction route

Scheme 5



wherein Q is radical



-N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(CH₂CH₂OCH₃)₂ or The reagents F₃S-X are known,

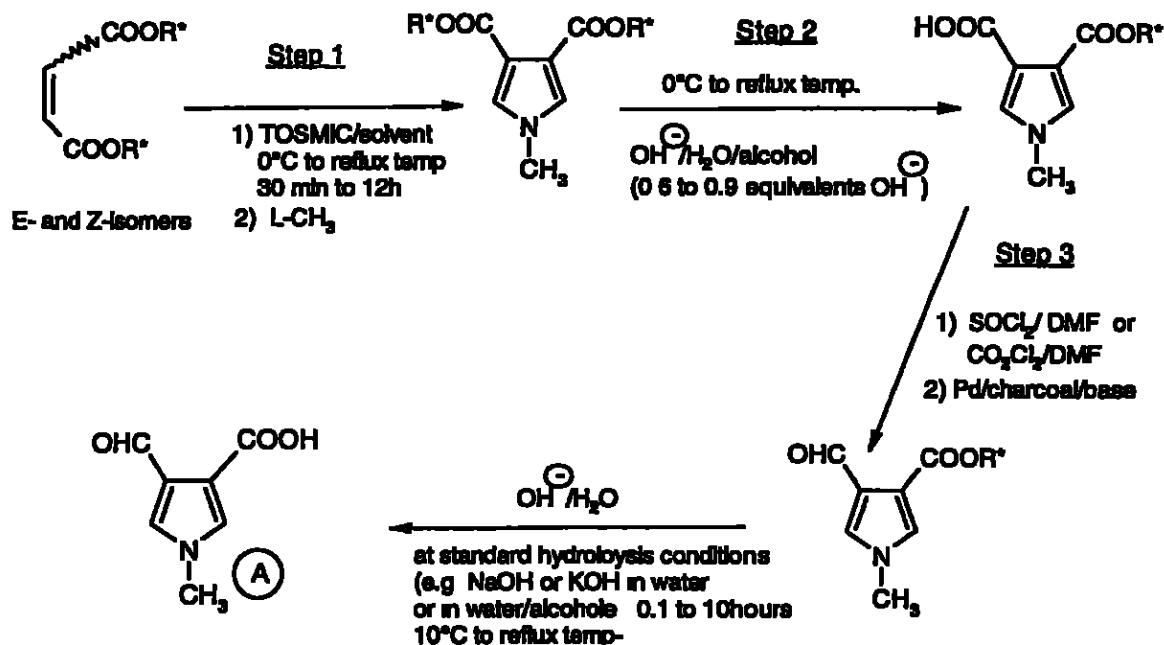
e.g. from J Org Chem, 1999, (64), 7048

The last reaction step of Scheme 5 comprises a coupling (amidation) reaction which is advantageously conducted in the presence of 1 to 2 equivalents of a sterically hindered base like DABCO (1,4-diazabicyclo[2.2.2]octane) in a few drops of acetonitrile as a contact medium, by heating the reaction mixture for 2 to 3 hours to a temperature of 80°C to 140°C.

until the reaction has taken place. After cooling routine work-up procedure yields the final product of formula I wherein R_1 is CHF_2 .

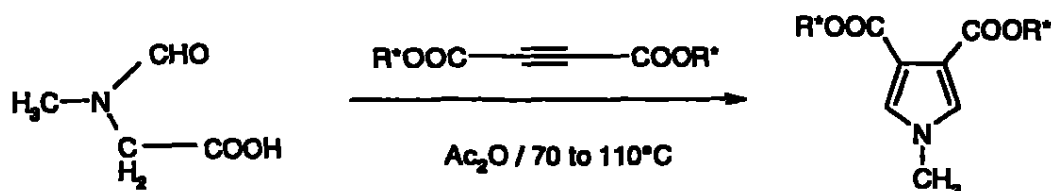
The compound B and the synthesis thereof has especially been created for the production of the active ingredients of the present invention, and therefore represent further features of this invention. Likewise the novel compound A and the preceding esters are part of this invention. Compound A may be obtained as follows:

Scheme 6.



wherein R^* is $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or $\text{Si}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl})_3$, and L is a leaving group like a halogen atom, -O-Tos, etc. Reaction Step 3 is a modified version of a Rosenmund reaction, which is not yet known in the art, and thus represents another feature of this invention. Specifics are reactant combinations SOCl_2/DMF or oxalic acid dichloride/DMF, DMF in catalytic amount, optional inert solvent, in the first step and in the second step reducing conditions like Pd on carbon at a temperature between 0°C and +10°C, preferably between 0°C and +5°C, and advantageously in the presence of tertiary amine, like e.g. a Hünig-base.

Alternatively, the 3,4-diester-1-methylpyrrole of Scheme 6 may be obtained according to R. K. Huisgen, US 3,285,931) as outlined in scheme 7.

Scheme 7

Surprisingly, it has now been found that the novel compounds of formula I have, for practical purposes, a very advantageous spectrum of activities for protecting plants against diseases that are caused by fungi as well as by bacteria and viruses

The compounds of formula I can be used in the agricultural sector and related fields of use as active ingredients for controlling plant pests. The novel compounds are distinguished by excellent activity at low rates of application, by being well tolerated by plants and by being environmentally safe. They have very useful curative, preventive and systemic properties and are used for protecting numerous cultivated plants. The compounds of formula I can be used to inhibit or destroy the pests that occur on plants or parts of plants (fruit, blossoms, leaves, stems, tubers, roots) of different crops of useful plants, while at the same time protecting also those parts of the plants that grow later e.g. from phytopathogenic micro-organisms.

It is also possible to use compounds of formula I as dressing agents for the treatment of plant propagation material, in particular of seeds (fruit, tubers, grains) and plant cuttings (e.g. rice), for the protection against fungal infections as well as against phytopathogenic fungi occurring in the soil.

The compounds I are, for example, effective against the phytopathogenic fungi of the following classes: Fungi imperfecti (e.g. Botrytis, Pyricularia, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora and Alternaria) and Basidiomycetes (e.g. Rhizoctonia, Hemileia, Puccinia). Additionally, they are also effective against the Ascomycetes classes (e.g. Venturia and Erysiphe, Podosphaera, Monilinia, Uncinula) and of the Oomycetes classes (e.g. Phytophthora, Pythium, Plasmopara). Outstanding activity has been observed against powdery mildew (Erysiphe spp.). Furthermore, the novel compounds of formula I are effective against phytopathogenic bacteria and viruses (e.g. against Xanthomonas spp., Pseudomonas spp., Erwinia amylovora as well as against the tobacco mosaic virus).

Within the scope of present invention, target crops to be protected typically comprise the following species of plants cereal (wheat, barley, rye, oat, rice, maize, sorghum and related species), beet (sugar beet and fodder beet), pomes, drupes and soft fruit (apples, pears, plums, peaches, almonds, cherries, strawberries, raspberries and blackberries), leguminous plants (beans, lentils, peas, soybeans), oil plants (rape, mustard, poppy, olives, sunflowers, coconut, castor oil plants, cocoa beans, groundnuts), cucumber plants (pumpkins, cucumbers, melons), fibre plants (cotton, flax, hemp, jute), citrus fruit (oranges, lemons, grapefruit, mandarins), vegetables (spinach, lettuce, asparagus, cabbages, carrots, onions, tomatoes, potatoes, paprika), lauraceae (avocado, cinnamomum, camphor) or plants such as tobacco, nuts, coffee, eggplants, sugar cane, tea, pepper, vines, hops, bananas and natural rubber plants, as well as ornamentals

The compounds of formula I are used in unmodified form or, preferably, together with the adjuvants conventionally employed in the art of formulation. To this end they are conveniently formulated in known manner to emulsifiable concentrates, coatable pastes, directly sprayable or dilutable solutions, dilute emulsions, wettable powders, soluble powders, dusts, granulates, and also encapsulations e.g. in polymeric substances. As with the type of the compositions, the methods of application, such as spraying, atomising, dusting, scattering, coating or pouring, are chosen in accordance with the intended objectives and the prevailing circumstances. The compositions may also contain further adjuvants such as stabilizers, antifoams, viscosity regulators, binders or tackifiers as well as fertilizers, micronutrient donors or other formulations for obtaining special effects.

Suitable carriers and adjuvants can be solid or liquid and are substances useful in formulation technology, e.g. natural or regenerated mineral substances, solvents, dispersants, wetting agents, tackifiers, thickeners, binders or fertilizers. Such carriers are for example described in WO 97/33890.

The compounds of formula I are normally used in the form of compositions and can be applied to the crop area or plant to be treated, simultaneously or in succession with further compounds. These further compounds can be e.g. fertilizers or micronutrient donors or other preparations which influence the growth of plants. They can also be selective herbicides as well as insecticides, fungicides, bactericides, nematocides, molluscicides or mixtures

of several of these preparations, if desired together with further carriers, surfactants or application promoting adjuvants customarily employed in the art of formulation

The compounds of formula I can be mixed with other fungicides, resulting in some cases in unexpected synergistic activities. Mixing components which are particularly preferred are azoles, such as azaconazole, BAY 14120, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, hexaconazole, imazalil, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, pefurazoate, penconazole, pyrnfenox, prochloraz, propiconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, tradimefon, triadimenol, trflumizole, triticonazole, pyrimidinyl carbinole, such as ancymidol, fenarimol, nuanmol, 2-amino-pyrimidines, such as bupinmate, dimethinmol, ethinmol, morpholines, such as dodamorph, fenpropidine, fenpropimorph, spiroxamine, indemorph, anilinopyrimidines, such as cyprodinil, mepanipynm, pyrimethanil, pyrroles, such as fenpiclonil, fludioxonil, phenylamides, such as benalaxyl, furalaxyl, metalaxyl, R-metalaxyl, ofurace, oxadixyl, benzimidazoles, such as benomyi, carbendazim, debacarb, fubendazole, thiabendazole, dicarboximides, such as chlozolate, dichlozoline, iprodione, myclozoline, procymidone, vinclozoline, carboxamides, such as carboxin, fenfuram, flutolanil, mepronil, oxycarboxin, thifluzamide, guanidines, such as guazatine, dodine, iminoctadine, strobilunnes, such as azoxystrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, SSF-129, trifloxystrobin, picoxystrobin, BAS 500F (proposed name pyraclostrobin), BAS 520, dithiocarbamates, such as ferbam, mancozeb, maneb, metram, propineb, thiram, zineb, ziram, N-halomethyltetrahydrophthalimides, such as captan, captan, dichlofluanid, fluoromides, folpet, tolyfluanid, Cu-compounds, such as Bordeaux mixture, copper hydroxide, copper oxychloride, copper sulfate, cuprous oxide, mancopper, oxine-copper, nitrophenol-derivatives, such as dinocap, nitrothal-isopropyl, organo-p-derivatives, such as edifenphos, iprobenphos, isoprothiolane, phosdiphen, pyrazophos, tolclofos-methyl, various others, such as acibenzolar-S-methyl, anilazine, benthiavalicarb, blastocidin-S, chinomethionate, chloroneb, chlorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dichlone, diclomezine, dicloran, diethofencarb, dimethomorph, SYP-LI90 (proposed name flumorph), dithianon, ethaboxam, etindiazole, famoxadone, fenamidone, fenoxanil, fentin, fenmzone, fluazinam, flusulfamide, fenhexamid, fosetyl-aluminium, hymexazol, iprovalicarb, IKF-916 (cyazofamid), kasugamycin, methasulfocarb, metrafenone, nicobifen, pencycuron, phthalide, polyoxins, probenazole, propamocarb, pyroquilon, quinoxifen, quintozone, sulfur, triazoxad, tricyclazole, triforine, validamycin, zoxamide (RH7281)

A preferred method of applying a compound of formula I, or an agrochemical composition which contains at least one of said compounds, is foliar application. The frequency of application and the rate of application will depend on the risk of infestation by the corresponding pathogen. However, the compounds of formula I can also penetrate the plant through the roots via the soil (systemic action) by drenching the locus of the plant with a liquid formulation, or by applying the compounds in solid form to the soil, e.g. in granular form (soil application). In crops of water rice such granulates can be applied to the flooded rice field. The compounds of formula I may also be applied to seeds (coating) by impregnating the seeds or tubers either with a liquid formulation of the fungicide or coating them with a solid formulation.

The formulation, i.e. the compositions containing the compound of formula I and, if desired, a solid or liquid adjuvant, are prepared in known manner, typically by intimately mixing and/or grinding the compound with extenders, e.g. solvents, solid carriers and, optionally, surface active compounds (surfactants).

The agrochemical formulations will usually contain from 0.1 to 99 % by weight, preferably from 0.1 to 95 % by weight, of the compound of formula I, 99.9 to 1 % by weight, preferably 99.8 to 5 % by weight, of a solid or liquid adjuvant, and from 0 to 25 % by weight, preferably from 0.1 to 25 % by weight, of a surfactant.

Advantageous rates of application are normally from 5 g to 2 kg of active ingredient (a.i.) per hectare (ha), preferably from 10 g to 1 kg a.i./ha, most preferably from 20 g to 600 g a.i./ha. When used as seed drenching agent, convenient dosages are from 10 mg to 1 g of active substance per kg of seeds.

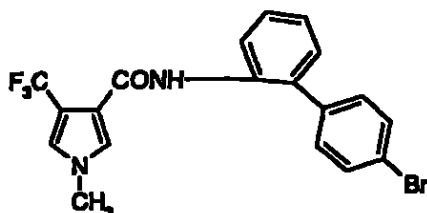
Whereas it is preferred to formulate commercial products as concentrates, the end user will normally use dilute formulations.

The following non-limiting Examples illustrate the above-described invention in more detail. Temperatures are given in degrees Celsius. The following abbreviations are used: m.p. = melting point; b.p. = boiling point. "NMR" means nuclear magnetic resonance.

spectrum MS stands for mass spectrum "%" is percent by weight, unless corresponding concentrations are indicated in other units

Example 1

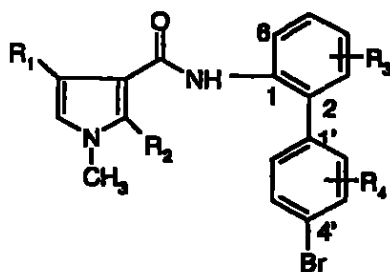
1-Methyl-4-trifluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide



A solution of 1-methyl-4-trifluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (0.42 g, 2.2 mmol) and oxalyl chloride (0.30 g, 2.4 mmol) in methylene chloride (20 ml) is stirred for 3 hours at room temperature in the presence of a catalytic amount of DMF. Then the resulting acid chloride solution is slowly added to a solution of 2-(4'-bromophenyl)aniline (0.55 g, 2.2 mmol) and triethylamine (0.33 g, 3.3 mmol) in 15 ml of methylene chloride. The resulting mixture is then stirred for 16 hours at room temperature. After the addition of ethylacetate, the organic phase is washed twice with water. After drying the organic phase over Na_2SO_4 , the solvent is removed in a water-jet-vacuum and the obtained crude product is finally purified by column chromatography (silica gel, eluant ethylacetate/hexane=1/2). 0.52 g of 1-methyl-4-trifluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide are obtained in the form of a yellow powder having a melting point of 163-164°C.

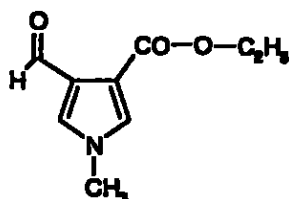
The following compounds of formula I are prepared in a similar way, using analogous methods.

Table 1

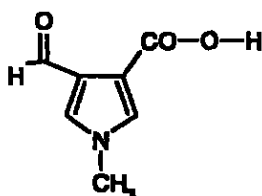


Compd No	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	phys data, m p °C
1.1	CF ₃	H	H	H	163-164
1.2	CF ₂ H	H	H	H	166-167

1 3	CFH ₂	H	H	H	
1 4	CF ₃	F	H	H	resin, M ^r =411
1 5	CF ₂ H	F	H	H	resin, M ^r =423
1 6	CFH ₂	F	H	H	
1 7	CF ₃	H	6-F	H	
1 8	CF ₂ H	H	6-F	H	
1 9	CF ₃	F	6-F	H	
1 10	CF ₂ H	F	6-F	H	

Example 2**4-Formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid ethylester**

A solution of 21.6 g (0.11 mol) 1-methyl-1H-pyrazole-3,4-dicarboxylic acid monoethylester and 14.9 g (0.117 mol) oxalyl chloride and 150 ml methylene chloride is stirred for 3 hours at room temperature in the presence of a catalytic amount of absolute DMF. After 3 hours the solvent is removed in a water jet vacuum and the crude acid chloride (21.5 g) is dissolved in 400 ml of dry tetrahydrofuran. After addition of 14.2 g (0.11 mol) of N,N-diisopropylethylamine (Hünig-base) the mixture is hydrogenated with hydrogen in the presence of 6.0 g 10% Pd/C at 0°-5°C for 5 1/2 hours. Then the catalyst is filtered off and the solvent removed in a water jet vacuum. The raw material is purified by flash-chromatography over silica gel (eluant: t-butylmethylether/hexane 1/5). Yield: 16 g 4-formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid ethylester in the form of a yellow powder; m.p. 75°-76°C.

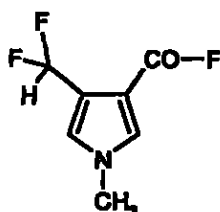
Example 3**4-Formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid**

To a solution of 4.6 g (0.0255 mol) 4-formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid ethylester and 90 ml of ethanol is added a solution of 2.1 g (0.031 mol) potassium hydroxide of 85% and 20 ml of water producing a slightly exothermic reaction. The resulting mixture is stirred

for 2 hours at +80°C and then the solvent mixture EtOH/H₂O is distilled off in vacuo. The resulting oil is dissolved in 100 ml of H₂O and washed twice with ethylacetate. Then 20 ml of 2N hydrogen chloride solution is added slowly to the water phase in the cold. The precipitated solid is filtered off and washed with water. After drying of the precipitate in a vacuum oven the pure acid is obtained. Yield 3.6 g of 4-formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid in the form of a slightly yellow powder; m.p. 178°-180°C.

Example 3

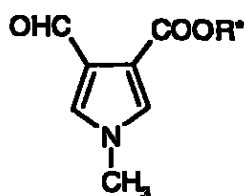
4-Difluoromethyl-1-methyl-1H-pyrrole-3-carbonyl fluoride



To a cooled solution of 2.6 g (0.017 mol) 4-formyl-1-methyl-1H-pyrrole-carboxylic acid and 70 ml methylene chloride is added a solution of 11.0 g (0.068 mol) diethylaminosulfurtrifluoride (DAST) and 10 ml methylene chloride in such a manner that the temperature remains constant at 0°C to +2°C. Then the mixture is stirred for 30 minutes at 0°C and 16 hours at room temperature. The reaction mixture is taken up in ethylacetate and washed twice with ice water and brine. After drying the solvent is removed in a water jet vacuum and the residue purified by flash chromatography over silica gel (eluant: hexane/ethylacetate 2:1). Yield 1.95 g 4-difluoromethyl-1-methyl-1H-pyrrole-3-carbonyl fluoride in the form of a brownish solid; m.p. 53°-54°C.

In a similar manner the intermediates of the general formula B of table 2 may be obtained.

Table 2



Compound No	R*	phys. Data (m.p. [°C])
1.1	CH ₃	
1.2	C ₂ H ₅	76-77

1 3	C_3H_7-n	
1 4	C_4H_9-n	
1 5	$C_8H_{13}-n$	
1 6	$Si(CH_3)_3$	

Formulation Examples for compounds of formula I

Working procedures for preparing formulations of the compounds of formula I such as Emulsifiable concentrates, Solutions, Granulates, Dusts and Wettable powders are described in WO 97/33890

Biological Examples Fungicidal actions

Example B-1. Action against *Puccinia recondita* / wheat (Brownrust on wheat)

1 week old wheat plants cv Arina are treated with the formulated test compound (0.02% active ingredient) in a spray chamber. One day after application wheat plants are inoculated by spraying a spore suspension (1×10^5 uredospores/ml) on the test plants. After an incubation period of 2 days at 20° C and 95% r.h. plants are kept in a greenhouse for 8 days at 20° C and 60% r.h. The disease incidence is assessed 10 days after inoculation.

Compounds of Table 1 show good activity in this test (< 20% infestation). Infestation is prevented virtually completely (0-5% infestation) with compounds 1.1, 1.2, 1.4 and 1.5.

Example B-2. Action against *Podosphaera leucotricha* / apple (Powdery mildew on apple)

5 week old apple seedlings cv McIntosh are treated with the formulated test compound (0.002% active ingredient) in a spray chamber. One day after application apple plants are inoculated by shaking plants infected with apple powdery mildew above the test plants. After an incubation period of 12 days at 22° C and 60% r.h. under a light regime of 14/10 h (light/dark) the disease incidence is assessed.

Compounds of Table 1 show good activity in this test. The compounds 1.1, 1.2, 1.4 and 1.5 exhibit strong efficacy (< 20% infestation).

Example B-3. Action against *Venturia inaequalis* / apple (Scab on apple)

4 week old apple seedlings cv McIntosh are treated with the formulated test compound (0.02% active ingredient) in a spray chamber. One day after application apple plants are inoculated by spraying a spore suspension (4×10^5 conidia/ml) on the test plants. After an incubation period of 4 days at 21° C and 95% r.h. the plants are placed for 4 days at 21° C and 60% r.h. in a greenhouse. After another 4 day incubation period at 21° C and 95% r.h. the disease incidence is assessed.

Compounds of Table 1 show good activity in this test. The compounds 1.1, 1.2, 1.4 and 1.5 exhibit strong efficacy (< 20% infestation).

Example B-4. Action against *Erysiphe graminis* / barley (Powdery mildew on barley)

1 week old barley plants cv Express are treated with the formulated test compound (0.02% active ingredient) in a spray chamber. One day after application barley plants are inoculated by shaking powdery mildew infected plants above the test plants. After an incubation period of 6 days at 20° C / 18° C (day/night) and 60% r.h. in a greenhouse the disease incidence is assessed.

Compounds of Table 1 show good activity in this test. The compounds 1.1, 1.2, 1.4 and 1.5 exhibit strong efficacy (< 20% infestation).

Example B-5. Action against *Botrytis cinerea* / apple (Botrytis on apple fruits)

In an apple fruit cv Golden Delicious 3 holes are drilled and each filled with 30 µl droplets of the formulated test compound (0.002% active ingredient). Two hours after application 50 µl of a spore suspension of *B. cinerea* (4×10^5 conidia/ml) are pipetted on the application sites. After an incubation period of 7 days at 22° C in a growth chamber the disease incidence is assessed.

Compounds of Table 1 show good activity in this test. The compounds 1.1, 1.2, 1.4 and 1.5 exhibit very strong efficacy (< 10% infestation).

Example B-6. Action against *Botrytis cinerea* / grape (Botrytis on grapes)

5 week old grape seedlings cv Gutedel are treated with the formulated test compound (0.002% active ingredient) in a spray chamber. Two days after application grape plants are inoculated by spraying a spore suspension (1×10^6 conidia/ml) on the test plants. After an

- 17 -

incubation period of 4 days at 21° C and 95% r h in a greenhouse the disease incidence is assessed

Compounds of Table 1 show good activity in this test The compounds 1 1, 1 2, 1 4 and 1 5 exhibit very strong efficacy (< 10% infestation)

Example B-7. Action against *Botrytis cinerea* / tomato (Botrytis on tomatoes)

4 week old tomato plants cv Roter Gnom are treated with the formulated test compound (0.002% active ingredient) in a spray chamber Two days after application tomato plants are inoculated by spraying a spore suspension (1×10^5 conidia/ml) on the test plants After an incubation period of 4 days at 20° C and 95% r h in a growth chamber the disease incidence is assessed

Compounds of Table 1 show good activity in this test The compounds 1 1, 1 2, 1 4 and 1 5 exhibit very strong efficacy (< 10% infestation)

Example B-8. Action against *Pyrenophora teres* / barley (Net blotch on barley)

1 week old barley plants cv Express are treated with the formulated test compound (0.002% active ingredient) in a spray chamber Two days after application barley plants are inoculated by spraying a spore suspension (3×10^4 conidia/ml) on the test plants After an incubation period of 2 days at 20° C and 95% r h plants are kept for 2 days at 20° C and 60% r h in a greenhouse The disease incidence is assessed 4 days after inoculation

Compounds of Table 1 show good activity in this test The compounds 1 1, 1 2, 1 4 and 1 5 exhibit strong efficacy (< 20% infestation)

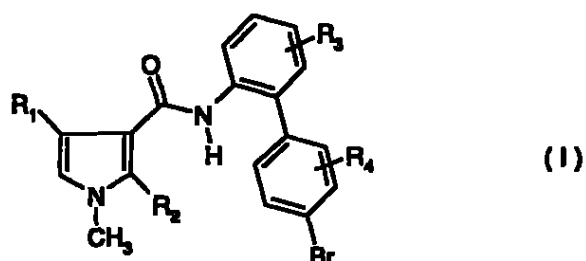
Example B-9. Action against *Septoria nodorum* / wheat (Septoria leaf spot on wheat)

1 week old wheat plants cv Anna are treated with the formulated test compound (0.02% active ingredient) in a spray chamber One day after application wheat plants are inoculated by spraying a spore suspension (5×10^5 conidia/ml) on the test plants After an incubation period of 1 day at 20° C and 95% r h plants are kept for 10 days at 20° C and 60% r h in a greenhouse The disease incidence is assessed 11 days after inoculation

Compounds of Table 1 show good activity in this test The compounds 1 1, 1 2, 1 4 and 1 5 exhibit strong efficacy (< 20% infestation)

What is claimed is

1 A pyrrolecarboxamide of formula I



wherein

R_1 is CF_3 , CF_2H or CFH_2 ,

R_2 is hydrogen or fluoro,

R_3 is hydrogen or fluoro, and

R_4 is hydrogen, fluoro, chloro, bromo, methyl, CF_3 , OCF_3 or SCF_3 .

2 A compound of formula I according to claim 1, wherein

R_4 is hydrogen, chloro, methyl, CF_3 or OCF_3

3 A compound of formula I according to claim 2, wherein

R_2 is hydrogen

4 A compound of formula I according to claim 2, wherein

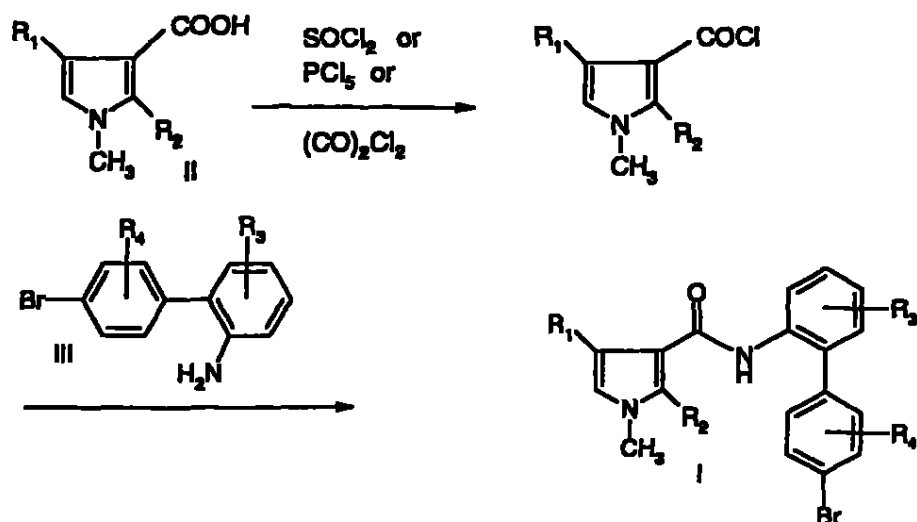
R_2 is fluoro

5 A compound of formula I according to claim 1 selected from the group comprising

1-methyl-4-trifluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide or

1-methyl-4-difluoromethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (4'-bromobiphenyl-2-yl) amide

6 A process for the preparation of compounds of formula I which comprises reacting the starting materials according to the scheme

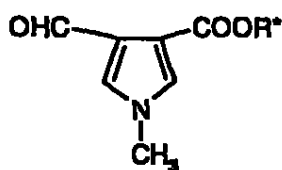


wherein R_1 , R_2 , R_3 and R_4 are as defined for formula I in claim 1

7 A composition for controlling microorganisms and preventing attack and infestation of plants therewith, wherein the active ingredient is a compound as claimed in claim 1 together with a suitable carrier

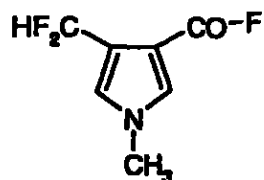
8 A method of controlling or preventing infestation of cultivated plants by phytopathogenic microorganisms by application of a compound of formula I as claimed in claim 1 to plants, to parts thereof or the locus thereof

9 A compound of the general formula

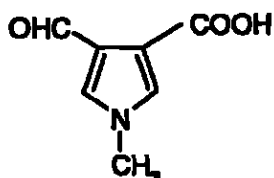


wherein R^* is hydrogen, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, or $\text{Si}(\text{C}_1\text{-C}_6\text{alkyl})_3$

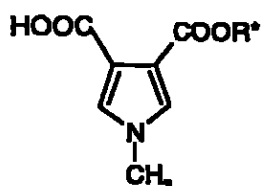
10 The compound of the formula



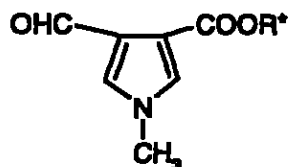
11 A process for the preparation of a compound of the formula



which process comprises reducing a compound of the formula



wherein R* is C₁-C₈alkyl, or Si(C₁-C₈alkyl)₃, in a two-step process by reacting it first with a halogenating agent selected from SOCl₂/ dimethylformamide and oxalic acid chloride/ dimethylformamide, and in a second step reducing the intermediate acid anhydride with palladium on carbon in the presence of a base, and hydrolyzing the resulting ester of the formula



wherein R* is C₁-C₈alkyl, or Si(C₁-C₈alkyl)₃ under alkaline conditions

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 02/01344

A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D207/34 A01N43/36

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 C07D A01N

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, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	WO 00 09482 A (NOVARTIS ERFINDE VERWALT GMBH, EBERLE MARTIN (CH), NOVARTIS AG (CH)) 24 February 2000 (2000-02-24) cited in the application example P1 table 1 examples 1 02, 1 03, table 12 claim 7, examples 2, 3 claims 1, 10-12	1-5, 7, 8
Y	WO 97 08148 A (BASF AG, EICKEN KARL (DE), RANG HARALD (DE), HARREUS ALBRECHT (DE)) 6 March 1997 (1997-03-06) example 1 182, table 1 examples 3 9, 3 10, 3 19, 3 20, table 3 claims 3-6	1-5, 7, 8
	-/-	

☒ 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
- & document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

10 June 2002

Date of mailing of the international search report

21/06/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. 5818 Patentplan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 851 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Seitner, I

INTERNATIONAL SEARCH REP RT

International Application No
PCT/EP 02/01344

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 219 756 A (CELAMERCK GMBH & CO KG) 29 April 1987 (1987-04-29) example 2, table C claims 7-9	1-5,7,8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/01344

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0009482	A	24-02-2000	
		AU 5513899 A	06-03-2000
		BR 9912962 A	08-05-2001
		CN 1311774 T	05-09-2001
		WO 0009482 A1	24-02-2000
		EP 1105375 A1	13-06-2001
		PL 345823 A1	14-01-2002
		TR 200100478 T2	21-06-2001
		US 2002019541 A1	14-02-2002
WO 9708148	A	06-03-1997	
		DE 19531813 A1	06-03-1997
		AU 6928596 A	19-03-1997
		WO 9708148 A1	06-03-1997
		EP 0847388 A1	17-06-1998
		JP 11511449 T	05-10-1999
		US 5998450 A	07-12-1999
EP 0219756	A	29-04-1987	
		DE 3536029 A1	09-04-1987
		DE 3541718 A1	27-05-1987
		DE 3615447 A1	12-11-1987
		AT 99682 T	15-01-1994
		AU 6360886 A	16-04-1987
		AU 654470 B2	10-11-1994
		AU 6599990 A	11-04-1991
		BR 8604917 A	07-07-1987
		CA 1290326 A1	08-10-1991
		CZ 8607259 A3	11-09-1996
		DD 258170 A5	13-07-1988
		DE 3689506 D1	17-02-1994
		DK 480286 A	10-04-1987
		EP 0219756 A1	29-04-1987
		ES 2061432 T3	16-12-1994
		FI 864062 A	10-04-1987
		HU 43997 A2	28-01-1988
		IE 63475 B	19-04-1995
		IL 80257 A	21-11-1991
		JP 2048027 C	25-04-1996
		JP 7072164 B	02-08-1995
		JP 62103051 A	13-05-1987
		KR 9409529 B1	14-10-1994
		NZ 217845 A	26-07-1990
		PT 83504 A , B	01-11-1986
		US 4910200 A	20-03-1990
		YU 172586 A1	31-10-1988
		ZA 8607662 A	29-06-1988

PATENT COOPERATION TREATY

WO 02/064562
PCT/EP02/01344

NO 28

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE
COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES12
To: 1102
BASTIAN, Werner
Syngenta Participations AG
Intellectual Property
P O Box
CH-4002 Basel
SUISSEINTELLECTUAL PROPERTY
R&T 8.0

(PCT Rule 47 1(c), first sentence)

30 Aug. 2002

Date of mailing (day/month/year) 22 August 2002 (22 08 02)	DATA ENTERED	APPL DATA INVOICE REG F&T C.C.
Applicant's or agent's file reference PF/5-50068A	DATE 18 SEP 2002 VISUM	IMPORTANT NOTICE
International application No PCT/EP02/01344	International filing date (day/month/year) 08 February 2002 (08 02 02)	Priority date (day/month/year) 09 February 2001 (09 02 01)
Applicant SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al		

- 1 Notice is hereby given that the International Bureau has communicated as provided in Article 20 the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this notice
KP, KR, US

In accordance with Rule 47 1(c) third sentence, those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s)

- 2 The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time

AE, AG, AL, AM, AP, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EA, EC, EE, EP, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OA, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW

The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49 1(a bis))

3. Enclosed with this notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on

22 August 2002 (22 08 02) under No. WO 02/064562

4. TIME LIMITS for filing a demand for international preliminary examination and for entry into national phase

The applicable time limit for entering the national phase will subject to what is said in the following paragraph be 30 MONTHS from the priority date not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of 18 months from the priority date but also in respect of any designated Office in the absence of filing of such demand where Article 22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of the designated Office. For further details see PCT Gazette No. 44/2001 of 1 November 2001 pages 19928, 19932 and 19934 as well as the PCT News letter October and November 2001 and February 2002 issues

In practice time limits other than the 30-month time limit will continue to apply for various periods of time in respect of certain designated or elected Offices. For regular updates on the applicable time limits (20, 21, 30 or 31 months or other time limit) Office by Office refer to the PCT Gazette, the PCT Newsletter and the PCT Applicant's Guide, Volume II National Chapters, all available from WIPO's Internet site at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>

For filing a demand for international preliminary examination, see the PCT Applicant's Guide, Volume I/A, Chapter IX. Only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II)

It is the applicant's sole responsibility to monitor all these limits.

The International Bureau of WIPO 34 chemin des Colombettes 1211 Geneva 20 Switzerland Facsimile No (41 22) 740.14.35	Authorized officer J Zahra Telephone No (41 22) 338 91 11
---	---

PATENT COOPERATION TREATY

29

PCT

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE

(PCT Rule 92bis 1 and
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To

WARD, Steven, Paul
Syngenta Limited
Intellectual Property Dept.
P O Box 3538
Bracknell, Berkshire RG42 6YA
United Kingdom

IPD ACPC TECHNICALS
MKO
- 0 1 1 0 2 0 2
642 6YA
FOLIO

Date of mailing (day/month/year) 15 November 2002 (15 11 02)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference PF/5-50068A	
International application No. PCT/EP02/01344	International filing date (day/month/year) 08 February 2002 (08 02 02)

1 The following indications appeared on record concerning

☐ the applicant ☐ the inventor ☒ the agent ☐ the common representative

Name and Address BASTIAN, Werner Syngenta Participations AG Intellectual Property P O Box CH-4002 Basel Switzerland	State of Nationality	State of Residence
	Telephone No. 41 61 323 11 11	
	Facsimile No. 41 61 323 50 44	
	Teleprinter No.	

2 The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning

☒ the person ☐ the name ☐ the address ☐ the nationality ☐ the residence

Name and Address WARD, Steven, Paul Syngenta Limited Intellectual Property Dept. P O Box 3538 Bracknell, Berkshire RG42 6YA United Kingdom	State of Nationality	State of Residence
	Telephone No. 01344 413720	
	Facsimile No. 01344 481112	
	Teleprinter No.	

3. Further observations if necessary

4. A copy of this notification has been sent to

☒ the receiving Office ☐ the designated Offices concerned
☐ the International Searching Authority ☒ the elected Offices concerned
☒ the International Preliminary Examining Authority ☐ other

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. (41-22) 740.14.35	Authorized officer Diana NISSEN (Fax 338 8970) Telephone No (41 22) 338.83.38
--	---

PATENT COOPERATION TREATY

30

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

INFORMATION CONCERNING ELECTED
OFFICES NOTIFIED OF THEIR ELECTION

(PCT Rule 61.3)

To

WARD, Steven, Paul
Syngenta Limited
Intellectual Property Dept.
P O Box 3538
Bracknell, Berkshire RG42 6YA
United Kingdom

Entered date

Date of mailing (day/month/year) *Under PCT procedure*
15 November 2002 (15 11 02)

Applicant's or agent's file reference
PF/5-50068A

IMPORTANT INFORMATION

International application No.
PCT/EP02/01344

International filing date (day/month/year)
08 February 2002 (08 02 02)

Priority date (day/month/year)
09 February 2001 (09 02.01)

Applicant

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al

- 1 The applicant is hereby informed that the International Bureau has, according to Article 31(7) notified each of the following Offices of its election

EP AT,BE,CH,CY,DE,DK,ES,FI,FR,GB,GR,IE,IT,LU,MC,NL,PT,SE,TR
National AU,BG,CA,CN,DE,GB,IL,JP,KP,KR,MN,NO,PL,RO,RU,SK,US

2. The following Offices have waived the requirement for the notification of their election the notification will be sent to them by the International Bureau only upon their request:

AP GH,GM,KE,LS,MW,MZ,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW
EA AM,AZ,BY,KG,KZ,MD,RU,TJ,TM
OA BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,ML,MR,NE,SN,TD,TG
National AE,AG,AL,AM,AT,AZ,BA,BB,BR,BY,BZ,CH,CO,CR,CU,CZ,DK,DM,DZ,EC,EE,
ES,FI,GD,GE,GH,GM,HR,HU,ID,IN,IS,KE,KG,KZ,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LV,MA,MD,MG,
MK,MW,MX,MZ,NZ,PH,PT,SD,SE,SG,SI,SL,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,UZ,VN,YU,ZA,
ZW

3. The applicant is reminded that he must enter the "national phase" before the expiration of 30 months from the priority date before each of the Offices listed above. This must be done by paying the national fee(s) and furnishing, if prescribed, a translation of the international application (Article 39(1)(a)) as well as, where applicable, by furnishing a translation of any annexes of the international preliminary examination report (Article 38(3)(b) and Rule 74.1).

Some offices have fixed time limits expiring later than the above-mentioned time limit. For detailed information about the applicable time limits and the acts to be performed upon entry into the national phase before a particular Office, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The entry into the European regional phase is postponed until 31 months from the priority date for all States designated for the purposes of obtaining a European patent.

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

Facsimile No. (41 22) 740 14.35

Authorized officer

Diana NISSEN (Fax 338 8970)

Telephone No. (41 22) 338.83.38

PATENT COOPERATION TREATY

3/
No 13966

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To

BASTIAN, Werner
Syngenta Participations AG
Intellectual Property
P O Box
CH-4002 Basel
SUISSE

Date of mailing (day/month/year) 10 June 2002 (10.06 02)	
Applicant's or agent's file reference PF/5-50058A	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP02/01344	International filing date (day/month/year) 08 February 2002 (08 02 02) ✓
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 08 February 2001 (08 02 01) ✓
Applicant SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al	

- 1 The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR" in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17 1(a) or (b).
- 2 This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
- 3 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). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17 1(c) 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.
- 4 The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17 1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17 1(c) 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.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
09 Febr 2001 (09 02 01) ✓	0103258 0 ✓	GB	29 Apr 2002 (29 04 02)

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Calandrettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Sun LEE
Facsimile No. (41-22) 740.14.35	Telephone No. (41-22) 338.83.38

Form PCT/IB/304 (July 1998)

004805283

PCT

REQUEST

The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty

For receiving Office use only

International Application No.

International Filing Date

Name of receiving Office and "PCT International Application"

Applicant's or agent's file reference PF/5 -50068A
(if desired) (12 characters maximum)

Box No. I TITLE OF INVENTION NOVEL PYRROLECARBOXAMIDES	
Box No. II APPLICANT ☐ This person is also inventor	
Name and address: (Family name followed by given name for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.) Syngenta Participations AG Schwarzwaldallee 215 4058 Basel CH	
Telephone No. +41 61 323 11 11	
Facsimile No. +41 61 323 50 44	
Teleprinter No.	
Applicant's registration No. with the Office	
State (that is, country) of nationality CH	State (that is, country) of residence: CH
This person is applicant for the purposes of ☐ all designated States ☒ all designated States except the United States of America ☐ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)	
Name and address: (Family name followed by given name for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.) WALTER, Harald Syngenta Crop Protection AG Schwarzwaldallee 215 4058 Basel CH	
This person is ☐ applicant only ☒ applicant and inventor ☐ inventor only (If this check box is marked, do not fill in below.)	
Applicant's registration No. with the Office	
State (that is, country) of nationality CH	State (that is, country) of residence: CH
This person is applicant for the purposes of ☐ all designated States ☐ all designated States except the United States of America ☒ the United States of America only ☐ the States indicated in the Supplemental Box	
☒ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on a continuation sheet.	
Box No. IV 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 ☐ common representative	
Name and address: (Family name followed by given name, for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.) BASTIAN, Werner c/o Syngenta Participations AG Intellectual Property P O Box CH-4002 Basel Switzerland	
Telephone No. +41 61 323 11 11	
Facsimile No. +41 61 323 50 44	
Teleprinter No.	
☐ Address for correspondence Mark this check box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent	

Box No.V DESIGNATION OF STATES mark the applicable check-boxes below at least one must be marked.

The following designations are hereby made under Rule 4 9(a)

Regional Patent

- ☒ AP ARIPO Patent. GH Ghana GM Gambia, KE Kenya LS Lesotho, MW Malawi MZ Mozambique, SD Sudan, SL Sierra Leone, SZ Swaziland, TZ United Republic of Tanzania, UG Uganda, ZW Zimbabwe, and any other State which is a Contracting State of the Harare Protocol and of the PCT
- ☒ EA Eurasian Patent AM Armenia AZ Azerbaijan, BY Belarus KG Kyrgyzstan KZ Kazakhstan, MD Republic of Moldova, RU Russian Federation, TJ Tajikistan, TM Turkmenistan, and any other State which is a Contracting State of the Eurasian Patent Convention and of the PCT
- ☒ EP European Patent. AT Austria BE Belgium, CH and LI Switzerland and Liechtenstein, CY Cyprus, DE Germany DK Denmark ES Spain, FI Finland, FR France, GB United Kingdom GR Greece, IE Ireland, IT Italy LU Luxembourg, MC Monaco, NL Netherlands, PT Portugal, SE Sweden, TR Turkey and any other State which is a Contracting State of the European Patent Convention and of the PCT
- ☒ OA OAPI Patent BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Central African Republic, CG Congo, CI Côte d'Ivoire, CM Cameroon, GA Gabon, GN Guinea, GW Guinea-Bissau ML Mali, MR Mauritania, NE Niger SN Senegal TD Chad, TG Togo, and any other State which is a member State of OAPI and a Contracting State of the PCT (If other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line).....

National Patent (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line).

- | | | |
|---|--|--|
| ☒ AE United Arab Emirates | ☒ GE Georgia | ☒ MW Malawi |
| ☒ AG Antigua and Barbuda | ☒ GH Ghana | ☒ MX Mexico |
| ☒ AL Albania | ☒ GM Gambia | ☒ MZ Mozambique |
| ☒ AM Armenia | ☒ HR Croatia | ☒ NO Norway |
| ☒ AT Austria | ☒ HU Hungary | ☒ NZ New Zealand |
| ☒ AU Australia | ☒ ID Indonesia | ☒ PL Poland |
| ☒ AZ Azerbaijan | ☒ IL Israel | ☒ PT Portugal |
| ☒ BA Bosnia and Herzegovina | ☒ IN India | ☒ RO Romania |
| | ☒ IS Iceland | ☒ RU Russian Federation |
| ☒ BB Barbados | ☒ JP Japan | |
| ☒ BG Bulgaria | ☒ KE Kenya | ☒ SD Sudan |
| ☒ BR Brazil | ☒ KG Kyrgyzstan | ☒ SE Sweden |
| ☒ BY Belarus | ☒ KP Democratic People's Republic of Korea | ☒ SG Singapore |
| ☒ BZ Belize | ☒ KR Republic of Korea | ☒ SI Slovenia |
| ☒ CA Canada | ☒ KZ Kazakhstan | ☒ SK Slovakia |
| ☒ CH & LI Switzerland and Liechtenstein | ☒ LC Saint Lucia | ☒ SL Sierra Leone |
| ☒ CN China | ☒ LK Sri Lanka | ☒ TJ Tajikistan |
| ☒ CO Colombia | ☒ LR Liberia | ☒ TM Turkmenistan |
| ☒ CR Costa Rica | ☒ LS Lesotho | ☒ TR Turkey |
| ☒ CU Cuba | ☒ LT Lithuania | ☒ TT Trinidad and Tobago |
| ☒ CZ Czech Republic | ☒ LU Luxembourg | |
| ☒ DE Germany | ☒ LV Latvia | ☒ TZ United Republic of Tanzania |
| ☒ DK Denmark | ☒ MA Morocco | ☒ UA Ukraine |
| ☒ DM Dominica | ☒ MD Republic of Moldova | ☒ UG Uganda |
| ☒ DZ Algeria | | ☒ US United States of America |
| ☒ EE Estonia | ☒ MG Madagascar | ☒ UZ Uzbekistan |
| ☒ ES Spain | ☒ MK The former Yugoslav Republic of Macedonia | ☒ VN Viet Nam |
| ☒ FI Finland | ☒ MN Mongolia | ☒ YU Yugoslavia |
| ☒ GB United Kingdom | | ☒ ZA South Africa |
| ☒ GD Grenada | | ☒ ZW Zimbabwe |

Check-box reserved for designating States which have become party to the PCT after issuance of this sheet.

- | | |
|---|---|
| ☒ EC Ecuador | ☒ TN Tunisia (from 10 th December 01) ☐ |
| ☒ PH Philippines (from 17 th August 01) ☐ | ☐ |

Precautionary Designation Statement In addition to the designations made above the applicant also makes under Rule 4 9(b) all other designations which would be permitted under the PCT except any designation(s) indicated in the Supplemental Box as being excluded from the scope of this statement. The applicant declares that those additional designations are subject to confirmation and that any designation which is not confirmed before the expiration of 15 months from the priority date is to be regarded as withdrawn by the applicant at the expiration of that time limit. (Confirmation (including fees) must reach the receiving Office within the 15-month time limit.)

Along Form PCT/RO/101

See Notes to the request form

Box No. VI PRIORITY CLAIM

The priority of the following earlier application(s) is hereby claimed.

Filing Date of earlier application (day/month/year)	Number of earlier application	Where earlier application is.		
		national application country	regional application * regional Office	international application receiving Office
item (1) 09 February 2001 (09 02 01)	0103258.0	GB		
item (2)				
item (3)				
item (4)				
item (5)				

☐ Further priority claims are indicated in the Supplemental Box

The receiving Office is requested to prepare and transmit to the International Bureau a certified copy of the earlier application(s) (only if the earlier application was filed with the Office which for the purposes of the present international application is the receiving Office) identified above as:

☐ all items ☐ item (1) ☐ item (2) ☐ item (3) ☐ item (4) ☐ item (5) ☐ other see Suppl. Box

* Where the earlier application is an ARIPO application, it is mandatory to indicate in the Supplemental Box at least one country party to the Paris Convention for the Protection of Industrial Property for which that earlier application was filed (Rule 4.10(b)(4)).

Box No. VII INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

Choice of International Searching Authority (ISA) (If two or more International Searching Authorities are competent to carry out the international search, indicate the Authority chosen, the two-letter code may be used).

ISA /

Request to use results of earlier search, reference to that search (if an earlier search has been carried out by or requested from the International Searching Authority).

Date (day/month/year)

Number

Country (or regional Office)

Box No. VIII DECLARATIONS

The following declarations are contained in Boxes Nos. VIII(i) to (v) (mark the applicable check-boxes below and indicate in the right column the number of each type of declaration):

Number of
declarations

- | | | | |
|--------------------------|--------------------|--|--|
| ☐ | Box No. VIII (i) | Declaration as to the identity of the inventor | |
| ☐ | Box No. VIII (ii) | Declaration as to the applicant's entitlement as at the international filing date, to apply for and being granted a patent | |
| ☐ | Box No. VIII (iii) | Declaration as to the applicant's entitlement as at the international filing date to claim the priority of the earlier application | |
| ☐ | Box No. VIII (iv) | Declaration of inventorship (only for the purposes of designation of the United States of America) | |
| ☐ | Box No. VIII (v) | Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty | |

Box No. IX CHECK LIST, LANGUAGE OF FILING		
Thus international application contains. (a) the following number of sheets in paper form request 4 description (excluding sequence listing part) 17 claims 3 abstract 1 drawings 0 Sub-total number of sheets 25 sequence listing part of description (actual number of sheets if filed in paper form, whether or not also filed in computer readable form. see (b) below) 0 Total number of sheets 25 (b) sequence listing part of description filed in computer readable form (i) ☐ only (under Section 801(a)(i)) (ii) ☐ in addition to being filed in paper form (under Section 801(a)(ii)) Type and number of carrier (diskette, CD-ROM, CD-R or other) on which the sequence listing part is contained (additional copies to be indicated under item 9(ii), in § right column).	Thus international application is accompanied by the following item(s) (mark the applicable check-boxes below and indicate in right column the number of each item): 1 ☒ fee calculation sheet 1 2 ☒ original separate power of attorney 1 3 ☐ original general power of attorney 4 ☒ copy of general power of attorney reference number if any AV 42789 1 5 ☐ statement explaining lack of signature 6 ☒ priority document(s) identified in Box No VI as item(s) (1) will follow 1 7 ☐ translation of international application into (language) 8 ☐ separate indications concerning deposited microorganism or other biological material 9 ☐ sequence listing in computer readable form (indicate also type and number of carriers (diskette, CD-ROM CD-R or other)) (i) ☐ copy submitted for the purposes of international search under rule 13ter only (and not as part of the international application) (ii) ☐ (only where check-box (b)(i) or (b)(ii) is marked in left column) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under rule 13ter (iii) ☐ together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listing part mentioned in left column 10 ☐ other (specify)	Number of items
Figure of the drawings which should accompany the abstract. —	Language of filing of the international application: English	
Box No. X SIGNATURE OF APPLICANT OR AGENT		
Next to each signature indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the request) In the name of the applicants The representative  ZWICKL, Markus, AV 42789 28 01 2002		

For receiving Office use only	
1 Date of actual receipt of the purported international application.	2 Drawings: ☐ received ☐ not received.
3 Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application.	
4 Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2).	
5 International Searching Authority ISA/ (If two or more are competent)	6. ☐ Transmittal of search copy delayed until search fee is paid

For International Bureau use only
Date of receipt of the record copy by the International Bureau

Along Form PCT/RO/101

See Notes to the request form

PCT

FEE CALCULATION SHEET Annex to the Request

For receiving Office use only

Applicant's or agent's file reference PF/5 -50068A Applicant Syngenta Participations AG et al CALCULATION OF PRESCRIBED FEES 1 TRANSMITTAL FEE EUR 102 - T 2 SEARCH FEE EUR 945 - S <i>International search to be carried out by _____ (If two or more International Searching Authorities are competent in relation to the international application, indicate the name of the Authority which is chosen to carry out the international search)</i> 3 INTERNATIONAL FEE Basic Fee Where item (b) of Box No. IX applies, enter Sub-total number of sheets } 25 Where item (b) of Box No. IX does not apply enter Total number of sheets b1 first 30 sheets EUR 409 - b1 b2 0 x 9 - = EUR 0 - b2 <i>number of sheets in excess of 30 fee per sheet</i> b3 additional component (only if sequence listing part of description is filed as filed in computer readable form under Section 801(a)(i), or both in that form and on paper under Section 801(a)(ii)) 400 x 0 - = EUR 0 - b3 <i>fee per sheet</i> Add amounts entered at b1, b2 and b3 and enter total at B. EUR 409 - B Designation Fees The international application contains 89 designations 6 x 88 - = EUR 528 - D <i>number of designation fees payable (maximum 6) amount of designation fee</i> Add amounts entered at B and D and enter total at I. EUR 937 - I <i>(Applicants from certain States are entitled to a reduction of 75% of the international fee. Where the applicant is (or all applicants are) so entitled, the total to be entered at I is 25% of the sum of the amounts entered at B and D)</i> 4 FEE FOR PRIORITY DOCUMENT (if applicable) EUR 0 - P 5 TOTAL FEES PAYABLE Add amounts entered at T, S, I and P and enter total in the TOTAL box. EUR 1984 - TOTAL ☐ The designation fees are not paid at this time.	International application No. Date stamp of the receiving Office
MODE OF PAYMENT ☒ authorization to charge deposit account (see below) ☐ postal money order ☐ cash ☐ coupons ☐ cheque ☐ bank draft ☐ revenue stamps ☐ other (specify):	
AUTHORIZATION TO CHARGE (OR CREDIT) DEPOSIT ACCOUNT <i>(This mode of payment may not be available at all receiving Offices)</i> ☒ Authorization to charge the total fees indicated above. ☒ <i>(This check-box may be marked only if the conditions for deposit accounts of the Receiving Office so permit) Authorization to charge any deficiency or credit any overpayment in the total fees indicated above.</i> ☐ Authorization to charge the fee for priority document	
Receiving Office RO/ EP Deposit Account No. 2811 0232 Date (day/month/year) 28 01 2002 Name: Syngenta Crop Protection AG <i>J. Ceroni</i> Jocelyne Ceroni Signature Application Specialist <i>M. Simon</i> Martina Simon Application Specialist	

Along Form PCT/RO/101 (Annex)

See Notes to the fee calculation sheet

PATENT COOPERATION TREATY

HKD
32
NOTED in observation
2663
PCT 0V

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

12 JUN 2003	
Sub	CH
1	CH

To

WARD, Steven Paul
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG
Intellectual Property
P O Box
CH-4002 Basel
SUISSE

VERIFY

NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF
THE INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT
(PCT Rule 71.1)

Date of mailing
(day/month/year) 06 06 2003

Applicant's or agent's file reference
PF/5-50068A

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No
PCT/EP02/01344

International filing date (day/month/year)
08/02/2002

Priority date (day/month/year)
09/02/2001

Applicant
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al

- 1 The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary examination report 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 examination report. 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.

For the purpose of deciding whether the claimed invention is patentable or not, the elected Offices may apply criteria additional to or different from the criteria on which the international preliminary examination report is based (see Articles 27(5), 33(5)). Additional criteria may include e.g. exemptions from patentability and the requirements of enabling disclosure and of clarity and support of claims.

Name and mailing address of the IPEA/

 European Patent Office P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk Pays Bas
Tel +31 70 340 2040 Tlx 31 651 epo nl
Fax +31 70 340 3016

Authorized officer

Cardenas, C

Tel +31 70 340-3370



PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PF/5 50068A		FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No PCT/EP02/01344	International filing date (day/month/year) 08/02/2002	Priority date (day/month/year) 09/02/2001	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D207/34			
Applicant SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al			
1 This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36 2 This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet ☐ This report is also accompanied by ANNEXES i.e. sheets of the description claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70 16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT) These annexes consist of a total of sheets			
3 This report contains indications relating to the following items. - I ☒ Basis of the report - II ☐ Priority - III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty inventive step and industrial applicability - IV ☐ Lack of unity of invention - V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty inventive step or industrial applicability citations and explanations supporting such statement - VI ☐ Certain documents cited - VII ☐ Certain defects in the international application - VIII ☐ Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 12/08/2002		Date of completion of this report 06.08.2003	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority  European Patent Office P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk Pays Bas Tel. +31 70 340 2040 Tlx 31 651 epo nl Fax. +31 70 340 3016		Authorized officer Sertner, I Telephone No. +31 70 340 2388 	

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No PCT/EP02/01344

I Basis of the report

- 1 With regard to the elements of the international application (*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 since they do not contain amendments (Rules 70 16 and 70 17)*)

Description, pages

1-17 as originally filed

Claims, No

1-11 as originally filed

- 2 With regard to the language all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item

These elements were available or furnished to this Authority in the following language which is

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of the international search (under Rule 23 1(b))
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48 3(b))
- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55 2 and/or 55 3)

- 3 With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing

- ☐ contained in the international application in written form
- ☐ filed together with the international application in computer readable form
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished

- 4 The amendments have resulted in the cancellation of

- ☐ the description, pages
- ☐ the claims, Nos
- ☐ the drawings, sheets

- 5 ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed (Rule 70 2(c))

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No **PCT/EP02/01344**

(Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report)

6 Additional observations, if necessary

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	1-11
	No	Claims	
Inventive step (IS)	Yes	Claims	1-8
	No	Claims	9-11
Industrial applicability (IA)	Yes	Claims	1-11
	No	Claims	

**2 Citations and explanations
see separate sheet**

Re Item V

Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability, citations and explanations supporting such statement

Reference is made to the following document

D1 WO 00 09482 A (NOVARTIS ERFIND VERWALT GMBH ,EBERLE MARTIN (CH), NOVARTIS AG (CH)) 24 February 2000 (2000-02-24) cited in the application

Novelty and Inventive Step

Document D1, which is considered to represent the most relevant state of the art, discloses fungicidal compounds (cf examples 1 02 and 1 03, table 1, as well as claims 5-7, and 10-12) from which the subject-matter of the present claims 1-5 mainly differs in that the second phenyl ring of the biphenyl moiety is substituted by bromo in position 4, whereas D1 is claiming the corresponding halogen derivatives in general and is explicitly disclosing the chlorine and fluorine derivatives

The compounds of present claim 1 represent a novel selection of D1 and therefore, the subject matter of claims 1-11 is considered novel (Article 33(2) PCT)

The problem to be solved by the present invention may be regarded as the provision of further fungicidal compounds. The solution proposed in claim 1 and of the present application is considered as involving an inventive step (Article 33(3) PCT) for the following reason

The bromo-derivatives of the present application have been proven to be significantly more biologically active than the chlorine and fluorine derivatives of D1 which is regarded as an unexpected effect conferring inventiveness

The subject matter of claims 1-8 is therefore considered as inventive (Article 33(3) PCT)

However, the intermediate chemical products according to claims 9 and 10 as well as the process for their preparation according to claim 11 do not make any structural contribution to the final products of claim 1 i.e. they do not display the 4-bromo-biphenyl moiety which differentiates the compounds of claim 1 from the known compounds in the

92 +2

INTERNATIONAL PRELIMINARY

International application No PCT/EP02/01344

EXAMINATION REPORT - SEPARATE SHEET

prior art D1

Consequently, the subject matter of **claims 9-11** is not considered as involving an **inventive step**

Industrial Applicability

The compounds of the present application are useful as fungicides and are therefore considered as **industrially applicable (Article 33(4)PCT)**

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional No PCT/EP02/0134

Re Item V

Declaración motivada bajo el artículo 35(2) con respeto a novedad, nivel inventivo o aplicabilidad industrial, las citaciones y explicaciones ayudan a dicha declaración

Se hace referencia a los siguientes documentos

D1 WO 00 09482 A (NOVARTIS ERFIND VERWALT GMBH,
EBERLE MARTIN (CH), NOVARTIS AG (CH)) 24 de Febrero
2000 (2000-02-24) citado en la solicitud

Novedad y Nivel Inventivo

Documento D1, que se considera representa el más importante estado de la técnica, describe compuestos fungicidas (cf Ejemplos 1 02 y 1 03, tabla 1, así como también las reivindicaciones 5-7 y 10-12 de cual la materia de asunto de la presentes reivindicaciones 1-5 difiere principalmente en que el segundo anillo de fenilo de la porción bifenilo se sustituye por bromo en la posición 4, por lo tanto D1 está reivindicando los derivados de halógeno correspondientes en general y

explícitamente se describen los derivados de cloro y flúor

Los compuestos de la actual reivindicación 1 representa una selección novedosa de D1 y por lo tanto, la materia de asunto de la reivindicaciones 1-11 se considera novedosa (Artículo 32(2) PCT) El problema a ser resuelto por la presente invención puede ser considerado como la provisión de compuestos fungicidas adicionales La solución propuesta en la reivindicación 1 y de la presente solicitud se considera que implica un nivel inventivo (Artículo 33(3) PCT)

Los derivados -bromo de la presente solicitud han sido probados por ser activos biológicamente más significativamente que los derivados de cloro y el flúor de D1 que es considerado como un efecto inesperado que confiere inventiva

La materia de asunto de las reivindicaciones 1-8 se considera por lo tanto como inventivo (Artículo 33(3) PCT)

Sin embargo, los productos químicos intermedios de acuerdo con las reivindicaciones 9 y 10 así como también el proceso para su preparación de acuerdo a la reivindicación 11 que no hace ninguna contribución estructural de los productos finales de la reivindicación

1 es decir ellos no muestran la porción 4-bromo-bifenil que diferencia los compuestos de la reivindicación 1 de los compuestos conocidos en la técnica anterior D1

Consecuentemente, la materia de asunto de las reivindicaciones 9-11 no se consideran que implican un nivel inventivo

Aplicabilidad Industrial

Los compuestos de la presente solicitud son útiles como fungicidas y son por lo tanto considerados como aplicables industrialmente (Artículo 33(4) PCT)

REPORTE DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Solicitud Internacional No

PCT/EP 02/01344

A Clasificación de la materia de asunto

IPC 7 C07D207/34 A01N43/36

De acuerdo a la Clasificación de Patentes Internacional
(IPC) o a ambos, clasificación nacional e IPC

B CAMBIOS BUSCADOS

Documentación mínima buscada (sistema de clasificación
seguido por símbolos de clasificación)

ICP 7 C07D A01N

La documentación mínima buscada no es otra que la
documentación mínima para que el alcance de tales
documentos se incluya en los campos buscados

La base de datos electrónica consultada durante la
búsqueda internacional (nombre de la base de datos y,

donde la búsqueda práctica de los términos de búsqueda se utiliza)

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

C DOCUMENTOS CONSIDERADOS A SER IMPORTANTES

Categoría	Citación del documento, indicación, donde es apropiado, de los trámites importantes	Importancia de la reivindicación No
Y	WO 00 09482 A (NOVARTIS ERFINDE VERHALT GMBH, EBERLE MARTIN (CH), NOVARTIS AG (CH)) 24 February 2000 (2000-02-24) cited in the application example P1 table 1 examples 1 02, 1 03, table 12 claim 7, examples 2, 3 claims 1, 10-12	1-5, 7, 8
Y	WO 97 08148 A (BASF AG, EICKEN KARL (DE), RANG HARALD (DE), HARREUS ALBRECHT (DE)) 6 March 1997 (1997-03-06) example 1 182, table 1 examples 3 9, 3 10, 3 19, 3 20, table 3 claims 3-6	1-5, 7, 8
	-/-	

☐ documentos adicionales se listan a continuación de la casilla C

■ los miembros de las familias de patentes se listan en el anexo

° categorías espaciales de documentos citados

"A" documentos que definen el estado general de la técnica que no se considera de particular importancia

"E" documentos anticipados pero publicados o después de la fecha de presentación internacional

"L" documentos que pueden arrojar dudas sobre la prioridad de la(s) reivindicación(es) o que se citen para establecer la fecha de publicación de otra citación u otra razón especial (como se especifique)

"O" documento que se refiere a una descripción oral, uso, exhibición u otros medios

"P" Documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero después que la fecha de prioridad reivindicada

"T" documento posterior publicado después de la fecha de presentación internacional o fecha de prioridad y no en conflicto con la solicitud pero citado para entender el principio o teoría resaltada en la invención

"X" documento de particular importancia, la invención reivindicada no puede ser considerada novedosa o no puede ser considerada que implica un nivel inventivo cuando los documentos se toman solos

"Y" documento de particular importancia, la invención reivindicada no puede ser considerada que implica un nivel inventivo cuando el documento se combina con uno u otros más de tales documentos, tales como combinación que son obvias para un experto en la técnica

"&" documento medio de la misma familia de patente

Fecha de actual de terminación de la búsqueda internacional

10 junio 2002

fecha de correspondencia del reporte de búsqueda internacional

21/06/2002

Nombre y correspondencia del ISA

European Patent Office, P B 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk
Teléfono (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Oficial autorizado

Seitner, I

Solicitud Internacional No

PCT/EP 02/01344

C (Continuación) DOCUMENTOS CONSIDERADOS A SER
IMPORTANTES

Categoría	Citación del documento, indicación, donde es apropiado, de los trámites importantes	Importancia de la reivindicación No
Y	EP 0 219 756 A (CELANERCK GMBH & CO KG) 29 April 1987 (1987-04-29) example 2, table C claims 7-9	1-5,7,8

REPORTE DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Información sobre los miembros de familia de patentes

Solicitud Internacional No

PCT/EP 02/01344

WO 0009482	A	24-02-2000	AU	5513899 A	06-03-2000
			BR	9912962 A	08-05-2001
			CN	1311774 T	05-09-2001
			WO	0009482 A1	24-02-2000
			EP	1105375 A1	13-06-2001
			PL	345823 A1	14-01-2002
			TR	200100478 T2	21-06-2001
			US	2002019541 A1	14-02-2002
WO 9708148	A	06-03-1997	DE	19531813 A1	06-03-1997
			AU	6928596 A	19-03-1997
			WO	9708148 A1	06-03-1997
			EP	0847388 A1	17-06-1998
			JP	11511449 T	05-10-1999
			US	5998450 A	07-12-1999
EP 0219756	A	29-04-1987	DE	3536029 A1	09-04-1987
			DE	3541718 A1	27-05-1987
			DE	3615447 A1	12-11-1987
			AT	99682 T	15-01-1994
			AU	6360886 A	16-04-1987
			AU	654470 B2	10-11-1994
			AU	6599990 A	11-04-1991
			BR	8604917 A	07-07-1987
			CA	1290326 A1	08-10-1991
			CZ	8607259 A3	11-09-1996
			DD	258170 A5	13-07-1988
			DE	3689506 D1	17-02-1994
			DK	480286 A	10-04-1987
			EP	0219756 A1	29-04-1987
			ES	2061432 T3	16-12-1994
			FI	864062 A	10-04-1987
			HU	43997 A2	28-01-1988
			IE	63475 B	19-04-1995
			IL	80257 A	21-11-1991
			JP	2048027 C	25-04-1996
			JP	7072164 B	02-08-1995
			JP	62103051 A	13-05-1987
			KR	9409529 B1	14-10-1994
			NZ	217845 A	26-07-1990
			PT	83504 A , B	01-11-1986
			US	4910200 A	20-03-1990
			YU	172586 A1	31-10-1988
			ZA	8607662 A	29-06-1988

TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES
DE LA
AUTORIDAD EXAMINADORA PRELIMINAR INTERNACIONAL
A

WARD, Steven Paul
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG
Intellectual Property
P O Box
CH-4002 Basel
SUISSE

NOTIFICACION DE REMISIÓN DEL REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR
INTERNACIONAL

(Regla 71 1 PCT)

Fecha de correspondencia (día/mes/año)

06 06 2003

Archivo de referencia del agente o solicitante

PF/5-50068A

NOTIFICACIÓN IMPORTANTE

Solicitud internacional No

PCT/EP02/01344

Fecha de presentación internacional (día/mes/año)

08/02/2002

Fecha de prioridad (día/mes/año)

09/02/2001

Solicitante

SYNGETA PARTICIPATIONS AG et al

- 1 Por medio de la presente se notifica al solicitante que la Autoridad Examinadora Preliminar Internacional transmite junto con esto el reporte de examen preliminar internacional y sus anexos, si los hay, establecidos en la solicitud internacional
- 2 Una copia del reporte y sus anexos, si los hay, están siendo transmitidos a la Oficina Internacional para comunicación a todas las oficinas elegidas
- 3 Cuando se requiera por cualquiera de las oficinas seleccionadas, la Oficina Internacional preparara una traducción en ingles del reporte (pero no de ninguno anexo y transmitirá dicha traducción a aquellas oficinas
- 4 **ADVERTENCIA**

El solicitante debe entrar a la fase antes de que cada una de las oficinas seleccionadas para desempeñar ciertos actos (presentar traducciones y pagar tarifas nacionales) dentro de los treinta meses a partir de la fecha de prioridad (o después en algunas oficinas)

(artículo 39 (1)) (ver también la advertencia por la Oficina Internacional con la forma PCT/IB/301)

Cuando una traducción de la solicitud internacional se deba suministrar a una oficina seleccionada, dicha traducción debe contener una traducción de cualquier anexo al reporte de examen preliminar internacional. Es responsabilidad del solicitante preparar y suministrar dicha traducción a cada una de las oficinas seleccionadas concernientes.

Para detalles adicionales sobre los límites de tiempo aplicables y requerimientos de las oficinas seleccionadas, ver Volumen II de la guía del solicitante PCT.

Para el propósito de decidir si la invención reivindicada es patentable o no, las oficinas seleccionadas pueden aplicar criterios adicionales a o diferentes de los criterios sobre los cuales el reporte de examen preliminar internacional se basa (ver Artículos 27(5), 33(5)). Criterios adicionales pueden incluir por ejemplo excepciones de patentabilidad y los requerimientos de promulgar la

descripción y de claridad y apoyo de las
reivindicaciones

Nombre y dirección de correspondencia del IPEA/

European Patent Office-P B 5818 patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk- Pays Bas
Tel +31 70 340 - 2040 Tx 31 651 epo nl
Fax +31 70 340 - 3016

Oficial autorizado

Cardenas, C
Tel +31 70 340 - 3370

TRATADO DE COOPERACIÓN DE PATENTES**PCT****REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL**

(Artículo 36 y regla 70 PCT)

Archivo de referencia de agente o solicitante

PF/5-50068A

PARA ACCIÓN ADICIONAL

Ver notificación de remisión de reporte de examen
preliminar internacional (de PCT/IPEA/416)

Solicitud Internacional No

PCT/EP02/01344

Fecha de presentación internacional (día/mes/año)

08/02/2002

fecha de prioridad (día/mes/año)

09/02/2001

Clasificación de Patente Internacional (IPC) o
clasificación nacional e IPC

CO7D207/34

Solicitante

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al

- 1 Este examen de reporte preliminar internacional ha sido preparado por esta Autoridad Examinadora Preliminar Internacional y es remitida al solicitante de acuerdo con el artículo 36
- 2 Este REPORTE consiste de un total de 5 hojas incluyendo esta portada

☐ Este reporte también está acompañado por ANEXOS, por ejemplo hojas de la descripción, reivindicaciones y/o dibujos los cuales han sido corregidos y son la base para este reporte y/o las hojas que contienen las rectificaciones hechas antes por esta autoridad

Estos anexos consisten de un total de hojas

- 3 Este reporte contiene indicaciones relacionadas con los siguientes ítems

- I ☒ Base del reporte
- II ☐ Prioridad
- III ☐ Opinión de sin fundamento con respecto a novedad, nivel inventivo y aplicabilidad industrial
- IV ☐ Falta de unidad de invención
- V ☒ Declaración motivada bajo el artículo 35(2) con respecto a novedad, nivel inventivo o aplicabilidad

industrial, las citaciones y explicaciones ayudan a
dicha declaración

- VI ☐ Ciertos documentos citados
- VII ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional
- VII ☐ Ciertas observaciones sobre la solicitud
internacional

Fecha de sumisión de la demanda

12/08/2002

fecha de terminación del reporte

06 06 2003

Nombre y dirección de correspondencia de la autoridad
examinadora preliminar internacional

European Patent Office-P B 5818 patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk- Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx 31 651 epo nl
Fax +31 70 340 - 3016

Oficial autorizado

Seitner, I

Teléfono No +31 70 340 2389

REPORTE DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional No PCT/EP02/0134

I Bases del reporte

- 1 con respecto a los elementos de la solicitud internacional (reemplazo de las hojas que han sido suministradas a la oficina de recepción en respuesta a una invitación de acuerdo con el artículo 14 se refieren a en este reporte como "originalmente presentadas" y no son anexadas a este reporte ya que ellas no contienen correcciones (regla 70 16 y 70 17))

Descripción, paginas

1-17 como se presento originalmente

Reivindicaciones, No

1-11 como de presento originalmente

- 2 Con respecto al idioma, todos los elementos marcados anteriormente estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta autoridad en el idioma en el que la solicitud internacional fue presentada, a menos de que se indique lo contrario de acuerdo con este ítem

Estos elementos estuvieron disponibles o fueron suministrados a esta autoridad en el siguiente idioma , el cual es

- ☐ El idioma de una traducción suministrada para propósitos de búsqueda internacional (bajo la regla 23 1(b))
- ☐ El idioma de la publicación de la solicitud internacional (de acuerdo con la regla 48 3(b))
- ☐ El idioma de traducción suministrado para propósitos de examen preliminar internacional (de acuerdo con la regla 55 2 y/o 55 3)

3 Con respecto cualquier **secuencia de ácido amino y/o nucleótido** descrito en la solicitud internacional, el examen preliminar internacional se llevo a cabo sobre la base de la lista de secuencia

- ☐ Contenida en la solicitud internacional en forma escrita
- ☐ Presentada junto con la solicitud internacional en forma legible por computador
- ☐ Suministrada subsecuentemente a esta autoridad en forma escrita

- ☐ Suministrada subsecuentemente a esta autoridad en forma escrita forma legible por computador
- ☐ La declaración de que el listado de secuencias escrito suministrado subsecuentemente no va más allá de la descripción en la solicitud internacional como se presento ha sido suministrada
- ☐ La declaración de que la información registrada en forma legible por computador es idéntica al listado de secuencias escrito que se ha suministrado
- 4 Las correcciones han resultado en la cancelación de
- ☐ La descripción, páginas
- ☐ Los reivindicaciones, Nos
- ☐ Los dibujos, hojas
- 5 ☐ Este reporte ha sido establecido como si (algunas de) las correcciones no hubieran sido hechas, ya que ellas se han considerado que van más allá de la descripción como se presentó (regla 70 2(c))

(Cualquier hoja de reemplazo que contenga tales correcciones debe ser referida bajo el item 1, y anexada a este reporte

6 Observaciones adicionales, si es necesario

V Declaración motivada bajo el artículo 35(2) con respecto a novedad, nivel inventivo o aplicabilidad industrial, las citaciones y explicaciones ayudan a dicha declaración

1 Declaración

Novedad (N)	si reivindicaciones 1-11
	No reivindicaciones
Nivel inventivo (IS)	si reivindicaciones 1-8
	No reivindicaciones 9-11
Aplicabilidad industrial (IA)	
	Si reivindicaciones 1-11
	No reivindicaciones

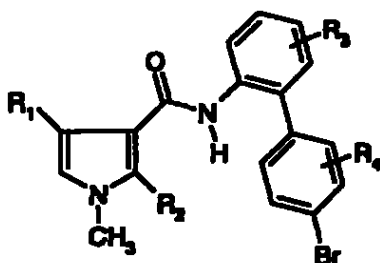
2 Citaciones y explicaciones

Ver hoja independiente

PIRROL-CARBOXAMIDAS PARA USO COMO FUNGICIDAS

La presente invención se relaciona con pirrolcarboxamidas novedosas las cuales tienen actividad microbici-da, en particular actividad fungici-da La invención también se relaciona con la preparación de estas sustancias, con composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los compuestos novedosos como ingrediente activo, con la preparación de las composiciones mencionadas y con el uso de los ingredientes o composiciones activos en agricultura y horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos, preferiblemente hongos

Las pirrolcarboxamidas de la presente invención tienen la fórmula general I



(I)

En donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_2 es hidrógeno o flúor,

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_4 es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, CF_3 ,

OCF_3 o SCF_3

Sorprendentemente, se ha encontrado que los compuestos de fórmula I exhiben propiedades biológicas mejoradas que los hacen más adecuados para el uso practico en agricultura y horticultura

Cuando los átomos de carbono asimétricos están presentes en los compuestos de fórmula I, estos compuestos están en forma óptimamente activa La invención se relaciona con isómeros puros, tales como enantiómeros y diastereómeros, así como también todas las mezclas posibles de isómeros, por ejemplo, mezclas de diastereómeros, racematos o mezclas de racematos

Las modalidades preferidas de los compuestos de fórmula I son aquellas en donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_1 es CF_3 , o

R_2 es hidrógeno o flúor, o

R_2 es hidrógeno, o

R_2 es flúor, o

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_3 es hidrógeno, o

R_3 es flúor, o

R_4 es hidrógeno, cloro, metilo, CF_3 u OCF_3 , o

R_4 es hidrógeno o metilo, o

R_4 es hidrógeno, o

R_2 , R_3 y R_4 son todos hidrógeno

Dentro del grupo de compuestos de la fórmula I
aquellos compuestos son preferidos en donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_2 es hidrógeno o flúor,

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_4 es hidrógeno, cloro, metilo, CF_3 u OCF_3 (subgrupo

A)

Dentro del subgrupo A están aquellos compuestos
preferidos en donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_2 es hidrógeno,

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_4 es hidrógeno, cloro, metilo, CF_3 u OCF_3 (subgrupo A1)

Otro grupo de compuestos de la fórmula I dentro del subgrupo A son aquellos en donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_2 es flúor,

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_4 es hidrógeno, cloro, metilo, CF_3 u OCF_3 (subgrupo A2)

Entre estos subgrupos, aquellos compuestos son preferidos en donde R_2 , R_3 y R_4 son todos hidrógeno

Los compuestos individuales preferidos son

(4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-trifluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico,

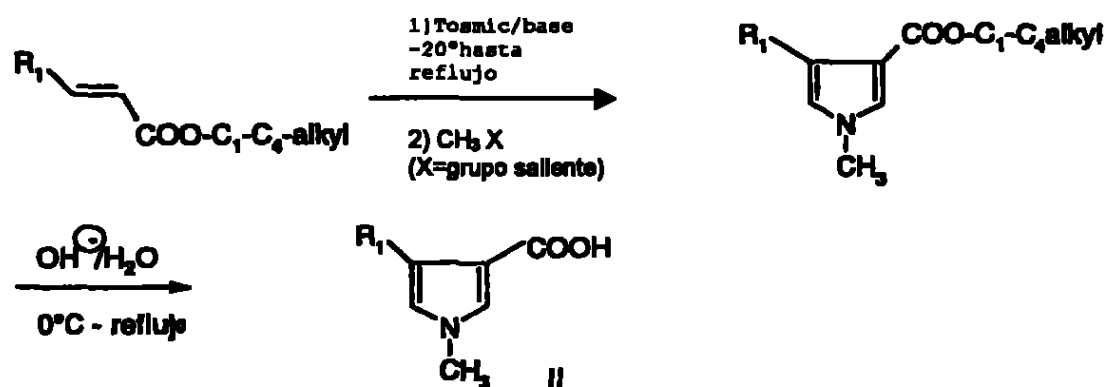
(4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-difluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico

Los compuestos de acuerdo con la fórmula I se pueden preparar de acuerdo con la siguiente reacción en esquema (Ac designa un grupo acetilo)

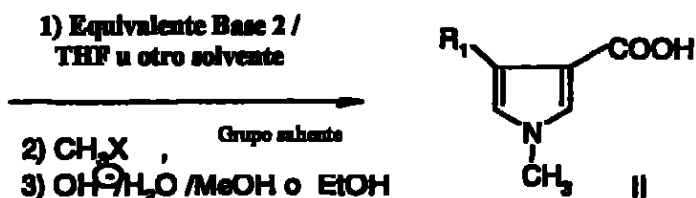
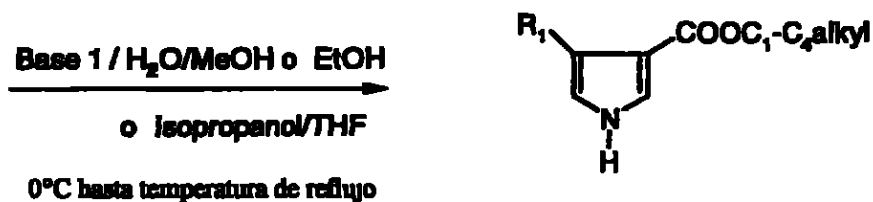
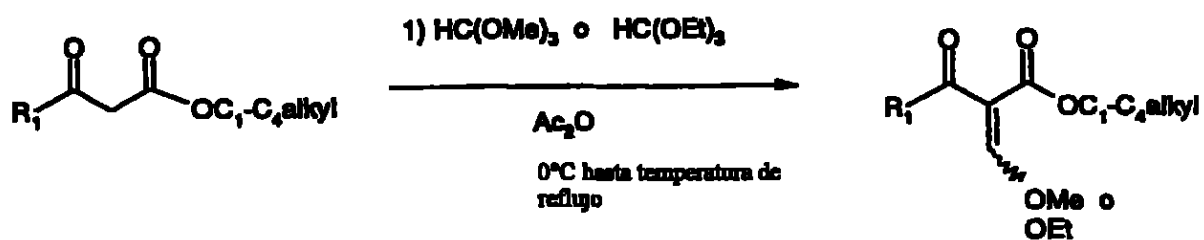
A) síntesis de los ácidos pirrolo carboxílicos

Ruta 1 (ruta Tosmic)

Esquema 1



Ruta 2 (ruta de ácido Trifluoracético, análogos a la JP-07157466)

Esquema 2

0°C temperatura de reflujo

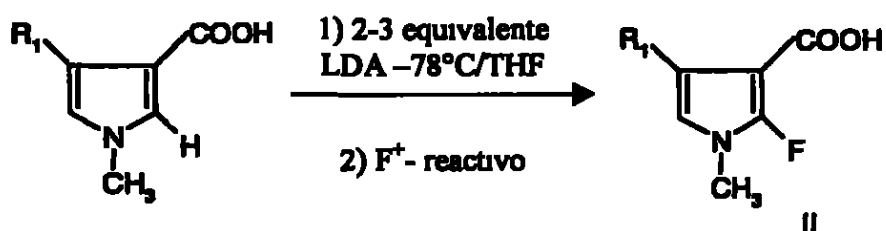
Base 1 = $NaHCO_3$, Na_2CO_3 , $KHCO_3$, $CaCO_3$ y otras bases

Base 2 = $NaOH$, KOH , NaH , KH , $n\text{-BuLi}$ y otros

La síntesis de los ácidos pirrolocarboxílicos de la fórmula II en donde $R_2 = H$ se describe en WO-00/09482

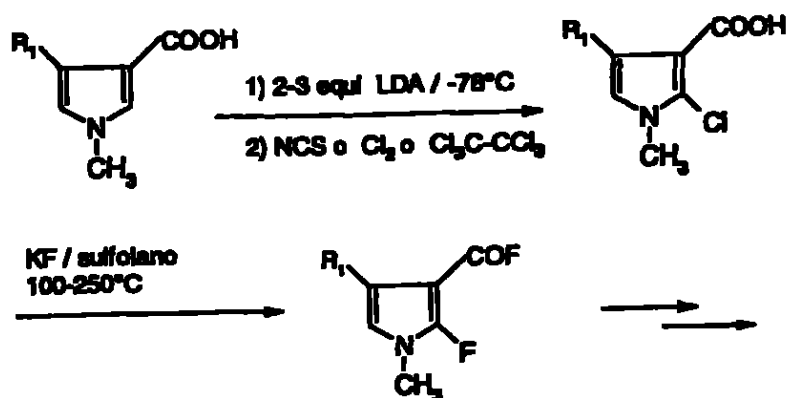
La síntesis de los ácidos pirrolocarboxílicos de la fórmula II en donde R_2 es fluor se puede conducir de acuerdo al esquema 2A o 2B

Esquema 2A

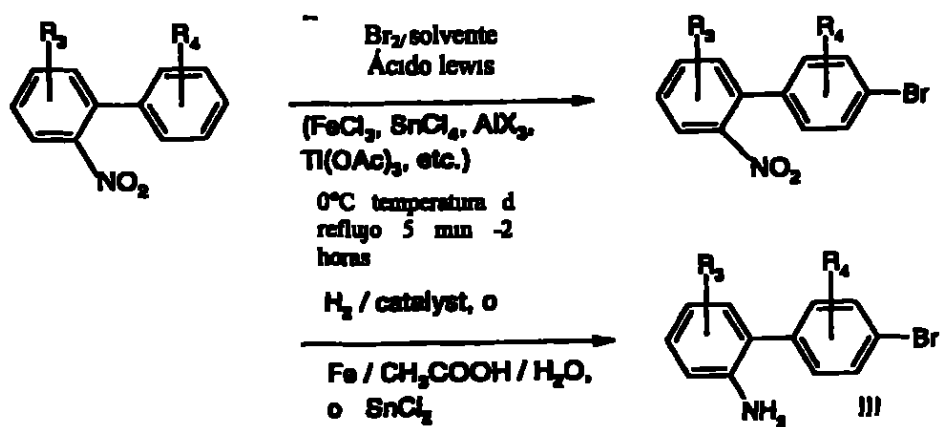


F^+ -reactivos = N-fluor-bis (fenilsulfonil) amina, N-fluor-N-metilo-tolueno-4-sulfonamida, 2-fluor-3,3-dimetil-2,3-dihidro-1,2-benzisotiazol- 1,1-dióxido, 1-fluor-sym -colidiniumtetrafluoroborato

LDA = litiodiisopropilamida

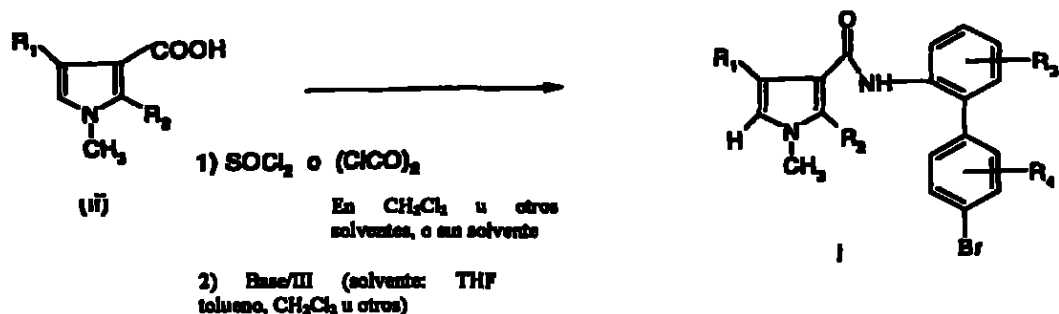
Esquema 2B

B) Síntesis de amina III

Esquema 3

(AlX₃ es preferiblemente AlCl₃, solvente agua, DMF, THF, CH₂Cl₂, CHCl₃, ClCH₂CH₂Cl, etc)

c) Síntesis de amidas

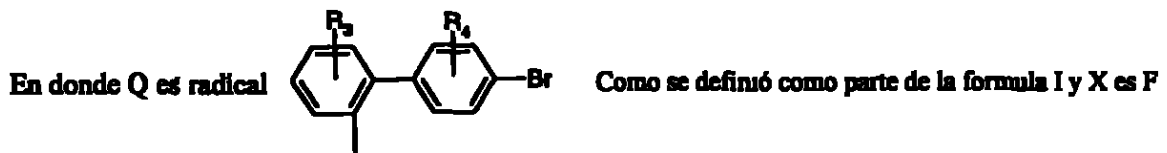
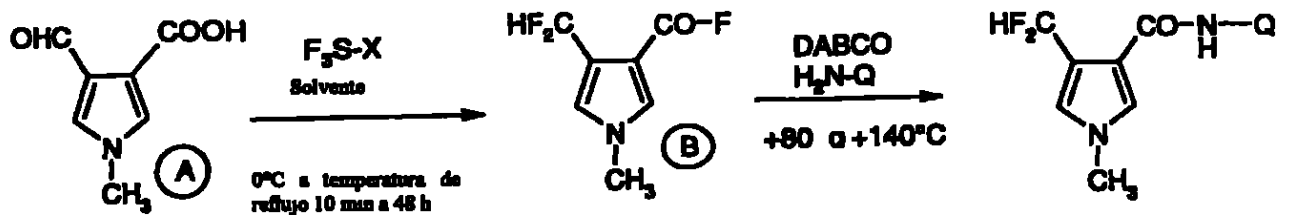
Esquema 4

Base = $\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_3$, base hünig, Na_2CO_3 , K_2CO_3 y otros

El ácido pirrolocarboxílico II reacciona con un agente activante tal como el cloruro de tionilo, el pentacloruro fosforoso o el cloruro de ácido oxálico (u salino) en la presencia de un solvente a una temperatura entre 0°C y la temperatura de reflujo y un tiempo de reacción de 30 minutos a 24 horas para dar el cloruro de ácido correspondiente. Los solventes representativos como tolueno, benceno, xileno, hexano, ciclohexano, cloroformo o metilencloruro. El cloruro de acyl obtenido es normalmente no aislado. Las nuevas carboxamidas de la fórmula I se obtienen preferiblemente al hacer reaccionar

el ácido pirrolocarboxílico activado con una amina aromática de fórmula III en la presencia de un solvente como tolueno, benceno, xileno, hexano, cloroformo, ciclohexano o metilencloruro y en la presencia de un agente que liga un ácido como la trietilamina, la base hünig, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio o el carbonato hidrógeno de sodio a una temperatura entre 0°C y temperatura de reflujo. Preferiblemente la secuencia de reacción completa del esquema 4 es conducida en una reacción de vaso simple.

Los intermedios del fluoruro de ácido carboxílico de la fórmula II en donde R_1 es CHF_2 se pueden obtener de acuerdo con la siguiente ruta de reacción.

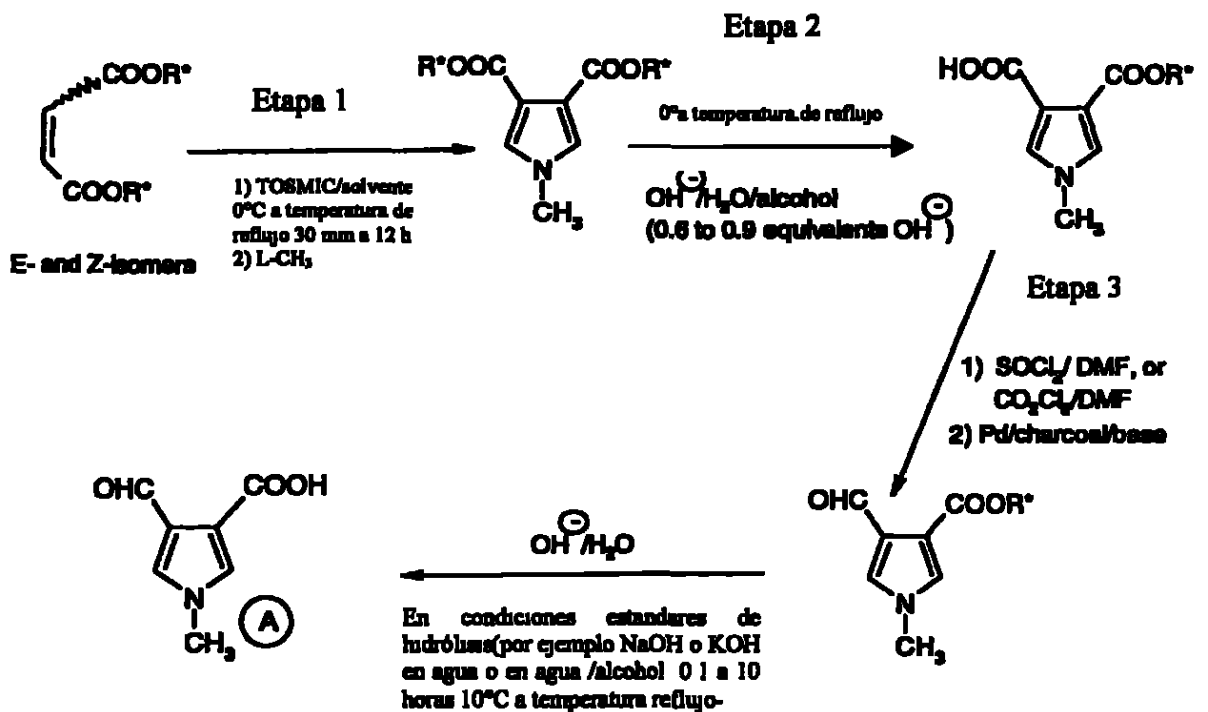
Esquema 5

Los reactivos F₃S-X son conocidos, por ejemplo de
J Org Chem, 1999, (64), 7048

La última etapa de reacción del esquema 5 comprende una reacción acoplante (amidación) que es conducida ventajosamente en la presencia de 1 a 2 equivalentes de la base estorbada como DABCO (1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano) en pocas gotas de acetonitrilo como un medio de contacto, al calentar la mezcla de reacción durante 2 a 3 horas a una temperatura de 80°C a 140°C hasta que tenga lugar la reacción. Después de la rutina de enfriamiento el procedimiento de conformación produce en el producto final de la fórmula I en donde R₁ es CHF₂.

El compuesto B y la síntesis de este han sido especialmente creados para la producción de los ingredientes activos de la presente invención, y por lo tanto representan características adicionales de esta invención. De manera similar el compuesto novedoso A de los ésteres precedentes son parte de esta invención. El compuesto A se puede obtener como sigue:

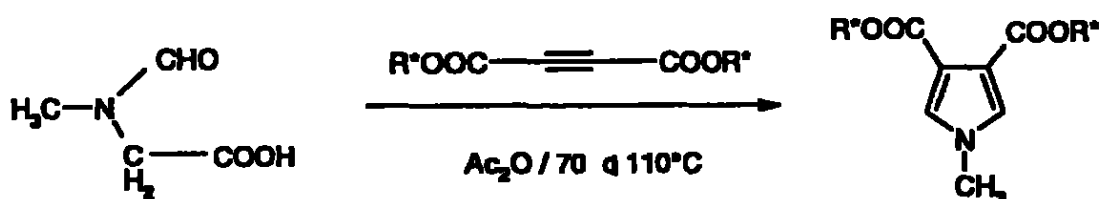
Esquema 6



En donde R^* es alquilo C_1-C_6 , o $Si(alquilo\ C_1-C_6)_3$, y L es un grupo saliente como un átomo de halógeno, -O-Tos, etc. La etapa de reacción 3 es una versión modificada de la reacción de Rosenmund, que no es todavía conocida en la técnica, y represente a cierta característica de esta invención. Especificas son las combinaciones reactivas $SOCl_2/DMF$ de bicloruro de ácido oxálico/DMF, DMF en cantidad catalítica, solvente inerte opcional, en la primer etapa y en la segunda etapa condiciones de reducción como Pd sobre carbono a una temperatura entre $0^\circ C$ y $+10^\circ C$, preferiblemente entre $0^\circ C$ y $+5^\circ C$, y ventajosamente en la presencia de una amina terciaria, como por ejemplo una base hünig.

Alternativamente, el 3,4-diéster-1-metilpirrol del esquema 6 se puede obtener de acuerdo a (R K Huisgen, US 3,285,931) como se subraya en el esquema 7.

Esquema 7



Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos novedosos de fórmula I tienen, para propósitos prácticos, un espectro muy ventajoso de actividades para proteger plantas contra enfermedades que son originadas por hongos así como también por bacterias y virus

Los compuestos de fórmula I se pueden utilizar en el sector agrícola y campos relacionados de uso como ingredientes activos para controlar plagas de plantas. Los compuestos novedosos son distinguidos por excelente actividad a bajas proporciones de aplicación, siendo bien tolerados por las plantas y siendo ambientalmente seguros. Ellos tienen propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles y son utilizados para proteger numerosas plantas cultivadas. Los compuestos de fórmula I se pueden utilizar para inhibir o destruir las plagas que se presentan sobre las plantas o partes de las plantas (frutas, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) o diferentes plantaciones de plantas útiles, aunque al mismo tiempo protegen también aquellas partes de las plantas que crecen posteriormente por ejemplo de los microorganismos fitopatógenos.

También es posible utilizar compuestos de fórmula I como agentes de recubrimiento para el tratamiento de material de propagación vegetal, en particular de semillas (frutos, tubérculos, granos) y plantas de corte (por ejemplo arroz), para la protección contra infecciones fungosas así como también contra hongos fitopatógenos que ocurren en el suelo

Los compuestos I son, por ejemplo, efectivos contra los hongos fitopatógenos de las siguientes clases Fungi Imperfecti (por ejemplo Botrytis, Piricularia, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora y Alternaria) y Basidiomicetes (por ejemplo Rizoctonia, Hemileia, Puccinia) Adicionalmente, ellos son efectivos contra clases de Ascomicetes (por ejemplo Venturia y Erysiphe, Podosfera, Monilinia, Uncinula) y de las clases Oomicetes (por ejemplo Fitofthora, Pitium, Plasmopara) La actividad restante ha sido observada contra mildew polvoriento (Erysiphe spp) Adicionalmente, los compuestos novedosos de fórmula I son efectivos contra las bacterias y los virus fitopatógenos (por ejemplo contra Xantomonas spp, Seudomonas spp, Erwinia amylovora así como también contra el virus del mosaico del tabaco)

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos objeto que se deben proteger típicamente comprenden las siguientes especies de plantas cereales (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas), remolacha (remolacha de azúcar y remolacha de forraje), pomos, drupas y frutas suaves (manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas, fresas, frambuesa y zarzamora), plantas leguminosas (habas, lentejas, alverjas, soya), plantas de aceite (colza, mostaza, amapola, olivas, girasoles, coco, plantas de aceite de castor, semillas de cacao, maní), plantas de cohombro (calabaza, cohombros, melones), plantas de fibra (algodón, lino, cáñamo, yute), frutas cítricas (naranjas, limones, toronjas, mandarinas), vegetales (espinaca, lechuga, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, papas, páprika), lauráceas (aguacate, canela, alcanfor) o plantas tales como tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, te, pimienta, vides, lúpulos, bananos y plantas de caucho natural, así como también ornamentales

Los compuestos de fórmula I son utilizados en forma no modificada o, preferiblemente, junto con ayudantes convencionalmente empleados en la técnica de formulación

Para este fin ellos son convenientemente formulados de manera conocida en concentrados emulsificables, pastas recubribles, soluciones directamente roceables o diluibles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, talcos, granulados, y también encapsulaciones por ejemplo en sustancias poliméricas. Como con el tipo de las composiciones, los métodos de aplicación, tales como rociado, atomización, tasqueado, esparcido, recubrimiento o vertimiento, son escogidos de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalentes. Las composiciones también pueden contener adyuvantes adicionales tales como estabilizadores, antiespumantes, reguladores de viscosidad, ligantes o pegantes así como también fertilizantes, donadores de micro nutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

Los portadores adecuados y adyuvantes pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en la tecnología de formulación, por ejemplo, sustancias minerales naturales o regeneradas, solventes, dispersantes, agentes humectantes, pegantes, espesantes, ligadores o fertilizantes. Tales portadores son por ejemplo descritos en la WO 97/33890.

Los compuestos de fórmula I son normalmente utilizados en la forma de composiciones y se pueden aplicar al área de cultivos o a la planta a ser tratada, simultáneamente o en su sesión con compuestos adicionales. Estos compuestos adicionales pueden ser por ejemplo fertilizantes o donadores de micro nutrientes u otras preparaciones que influyen en el crecimiento de plantas. Ellos también pueden ser herbicidas selectivos así como también insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, moluscicidas o mezclas de varias de estas preparaciones, si se desea junto con portadores adicionales, tensoactivos o adyuvantes que promueven la aplicación empleados comúnmente en la técnica de formulación.

Los compuestos de fórmula I pueden ser mezclados con otros fungicidas, dando como resultado en algunos casos actividades sinérgicas inesperadas. La mezcla de componentes que son particularmente preferidos son azoles, tales como azaconazol, BAY 14120, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol,

piconazol, metconazol, miclobutanilo, pefurazoato, penconazol, pirifenox, procloraz, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol, pirimidinil carbinol, tales como ancimidol, fenarimol, nuarimol, 2-amino-pirimidinas, tales como bupirimato, dimetirimol, etirimol, morfelines, tales como dodemorf, fenpropidino, fenpropimorf, espiroxamina, tridemorf, anilino-pirimidinas, tales como ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanil, pirroles, tales como fempiclonil, fludioxonil, fenilaminas, tales como benalaxil, furalaxil, metalaxil, R-metalaxil, ofurace, oxadixil, benzimidazoles, tales como benomil, carbendazim, debacarb, fuberidazol, tiabendazol, dicarboximidas, tales como clozolinato, diclozolino, iprodiona, miclozoline, procymidona, vinclozolino, carboxamidas, tales como carboxin, fenfuram, flutolanil, mepronil, oxicarboxin, tifluzamida, guanidinas, tales como guazatina, domina, iminocladina, estrobilurinas, tales como azoxistrobina, kresoxim-metil, metominostrobin, SSF-129, trifloxistrobina, picoxistrobina, BAS 500F (nombre propuesto de piraclostrobin), BAS 520, ditiocarbamatos, tales como ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram, N-halometiltiotetrahidroeftalimidas,

tales como captafol, captan, diclofuanil, fluoromidas, folpet, tolifuanid, compuestos de cobre, tales como mezcla Bordo, hidroxido de cobre, oxícloruro de cobre, sulfato de cobre, oxido cuproso, mancobre, oxincobre, derivados de nitrofenol, tales como dinocap, nitrotal-isopropil, organo-p-derivados, tales como edifenfos, iprobenfos, isoprotionalo, fosdifen, pirazofos, tolclfosmetil, otros varios, tales como acibenzolar-S-metil, anilazina, betiavalicarb, blasticidin-S, quinometiolato, cloroneb, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanil, diclona, diclomezina, dicloran, dietofencarb, dimetomorf, SYP-LI90 (nombre propuesto flumorf), ditianon, etaboxam, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenoxanil, fentin, ferimzona, fluazinam, flusulfamida, fenexamida, fosetil-aluminio, himexazol, improvalicarb, IKF-916 (clazofamida), kasugamicina, metasulfocarb, metrafenona, nicobifen, pencicuron, ftalida, polioxinas, probenazol, propamocarb, piroquilon, quinoxifen, quintozeno, azufre, triazoxido, triciclazol, triforina, validamicina, zoxamida (RH7281)

Un método preferido para aplicar un compuesto de fórmula I, o una composición agroquímica que contiene al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar

La frecuencia de la aplicación y la proporción de la aplicación dependerán del riesgo de infestación por el patógeno correspondiente Sin embargo, los compuestos de fórmula I también pueden penetrar la planta a través de las raíces por vía del suelo (acción sistémica) al mojar el locus de la planta con una formulación líquida, o al aplicar los compuestos en forma sólida al suelo, por ejemplo, en forma granular (aplicación al suelo) En los cultivos de arroz de agua tales como granulados se pueden aplicar al campo de arroz fluido Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar a semillas (recubrimiento) al impregnar las semillas o los tubérculos bien sea con una formulación líquida del fungicida o recubriéndolos con una formulación sólida

La formulación, es decir las composiciones que contienen el compuesto de fórmula I y, si se desea, un sólido o un ayudante líquido se preparan de manera conocida, típicamente al mezclar íntimamente y/o moler el compuesto con extendedores, por ejemplo, solventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos de superficie activa (tensoactivos)

Las formulaciones agroquímicas usualmente contendrán de 0.1 a 99% en peso, preferiblemente de 0.1 a 95% en peso, del compuesto de fórmula I, 99.9 a 1% en peso, preferiblemente 99.8 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y de 0 a 25% en peso, preferiblemente de 0.1 a 25% en peso, de un tensoactivo

Las proporciones ventajosas de aplicación son normalmente de 5 g a 2kg de ingrediente activo (a.1) por hectárea (ha), preferiblemente de 10 g a 1kg a.1 /ha, más preferiblemente de 20 g a 600 g a.1/ha. Cuando se utiliza como agente humectante de semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas

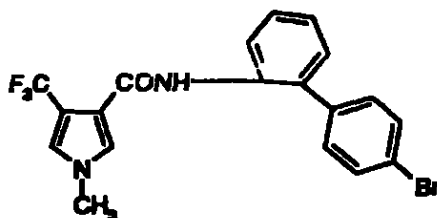
Mientras que se prefiere formular productos comerciales como concentrados, el usuario final utilizara normalmente formulaciones diluidas

Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran la invención anteriormente descrita con más detalle. Las temperaturas son dadas en grados Celsius. Las siguientes abreviaturas son utilizadas: p.f. = punto de fusión, p.e. = punto de ebullición. "ERM" significa espectro de

resonancia magnética nuclear El MS establece el espectro de masa "%" es el porcentaje en peso, a menos que las concentraciones correspondientes sean indicadas en otras unidades

Ejemplo 1

(4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-trifluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico,

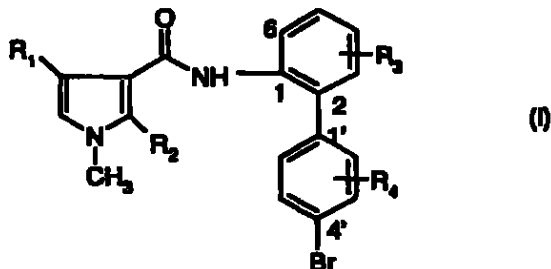


Una solución de ácido 1-metilo-4-trifluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico (0.42 g, 2.2 mmol) y cloruro de oxalilo (0.30 g, 2.4 mmol) en cloruro de metileno (20 ml) se agitaron durante 3 horas a temperatura ambiente en la presencia de una cantidad catalítica de DMF. Luego la solución de cloruro ácido resultante se agrega lentamente a la solución de 2-(4'-bromobifenil) anilina (0.55 g, 2.2 mmol) y trietilamina (0.33 g, 3.3 mmol) en 15 ml de cloruro de metileno. La mezcla resultante es luego

agitada durante 16 horas a temperatura ambiente Después de la adición de etilacetato, la fase orgánica se lava dos veces con agua Después de secar la fase orgánica sobre Na_2SO_4 , el solvente se remueve en un vacío de chorro de agua y el producto crudo obtenido es finamente purificado por cromatografía de columna (silica gel, eluante etilacetato/hexano = 1/2) 0.52 g de (4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-trifluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico se obtiene en la forma de un polvo amarillo que tiene un punto de fusión de 163-164°C

Los siguientes compuestos de la fórmula I se preparan de manera similar, utilizando métodos análogos

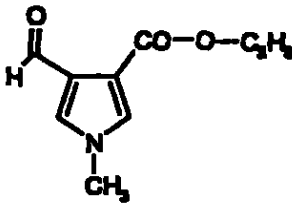
Tabla 1



Compuesto No	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Datos físicos, p f °C
1 1	CF ₃	H	H	H	163-164
1 2	CF ₂ H	H	H	H	166-167
1 3	CFH ₂	H	H	H	
1 4	CF ₃	F	H	H	Resina, M ^r =411
1 5	CF ₂ H	F	H	H	Resina, M ^r =423
1 6	CFH ₂	F	H	H	
1 7	CF ₃	H	6-F	H	
1 8	CF ₂ H	H	6-F	H	
1 9	CF ₃	F	6-F	H	
1 10	CF ₂ H	F	6-F	H	

Ejemplo 2

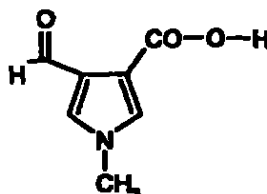
Etilester de ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol-
carboxílico,



Una solución de 21.6 g (0.11 mol) de monoetilester de ácido 1-metil-1H-pirrazol-3, 4-dicarboxílico y 14.9 g (0.117 mol) de cloruro de oxalilo y 150 ml de cloruro de metileno se agitan durante 3 horas a temperatura ambiente en la presencia de una cantidad catalítica de DMF absoluto. Después de 3 horas el solvente se remueve en un vacío de chorro de agua y el cloruro de ácido crudo (21.5 g) se disuelve en 400 ml de tetrahidrofurano seco. Después de la adición de 14.2 g (0.11 mol) de N, N-diisopropiletilamina (base húmida) la mezcla se hidrogena con hidrógeno en la presencia de 6.0 g 10% Pd/C a 0°-5°C durante 5 ½ horas. Luego el catalizador se filtra y el solvente se remueve en un vacío de chorro de agua. La materia prima se purifica mediante cromatografía de destello sobre sílica gel (eluante t-butilmetileter/hexano 1:5). Rendimiento 16 g de Etilester de ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol carboxílico en la forma de un polvo amarillo, p f 75°-76°C

Ejemplo 3

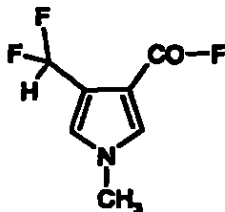
Ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol-carboxílico



A una solución de 4.6 g (0.0255 mol) de Etiléster de ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol-carboxílico y 90 ml de etanol se agrega a una solución de 2.1 g (0.031 mol) de hidróxido de potasio de 85% y 20 ml de agua que producen una reacción ligeramente exotérmica. La mezcla resultante es agitada durante 2 horas a +80°C y luego la mezcla de solvente EtOH/H₂O se destila en vacío. El aceite resultante se disuelve en 100 ml de H₂O y se lava dos veces con etilacetato. Luego se agregan 20 ml de solución de cloruro de hidrógeno 2N lentamente de la fase de agua en el frío. El sólido precipitado se filtra y se lava con agua. Después de secar el precipitado en un horno de vacío se obtiene el ácido puro. Rendimiento 3.6 g de ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol-carboxílico en la forma de un polvo ligeramente amarillo, p f 178°-180°C.

Ejemplo 3

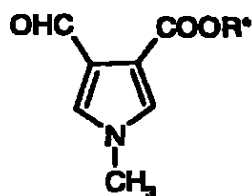
Fluoruro de 4-difluorometil-1-metil-1H-pirrol-3-carbonilo



A una solución enfriada de 2.6 g (0.017 mol) de ácido 4-Formil-1-metil-1H-pirrol-carboxílico y 70 ml de cloruro de metileno se agrega una solución de 11.0 g (0.068 mol) de fluoruro dietilaminosulfurtrifluoruro (DAST) 10 ml de metilencloruro de tal manera que la temperatura permanece constante a 0° a +2°C. Luego la mezcla se agita durante 30 minutos a 0°C y 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se toma en etilacetato y se lava dos veces con agua helada y agua salobre. Después de secar los solventes se remueven en un vacío de chorro de agua y el residuo purificado mediante cromatografía de destello sobre sílica gel (eluante hexano/etilacetato 2/1). Rendimiento 1.95 g de Fluoruro de 4-difluorometil-1-metil-1H-pirrol-3-carbonilo en la forma de un sólido café, p. f. 53°-54°C.

De una manera similar los intermedios de la fórmula general de la tabla 2 se pueden obtener

Tabla 2



Compuesto No	R*	Datos físicos (p f [°C])
1 1	CH ₃	
1 2	C ₂ H ₅	76-77
1 3	C ₃ H ₇ -n	
1 4	C ₄ H ₉ -n	
1 5	C ₆ H ₁₃ -n	
1 6	Si (CH ₃) ₃	

Ejemplos de formulación para compuestos de fórmula I

El procedimiento de trabajo para preparar formulación en los compuestos de fórmula I tal como

concentrados emulsificables, soluciones, granulados, talcos y polvos humectables se describen en la WO 97/33890

Ejemplos biológicos Acciones fungicidas

Ejemplo B-1 Acción contra *Puccinia recondita*/trigo
(hongo café sobre trigo)

Plantas de trigo de 1 semana cv Arina son tratadas con el compuesto del ensayo formulado (0.02% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Un día después de la aplicación las plantas de trigo son inoculadas mediante rociado con una suspensión de esporas (1×10^5 uredoesporas/ml) sobre las plantas de ensayo. Después del periodo de incubación de 2 días a 20°C y 95% de humedad relativa las plantas son mantenidas en un invernadero durante 8 días a 20°C y 60% de humedad relativa. La incidencia de enfermedad se evalúa 10 días después de la inoculación.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo (<20% de infestación). La

infestación se evita virtualmente de manera completa (0-5% de infestación) con compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5

Ejemplo B-2 Acción contra *Podosfera leucotricha*/manzana
(mildew polvoroso sobre manzana)

Plantas de manzana de 5 semanas cv McIntosh son tratadas con el compuesto del ensayo formulado (0.002% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Un día después de la aplicación a las plantas de manzanas son inoculadas al agitar las plantas infectadas con mildew polvoroso de manzana por encima de las plantas de ensayo. Después del periodo de incubación de 12 días a 22°C y 60% de humedad relativa bajo un régimen de luz de 14/10 h (luz/oscuridad) se evalúa la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5 exhiben fuerte eficacia (<20% de infestación).

Ejemplo B-3 Acción contra *venturia inaequalis*/manzana
(roña sobre manzana)

Plantas de manzana de 4 semanas cv McIntosh son tratadas con el compuesto del ensayo formulado (0.02% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Un día después de la aplicación las plantas de manzanas son inoculadas mediante rociado de una suspensión de esporas (4×10^5 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Después del periodo de incubación de 4 días a 21°C y 95% de humedad relativa las plantas son ubicadas durante 4 días a 21°C y 60% de humedad relativa en un invernadero. Después de otro periodo de 4 días de incubación a 21°C y 95% de humedad relativa la incidencia de la enfermedad se evalúa.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1.1, 1.2, 1.4 y 1.5 exhiben fuerte eficacia (<20% de infestación).

Ejemplo B-4 Acción contra *Erysiphe graminis*/cebada
(mildew polvoroso sobre cebada)

Plantas de cebada de 1 semana cv Express son tratadas con el compuesto de ensayo formulado (0.02% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Un día después de la aplicación las plantas de cebada son inoculadas al agitar las plantas infectadas con mildew polvoroso por encima de las plantas de ensayo. Después de un periodo de incubación de 6 días a 20°C / 18°C (día/noche) y 60% de humedad relativa en un invernadero se evalúa la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1.1, 1.2, 1.4 y 1.5 exhiben fuerte eficacia (<20% de infestación).

Ejemplo B-5 Acción contra *Botrytis cinerea*/manzana
(Botrytis sobre frutas de manzana)

En una fruta de manzana cv Golden Delicious se perforan 3 huecos y cada uno se llena con 30 µl gotas del compuesto de ensayo formulado (0.002% de ingrediente activo). Dos horas después de la aplicación 50 µl de una

suspensión de esporas de *B. cinerea* (4×10^5 conidia/ml) se pipetea sobre los sitios de aplicación. Después de un periodo de incubación de 7 días a 22°C en una cámara de crecimiento la incidencia de la enfermedad se evalúa.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5 exhiben muy fuerte eficacia (<10% de infestación).

Ejemplo B-6 Acción contra *Botrytis cinerea*/uva
(*Botrytis* sobre uvas)

Plántulas de uva de 5 semanas cv Gutedel son tratadas con el compuesto de ensayo formulado (0.002% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Dos días después de la aplicación las plántulas de uva son inoculadas mediante el rociado de una suspensión de esporas (1×10^6 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Después de un periodo de incubación de 4 días a 21°C y 95% de humedad relativa en un invernadero la incidencia de la enfermedad se evalúa.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5 exhiben muy fuerte eficacia (<10% de infestación)

Ejemplo B-7 Acción contra *Botrytis cinerea*/tomate
(*Botrytis* sobre tomates)

Plantas de tomate de 4 semanas cv Roter Gnom son tratadas con el compuesto de ensayo formulado (0.002% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Dos días después de la aplicación las plantas de tomate son inoculadas mediante el rociado de una suspensión de esporas (1×10^5 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Después de un periodo de incubación de 4 días a 20°C y 95% de humedad relativa en una cámara de crecimiento la incidencia de la enfermedad se evalúa.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5 exhiben muy fuerte eficacia (<10% de infestación)

Ejemplo B-8 Acción contra *pyrenophora teres*/cebada
(mancha neta sobre cebada)

Plantas de cebada de 1 semanas cv Express son tratadas con el compuesto de ensayo formulado (0.002% de ingrediente activo) en una cámara de rociado. Dos días después de la aplicación las plántulas de cebada son inoculadas mediante el rociado de una suspensión de esporas (3×10^4 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Después de un periodo de incubación de 2 días a 20°C y 95% de humedad relativa las plantas son mantenidas dos días a 20°C y 60% de humedad relativa en un invernadero. La incidencia de la enfermedad se evalúa 4 días después de la inoculación.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1.1, 1.2, 1.4 y 1.5 exhiben fuerte eficacia (<20% de infestación).

Ejemplo B-9 Acción contra *Septoria nodorum*/trigo
(mancha de hoja de Septoria sobre trigo)

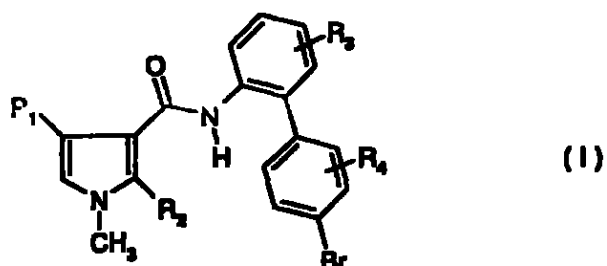
Plantas de trigo de 1 semanas cv Arina son tratadas con el compuesto de ensayo formulado (0.02% de

ingrediente activo) en una cámara de rociado. Un día después de la aplicación las plantas de trigo son inoculadas mediante el rociado de una suspensión de esporas (5×10^5 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Después de un periodo de incubación de 1 día a 20°C y 95% de humedad relativa las plantas son mantenidas durante 10 días a 20°C y 60% de humedad relativa en un invernadero. La incidencia de la enfermedad se evalúa 11 días después de la inoculación.

Los compuestos de la tabla 1 muestran buena actividad en este ensayo. Los compuestos 1 1, 1 2, 1 4 y 1 5 exhiben fuerte eficacia (<20% de infestación).

REIVINDICACIONES

- 1 Una pirrolcarboxamida de fórmula I



En donde

R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 ,

R_2 es hidrógeno o flúor,

R_3 es hidrógeno o flúor, y

R_4 es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, CF_3 ,
 OCF_3 o SCF_3

- 2 Un compuesto de fórmula I de acuerdo a la reivindicación 1, en donde

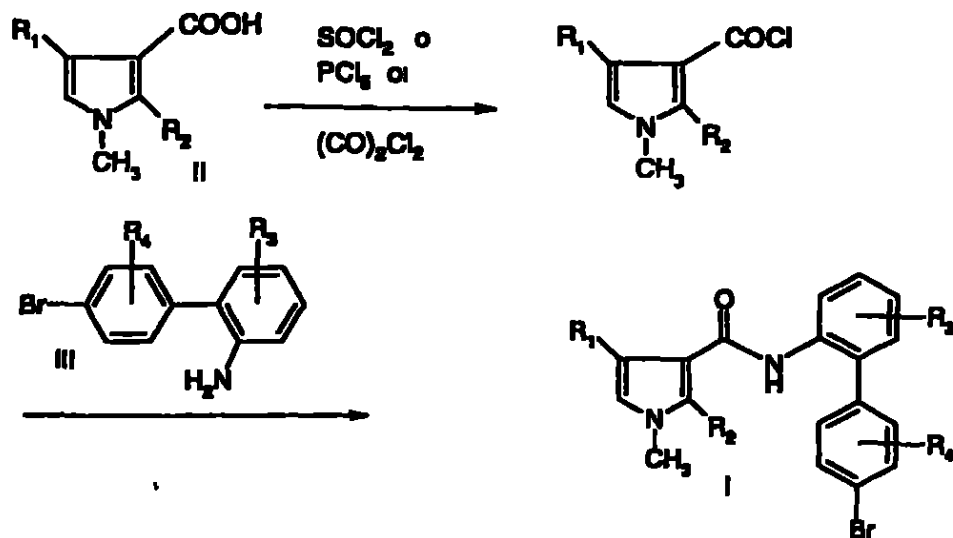
R_4 es hidrógeno, cloro, metilo, CF_3 u OCF_3

- 3 Un compuesto de fórmula I de acuerdo a la reivindicación 2, en donde

R_2 es hidrógeno

- 4 Un compuesto de fórmula I de acuerdo a la reivindicación 2, en donde R_2 es fluor
- 5 Un compuesto de fórmula I de acuerdo a la reivindicación 1 seleccionado del grupo que comprende (4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-trifluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico o (4'-bromobifenil-2-yl) amida de ácido 1-metilo-4-difluorometilo-1H-pirrol-3-carboxílico

- 6 Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula I que comprenden hacer reaccionar los materiales de partida de acuerdo con el esquema

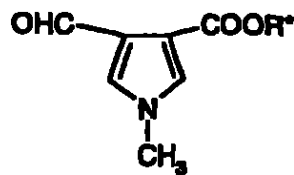


En donde R₁, R₂, R₃ y R₄ son como se definió para la fórmula I en la reivindicación 1

- 7 Una composición para controlar microorganismos y evitar el ataque e infestación de plantas con esta, en donde el ingrediente activo es un compuesto como se reivindicó en la reivindicación 1 junto con un portador adecuado

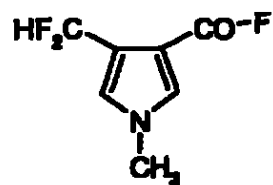
8 Un método para controlar o prevenir la infestación de plantas cultivadas por microorganismos fitopatógenos mediante la aplicación de un compuesto de fórmula I como se reivindicó en la reivindicación 1 a plantas, a partes de esta o a locus de esta

9 Un compuesto de fórmula general

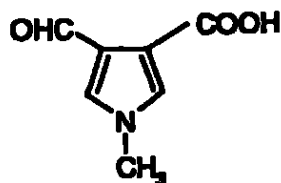


En donde R* es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, o Si (alquilo C₁-C₆)₃

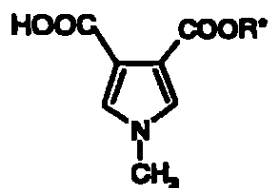
10 El compuesto de fórmula



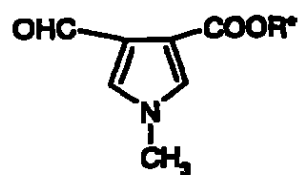
- 11 Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula



Cuyo proceso comprende reducir un compuesto de fórmula



En donde R' es alquilo C_1-C_6 , o Si (alquilo C_1-C_6)₃, en un proceso de dos etapas al hacer reaccionar este primero con un agente halogenante seleccionado de $SOCl_2$ /dimetilformamida y cloruro de ácido oxálico/dimetilformamida, y en una segunda etapa reducir el cloruro de ácido intermedio con paladio sobre carbono en la presencia de una base, e hidrolizar el estar resultante de la fórmula



En donde R^* es alquilo C_1-C_6 , o Si (alquilo C_1-C_6)₃
bajo condiciones alcalinas

RESUMEN

La invención se relaciona con pirrolcarboxamidas novedosas de la fórmula (I) en donde R_1 es CF_3 , CF_2H o CFH_2 , R_2 es hidrógeno o flúor, R_3 es hidrógeno o flúor, R_4 es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, CF_3 , OCF_3 o SCF_3 . Los compuestos de la fórmula (I) tienen propiedades protectoras para las plantas y son adecuados para proteger plantas contra infestaciones por microorganismos fitopatógenos.

'CAVELIER

**ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a N° 72-26
BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA**

192

Representación, Ratificación y Poder con autenticación notarial y Apostilla para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias

Representation, Ratification and Power-of-Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses

REPRESENTACION, RATIFICACION Y PODER

**REPRESENTATION, RATIFICATION AND POWER-
OF-ATTORNEY** 13602

13602
90-1

**Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned
Syngenta Participations AG**

dommehado (a) en/of Schwarzwaldallee 215
CH-4058 Basel
SWITZERLAND

por el presente ratificamos las solicitudes de
patente Nos 03 000 260 y 03.038 176

presentada por EMILIO FERRERO
como agente oficial de la Superintendencia de
Industria y Comercio
en Bogotá, Colombia

al 3 de enero y 7 de mayo de 2003, resp. y por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929 GONZALO FERDOMO, tpa. 831 LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELLIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como sus (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cese la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplente, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiere (conferirnos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (autorizo) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, y como a no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los supuestos

C CAVELIER ABOGADOS
WPP0001 112 00NUTA 121 1210-7

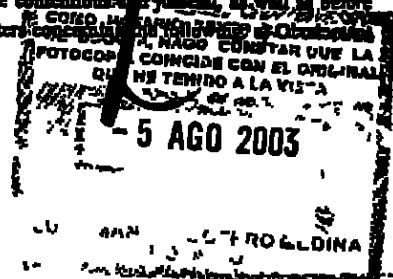
hereby certify the patent applications Nos
03.000.260 and 03.038.176

Filed without a Power of Attorney by EMILIO FERRERO

before the Superintendency of Industry
and Commerce

m Bogotá, Colombia
on January 3 and May 7, 2003, respectively
and do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929 GONZALO PERDOMO, tpa. 831 LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4° N° 72- 35 Bogotá, Colombia, in due compliance with the terms of Paragraph 1st. of Article 543 of the Commercial Code, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the same fact or its excuses will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at each time.

In addition we grant a Power of Attorney in favor of the above named attorneys at law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without introduction, specially those administrative, administrative commissure and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters connected with the above mentioned.



366 ES

asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, emblemas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de origen su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria, y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa o judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos, acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan suscribir este mandato, transigir conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir renunciar, y ratificar los actos de agencias oficiales.

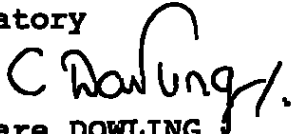
of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain names, vegetal varieties and denominations of origin, its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights, actions and suits mentioned by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney

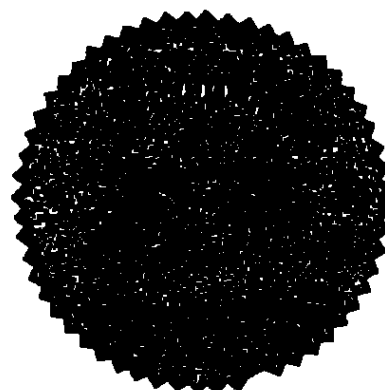
Dado y firmado hoy/Given and signed this 03 June 2003

en/in Bracknell, United Kingdom
por/by Clare DOWLING, Authorised Signatory

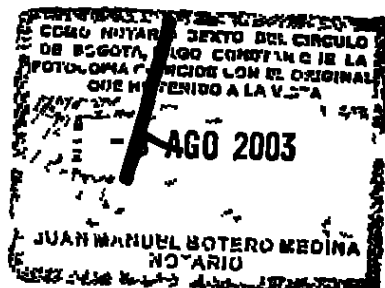
Firma June 2003

Signature


Clare DOWLING
Authorised Signatory
Syngenta Participations AG



© CAVELIER ABOGADOS
WFFOD801-192 (MINUTA 12.1 1.2.10.2)



AUTENTICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

El infrascrito Notario Certifica. Que la firma que antecede de
Oliver Dowling
 es autentica, que el signatario desempeña actualmente el cargo
 de Chairman & Signatory
 de la compa^{nia} Synstar Participations AG
 sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a
 las leyes de Switzerland

que la dirección de dicha compa^{nia} es St. Albans
CH-4058 Basel
 y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

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

Dado y firmado en _____

El _____

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

110

The undersigned Notary certifies That the preceding signature
 of Oliver Dowling
 is authentic, that the signatory currently acts in the position
 of Chairman & Signatory
 of the company Synstar Participations AG
 a company currently existing and organized under the laws
 of Switzerland

that the address is St. Albans
CH-4058 Basel
 and that the signatory has the power to grant this document.

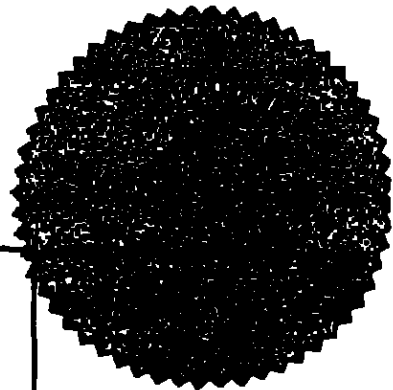
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
 examination of the corresponding documents

Given and signed at _____

On _____

HON. NELL COLL AND FREEMAN

El Notario Publico - The Notary Public
 (Firma-sello) (Signature-seal)

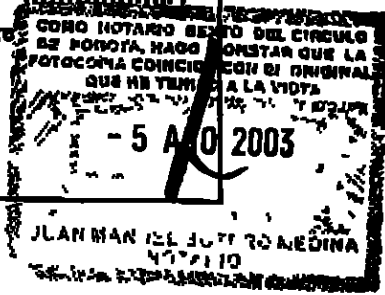


APOSTILLE
 (Convention de La Hays du 5 octobre 1961)

1 Country --
 This public document
 2 has been signed by
 3 acting in the capacity of
 4 bears the seal/stamp of

Certified

5 at 6 the
 7 by
 8 No
 9 Seal/stamp 10 Signature



(Hague Convention of 5 October 1961 / Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1 Country United Kingdom of Great Britain and Northern Ireland
Pays. Royaume-Uni de Grande-Bretagne et d'Irlande du Nord

2 Has been signed by **K Greenwood**
a été signé par

4 Bears the year 1941 on the L.H. Seal Notary Public
5 at London, London

7 by Her Majesty's Principal Secretary of State for Foreign and Commonwealth Affairs /
par le Secrétaire d'Etat Principal de Sa Majesté aux Affaires Etrangères et du Commonwealth

8. Number of **UAN MANUEL S. GARCIA**
N. ARIQ **180585**

10. Signature A. Walakira



For the Secretary of State / Pour le Secrétaire d'Etat

**If this document is to be used in a country which is not party to the Hague Convention of 5 October 1961
it should be presented to the consular section of the mission representing that country**

TRADUCCIÓN OFICIAL NÚMERO 099/2003 REALIZADA POR EDUARDO CALADO NOGUERA, TRADUCTOR OFICIAL APROBADO POR RESOLUCIÓN 541 DEL 27 DE FEBRERO DE 1976 Y DEBIDAMENTE INSCRITO ANTE EL MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES DE COLOMBIA, DE LOS SELLOS Y AUTENTICACIONES QUE APARECEN EN EL DOCUMENTO DE REPRESENTACIÓN, RATIFICACIÓN Y PODER OTORGADO POR SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, DOMICILIADA EN SCHWARZWALDALLEE 215 CH-4058 BASEL, SUIZA POR EL CUAL RATIFICAN LAS SOLICITUDES DE REGISTRO NÚMEROS 03 000 260 Y 03 038 176, PRESENTADA POR EL DOCTOR EMILIO FERRERO COMO AGENTE OFICIOSO ANTE LA SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DE BOGOTÁ, COLOMBIA EL DIA 3 DE ENERO Y EL 7 DE MAYO DE 2003, RESPECTIVAMENTE Y QUE IGUALMENTE OTORGA PODER A LOS DOCTORES EMILIO FERRERO, TPA 31929, GONZALO PERDOMO, TPA 831, LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, TPA 23555 Y GERMÁN CAVELIER, TPA 832 Dado y firmado hoy 3 de junio de 2003 en Bracknell, Reino Unido por Clare DOWLING, Firma Clare DOWLING, firmante autorizado, Syngenta Participations AG

A continuación aparece una autenticación notarial en inglés y en español por la cual se certifica la firma anterior, el domicilio y la dirección de la empresa y la capacidad del firmante para otorgar el poder y la ratificación precedentes

APOSTILLA

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

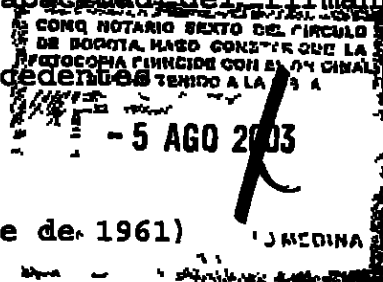
1 Estados Unidos de América

Este documento público

2 ha sido firmado por K GREENWOOD

3 quien actúa en su calidad de NOTARIO PÚBLICO

4 lleva el sello de dicho NOTARIO PÚBLICO



CERTIFICADO

5 en Londres

6 el 5 de junio de 2003

7 por el Secretario principal de Su Majestad para Asuntos
extranjeros y de la comunidad

8 Número G180585

9 Sello

Oficina de la Comunidad y Asuntos Extranjeros

10 Firma A Walakira (ilegible) a nombre del secretario de
estado

Si este documento va a usarse en un país que no sea parte de
la Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961, debe
presentarse ante la sección consular de la misión que
representa dicho país

COLO-13602-841-002 7

WPCL002G ID 4623

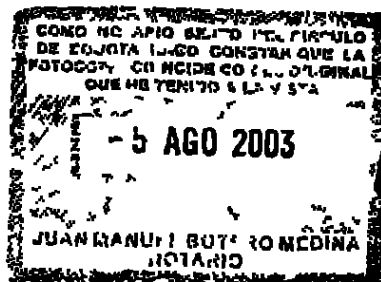
Bogotá, 9 de julio de 2003

Eduardo Calado

Eduardo Calado Noguera
TRADUCTOR OFICIAL
INGLES ESPAÑOL INGLÉS
Res 541 Febrero de 1999

462051
Eduardo Calado
LUGAR DE FIRMA
DOF 07/07/03
LASEC INPT

MINISTERIO DE REACCIÓN



LEGATIZADO

2003 JUL 10 P 11

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

COMO NOTARIO SE... DEL CÍRCULO...
 LA NOTA HA DE CONSTAR QUE LA FIRMA...
Edoardo Palero
Poguer
 ... CON LA FIRMA REGISTRADA POR...
 ... EN ESTA NOTARIA...
 ... 10 JUL 2002

NO...
 ...
 ...
 ...

COMO NOTARIO SE... DEL CÍRCULO...
 ... HA DE CONSTAR QUE LA...
 ... CON EL ORIGINAL...
 ... A LA Y STA...
 - 5 APO 2003
 ... MEDINA

Se saca folio 113 correspondiente al Arte final
duy sep 16/03

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 03067451 00000000
Fecha (AMD) : 2003-08-06 17:01:49
Fuente : 011 PCI-PATENT 279 FASE NNCI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE MARCAS COMERCIALES
Folios 114 ¹¹³

NIT 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 03 - 32,333
FECHA : JULIO 28 DE 2003

CONSIGNACION

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No PAGO	FECHA PGO	Vr PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	15534385	28/07/2003	30,555,000 00

CONCEPTO

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	30003-01-01	SOLICITUDES	
		1 TRAMITES DE SOL DE PATENTE DE IN	400,000 00
		TOTAL :	400 000.00

SON CUATROCIENTOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No _____

Cdo 13602-841-004-3

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
Indicacion de que se solicita la concesion de una patente	()	()
Datos de Identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud	()	()
Descripción de la invencion	()	()
Dibujos de ser estos pertinentes	()	()
Comprobante de Pago de las tasas establecidas		
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()		
- Indicacion de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
- Representación gráfica y fotografica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño	()	()
Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()
ESQUEMA DE TRAZADO ()		
- Indicacion de que solicita el registro de un Esquema de trazado	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud	()	()
Representación grafica del esquema de trazado	()	()
Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()	INCOMPLETA ()	()

Firma Responsable

Fecha



115

2020
Bogotá, D C ,

Doctor
EMILIO FERRERO
Apoderado
Syngenta Participations AG

Oficio N° 08433

ASUNTO	Radicación N°	03-087451
	Solicitud internacional	PCT/EP02/01344
	Fecha inicio fase nacional	09/09/2003
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Folios	001

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

☐ La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486).

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

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA OSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

10 OCT 2003

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha _____