

Q. Y.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

04-19469

54. TITULO "DERIVADOS DE NODOBENEOPIRAN-4-ONA QUE TIENEN
ACTIVIDAD FUNGICIDA."

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL CO3D311/22

71. SOLICITANTE BAYER CROPSCIENCE S.A.

DOMICILIO LYON, FRANCIA

74. APODERADO ALVARO CORREA ORODNEZ
T.P No. 20.281

22. BOGOTA, D.C., Marzo 3 DE 2004.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

019469 00

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación: 04019469 00000000

Folios: 98

Fecha (ANS): 2004-02-03 16:43:28

Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

18
icación

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

①

SOLICITUD DE :

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Capítulo I.

☒

Capítulo II.

②

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE S.A.

Dirección: 16 rue Jean-Marie Leclair - 69009 LYON, France

Nacionalidad o Domicilio: LYON, FRANCIA

Lugar de Constitución: FRANCIA

Teléfono:

Fax:

E-Mail:

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avda 82 No. 10-62 Piso 6

Teléfono: 634-1500

Fax: 376-2211

E-Mail: patenta.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

79.143.366 de
Usaquén

TP 20.281

④

INVENTOR (E9)
(72)

Nombre: VER PAGINA ADJUNTA.

Dirección: VER PAGINA ADJUNTA.

Nacionalidad o Domicilio: VER PAGINA ADJUNTA.

⑤ PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP02/09418

Fecha Julio 31, 2002

Publicación Internacional No. WO 03/014103

Fecha Febrero 20, 2003

⑥

Título (54)

DERIVADOS DE YODOBENZÓPIRAN-4-ONA QUE TIENEN ACTIVIDAD FUNGICIDA.

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07D311/56, C07D311/22

⑧

Prioridad

SI

☒

NO

☐

(33) País de Origen

FR

(32) Fecha

Agosto 3, 2001

(31) Número de Solicitud

0110430

⑨

Comprobante de pago No. 04-17,048

Fecha MARZO 2 DE 2004

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

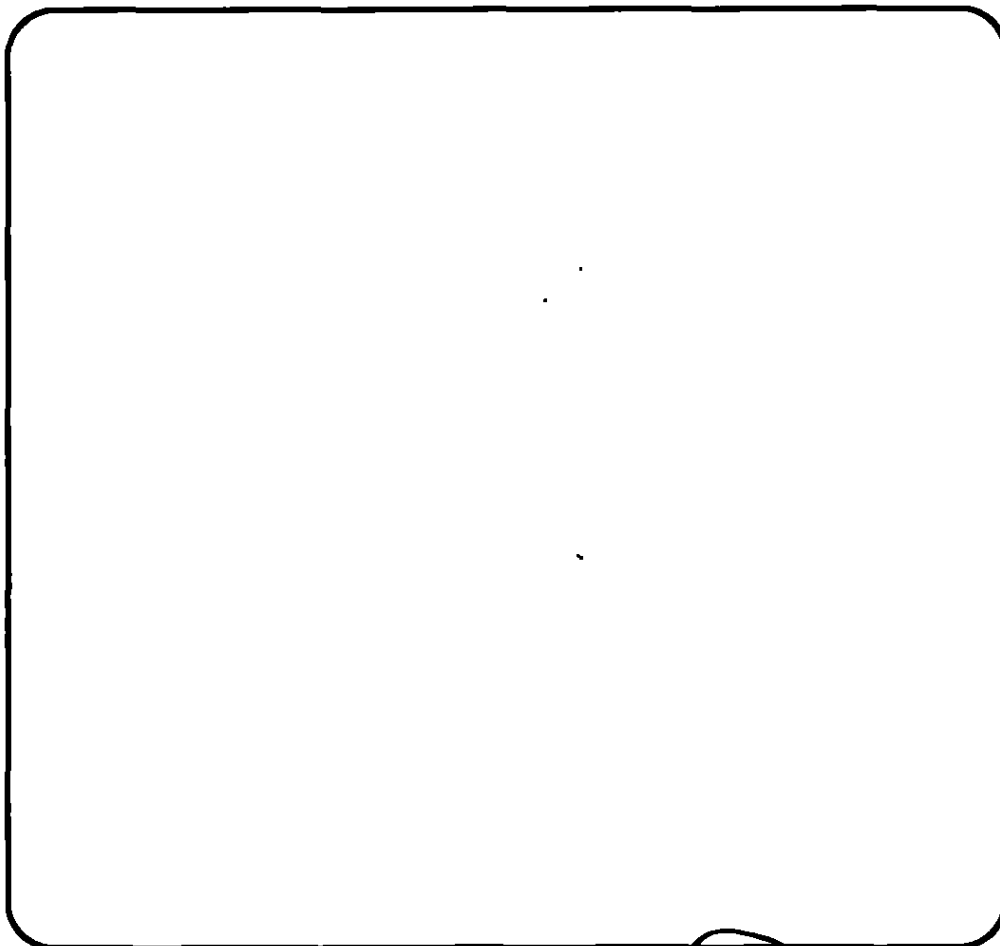
10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☐ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, al fuere el caso
- ☒ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☐ Arte final 12 x 12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☒ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☐ Otros:

11

FIGURA CARACTERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

FIRMA:

C.C. 79.143.366 de

Uruquén

T.P. 20.281

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
 Radicacion : 04019469 00000000 Folios: 98
 Fecha (AMD): 2004-03-03 16:43:28
 Traslite : 011 PCT-PATENT 379 FASE MACI 411 PRESENTAC
 Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 17,048
 FECHA : MARZO 2 DE 2004

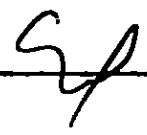
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
JULIAN ANDRES VARGAS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	22156014	02/03/2004	76,085,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	422,000.00
	TOTAL :	\$ 422,000.00

SON: CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ANEXO - INVENTORES**PCT/EP02/09418****TITULO: DERIVADOS DE YODOBENZOPIRAN-4-ONA QUE TIENEN ACTIVIDAD FUNGICIDA.**

Nombre:	<u>WEGMANN, Thomas</u>
Dirección:	<u>21 route de Saint Romain,</u> <u>F-69450 SAINT-CYR-AU-MONT-D'OR,</u> <u>Francia</u>
Nacionalidad ó Domicilio:	<u>ALEMÁN</u>
Nombre:	<u>HUSER, Nathalie</u>
Dirección:	<u>3 avenue Douaumont,</u> <u>F-69009 Lyon,</u> <u>Francia</u>
Nacionalidad ó Domicilio:	<u>FRANCESA</u>
Nombre:	<u>PREUSS, Rainer, Karl</u>
Dirección:	<u>27 quai Jean-Baptiste Simon,</u> <u>F-69270 FONTAINES-SUR-SAONE</u> <u>Francia</u>
Nacionalidad ó Domicilio:	<u>ALEMÁN</u>
Nombre:	<u>PEREZ, Joseph</u>
Dirección:	<u>9 chemin de Montpellas,</u> <u>F-69009 Lyon,</u> <u>Francia</u>
Nacionalidad ó Domicilio:	<u>FRANCES</u>
**Nombre:	<u>CARBONNE, Stéphane</u>
Dirección:	<u>47, rue de Cuire, Apt. No 6</u> <u>F-69004 Lyon,</u> <u>Francia</u>
Nacionalidad ó Domicilio:	<u>FRANCESA</u>
<u>**NOTA: VER MODIFICACIÓN INTERNACIONAL SOBRE NUEVO INVENTOR</u>	

RAISBECK, LARA, RODRÍGUEZ & RUEDA
Miembros de la Firma
BAKER & MCKENZIE

Avenida 82 No. 10-62, 6° Piso
Teléfono: (57-1) 634-1500
Bogotá, D.C. COLOMBIA
www.bakernet.com
office.bogota@bakernet.com

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

E. _____ S. _____ D. _____

Ref.: Solicitud de Nueva Patente de Invención Titulada:
"DERIVADOS DE YODOBENZOPIRAN-4-ONA QUE TIENEN
ACTIVIDAD FUNGICIDA."

Solicitante: BAYER CROPSCIENCE S.A.

SUSTITUCIÓN DE PODER

CARLOS R. OLARTE, mayor y vecino de Bogotá. D.C., identificado como aparece al pie de mi firma, actuando en mi carácter de apoderado de la sociedad de la referencia, respetuosamente me permito manifestar que SUSTITUYO el poder a mi conferido por la mencionada sociedad en el doctor ALVARO CORREA ORDOÑEZ, identificado con la Cédula de Ciudadanía número 79.143.366 de Usaquén y con la Tarjeta Profesional número 20.281, para que sea él quien en adelante, asuma el trámite de la presente solicitud.

El apoderado sustituto queda con las mismas facultades del principal.

Atentamente,



CARLOS R OLARTE
C.C. No. 79.782.747 de Bogotá
T. P. No. 74.295 del Consejo Superior de la Judicatura

**DILIGENCIA DE RECONOCIMIENTO
Y PRESENTACION PERSONAL**

Ante el Notario Once del Circulo de Santa Fe de
Bogotá, compareció [Firma]

Quien exhibió la C.C. No. 749
expedida en [Firma] I.P. 749
y declaró que la firma y huella que aparecen en
el presente memorial son suyas y que el conte-
nido del mismo es cierto.
Memorial dirigido a INTERESADO

25 SET 2008
Santa Fe de Bogotá, D.C.

Firma del Declarante [Firma] **HUELLA**
Autorizó la anterior Diligencia

NOTARIO ONCE DEL CIRCULO DE SANTA FE DE BOGOTÁ

REPUSLICA DE COLOMBIA
NOTARIA 11 DEL CIRCULO DE
BOGOTÁ, D. C.

XIMENA BAUTISTA NAVARRO
NOTARIA ONCE (E)

POD-02266

Patentes;

Traducción oficial del inglés/francés por Marlén Neira Castro,
resolución 2117 y 2413 del Ministerio de Justicia de Colombia.

PODER DE BAYER CROPSCIENCE SA.

Bilingüe inglés, español otorgado por Bayer Cropscience SA, con
sede en Lyon, Francia a Carlos Reinaldo Olarte y/o Alvaro Correa
Ordóñez. Firmado el 20 de febrero de 2003 ilegible por
Ludovic Balmeffrezo1
Representante Autorizado

Sello de Legalización Notarial en francés
El suscrito notario K. Gidon, Notario de Chasselay- Ródano,
certifica la autenticidad de la firma del Sr. Ludovic Balmeffrezo1
puesta en el documento, fechado el 21- 02- 2003. Firma y sello
ilegible de Notario.

Sello en reverso en francés:

APOSTILLA

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

1. País : República Francesa
Este documento Público
2. ha sido firmado por Gidon Karine
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de Notario de Chasselay - Ródano

CERTIFICADO

5. En Lyon
6. El 21 febrero 2003
7. Por el Procurador General ante el Tribunal de Apelación
8. No. 352 - ilegible
9. Gran Sello del Tribunal de Apelación de Lyon- Procurador General
10. Firma ilegible.

CERTIFICADO NOTARIAL (COMPAÑÍAS)

El suscrito certifica por la presente que:

BAYER CROPSCIENCE S.A.

(Anotar el nombre de la compañía y la dirección completa)

Domiciliada en el número 55 Avenue René Cassin - 69000 Lyon, Francia, es una

MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987

Marlen Neira Castro
MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Francés - Español - Francés
Resolución No. 2413 del 12 Nov. 1987

07 OCT 2003
NOTARIO OFICIAL DE ESTE
ESTADO PARA POR QUE ESTA
OTOCOPIA CONFORME CON EL
ORIGINAL DE LA VERDAD.

-compañía debidamente constituida en virtud de las leyes de Francia,
 (anotar el nombre del Estado o país)
 y que Ludovic Balmeffrazol
 (anotar el apellido y nombre del firmante del poder que compromete a la compañía)
 quien firmó el documento en su condición de representante legal de la compañía,
 y está autorizado a suscribir todos los documentos relativos a la propiedad
 industrial por cuenta de la compañía.
 Fechado el 20 de febrero de 2003.
 Firma y sello ilegible de Notario: Bidon Karine- Chasselay- Ródano.

APOSTILLA

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

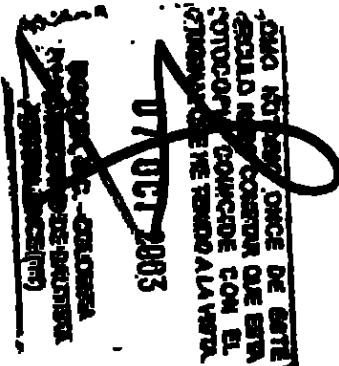
1. País : República Francesa
 Este documento Público
2. ha sido firmado por Bidon Karine
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de Notario de Chasselay - Ródano

CERTIFICADO

5. En Lyon
6. El 21 febrero 2003
7. Por el Procurador General ante el Tribunal de Apelación
8. No. 352 - ilegible
9. Gran Sello del Tribunal de Apelación de Lyon- Procurador General
10. Firma ilegible.

Es traducción fiel del francés, con copia archivo para confrontación. Bogotá 15-
 3-03-

Marlen Neira C.
 MARLEN NEIRA CASTRO
 Traductor e Intérprete Oficial
 Inglés - Español - Inglés
 Resolución No. 2413 del 12 Nov. 1987
 Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987



000008

MAINSE, LARA, RUBIQUER, RUEBA DE GONZALEZ
Members of the Firm
BAKER & MCKENZIE
APARTADO AEREO 3746
BOGOTA, COLOMBIA

POWER OF ATTORNEY

The undersigned,

BAYER CROPSCIENCE S.A.

located in
55 avenue René Cassin
69009 LYON, France

declares that it hereby grants to

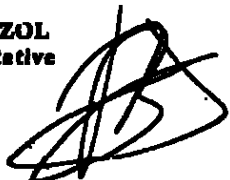
**CARLOS REINALDO OLARTE AND/OR
ALVARO CORREA ORDONEZ**

a full and sufficient power of attorney to apply to the proper national officers and authorities for the purpose of: Letters Patent, mergers, changes of name, assignments, filing and prosecution of oppositions, changes of address to which end it empowers them to take all steps necessary before said authorities for the objects stated, to file petitions, prepare descriptions, make protests, declarations, appeals and objections, pay imports, apply for certifications, receive documents and securities, abandon applications and collect refunds. To the said mandatory sufficient power is granted hereby to receive notifications for and on behalf of the Company, to confer powers on those who are to represent the company judicially and extrajudicially, to answer in court in the matter of all claims and demands that may be presented in connection with the marks, and to do everything that may be required, before administrative or judicial officers of any class giving them likewise power to substitute these presents and revoke such substitutions if necessary.

Done and subscribed in Lyon

on the 20 day of february 2003

Slavko BALMEFREZOL
Authorized Representative



P O D E R

La abajo firmada

BAYER CROPSCIENCE S.A.

domiciliada en
55 Avenue René Cassin
69009 Lyon, Francia

declara por el presente otorgar a

**CARLOS REINALDO OLARTE y/o
ALVARO CORREA ORDONEZ**

poder especial amplio y bastante para recabar de las oficinas y autoridades nacionales que correspondan, la obtención de: Patentes de Invención, fusiones, cambios de nombre, traspasos, presentación y trámite de oposiciones, cambios de dirección a cuyo efecto los faculta para dar ante dichas autoridades, todos los pasos necesarios al objeto indicado, elevar solicitudes, formular descripciones, protestas, declaraciones, apelaciones y reclamos, oblar impuestos, solicitar testimonios, recibir documentos y valores, desistir y percibir. Se concede a los expresados mandatarios poder bastante para recibir notificaciones a nombre de la compañía, otorgar poderes a quienes vayan a representar a la compañía judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a todas las reclamaciones o demandas que por motivo de las marcas se presentaren y hacer cuanto fuere necesario, ante las autoridades administrativas o judiciales de cualquier orden, dándoles asimismo facultad para sustituir el presente y en caso necesario revocar dichas sustituciones.

Dado y firmado en

a los 20 días del mes Febrero de 2003

Je soussigné **Slavko BALMEFREZOL**
Notaire (Chambre Rhône)
Certifie sincèrement la signature de
M. CARLOS REINALDO OLARTE y/o
qui a été faite le 20/02/2003.



112 HAFINA

27 OCT 2003

COPIA DE ESTE
DOCUMENTO QUE ESTA
OTORGADA CON EL
QUE SE TENDRA A LA VISTA

BOGOTA, D.C. - COLOMBIA
BOGOTA, D.C. - COLOMBIA
BOGOTA, D.C. - COLOMBIA

APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)
Colombie

1. — République française
- Le préposé: notaire public
2. — à: GIDON Karine
3. — ag: notaire
4. — en: seu de son étude
- à CHASSELAY (Rhône)

Attesté

5. — à LYON
6. — le 21 février 2003
7. — Par le Procureur général près la cour d'appel
8. — sous n° 352

10. — Signature



COU NOTARIAL ONCE DE CATE
ACORD NOTARIAL QUE EST
OTOCOPIA ONCE CON EL
TRABAJO DE TRABAJO ALIADO.

07/02/2003

RECIBO DE LA COPIA
DEL NOTARIO DE LA
PROCURADURIA GENERAL
DE LA CORTE DE APPEL
DE LYON

CERTIFICAT NOTARIE (SOCIETE)

Le soussigné certifie par la présente que

BAYER CROPS SCIENCE S.A.

(préciser la raison sociale et l'adresse et l'adresse complète de la Société)

domiciliée : **55 avenue René Cassin - 69009 LYON , France**

est une Société dûment constituée en vertu des lois de la France

(Insérer le nom de l'Etat ou du Pays)

et que **Ludovic BALMEFREZOL**

(Insérer les nom et prénom du signataire du pouvoir pour le compte de la Société)

qui a signé le document en qualité de représentant légal de

la Société et est autorisé à souscrire

tous documents relative à la propriété industrielle

pour le compte de celle-ci.

Date : 20 Février 2003

Sceau

Notaire



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Colombie

1. — République française
- Le présent acte public
2. — a été : **G. Duval Kacine**
3. — par : **Notaire**
4. — en : **son étude**
- à **CHASSELAY (Rhône)**
- Attesté
5. — à **LYON** le **21 février 2003**
7. — Par le Procureur général près la cour d'appel
8. — sous n° **352**
10. — Signature



COPIA NOTARIAL DE ESTE
ACTO HA SIDO COPIADA CON EL
OTOCOPIA COPIADA CON EL
OTOCOPIA QUE SE ENCONTRA A LA VENTA

21 FEB 2003

Legalizaciones correspondientes a la Cesión otorgada a Bayer Cropscience S.A.

Número 20 del archivo de documentos para el año 2004

Por este medio, autentico la firma anterior reconocida ante mí de

Señor Dr. Rainer Preuss
Jockelegraben 1a, 85510, Idstein
- conocido personal -

No existía impedimento alguno, de acuerdo con el § 3, apart 1, No. 7, de la Ley de autenticaciones.

Frankfurt am Main, - Höchst, enero 23 de 2004.

Armin Kripfer, Notario
(firma y sello del Notario)

cálculo de costos: - valor:	5.000,00 euros
Derechos § 45 I Ley de costos	10,50 euros
16% IVA	1,88 euros
	12,18 euros

Armin Kripfer, Notario
(firma y sello)

Apostille

(Convention de la Haya du octobre 1961)

1. País: República de Alemania

el presente documento oficial

2. está firmado por el Armin Kripfer

3. en su calidad de Notario

4. el mismo está provisto del sello del Notario

Certificado

5. en Innsbruck

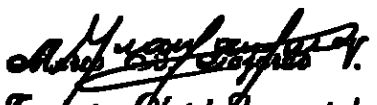
6. El 26 de Enero de 2004

7. por la Presidencia del gobierno regional de Landgericht

8. bajo el No. 704

9. Sello

10. Firma de Maria Garber
(firma y sello)


Traductor Oficial Juramentado
Reord. Min. Justicia No. 839/86

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA
MEMBERS OF THE FIRM
BAKER & MCKENZIE

ATTORNEYS AT LAW
CALLE 35 NO. 7-25, 4TH FLOOR
BOGOTA, D.C. COLOMBIA
TELEPHONE (57-1) 332-2800
FACSIMILE (57-1) 285-8908
NIT 890.068.840-3
OFFICE. BOGOTA@BAKERIN ET. COM
WWW.BAKERINFO.COM

ASSIGNMENT

Our Ref : PM01028

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,

PREUSS Rainer, PEREZ Joseph,

CARBONNE Stéphane

by means of this document assign(s) to

Bayer CropScience S.A.

A corporation organized under the laws of

France

domiciled in 16 rue Jean-Marie Leclair, 69009 LYON,
France

(hereinafter referred to as the "ASSIGNEE"), all my (our)
rights, title and interest in and to my (our) invention for a
new and useful improvement entitled and as fully set forth
and described in:

**Iodobenzopyran-4-one derivatives having fungicidal
activity**

so far as the Republic of Colombia is concerned.

Place, date and signature

Nov. 20, 2007

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,

PREUSS Rainer, PEREZ Joseph, CARBONNE Stéphane

CESION

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,
PREUSS Rainer PEREZ Joseph ,
CARBONNE Stéphane

por medio de la presente cedo (cedemos) a

BAYER CROPSCIENCE S. A.

una corporacion organizada bajo las leyes de

Francia

domiciliada en 16 rue Jean-Marie Leclair,
69009 LYON, France

(de ahora en adelante el "CESIONARIO"), todos mis
(nuestros) derechos, título e interés sobre mi (nuestra)
invención tal como describe en:

**Derivados de yodobenzopirán-4-ona que
tienen actividad fungicida**

en lo que concierne a la Republica de Colombia.

Lugar, fecha y firma

to be notarized and Apostille

Nummer 20 der Urkundenrolle für das Jahr 2004

Vorstehende vor mir anerkannte Unterschrift von

Herrn Dr. Rainer Preuss
Jeckelsgraben 1a, 65510 Idstein
-von Person bekannt-

beglaubige ich hiermit amtlich. .

Eine Vorbefassung gemäß § 3 Abs. 1 Nr. 7 BeurkG lag nicht vor.

Frankfurt/M.-Höchst, den 23. Januar 2004



Armin Knipfer, Notar

Kostenrechnung-Wert:	€	5.000,00
Geb. § 45 I KostO	€	10,50
16 % Mehrwertsteuer	€	1,68
	€	12,18
		=====

Armin Knipfer, Notar

APOSTILLE (Convention de la Haye du 5 octobre 1954)	
1. Land: Bundesrepublik Deutschland	
Diese öffentliche Urkunde	
2. ist unterschrieben von <u>Armin Knipfer</u>	
3. in seiner Eigenschaft als <u>amtlich bestellter Notar</u>	
4. sie ist versehen mit dem Siegel/Stampel des(der) <u>Notars</u>	
Bestätigt	
5. in Frankfurt/Main	6. am <u>23. Jan. 2004</u>
7. durch den Herrn Präsidenten des Landgerichts	
8. unter Nr. 91 Ea A <u>104</u>	
9. Siegel/Stampel	10. Unterschrift
	<u>Schlitz</u>



Legalizaciones Cesión otorgada a Bayer CropScience S.A. por WEGMANN Thomas, Huser Nathalie, PREUSS Rainer, PEREZ Joseph, CARBONNE Stéphane.

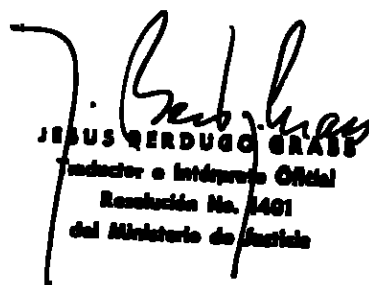
Yo el suscrito K. Gidon, Notario de Chasselay (Rhône) certifico auténticas las firmas de los señores WEGMANN, PÉREZ CARBONE, HUSER, suscritas en este documento. Chasselay, 08.01.2004

Apostille
(Convention de la Haya du octobre 1961)

1. País: República de Francia
- el presente documento oficial
2. está firmado por Gidon Karine
3. en su calidad de Notario
4. el mismo está provisto del sello de Chasselay (Rhône)

Certificado

5. en Lyon
6. El 12 de Enero de 2004
7. por el Procurador General de la Corte de Apelaciones
8. bajo el No. 71
9. Sello
10. Firma
(firma y sello)


JESUS VERDUGO GRASS
Traductor e Intérprete Oficial
Resolución No. 1401
del Ministerio de Justicia

RAISBECK, LARA, RODRIGUEZ & RUEDA
MEMBERS OF THE FIRM
BAKER & MCKENZIE

000014

ATTORNEYS AT LAW
CALLE 35 NO. 7-25, 4TH FLOOR
BOGOTA, D.C. COLOMBIA
TELEPHONE (57- 1) 332-2800
FACSIMILE (57- 1) 285-8908
NIT 860.068.840-3
OFFICE. BOGOTA@BAKER ET. COM
WWW.BAKERINFO.COM

ASSIGNMENT

Our Ref : PM01029

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,
PREUSS Rainer, PEREZ Joseph,
CARBONNE Stéphane

by means of this document assign(s) to
Bayer CropScience S.A.

A corporation organized under the laws of
France

domiciled in 16 rue Jean-Marie Leclair, 69009 LYON,
France

(hereinafter referred to as the "ASSIGNEE"), all my (our)
rights, title and interest in and to my (our) invention for a
new and useful Improvement entitled and as fully set forth
and described in:

Iodobenzopyran-4-one derivatives having fungicidal
activity

so far as the Republic of Colombia is concerned.

Place, date and signature

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,

PREUSS Rainer, PEREZ Joseph, CARBONNE Stéphane

CESION

WEGMANN Thomas, HUSER Nathalie,
PREUSS Rainer, PEREZ Joseph,
CARBONNE Stéphane

por medio de la presente cedo (cedemos) a
Bayer CropScience S. A.

una corporacion organizada bajo las leyes de
Francia .

domiciliada en 16 rue Jean-Marie Leclair,
69009 LYON, Francia

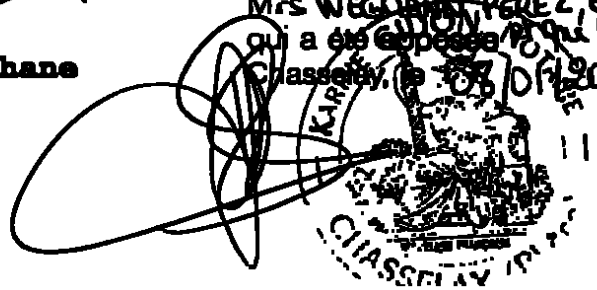
(de ahora en adelante el "CESIONARIO"), todos mis
(nuestros) derechos, título a interes sobre mi (nuestra)
invencion tal como describe en:

Derivados de yodobenzopiran-4-ona que
tienen actividad fungicida

en to que conerne a la Republica de Colombia.

Lugar, fecha y firma

Je soussigné M^e KGIDON
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la elgnature de
Mrs WEGMANN, PEREZ, CARBONNE
qui a été apposée par HUSER
Chasselay, le 08/07/2004



Bayer 2002/000151

LA COUR

de l'Appel de Lyon (ordonnance 1997)

Colombie

1997

Chiffre

Bidouf Karine

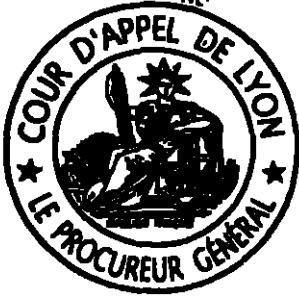
Notaire

Monétise

Chasseloy (Même)

Mon 12 JAN. 2004

21



[Handwritten signature]

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

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
20 February 2003 (20.02.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/014103 A1

(51) International Patent Classification⁷: C07D 311/56,
311/22, A01N 43/16

LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) International Application Number: PCT/EP02/09418

(22) International Filing Date: 31 July 2002 (31.07.2002)

(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, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK,
TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
0110430 3 August 2001 (03.08.2001) FR

Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted
a patent (Rule 4.17(ii)) for the following designations 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, OM, PH, PL, PT, RO, RU,
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,
UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW. 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, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,
GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR). OAPI patent (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG)

— of inventorship (Rule 4.17(i)) for US only

Published:

— with international search report

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

(71) Applicant (for all designated States except US): AVENTIS
CROPSCIENCE S.A. [FR/FR]; 55 avenue René Cassin,
F-69009-LYON (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventor/Applicants (for US only): WEGMANN,
Thomas [DE/FR]; 21 route de Saint Romain, F-69450
SAINT-CYR-AU-MONT-D'OR (FR). HUSER, Nathalie
[FR/FR]; 3 avenue Douaumont, F-69009 LYON (FR).
PREUSS, Rainer, Karl [DE/FR]; 27 quai Jean-Bap-
tiste Simon, F-69270 PONTAINES-SUR-SAONE (FR).
PEREZ, Joseph [FR/FR]; 9 chemin de Montpellier,
F-69009 LYON (FR).

(74) Agent: AVENTIS CROPSCIENCE S.A.; 14-20 rue
Pierre Baizet, F-69009 LYON (FR).

(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, FR, GB, GR, GU, GH,
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,

WO 03/014103 A1

(54) Title: IODOBENZOPYRAN-4-ONE DERIVATIVES HAVING FUNGICIDAL ACTIVITY

(57) Abstract: The present invention relates to iodobenzopyran-4-one derivatives possessing fungicidal properties against phytopathogenic organisms, a method for preparing some of these derivatives, their use for protecting plants, and fungicidal compositions comprising such derivatives in combination with one or more other fungicidal compounds.

000016

Iodobenzopyran-4-one derivatives having fungicidal activity**Description**

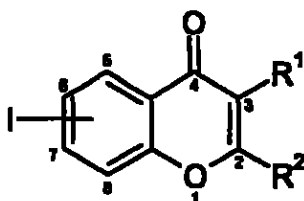
The present invention relates to iodobenzopyran-4-one derivatives possessing fungicidal properties against phytopathogenic organisms, a method
5 for preparing some of these derivatives, their use for protecting plants, and fungicidal compositions comprising such derivatives in combination with one or more other fungicidal compounds.

International Patent Application WO-97/13762 describes in particular derivatives of the halobenzopyranone type. This document discloses a very
10 large number of compounds by means of a very general chemical formula. However, the compounds given as examples are essentially compounds carrying a bromine atom or a carbon chain on the benzene ring. Thus, this document focuses on compounds which are not substituted with an iodine atom as is the case of the present invention. Indeed, only two iodinated compounds
15 are disclosed by this document without however indicating that such compounds can possess properties which are superior to the other derivatives, in particular the brominated derivatives.

It has now been discovered that certain particular iodobenzopyran-4-one derivatives possess excellent fungicidal properties against phytopathogenic
20 organisms. These properties may be further improved when these compounds are used as a mixture with one or more other fungicidal compounds.

A first aspect of the present invention relates to the compounds of formula

(I)



(I)

in which:

- the iodine atom is placed in the 5, 6, 7 or 8 position;

- R^1 is chosen from a halogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical;

5 - R^2 is chosen from a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, a halogen atom, the cyano radical, the radical $-W-R^3$;

10 - W is chosen from oxygen, sulphur or the radical $-NR^4$;

 - R^3 and R^4 , which are identical or different, are chosen, independently of each other, from the hydrogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical, an alkoxy radical, an amino radical, a 3- to
15 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, R^3 and R^4 may form together a 5- to 7-membered heterocycle which may be saturated, unsaturated or aromatic, and which may also comprise another heteroatom; and their possible geometric and/or optical isomers, in pure form or in the form of mixtures, in any
20 proportions, including the racemic mixture(s), their possible N-oxides, addition salts with an acid, and their possible metal or metalloid complexes; R^3 being different from the methyl radical or the butyl radical when the iodine is in the 6-position, when R^1 is the n-propyl radical and when W represents oxygen.

 When the radicals of the compounds of formula (I) are substituted, they
25 are substituted in a preferred manner with one or more groups which may be chosen independently of each other from alkyl, alkenyl and alkynyl radicals, a halogen atom, the cyano, trialkylsilyl, alkoxy, alkylthio, hydroxyl, nitro, amino, acyl, acyloxy, phenyl, heterocyclyl, phenylthio, phenoxy, heterocyclyloxy or

heterocyclithio radical and oxidized derivatives and may be optionally substituted with chemical entities containing a thio group.

The term heterocyclyl comprises heteroaryl groups and non-aromatic heterocyclyl groups which may be saturated or unsaturated.

5 The heteroaryl groups are generally 5- or 6-membered rings containing up to 4 heteroatoms chosen from nitrogen, oxygen and sulphur, optionally fused with a benzene ring. As examples of heteroaryl groups, there especially may be mentioned groups derived from thiophene, furan, pyrrole, thiazole, oxazole, imidazole, isothiazole, isoxazole, pyrazole, 1,3,4-oxadiazole, 1,3,4-thiadiazole,
10 1,2,4-oxadiazole, 1,2,4-thiadiazole, 1,2,4-triazole, 1,2,3-triazole, tetrazole, benzo[b]thiophene, benzo[b]furan, indole, benzo[c]thiophene, benzo[c]furan, isoindole, benzoxazole, benzothiazole, benzimidazole, benzisoxazole, benzisothiazole, indazole, benzothiadiazole, benzotriazole, dibenzofuran, dibenzothienophene, carbazole, pyridine, pyrazine, pyrimidine, pyridazine, 1,3,5-
15 triazine, 1,2,4-triazine, 1,2,4,5-tetrazine, quinoline, isoquinoline, quinoxaline, quinazoline, cinnoline, 1,8-naphthyridine, 1,5-naphthyridine, 1,6-naphthyridine, 1,7-naphthyridine, phthalazine, pyridopyrimidine, purine or pteridine.

The non-aromatic heterocyclyl groups are generally 3-, 5-, 6- or 7-membered rings containing up to 3 heteroatoms chosen from nitrogen, oxygen
20 and sulphur, for example oxiranyl, thiranyl, thiazolanyl, dioxolanyl, 1,3-benzoxazolanyl, 1,3-benzothiazinyl, morpholino, pyrazolanyl, sulpholanyl, dihydroquinazolanyl, piperidanyl, phthalimido, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, pyrrolidinyl, indolanyl, 2-oxopyrrolidino, 2-oxobenzoxazolin-3-yl or tetrahydroazepinyl.

25 The substituents, when they are present, on the phenyl or heterocyclyl groups may, for example, be halogen atoms, CN, NO₂, SF₃, B(OH)₂, trialkylsilyl, acyl, O-acyl or a radical E, OE or S(O)_n E as defined above for R² or alternatively is an optionally substituted amino radical; or alternatively two adjacent groups on the ring, together with the atoms to which they are attached,

form a carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted in a similar manner.

The term acyl comprises the acid residues containing sulphur or phosphorus and the carboxylic acid residues. Examples of acyl groups are thus
 5 -COR⁵, -COOR⁵, -CINR⁵R⁶, -CON(R⁵)OR⁶, -COONR⁵R⁶, -CON(R⁵)NR⁶R⁷,
 -COSR⁵, -CSSR⁵, -S(O)_qR⁵, -S(O)₂OR⁵, -S(O)_qNR⁵R⁶, -P(=L)(OR⁵)(OR⁶) or
 -COOR⁵, in which R⁵, R⁶ and R⁷, which may be identical or different, represent
 the hydrogen atom, an optionally substituted alkyl radical, an optionally
 substituted cycloalkyl radical, an optionally substituted cycloalkenyl radical, an
 10 optionally substituted alkenyl radical, an optionally substituted alkynyl radical,
 an optionally substituted phenyl group or an optionally substituted heterocyclyl
 group, or alternatively R⁵ and R⁶, or R⁶ and R⁷, together with the atom(s) to
 which they are attached, may form a ring, q represents 1 or 2 and L represents
 O or S.

15 The amino radicals may be substituted, for example, with one or two
 optionally substituted alkyl or optionally substituted acyl radicals, or alternatively
 two substituents may form a ring, preferably a 5- to 7-membered ring, which
 may be substituted and which may contain other heteroatoms, and for example
 morpholine.

20 Among the compounds of formula (I) there are preferred those possessing
 at least one of the following characteristics:

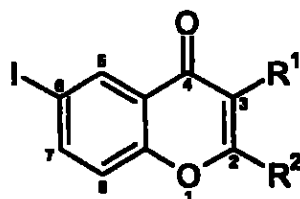
- the iodine atom is in the 6-position;
- R¹ represents a C₂-C₄ alkyl radical;
- R² represents the radical -W-R³ in which W represents oxygen and R³ is

25 as defined above.

The most preferred compounds of formula (I) simultaneously possess
 these three characteristics, in particular the compounds of formula (I) in which
 R³ represents a C₁-C₆ alkyl radical, a C₁-C₆ alkenyl radical or a C₁-C₆ alkynyl

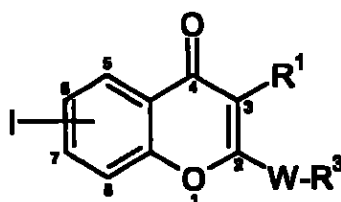
radical or alternatively the compounds of formula (I) in which R¹ is a n-propyl radical.

Among the compounds of formula (I), there may be mentioned, by way of examples, the following compounds of formulae (Ia) and (Ib) which do not limit
5 the scope of the present invention:

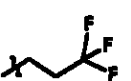


(Ia)

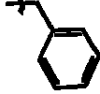
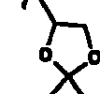
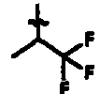
Example	R1	R2
1		
2		
3		
4		
5		
6		
7		
8		
9		

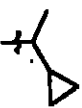
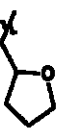
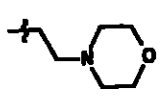
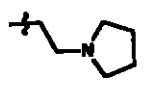
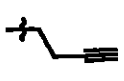
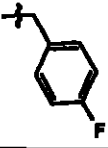


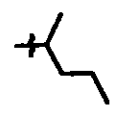
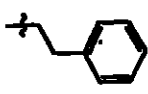
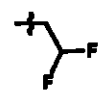
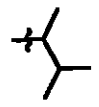
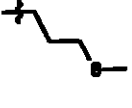
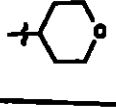
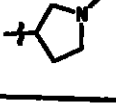
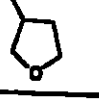
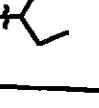
(Ib)

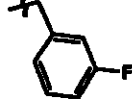
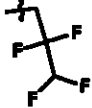
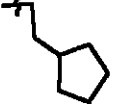
Example	I	W	R1	R3
10	8-1	O		
11	8-1	O		
12	8-1	O		
13	8-1	O		
14	8-1	O		
15	8-1	O		
16	8-1	O		
17	8-1	O		
18	8-1	O		
19	8-1	O		

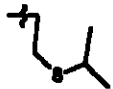
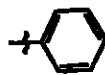
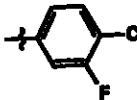
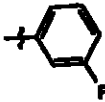
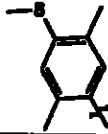
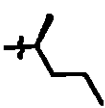
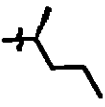
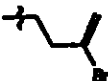
Example	I	W	R1	R3
20	6-1	O		
21	6-1	O		
22	6-1	O		
23	6-1	O		
24	6-1	O		
25	6-1	O		
26	6-1	O		
27	6-1	O		
28	6-1	O		
29	6-1	O		

Example	I	W	R1	R3
30	6-1	0		
31	6-1	0		
32	6-1	0		
33	6-1	0		
34	6-1	0		
35	6-1	0		
36	6-1	0		
37	6-1	0		
38	6-1	0		
39	6-1	0		

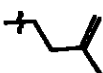
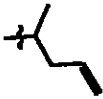
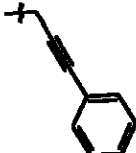
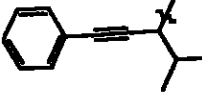
Example	I	W	R1	R3
40	6-1	O		
41	6-1	O		
42	6-1	O		
43	6-1	O		
44	6-1	O		
45	6-1	O		
46	6-1	O		
47	6-1	O		
48	6-1	O		
49	6-1	O		

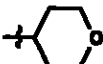
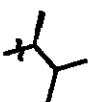
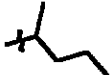
Example	I	W	R1	R3
50	6-1	O		
51	6-1	O		
52	6-1	O		
53	6-1	O		
54	6-1	O		
55	6-1	O		
56	6-1	O		
57	6-1	O		
58	6-1	O		
59	6-1	O		

Example	I	W	R1	R3
60	6-1	0		
61	6-1	0		
62	6-1	0		
63	6-1	0		
64	6-1	0		
65	6-1	0		
66	6-1	0		
67	6-1	0		
68	6-1	0		
69	6-1	0		

Example	I	W	R1	R3
70	8-1	O		
71	8-1	O		
72	8-1	O		+H
73	8-1	O		
74	8-1	O		
75	8-1	O		
76	8-1	O		
77	8-1	O		
78	8-1	O		
79	8-1	O		

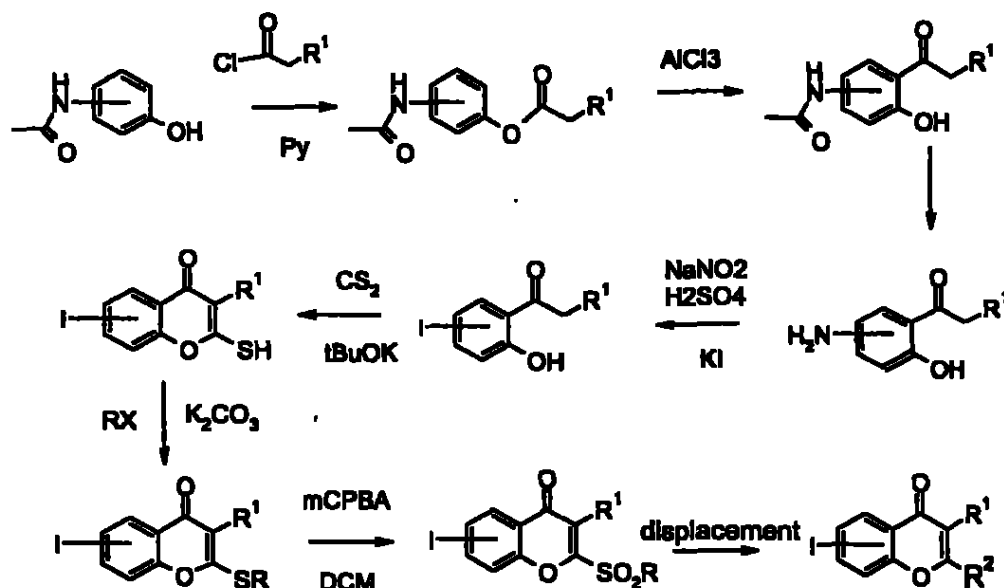
22

Example	I	W	R1	R3
80	8-1	O		
81	8-1	O		
82	8-1	O		
83	8-1	O		
84	8-1	O		
85	8-1	O		
86	8-1	O		
87	8-1	O		
88	8-1	O		

Example	I	W	R1	R3
88	8-1	O		
89	8-1	O		
90	8-1	O		
91	8-1	O		
92	8-1	O		
93	8-1	O		
94	8-1	O		
95	8-1	O		
96	8-1	O		
97	8-1	O		
98	8-1	NR4		R3=R4=H

The compounds of the present invention may be prepared by numerous methods which are known procedures, in particular those disclosed in Patent Application EP-861 242.

- 5 In a particularly advantageous manner, the compounds of formula (I) may also be prepared according to the following method:



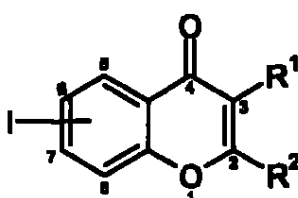
This method constitutes another aspect of this invention.

- 10 Other methods may also be used to prepare the compounds of formula (I), such as methods similar to those described in *Chemistry and Industry*, (1980), 116; *J. Chem. Soc. Chem. Com.*, 1, (1981), 282 and *J. Org. Chem.*, (1992), 57, 6502.

- 15 The reagents and some of the intermediate compounds useful for the preparation of the compounds of formula (I) may be prepared by methods known to persons skilled in the art.

Another aspect of the present invention relates to a fungicidal composition comprising

- a) a compound of formula (I):



In which:

- the iodine atom is placed in the 5, 6, 7 or 8 position;**

- R² is chosen from a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkyl radical, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkynyl radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, a halogen atom, the cyano radical, the radical -W-R³;

- W is chosen from oxygen, sulphur or the radical -NR⁴;

- R^3 and R^4 , which are identical or different, are chosen, independently of

each other, from the hydrogen atom, a substituted or unsubstituted C₁-C₈ alkyl radical, a substituted or unsubstituted C₁-C₈ alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C₁-C₈ alkynyl radical, an alkoxy radical, an amino radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, R³ and R⁴ may form together a 5- to 7-membered heterocycle which may be saturated, unsaturated or aromatic, and which may also comprise another heteroatom; and their possible geometric and/or optical isomers, in pure form or in the form of mixtures, in any proportions, including the racemic mixture(s), their possible N-oxides, addition salts with an acid, and their possible metal or metalloid complexes;

- b) at least one other fungicidal compound.**

The preferred compounds of formula (I) for the composition according to the invention are those possessing at least one of the following characteristics:

- the iodine atom is in the 6-position;
- R¹ represents a C₂-C₄ alkyl radical;

- R² represents the radical -W-R³ in which W represents oxygen and R³ is as defined above.

The most preferred compounds of formula (I) for the composition according to the invention simultaneously possess these three characteristics, In particular the compounds of formula (I) in which R³ represents a C₁-C₈ alkyl radical, a C₁-C₈ alkenyl radical or a C₁-C₈ alkynyl radical or alternatively the compounds of formula (I) in which R¹ is a n-propyl radical.

There may be mentioned in particular the compounds whose chemical name is the following:

- 10
 - 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 2-ethoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 6-iodo-2-propoxy-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 2-but-2-ynyloxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 15
 - 2-but-3-enyloxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one,
 - 3-butyl-6-iodo-2-isopropoxy-benzopyran-4-one,
 - 6-iodo-3-propyl-2-(tetrahydro-pyran-4-yloxy)-benzopyran-4-one,
 - 6-iodo-3-propyl-2-(2,2,2-trifluoro-ethoxy)-benzopyran-4-one.

In the composition according to the invention, there is preferred the use of fungicidal compounds chosen from

b1) compounds capable of inhibiting the transport of electrons in the mitochondrial ubiquinol:ferricytochrome-c oxidoreductase respiratory chain of phytopathogenic fungal organisms, in particular strobilurin derivatives such as azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, pycoxystrobin, pyraclostrobin, trifloxystrobin, or fenamidone or famoxadone; or

b2) the compounds capable of inhibiting the biosynthesis of ergosterol, in particular compounds of the triazole type such as bromuconazole, epoxyconazole, fluquinconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole.

As other preferred compounds which may be used in the composition according to the invention, there may be mentioned cyprodinil, dinocap, fenpropidin, fenpropimorph, fosetyl, iprovalicarb, quinoxifen, spiroxamine.

As particular combinations of compounds of formula (I) with one or more other fungicidal compounds, the following combinations are preferred:

- | Compounds of formula (I): | Compound(s) b: |
|--|-------------------|
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + trifloxystrobin |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + pyraclostrobin |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + picoxystrobin |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + kresoxym-methyl |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fluquinconazole |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + tebuconazole |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + prochloraz |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + prothioconazole |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + triadimefon |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + triadimenol |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + triticonazole |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + epoxiconazole |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + dinocap |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + spiroxamine |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fenpropidin |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fenpropimorph |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + quinoxifen |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + cyprodinil |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fosetyl-Al |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fenamidone |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + iprovalicarb |
| • 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one | + fluoxastrobin |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + trifloxystrobin |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + pyraclostrobin |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + picoxystrobin |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + kresoxym-methyl |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + fluquinconazole |
| • 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one | + tebuconazole |

- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + prochloraz
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + prothioconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + triadimefon
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + triadimenol
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + triticonazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + epoxiconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + dinocap
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + spiroxamine
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fenpropidine
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fenpropimorph
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + quinoxifen
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + cyprodinil
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fosetyl-al
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fenamidone
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + iprovalicarb
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin

- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ fluquinconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ tebuconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ prochloraz
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ prothioconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ spiroxamine
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ fluquinconazole

- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ tebuconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin+ prochloraz
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ prothioconazole
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ spiroxamine
- 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyran-4-one + fosetyl-al + fenamidone
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ fluquinconazole
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ tebuconazole
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ prochloraz
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ prothioconazole
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + trifloxystrobin
+ spiroxamine
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ fluquinconazole
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ tebuconazole
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ prochloraz
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ prothioconazole

- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fluoxastrobin
+ spiroxamine
- 6-iodo-2-(1-methyl-butoxy)-3-propyl-benzopyran-4-one + fosetyl-Al
+ fenamidone

It has been possible to demonstrate a synergistic effect linked to the use of the composition according to the invention.

For their use, the compounds of formula (I) and the compositions comprising a compound of formula (I) combined with one or more other fungicidal compounds are usually mixed with a carrier and a surfactant which
5 are acceptable for use in agriculture.

The carrier or diluent in the composition according to the present invention may be a solid or a liquid, optionally in combination with a surfactant, for example a dispersing agent, an emulsifying agent or a wetting agent.

10 Suitable surfactants comprise anionic compounds such as a carboxylate, for example a metal carboxylate having a long chain fatty acid; a N-acylsarcosinate; mono- or diesters of phosphoric acid with fatty alcohol ethoxylates or alternatively salts of the said esters; fatty alcohol sulphates such as sodium dodecyl sulphate, sodium octadecyl sulphate or sodium cetyl
15 sulphate; ethoxylated fatty alcohol sulphates; ethoxylated alkylphenol sulphates; lignosulphonates; petroleum sulphonates; alkylaryl sulphonates such as alkylbenzene sulphonates or low alkylnaphthalene sulphonates, for example butylnaphthalene sulphonates; salts of sulphonated naphthalene-formaldehyde condensates; salts of sulphonated phenol-formaldehyde condensates; or even
20 more complex sulphonates such as amidesulphonates, for example the sulphonated product of condensation of oleic acid with N-methyltaurine or dialkyl sulphosuccinates, for example sodium sulphonate of dioctyl succinate. Among the nonionic agents, there may be mentioned the products of
25 condensation of esters of fatty acids, of fatty alcohols, of amides of fatty acids or of phenols substituted by fatty alkyls or alkenyls with ethylene oxide, fatty esters of ethers of polyhydric alcohols, for example sorbitan fatty acid esters, products of condensation of the said esters with ethylene oxide, for example fatty acid esters of polyoxyethylene sorbitan, block copolymers of ethylene and

propylene oxide, acetylenic glycols such as 2,4,7,9-tetramethyl-5-decyne-4,7-diol, or ethoxylated acetylenic glycols.

Among the cationic surfactants, there may be mentioned, for example, an aliphatic mono-, di- or polyamine in acetate, naphthenate or oleate form; an oxygen-containing amine such as an amine oxide or a polyoxyethylene alkylamine; an amine containing an amide bond prepared by condensation of a carboxylic acid with a diamine or a polyamine; or a quaternary ammonium salt.

The compositions according to the present invention may take any forms known in the art of formulating agrochemical compounds, for example, a solution, dispersion, aqueous emulsion, pulverulent powder, formulation for treating seeds, formulation for fumigation or smoking, dispersible powder, emulsifiable concentrate or granules. Furthermore, they may be in a form suitable for direct use or in a concentrated form or in the form of a primary composition requiring dilution with a suitable quantity of water or another diluent before application.

The concentration of active ingredient(s) in the composition of the present invention, as applied to plants, is preferably in the range between 0.0001 to 1.0% by weight, particularly 0.0001 and 0.01% by weight. In a primary composition, the quantity of active ingredient may vary considerably and may be, for example, between 5 and 95% by weight of composition.

The compounds of formula (I) of the present invention, used alone or in the form of mixtures, possess activity as a fungicide, particularly against fungicidal diseases of plants, for example powdery mildews and downy mildews and particularly cereal powdery mildew (*Blumeria graminis*), vine powdery mildew (*Uncinula necator*), apple powdery mildew (*Podosphaera leucotricha*), cucurbit powdery mildews (for example *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fulginea*, *Erysiphe polygoni*), powdery mildew of Solanaceae (for example *Leveillula taurica*), powdery mildew of fruit and ornamental plants (for example *Sphaerotheca pannosa*), vine downy mildew (*Plasmopara viticola*), rice blight (*Pyricularia oryzae*), cereal eyespot (*Pseudocercospora herpotrichoides*), rice sheath blight (*Pellicularia sasakii*), grey mould (*Botrytis cinerea*), damping off (*Rhizoctonia solani*), wheat brown rust (*Puccinia recondita*), tomato or potato

blight (*Phytophthora infestans*), apple scab (*Venturia inaequalis*), glume blotch (*Leptosphaeria nodorum*).

The compounds of formula (I) may also prove to be active on other phytopathogenic fungi, including other types of powdery mildew, rusts, as well as general pathogens originating from Deuteromycetes, Ascomycetes, Phycomycetes and Basidiomycetes.

The compounds of formula (I) according to the present invention have proved particularly active against powdery mildews of cereals, vine, plants and fruit trees, vegetable crops and ornamental plants.

Another aspect of the invention therefore also relates to a method for controlling phytopathogenic fungi of crops at a site which is infested or which may be infested by them, which comprises the application to the said site of at least one compound of formula (I), alone or in combination with one or more other fungicidal compounds as described above, notably within a composition according to the present invention.

In the method according to the present invention, the compound of formula (I) is generally applied to the seeds, the plants or to the place where they grow or will grow. Thus, this compound may be applied directly to the soil before, at the time of, or after sowing such that the presence of the active ingredient in the soil can control the growth of the phytopathogenic fungi which can attack seeds. When the soil is treated directly, the active substance may be applied in any manner so that it is intimately mixed with the soil, for example by spraying, by land spreading of a solid form such as granules, or by applying the active ingredient at the time of sowing by incorporating it into the seeds in the seeder. A suitable dose for application is in the range from 5 to 1 000 g per hectare, preferably from 10 to 500 g per hectare.

An alternative consists in applying the active ingredient directly to the plant, for example by spraying or dusting, either when the phytopathogenic fungus has started to appear on the plant, or before the appearance of the said fungus as a preventive measure, or preventively and curatively. In each of these cases, the preferred method of application is foliar spraying. It is generally important to obtain good control of phytopathogenic fungi during the

first stages of plant growth, these stages being the precise moments when the plants may be the most seriously damaged. It is sometimes advantageous to treat the roots of the plant before or during planting, for example by dipping the roots in a composition comprising a compound of formula (I).

5 The invention is illustrated without limitation by the following examples.

Example of test N°1

The compounds were tested for their activity against wheat powdery mildew (*Blumeria graminis*).

10 Winter wheat (Appolo variety) was planted in France (department of Mame) in 1 m² plots, at the rate of 200 kg/ha (soil: coloured rendzina) at a depth of 3 cm.

The compounds of the invention were applied to the wheat plants in two portions: Application A at the 1 cm ear stage and then Application B at the second visible node stage. Each of these applications was carried out by spraying an aqueous solution of the compounds at a dose of 125 g of active
15 ingredient/ha.

During Application A, the intensity of attack by the fungus *Blumeria graminis* is estimated at 3% of the total foliar volume.

20 The tests of intensity of attack are carried out 52 days after Application B by evaluating the percentage of affected surface area of the second leaves (counted from the ear).

The results presented in Table 1 were obtained with the following compounds according to the invention:

Compound 1: 2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one

Compound 2: 6-iodo-2-propoxy-3-propylbenzopyran-4-one

25 Compound 3: 2-butoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one

Control: untreated plants and Compound B: quinoxyfen (commercial reference Fortress®).

Compound	% affected surface area per (second) leaf
1	0.56
2	2.53
3	2.51

Control	30.47
A	6.47
B	4.91

Table 1 (Test of intensity of attack)

Under the same conditions, a test of frequency of attack was performed by evaluating the percentage of second leaf (from the ear) attacked by the fungus *Blumeria graminis*.

5 The results obtained are presented in Table 2.

Compound	% of second leaf attacked
1	28.0
3	54.0
Control	98.7
A	78.7
B	73.3

Table 2 (Test of frequency of attack)

The results of these two tests show that the iodinated compounds of formula (I) according to the present invention are active compared with the untreated control, and also more active than the commercial reference.

10

Example of test N°2

This example gives an illustration of the biological efficacy of the compounds of formula (I) on pathogenic strains resistant to strobilurin derivatives.

The experiment was performed in a greenhouse.

- 15 Resistant strains were isolated and samples taken in 2001 in the north of Germany in the Bremen region in a place treated with pyraclostrobin and with picoxystrobin. These strains are characterized by their resistance to these strobilurin-type compounds. They were then kept in a controlled-environment chamber on wheat plants (Kanzler variety) treated with trifloxystrobin.
- 20 The tested compounds were sprayed on the wheat plants using solutions for application diluted in water to a volume equivalent to 250 l/ha. 24 h later, the plants were inoculated with powdery mildew (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*).

The extent of the disease was evaluated on each plant after 13 days of incubation.

The results obtained are assembled in Table 3 and show that the compound used allows complete control of the strains treated. These results can be

5 applied to conditions of use in the open field.

Compound applied	quantity applied (g/ha)	Percentage of leaves affected by powdery mildew (%)
Control plants without treatment	-	100
Trifloxystrobin (EC at 125 g/l - Twist®)	31	100
	62	100
	125	100
	250	100
2-ethoxy-6-iodo-3- propylbenzopyran-4-one (SC at 500 g/l)	31	0
	62	0

Table 3

Example of test N°3

This example gives an illustration of the synergistic effect obtained using the
 10 compounds according to the invention in the form of a mixture with compounds
 of the strobilurin type, in particular trifloxystrobin, triazole, in particular
 fluquinconazole. The compounds according to the invention were tested in a
 greenhouse under preventive conditions. This synergistic effect was
 demonstrated on the principal diseases affecting cereals, in particular wheat
 15 and barley powdery mildews (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici* and *Blumeria*
graminis f. sp. *hordei*), wheat brown rust (*Puccinia recondita*) and wheat glume
 blotch (*Septoria tritici* and *Septoria nodorum*).

The combinations of active ingredients in Table 4 were evaluated.

Active ingredient(s)	Ratio	Applied doses (g/ha)
----------------------	-------	----------------------

2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one (SC at 500 g/l)	-	1.5, 3, 4, 6, 8, 12, 16, 25, 31, 50, 62
fluquinconazole (SC at 100 g/l - Flamenco®)	-	3, 6, 8, 12, 16, 25, 31, 50, 62, 125
Trifloxystrobin (WG at 500 g/kg - Flint®)	-	4, 8, 16, 31, 62, 125
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one (SC at 500 g/l) + trifloxystrobin (WG at 500 g/kg)	1/1 1/2.5 1/5	
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one (SC at 500 g/l) + fluquinconazole (SC at 100 g/l)	1/1 1/2 1/5	

Table 4

The epoxyconazole and kresoxim-methyl mixture (SC 125 g/l + 125 g/l - Ogam®) was used as reference at the recommended doses for application of 62+62 g/ha and 125+125 g/ha.

5 The compounds and mixtures tested were sprayed on wheat plants:

- two replications,
- volume for application equivalent to 250 l/ha.

On the day following the application, the wheat plants were inoculated with powdery mildew (*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*), brown rust (*Puccinia recondita*), glume blotches (*Septoria tritici* and *Septoria nodorum*) and the barley plants with powdery mildew (*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*).

10

Once the diseases had developed, the evaluation was made by determining the extent of disease per pot.

The level of synergy was calculated using the Colby formula in order to
15 calculate the theoretical efficacy and to compare it to the observed efficacy.

$$\text{Theoretical efficacy of A + B} = \text{efficacy of A (\%)} + \text{efficacy of B (\%)}$$

$$- [\text{efficacy of A (\%)} \times \text{efficacy of B (\%)} / 100]$$

If the observed efficacy is higher than the theoretical efficacy, a synergistic effect is demonstrated; if it is equal, an additive effect is demonstrated; if it is lower, an antagonist effect is demonstrated.

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and fluquinconazole for controlling wheat powdery mildew are assembled in Table 5.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	6	-	25	-	-
fluquinconazole	6	-	0	-	-
	12	-	0	-	-
	31	-	0	-	-
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + fluquinconazole	6+6	1/1	93	25	+68
	6+12	1/2	90	25	+65
	6+31	1/5	95	25	+70

Table 5

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and fluquinconazole for controlling barley powdery mildew are assembled in Table 6.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	12	-	50	-	-
fluquinconazole	12	-	25	-	-
	25	-	25	-	-

	62	-	75	-	-
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + fluquinconazole	12+12	1/1	90	62.5	+28
	12+25	1/2	95	62.5	+33
	12+62	1/5	98	87.5	+11

Table 6

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and fluquinconazole for controlling wheat brown rust are assembled in Table 7.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	50	-	0	-	-
fluquinconazole	100	-	60	-	-
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + fluquinconazole	50 + 100	1/2	90	60	+30

Table 7

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and fluquinconazole for controlling wheat glume blotch (*Septoria tritici*) are assembled in Table 8.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	50	-	0	-	-
fluquinconazole	100	-	60	-	-
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + fluquinconazole	50 + 100	1/2	90	60	+30

Table 8

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and fluquinconazole for controlling wheat glume blotch (*Septoria nodorum*) are assembled in Table 9.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	50	-	0	-	-
fluquinconazole	100	-	75	-	-
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + fluquinconazole	50 + 100	1/2	95	75	+20

Table 9

- 5 These results demonstrate a high synergistic effect of the mixtures of compound of formula (I) and fluquinconazole in ratios of 1/1, 1/2 or 1/5 against wheat and barley powdery mildews, wheat brown rust and glume blotches. These mixtures make it possible to obtain excellent results of efficacy at agronomic doses for application.
- 10 The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and trifloxystrobin for controlling wheat powdery mildew are assembled in Table 10.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	6	-	25		
	16	-	50	-	-
	25	-	75		
trifloxystrobin	16	-	30	-	-
	31	-	40		

000048
31

	62	-	50		
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + trifloxystrobin	16+16	1/1	95	65	+30
	25+62	1/2.5	95	87.5	+8
	6+31	1/5	85	55	+30

Table 10

The results obtained for a mixture of compound of formula (I) according to the invention and trifloxystrobin for controlling barley powdery mildew are assembled in Table 11.

Active ingredient(s)	Dose for application (g/ha)	Ratio	Observed efficacy (%)	Theoretical efficacy (%)	Level of synergy
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one	16	-	50	-	-
	25	-	75		
trifloxystrobin	16	-	0	-	-
	62	-	0		
2-ethoxy-6-iodo-3-propylbenzopyran-4-one + trifloxystrobin	16+16	1/1	75	50	+25
	25+62	1/2.5	85	75	+10

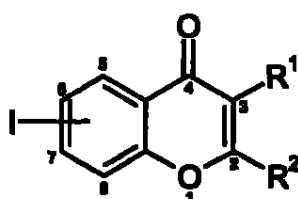
Table 11

5

These results demonstrate a high synergistic effect of the mixtures of compound of formula (I) and trifloxystrobin in ratios of 1/1, 1/2.5 or 1/5 against wheat and barley powdery mildews (on strains sensitive to compounds of the strobilurin type).

Claims

1. Compound of formula (I):



(I)

In which:

- the iodine atom is placed in the 5, 6, 7 or 8 position;

- R¹ is chosen from a halogen atom, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkyl radical, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkynyl radical;

- R² is chosen from a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkyl radical, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkynyl radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, a halogen atom, the cyano radical, the radical -W-R³;

- W is chosen from oxygen, sulphur or the radical -NR⁴;

- R³ and R⁴, which are identical or different, are chosen, independently of each other, from the hydrogen atom, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkyl radical, a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C₁-C₆ alkynyl radical, an alkoxy radical, an amino radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, R³ and R⁴ may form together a 5- to 7-membered heterocycle which may be saturated, unsaturated or aromatic, and which may also comprise another heteroatom;

and their possible geometric and/or optical isomers, in pure form or in the form of mixtures, in any proportions, including the racemic mixture(s), their possible N-oxides, addition salts with an acid, and their possible metal or metalloidal complexes; R³ being different from the methyl radical or the butyl

radical when the iodine is in the 6-position, when R^1 is the n-propyl radical and when W represents oxygen.

2. Compound according to Claim 1, for which the iodine atom is in the 6-position.

5 3. Compound according to either of Claims 1 and 2, for which R^2 is a radical $-W-R^3$.

4. Compound according to Claim 3, for which W represents oxygen.

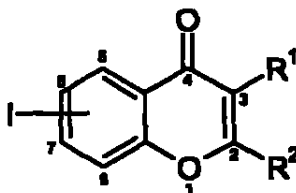
5. Compound according to any one of Claims 1 to 4, for which R^3 is a C_1-C_6 alkyl radical, a C_1-C_6 alkenyl radical or a C_1-C_6 alkynyl radical.

10 6. Compound according to any one of Claims 1 to 5, for which R^1 is a C_1-C_6 alkyl radical.

7. Compound according to Claim 6, for which R^1 is a n-propyl radical.

8. Method for preparing a compound of formula (I)

15



(I)

In which:

- the iodine atom is placed in the 5, 6, 7 or 8 position;

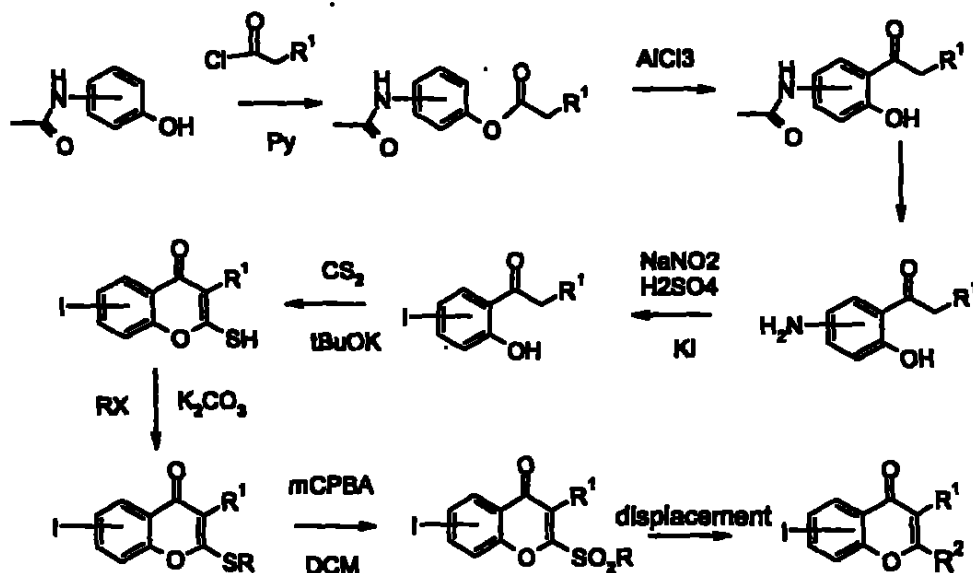
20 - R^1 is chosen from a halogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkynyl radical;

- R^2 is chosen from a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_6 alkynyl radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, a halogen atom, the cyano radical, the radical $-W-R^3$;

- W is chosen from oxygen, sulphur or the radical $-NR^4$;

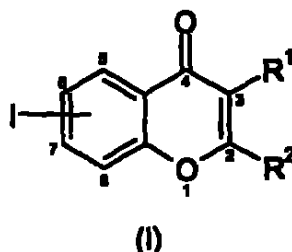
- R^3 and R^4 , which are identical or different, are chosen, independently of each other, from the hydrogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical, an alkoxy radical, an amino radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, R^3 and R^4 may form together a 5- to 7-membered heterocycle which may be saturated, unsaturated or aromatic, and which may also comprise another heteroatom;

and their possible geometric and/or optical isomers, in pure form or in the form of mixtures, in any proportions, including the racemic mixture(s), their possible N-oxides, addition salts with an acid, and their possible metal or metalloid complexes; comprising the following steps:



9. Fungicidal composition comprising

a) a compound of formula (I):



In which:

- the iodine atom is placed in the 5, 6, 7 or 8 position;

- R^1 is chosen from a halogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical;

- R^2 is chosen from a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, a halogen atom, the cyano radical, the radical $-W-R^3$;

- W is chosen from oxygen, sulphur or the radical $-NR^4$;

- R^3 and R^4 , which are identical or different, are chosen, independently of each other, from the hydrogen atom, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkyl radical, a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkenyl radical and a substituted or unsubstituted C_1-C_8 alkynyl radical, an alkoxy radical, an amino radical, a 3- to 7-membered carbo- or heterocycle which is substituted or unsubstituted and which may be saturated, unsaturated or aromatic, R^3 and R^4 may form together a 5- to 7-membered heterocycle which may be saturated, unsaturated or aromatic, and which may also comprise another heteroatom;

and their possible geometric and/or optical isomers, in pure form or in the form of mixtures, in any proportions, including the racemic mixture(s), their possible N-oxides, addition salts with an acid, and their possible metal or metalloid complexes;

b) at least one other fungicidal compound.

10. Composition according to Claim 9, comprising a compound of formula (I) in which the iodine atom is in the 6-position.

11. Composition according to either of Claims 9 and 10, comprising a compound of formula (I) in which R^2 is a radical $-W-R^3$.

12. Composition according to Claim 11, comprising a compound of formula (I) in which W represents oxygen.

13. Composition according to either of Claims 11 and 12, comprising a compound of formula (I) in which R^3 is a radical chosen from a C_1 - C_8 alkyl radical, a C_1 - C_8 alkenyl radical or a C_1 - C_8 alkynyl radical.

14. Composition according to any one of Claims 9 to 13, comprising a
5 compound of formula (I) in which R^1 is a C_1 - C_8 alkyl radical.

15. Composition according to Claim 14, comprising a compound of formula (I) in which R^1 is a *n*-propyl radical.

16. Composition according to any one of Claims 9 to 15, comprising, as compound b) a fungicidal compound chosen from

10 b1) compounds capable of inhibiting the transport of electrons in the mitochondrial ubiquinol:ferricytochrome-c oxidoreductase respiratory chain of phytopathogenic fungal organisms, or

b2) the compounds capable of inhibiting the biosynthesis of ergosterol.

17. Composition according to Claim 16, comprising as compound b1)
15 a fungicidal compound chosen from strobilurin derivatives, fenamidone or famoxadone.

18. Composition according to Claim 17, comprising a strobilurin derivative chosen from azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, pycoxystrobin, pyraclostrobin, trifloxystrobin.

20 19. Composition according to Claim 16, comprising as compound b2) a triazole-type fungicidal compound.

20. Composition according to Claim 19, comprising a triazole-type compound chosen from bromuconazole, epoxyconazole, fluquinconazole, prochloraz, prothioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol,
25 tritconazole.

21. Composition according to Claim 16, comprising as compound b) a compound chosen from cyprodinil, dinocap, fenpropidin, fenpropimorph, fosetyl, lprovalicarb, quinoxifen, spiroxamine.

22. Method for controlling phytopathogenic fungi of crops at a site
30 which is infested or which may be infested by them, which comprises the application to the said site of at least one compound of formula (I) according to any one of Claims 1 to 7 Claims.

23. Method for controlling phytopathogenic fungi of crops at a site which is infested or which may be infested by them, which comprises the application to the said site of at least one composition according to any one of Claims 9 to 21.

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D311/56 C07D311/22 A01N43/16

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, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No. -
X	WO 97 13762 A (AGREVO) 17 April 1997 (1997-04-17) cited in the application claims 2,3; examples 122,195	1-7,9-23
A	FR 2 124 427 A (WARNER LAMBERT) 22 September 1972 (1972-09-22) claim 3D; example 4	1-3
A	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 108, no. 27, 1988 Columbus, Ohio, US; abstract no. 186576u, page 689; XP002194558 abstract & JP 62 228001 A (TAKEDA) 6 October 1987 (1987-10-06)	1,2,9-23

☐ 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

7 November 2002

Date of mailing of the international search report

15/11/2002

Name and mailing address of the ISA

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

Authorized officer

- Francois, J

PCT/EP 02/09410

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9713762	A	17-04-1997	AT 201674 T	15-06-2001
			AU 7223896 A	30-04-1997
			BR 9610970 A	06-04-1999
			CA 2233666 A1	17-04-1997
			DE 69613139 D1	05-07-2001
			DE 69613139 T2	13-09-2001
			DK 861242 T3	06-08-2001
			EP 0861242 A1	02-09-1998
			ES 2157462 T3	16-08-2001
			WO 9713762 A1	17-04-1997
			GR 3036017 T3	28-09-2001
			HU 9900753 A2	28-07-1999
			JP 2000500739 T	25-01-2000
			PL 326159 A1	31-08-1998
			PT 861242 T	30-10-2001
			TW 420671 B	01-02-2001
			US 6034121 A	07-03-2000
			ZA 9608650 A	15-07-1997
FR 2124427	A	22-09-1972	AU 459499 B	27-03-1975
			AU 3840772 A	02-08-1973
			DE 2204051 A1	10-08-1972
			FR 2124427 A5	22-09-1972
			GB 1319041 A	31-05-1973
			JP 49032861 B	03-09-1974
JP 62228001	A	06-10-1987	NONE	

Derivados de yodobenzopiran-4-ona que tienen actividad fungicida

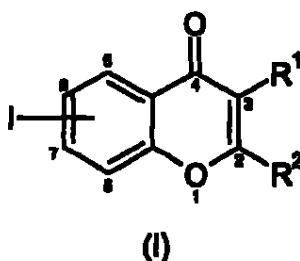
Descripción

La presente invención se refiere a derivados de yodobenzopiran-4-ona que poseen propiedades fungicidas contra organismos fitopatógenos, a un método para preparar algunos de estos derivados, a su uso para proteger plantas, y a composiciones fungicidas que comprenden dichos derivados en combinación con uno o más de otros compuestos fungicidas.

La Solicitud de Patente Internacional WO-97/13762 en particular describe derivados del tipo halobenzopiranona. Este documento describe un número muy amplio de compuestos mediante una fórmula química muy general. Sin embargo, los compuestos presentados a modo de ejemplo son esencialmente compuestos que tienen un átomo de bromo o una cadena de carbono en el anillo de benceno. De este modo, este documento se centra en compuestos que no están sustituidos con un átomo de yodo como es el caso de la presente invención. De hecho, en este documento sólo se describen dos compuestos yodados sin indicar, sin embargo, que dichos compuestos pueden poseer propiedades que son superiores a las de otros derivados, en particular a las de los derivados bromados.

Ahora se ha descubierto que determinados derivados de yodobenzopiran-4-ona poseen excelentes propiedades fungicidas contra organismos fitopatógenos. Estas propiedades pueden ser mejoradas aún más si estos compuestos son usados como una mezcla con uno o más de otros compuestos fungicidas.

Un primer aspecto de la presente invención se refiere a compuestos de fórmula (I)



en la que:

- El átomo de yodo está colocado en la posición 5, 6, 7 u 8;
- R¹ es elegido entre un átomo de halógeno, un radical alquilo C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C₁-C₆ sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C₁-C₆ sustituido o sin sustituir;
- R² es elegido entre un radical alquilo C₁-C₆ sustituido o sin sustituir, un radical

alquenilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros, que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, un átomo de halógeno, el radical ciano, el radical $-W-R^3$;

- 5 • W es elegido entre oxígeno, azufre o el radical $-NR^4$;
- R^3 y R^4 , que son idénticos o diferentes, son elegidos, independientemente el uno del otro, entre el átomo de hidrógeno, un radical alquilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un radical alcoxi, un radical amino, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 10 7 miembros que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, R^3 y R^4 pueden formar en conjunto un heterociclo de 5 a 7 miembros que puede ser saturado, no saturado o aromático, y que también puede comprender otro heteroátomo; y sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, en forma pura o en la forma de mezclas, en cualquier proporción, incluyendo la(s) mezcla(s) racémica(s), 15 sus posibles N-óxidos, sales de adición con un ácido, y sus posibles complejos metálicos o metaloides; siendo R^3 diferente al radical metilo o al radical butilo cuando el yodo está en la posición 6, cuando R^1 es el radical n-propilo y cuando W representa oxígeno.

Si los radicales de los compuestos con fórmula (I) están sustituidos, están 20 sustituidos preferentemente con uno o más grupos que pueden ser elegidos de forma independiente uno de otro entre radicales alquilo, alquenilo y alquinilo, un átomo de halógeno, el radical ciano, trialkilililo, alcoxi, alquiltio, hidroxilo, nitro, amino, acilo, aciloxi, fenilo, heterociclilo, feniltio, fenoxi, heterocicllloxi o heterocicllitio y los derivados oxidados y pueden estar sustituidos opcionalmente con entidades químicas que 25 contienen un grupo tio.

El término heterociclilo comprende grupos heteroarilo y grupos heterociclilo no aromáticos que pueden ser saturados o no saturados.

Los grupos heteroarilo generalmente son anillos de 5 a 6 miembros que 30 contienen hasta 4 heteroátomos elegidos entre nitrógeno, oxígeno y azufre, opcionalmente unidos a un anillo benceno. Como ejemplos de grupos heteroarilo, pueden mencionarse especialmente los grupos derivados del tiofeno, el furano, el pirrol, el tiazol, el oxazol, el imidazol, el isotiazol, el prazol, el 1,3,4-oxadiazol, el 1,3,4-tiadiazol, el 1,2,4-oxadiazol, el 1,2,4-tiadiazol, el 1,2,4-triazol, el 1,2,3-triazol, el tetrazol, el benzo[b]tiofeno, el benzo[b]furano, el indol, el benzo[c]tiofeno, el 35 benzo[c]furano, el isoindol, el benzoxazol, el berizotiazol, el bencimidazol, el

bencisoxazol, el bencisotiazol, el indazol, el benzotiadiazol, el benzotriazol, el dibenzofurano, el dibenzotiofeno, el carbazol, la pirdina, la piracina, la pirimidina, la pirdacina, la 1,3,5-triacina, la 1,2,4-triacina, la 1,2,4,5-tetracina, la quinolina, la isoquinolina, la quinoxalina, la quinazolina, la cinnolina, la 1,8-naftiridina, la 1,5-naftiridina, la 1,6-naftiridina, la 1,7-naftiridina, la ftalacina, la piridoplmidina, la purina o la pteridina.

Los grupos heterociclicos no aromáticos generalmente son anillos de 3, 5, 6 ó 7 miembros que contienen hasta 3 heteroátomos elegidos entre nitrógeno, oxígeno y azufre, por ejemplo oxiranilo, tiranilo, tiazolinilo, dioxolanilo, 1,3-benzoacnilo, 1,3-benzotiacnilo, morfolino, pirazolinilo, sulfolanilo, dihidroquinazolinilo, piperidinilo, ftalimido, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, pirrolidinilo, indolinilo, 2-oxopirrolidino, 2-oxobenzoxazolin-3-ilo o tetrahidroacepinilo.

Los sustituyentes, cuando están presentes, de los grupos fenilo o heterociclico pueden ser, por ejemplo, átomos de halógeno, CN, NO₂, SF₆, B(OH)₂, trialkilsililo, acilo, O-acilo o un radical E, OE o S(O)_n E como se ha definido anteriormente para R² o alternativamente es un radical amino opcionalmente sustituido; o alternativamente dos grupos adyacentes en el anillo, junto con los átomos a los que están unidos, forman un anillo carbocíclico o heterocíclico que puede estar opcionalmente sustituido de una forma similar.

El término acilo comprende los residuos ácidos que contienen azufre o fósforo y los residuos de ácido carboxílico. Por tanto, son ejemplos de grupos acilo -COR⁶, -COOR⁶, -CINR⁶R⁶, -COM(R⁶)OR⁶, -COONR⁶R⁶, -CON(R⁶)NR⁶R⁷, -COSR⁶, -CSSR⁶, -S(O)_qR⁶, -S(O)₂OR⁶, -S(O)_qNR⁶R⁶, -P(=L)(OR⁶)(OR⁶) ó -COOR⁶, en los que R⁶, R⁶ y R⁷, que pueden ser idénticos o diferentes, representan el átomo de hidrógeno, un radical alquilo opcionalmente sustituidos, un radical cicloalquilo opcionalmente sustituido, un radical cicloalquenilo opcionalmente sustituido, un radical alquenilo opcionalmente sustituido, un radical alquinilo opcionalmente sustituido, un grupo fenilo opcionalmente sustituido o un grupo heterociclico opcionalmente sustituido, o alternativamente R⁶ y R⁶, ó R⁶ y R⁷, junto con el(los) átomo(s) a los que están unidos, pueden formar un anillo, q representa 1 ó 2 y L representa O ó S.

Los radicales amino pueden estar sustituidos, por ejemplo, con uno o más radicales alquilo opcionalmente sustituidos o con radicales acilo opcionalmente sustituidos, o alternativamente dos sustituyentes pueden formar un anillo, preferiblemente un anillo de 5 a 7 miembros, que puede estar sustituido y que puede contener otros heteroátomos, y por ejemplo morfolina.

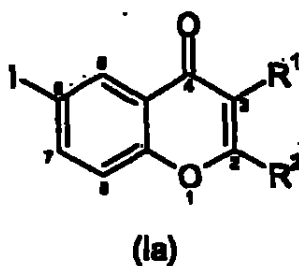
Entre los compuestos con fórmula (I) son preferidos aquellos que poseen al menos una de las siguientes características:

- El átomo de yodo está en la posición 6;
- R^1 representa un radical alquilo C_2-C_4 ;
- 5 • R^2 representa el radical $-W-R^3$ en el que W representa oxígeno y R^3 es como se ha definido anteriormente.

Los compuestos más preferidos con fórmula (I) poseen simultáneamente estas tres características, en particular los compuestos con fórmula (I) en los que R^3 representa un radical alquilo C_1-C_6 , un radical alquenoilo C_1-C_6 o un radical alquinilo C_1-C_6 o alternativamente los compuestos con fórmula (I) en los que R^1 es un radical n-propilo.

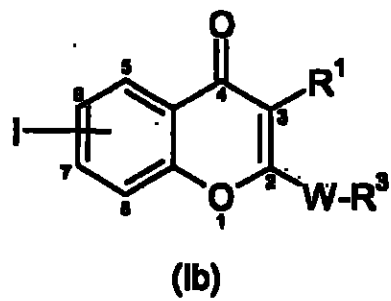
Entre los compuestos con fórmula (I), pueden mencionarse, a modo de ejemplo, los siguientes compuestos con fórmulas (Ia) y (Ib) que no limitan el alcance de la presente invención:

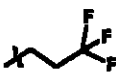
15



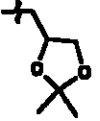
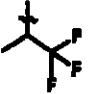
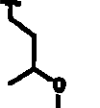
20

Ejemplo	R1	R2
1		
2		
3		
4		
5		
6		
7		
8		
9		

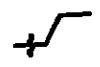
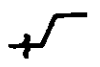
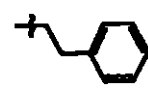
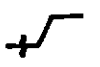
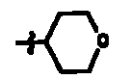
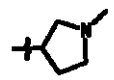


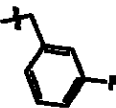
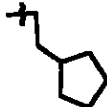
Ejemplo	I	W	R1	R3
10	8-1	0		
11	8-1	0		
12	8-1	0		
13	8-1	0		
14	8-1	0		
15	8-1	0		
16	8-1	0		
17	8-1	0		
18	8-1	0		
19	8-1	0		

Ejemplo	I	W	R1	R3
20	8-1	0		
21	8-1	0		
22	8-1	0		
23	8-1	0		
24	8-1	0		
25	8-1	0		
26	8-1	0		
27	8-1	0		
28	8-1	0		
29	8-1	0		

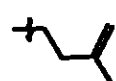
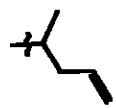
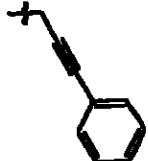
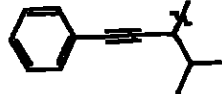
Ejemplo	I	W	R1	R2
30	6-1	0		
31	6-1	0		
32	6-1	0		
33	6-1	0		
34	6-1	0		
35	6-1	0		
36	6-1	0		
37	6-1	0		
38	6-1	0		
39	6-1	0		

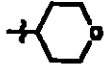
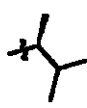
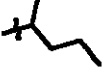
Exemple	I	W	R1	R2
40	8-1	O		
41	8-1	O		
42	8-1	O		
43	8-1	O		
44	8-1	O		
45	8-1	O		
46	8-1	O		
47	8-1	O		
48	8-1	O		
49	8-1	O		

Ejemplo	I	W	R1	R2
50	8-1	0		
51	8-1	0		
52	8-1	0		
53	8-1	0		
54	8-1	0		
55	8-1	0		
56	8-1	0		
57	8-1	0		
58	8-1	0		
59	8-1	0		

Ejemplo	I	W	R1	R3
80	8-1	0		
81	8-1	0		
82	8-1	0		
83	8-1	0		
84	8-1	0		
85	8-1	0		
86	8-1	0		
87	8-1	0		
88	8-1	0		
89	8-1	0		

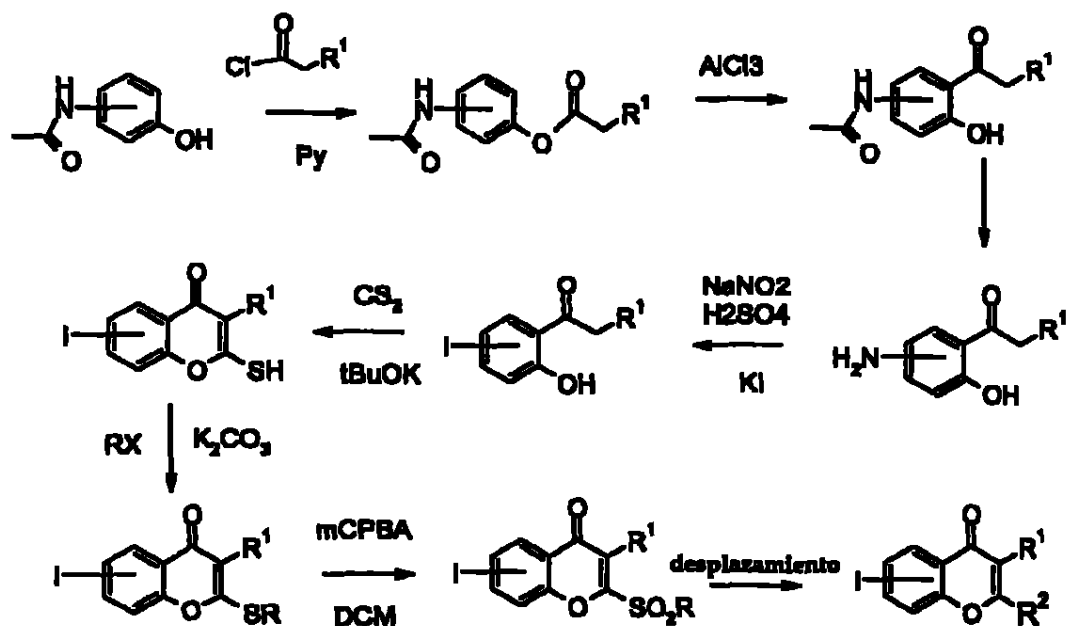
Ejemplo	I	W	R1	R3
70	8-1	0		
71	8-1	0		
72	8-1	0		
73	8-1	0		
74	8-1	0		
75	8-1	0		
76	8-1	0		
77	8-1	0		
78	8-1	0		
79	8-1	0		

Ejemplo	I	W	R1	R3
80	8-1	0		
81	8-1	0		
82	8-1	0		
83	8-1	0		
84	8-1	0		
85	8-1	0		
86	8-1	0		
87	8-1	0		
88	8-1	0		

Ejemplo	I	W	R1	R3
88	8-1	O		
89	8-1	O		
91	8-1	O		
92	8-1	O		
93	8-1	O		
94	8-1	O		
95	8-1	O		
96	8-1	O		
97	8-1	O		
98	8-1	NRM		R3=R4=H

Los compuestos de la presente invención pueden ser preparados mediante numerosos métodos que son procedimientos conocidos, en particular aquellos descritos en la Solicitud de Patente EP-861 242.

De forma particularmente ventajosa, los compuestos con fórmula (I) también pueden ser preparados de acuerdo con el siguiente método:



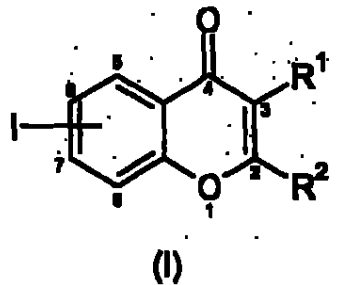
Este método constituye otro aspecto de esta invención.

También pueden usarse otros métodos para preparar los compuestos con fórmula (I), tales como métodos similares a aquellos descritos en *Chemistry and Industry*, (1980), 116; *J. Chem. Soc. Chem. Com.*, 1, (1981), 282 y *J. Org. Chem.*, (1992), 57, 6502.

Los reactivos y algunos de los compuestos intermedios útiles para la preparación de los compuestos con fórmula (I) pueden ser preparados mediante métodos conocidos por personas con conocimientos en la técnica.

Otro aspecto de la presente invención se refiere a una composición fungicida que comprende

a) un compuesto con fórmula (I):



en la que:

- El átomo de yodo está colocado en la posición 5, 6, 7 u 8;
- R^1 es elegido entre un átomo de halógeno, un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir;
- R^2 es elegido entre un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros, que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, un átomo de halógeno, el radical ciano, el radical $-W-R^3$;
- W es elegido entre oxígeno, azufre o el radical $-NR^4$;
- R^3 y R^4 , que son idénticos o diferentes, son elegidos, independientemente el uno del otro, entre el átomo de hidrógeno, un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alcoxi, un radical amino, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, R^3 y R^4 pueden formar en conjunto un heterociclo de 5 a 7 miembros que puede ser saturado, no saturado o aromático, y que también puede comprender otro heteroátomo; y sus posibles isómeros geométrico y/u ópticos, en forma pura o en la forma de mezclas, en cualquier proporción, incluyendo la(s) mezcla(s) racémica(s), sus posibles N-óxidos, sales de adición con un ácido, y sus posibles complejos metálicos o metaloides;

b) otro compuesto fungicida, al menos uno.

Los compuestos preferidos con fórmula (I) para la composición de acuerdo con la invención son aquellos que poseen al menos una de las siguientes características:

- El átomo de yodo está en la posición 6;
- R^1 representa un radical alquilo C_2-C_4 ;
- R^2 representa el radical $-W-R^3$ en el que W representa oxígeno y R^3 es tal como se ha definido anteriormente.

Los compuestos más preferidos con fórmula (I) para la composición de acuerdo con la invención poseen simultáneamente estas tres características, en particular los compuestos con fórmula (I) en los que R³ representa un radical alquilo C₁-C₆, un radical alquenilo C₁-C₆ o un radical alquinilo C₁-C₆ o alternativamente los compuestos con fórmula (I) en los que R¹ es un radical n-propilo.

Pueden mencionarse en particular los compuestos cuyo nombre químico es el siguiente:

- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 2-etoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 10 • 6-yodo-2-propoxi-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 2-but-2-iniloxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 2-but-3-eniloxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona,
- 3-butil-6-yodo-2-isopropil-benzopiran-4-ona,
- 15 • 6-yodo-3-propil-2-(tetrahidro-piran-4-iloxi)-benzopiran-4-ona,
- 6-yodo-3-propil-2-(2,2,2-trifluoro-etoxi)-benzopiran-4-ona,

En la composición de acuerdo con la invención, se prefiere el uso de compuestos fungicidas elegidos entre

b1) compuestos capaces de inhibir el transporte de electrones en la cadena respiratoria de oxidoreductasa mitocondrial de ubiquinol:ferricitocromo-c de organismos fúngicos fitopatógenos, en particular los derivados de estrobilurina tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, o fenamidona o famoxadona; o

b2) los compuestos capaces de inhibir la biosíntesis de ergosterol, en particular los compuestos del tipo triazol tales como bromuconazol, epoxiconazol, fluquinconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol.

Como otros compuestos preferidos que pueden ser usados en la composición de acuerdo con la invención, se pueden mencionar el ciprodinilo, el dinocap, la fenpropidina, el fenpropimorfo, el fosetilo, el iprovalicarb, el quinoxifeno, la espiroxamina.

Como combinaciones particulares de los compuestos con fórmula (I) con uno o más de otros compuestos fungicidas, se prefieren las siguientes combinaciones:

35

Compuestos con fórmula (I):

+ Compuesto(s) b:

- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + piraclostrobina
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + picoxistrobina
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + krenoxim-metilo
- 5 • 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fluquinconazol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + tebuconazol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + procloraz
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + protioconazol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + triadimefona
- 10 • 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + triadimenol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + triticonazol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + epoxiconazol
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + dinocap
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + expirosamina
- 15 • 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fenpropidina
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fenpropimorfo
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + quinoxifeno
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + ciprodinilo
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fosetil-al
- 20 • 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fenamidona
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + iprovalicarb
- 6-yodo-2-(1-metil-butoxi)-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + piraclostrobina
- 25 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + picoxistrobina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + kresoxim-metilo
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluquinconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + tebuconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + procloraz
- 30 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + protioconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + triadimefona
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + triadimenol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + triticonazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + epoxiconazol

- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + dinocap
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + espiroxamina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fenpropidina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fenpropimorfo
- 5 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + quinoxifeno
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + ciprodinilo
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fosetil-al
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fenamidona
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + iprovalicarb
- 10 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina + fluquinconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina + tebuconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina + procloraz
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + protioconazol
- 15 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + trifloxistrobina + espiroxamina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina + fluquinconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina + tebuconazol
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina + procloraz
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina + protioconazol
- 20 • 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fluoxastrobina + espiroxamina
- 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiran-4-ona + fosetil-al + fenamidona
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina + fluquinconazol
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina + tebuconazol
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina + procloraz
- 25 • 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina + protioconazol
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina + espiroxamina
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + fluoxastrobina + fluquinconazol
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + fluoxastrobina + procloraz
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + fluoxastrobina + protioconazol
- 30 • 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + fluoxastrobina + espiroxamina
- 6-yodo-2-(1-metilbutoxi)-3-propilbenzopiran-4-ona + fosetil-al + fenamidona

Ha sido posible demostrar un efecto sinérgico ligado al uso de la composición de acuerdo con la invención.

Para su uso, los compuestos con fórmula (I) y las composiciones que comprenden un compuesto con fórmula (I) combinado con uno o más de otros compuestos fungicidas son mezclas habitualmente con un vehículo y un tensioactivo que son aceptables para el uso en agricultura.

5 El vehículo o diluyente de la composición de acuerdo con la presente invención puede ser un sólido o un líquido, opcionalmente en combinación con un tensioactivo, por ejemplo un agente dispersante, un agente emulsificante o un agente humectante.

Los tensioactivos adecuados comprenden compuestos aniónicos tales como un carboxilato, por ejemplo un carboxilato metálico que tiene un ácido graso de
10 cadena larga; un N-acilsarcosinato; mono- o diésteres de ácido fosfórico con etoxilatos de alcoholes grasos o alternativamente sales de dichos ésteres; sulfatos de alcoholes grasos tales como el dodecilsulfato de sodio, el octadecilsulfato de sodio o el cetilsulfato de sodio; sulfatos de alcoholes grasos etoxilados; sulfatos de alquifenoles etoxilados; lignosulfonatos; sulfonatos de petróleo; sulfonatos de alquilnaftaleno, por
15 ejemplo sulfonatos de butilnaftaleno; sales de naftaleno sulfonado-condensados de formaldehído; sales de fenol sulfonado-condensados de formaldehído; o incluso sulfonatos más complejos tales como amidasulfonatos, por ejemplo el producto sulfonado de condensación del ácido oleico con N-metiltaurina o sulfosuccinatos de dialquilo, por ejemplo sulfonato de sodio o succinato de dioctilo. Entre los agentes no
20 iónicos, se pueden mencionar los productos de condensación de ésteres de ácidos grasos, de alcoholes grasos, de amidas de ácidos grasos o de fenoles sustituidos con alquillos grasos o con alquenos con óxido de etileno, ésteres grasos de éteres de alcoholes polihidroxilados, por ejemplo ésteres de ácido graso de sorbitán, productos de condensación de dichos ésteres con óxido de etileno, por ejemplo ésteres de ácido
25 graso de sorbitán de polioxi-etileno, copolímeros bloque de óxido de etileno y de propileno, glicoles acetilénicos tales como 2,4,7,9-tetrametil-5-decino-4,7-diol, o glicoles acetilénicos etoxilados.

Entre los tensioactivos catiónicos, se pueden mencionar, por ejemplo, una mono-, di- o poliamina alifática en forma de acetato, de naftenato o de oleato; una
30 amina que contiene oxígeno tal como un óxido de amina o una alquilamina de polioxi-etileno; una amina que contiene un enlace amida preparada por condensación de un ácido carboxílico con una diamina o una poliamina; o una sal de amonio cuaternaria.

Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden tomar
35 cualquier forma conocida en la técnica para formular compuestos agroquímicos, por

ejemplo, una disolución, una dispersión, una emulsión acuosa, un polvo pulverulento, una formulación para tratar semillas, una formulación para fumigar o ahumar, polvo dispersable, un concentrado emulsificable o gránulos. Además, pueden estar en una forma adecuada para el uso directo o en una forma concentrada o en la forma de una
5 composición primaria que requiere dilución con una cantidad adecuada de agua u otro diluyente antes de la aplicación.

La concentración de ingrediente(s) activo(s) en la composición de la presente invención, aplicada a plantas, preferiblemente está en el intervalo entre 0,0001 y 1,0% en peso, particularmente 0,0001 y 0,01% en peso. En una composición primaria, la
10 cantidad de ingrediente activo puede variar considerablemente y puede estar, por ejemplo, entre 5 y 95% en peso de la composición.

Los compuestos con fórmula (I) de la presente invención, usados solos o en la forma de mezclas, poseen actividad como un fungicida, particularmente contra enfermedades fungicidas de las plantas, por ejemplo mohos polvorientos y mohos de
15 pelusa y particularmente moho polvoriento de cereal (*Blumeria graminis*), moho polvoriento de vid (*Uncinula necator*), moho polvoriento de manzana (*Podosphaera leucotricha*), mohos polvorientos de pepino (por ejemplo *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Erysiphe polygoni*), moho polvoriento de Solanaceae (por ejemplo *Leveillula taurica*), moho polvoriento de fruta y plantas ornamentales (por
20 ejemplo *Sphaerotheca pannosa*), moho de pelusa de vid (*Plasmopara viticola*), tizón del arroz (*Pyricularia oryzae*), manchas de cereal (*Pseudocercospora herpotrichoides*), tizón de la valna de arroz (*Pellicularia sasakii*), moho gris (*Botrytis cinerea*), humedades (*Rhizoctonia solani*), moho marrón de trigo (*Puccinia recondita*), tizón del tomate o de la patata (*Phytophthora infestans*), costra de manzana (*Venturia inaequalis*), mancha de la gluma (*Leptosphaeria nodorum*).
25

Los compuestos con fórmula (I) también pueden probar ser activos sobre otros hongos fitopatógenos, incluyendo otros tipos de mohos, mohos polvorientos, así como en general patógenos que originan Deuteromycetes, Ascomycetes, Phycomycetes y Basidiomycetes.

30 Los compuestos con fórmula (I) e acuerdo con la presente invención han demostrado ser particularmente activos contra mohos polvorientos de cereales, vid, plantas y árboles frutales, cultivos vegetales y plantas ornamentales.

Por lo tanto, otro aspecto de la invención también se refiere a un método para controlar hongos fitopatógenos de cultivos en una localización que esté infectada o
35 que pueda ser infectada por ellos, que comprende la aplicación en dicha localización

de al menos un compuesto con fórmula (I), solo o en combinación con uno o más de otros compuestos fungicidas como se ha descrito anteriormente, notablemente dentro de una composición de acuerdo con la presente invención.

En el método de acuerdo con la presente invención, el compuesto con fórmula (I) generalmente es aplicado a las semillas, a las plantas o al lugar donde crecen o crecerán. De este modo, este compuesto puede ser aplicado directamente al suelo antes, en el momento, o después del sembrado de tal modo que la presencia del ingrediente activo en el suelo puede controlar el crecimiento de los hongos fitopatógenos que puedan atacar a las semillas. Si se trata directamente el suelo, la sustancia activa puede ser aplicada de cualquier manera de modo que sea mezclada íntimamente con el suelo, por ejemplo mediante pulverización, por esparcimiento en el suelo de una forma sólida tal como gránulos, o mediante la aplicación del ingrediente activo en el momento de sembrar incorporándolo dentro de las semillas en el semillero. Una dosis adecuada para la aplicación está en el intervalo desde 5 a 1000 g por hectárea, preferiblemente de 10 a 500 g por hectárea.

Una alternativa consiste en aplicar el ingrediente activo directamente a la planta, por ejemplo mediante pulverización o espolvoreamiento, tanto cuando el hongo fitopatógeno ha comenzado a aparecer sobre la planta, como antes de la aparición de dicho hongo como medida preventiva, o preventivamente y curativamente. En cada uno de estos casos, el método de aplicación preferido es la pulverización foliar. Generalmente, es importante obtener un buen control de los hongos fitopatógenos durante las primeras etapas del crecimiento de la planta, siendo estas etapas los momentos precisos en los que las plantas pueden ser dañadas más seriamente. A veces es ventajoso tratar las raíces de la planta antes o durante la plantación, por ejemplo metiendo las raíces en una composición que comprende un compuesto con fórmula (I).

La invención es ilustrada sin limitación mediante los siguientes ejemplos.

Ejemplo de prueba N° 1

Se probó la actividad de los compuestos frente a moho polvoriento (*Blumeria graminis*).

Se plantó trigo de invierno (variedad Appolo) en Francia (departamento de Maine) en terrenos de 1 m², a un ritmo de 200 kg/ha (suelo: rendzina coloreado) a una profundidad de 3 cm. Los compuestos de la invención fueron aplicados a las plantas de trigo en dos porciones: Aplicación A en la etapa de espiga de 1 cm y a continuación

Aplicación B en la segunda etapa del nodo visible. Cada una de estas aplicaciones fue llevada a cabo por pulverización de una disolución acuosa de los compuestos en una dosis de 125 g de ingrediente activo/ha.

5 Durante la Aplicación A, la intensidad de ataque del hongo *Blumeria graminis* se estima en un 3% del volumen foliar total.

Las pruebas de intensidad de ataque son llevadas a cabo 52 días después de la Aplicación B evaluando el porcentaje de área superficial afectada en las hojas secundarias (contadas desde la espiga).

10 Los resultados presentados en la Tabla 1 fueron obtenidos con los siguientes compuestos de acuerdo con la invención:

Compuesto 1: 2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona

Compuesto 2: 6-yodo-2-propoxi-3-propilbenzopiran-4-ona

Compuesto 3: 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona

15 Control: plantas sin tratar y Compuesto B: quinoxifeno (referencia comercial Fortress®).

Compuesto	% de área superficial afectada por hoja (secundaria)
1	0,58
2	2,53
3	2,51
Control	30,47
A	6,47
B	4,91

Tabla 1 (Prueba de intensidad de ataque)

20 Bajo las mismas condiciones, se llevó a cabo una prueba de frecuencia de ataque evaluando el porcentaje de hojas secundarias (a partir de la espiga) atacadas por el hongo *Blumeria graminis*.

Los resultados obtenidos se presentan en la Tabla 2.

Compuesto	% de hoja secundaria atacada
1	28,0
3	54,0
Control	98,7
A	78,7

B	73,3
---	------

Tabla 2 (Prueba de frecuencia de ataque)

Los resultados de estas dos pruebas muestran que los compuestos yodados con fórmula (I) de acuerdo con la presente invención son activos en comparación con el control sin tratar, y también son más activos que la referencia comercial.

Ejemplo de prueba N° 2

Este ejemplo proporciona una ilustración de la eficacia biológica de los compuestos con fórmula (I) sobre las cepas patógenas resistentes a los derivados de estrobilurina.

El experimento fue llevado a cabo en un invernadero.

Las cepas resistentes fueron aisladas y se tomó muestras en el 2001 en el norte de Alemania en la región de Bremen en un lugar tratado con piraclostrobina y con picoxistrobina. Estas cepas se caracterizan por su resistencia estos compuestos de tipo estrobilurina. A continuación se las mantuvo en una cámara de atmósfera controlada sobre plantas de trigo (variedad Kanzler) tratadas con trifloxistrobina.

Los compuestos probados fueron pulverizados sobre las plantas de trigo usando disoluciones para la aplicación diluida en agua hasta un volumen equivalente a 250 l/ha. 24 h después, las plantas fueron inoculadas con moho polvoriento (*Blumeria graminis f. sp. tritici*).

La extensión de la enfermedad fue evaluada sobre cada planta después de 13 días de incubación.

Los resultados obtenidos son presentados en la Tabla 3 y muestran que el compuesto usado permite el control completo de las cepas tratadas. Estos resultados pueden aplicarse a condiciones de uso en el campo abierto.

Compuesto aplicado	Cantidad aplicada (g/ha)	Porcentaje de hojas afectadas por el moho polvoriento (%)
Plantas de control sin tratamiento	-	100
Trifloxistrobina (EC a 125 g/l –Twist®)	31	100
	62	100
	125	100
	250	100

2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona (SC a 500 g/l)	31	0
	62	0

Tabla 3

Ejemplo de prueba N° 3

5 Este ejemplo proporciona una ilustración del efecto sinérgico obtenido usando los compuestos de acuerdo con la invención en la forma de una mezcla con compuestos del tipo estrobilurina, en particular trifloxistrobina, triazol, en particular fluquinconazol. Los compuestos de acuerdo con la invención fueron probados en un invernadero bajo condiciones preventivas. Este efecto sinérgico fue demostrado sobre las principales enfermedades que afectan a los cereales, en particular los mohos polvorientos de trigo y de cebada (*Blumeria graminis f. sp. tritici* y *Blumeria graminis f. sp. hordei*), el moho marrón de trigo (*Puccinia recondita*) y la mancha de la gluma de trigo (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*).

Se evaluó las combinaciones de ingredientes activos de la Tabla 4.

Ingrediente(s) activo(s)	Relación	Dosis aplicadas (g/ha)
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona (SC a 500 g/l)	-	1,5, 3, 4, 6, 8, 12, 16, 25, 31, 50, 62
Fluquinconazol (SC a 100 g/l - Flamenco®)	-	3, 6, 8, 12, 16, 25, 31, 50, 62, 125
Trifloxistrobina (WG a 500 g/kg - Flint®)	-	4, 8, 16, 31, 62, 125
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona (SC a 500 g/l) + trifloxistrobina (WG a 500 g/kg)	1/1 1/2,5 1/5	
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona (SC a 500 g/l) + fluquinconazol (SC a 100 g/l)	1/1 1/2 1/5	

Tabla 4

La mezcla de epoxiconazol y kresoxim-metilo (SC 125 g/l + 125 g/l - Ogam®)

fue usada como referencia a las dosis recomendadas para la aplicación de 62 + 62 g/ha y 125 + 125 g/ha.

Los compuestos y mezclas probados fueron pulverizados sobre las plantas de trigo:

- dos réplicas,
- volumen para la aplicación equivalente a 250 l/ha.

El día después de la aplicación, las plantas de trigo fueron inoculadas con moho polvoriento (*Blumeria graminis f. sp. tritici*), moho marrón (*Puccinia recondita*), manchas de la gluma (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*) y las plantas de cebada con moho polvoriento (*Blumeria graminis f. sp. hordei*).

Una vez que las enfermedades se han desarrollado, la evaluación se hizo determinando la extensión de la enfermedad por tiesto.

El nivel de sinergia fue calculado usando la fórmula de Colby con el objetivo de calcular la eficacia teórica y de compararla con la eficacia observada:

Eficacia teórica de A + B = eficacia de A (%) + eficacia de B (%) - [eficacia de A (%) x eficacia de B (%) / 100]

Si la eficacia observada es mayor que la eficacia teórica, se demuestra un efecto sinérgico; si es igual, se demuestra un efecto aditivo; si es inferior, se demuestra un efecto antagonista.

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de fluquinconazol para controlar el moho polvoriento de trigo son presentados en la Tabla 5.

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	6	-	25	-	-
fluquinconazol	6	-	0	-	-
	12	-	0	-	-
	31	-	0	-	-

2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + fluquinconazol	6 + 6	1/1	93	25	+ 68
	6 + 12	1/2	90	25	+ 65
	6 + 31	1/5	95	25	+ 70

Tabla 5

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de fluquinconazol para controlar el moho polvoriento de cebada se presentan en la Tabla 6.

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	12	-	50	-	-
fluquinconazol	12	-	25	-	-
	25	-	25	-	-
	62	-	75	-	-
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + fluquinconazol	12 + 12	1/1	90	62,5	+ 28
	12 + 25	1/2	95	62,5	+ 33
	12 + 62	1/5	98	87,5	+ 11

Tabla 6

10

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de fluquinconazol para controlar el moho marrón de trigo son presentados en la Tabla 7.

15

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	50	-	0	-	-

fluquinconazol	100	-	60	-	-
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + fluquinconazol	50 + 100	1/2	90	60	+ 30

Tabla 7

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de fluquinconazol para controlar la mancha de la gluma de trigo (*Septoria tritici*) son presentados en la Tabla 8.

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	50	-	0	-	-
fluquinconazol	100	-	60	-	-
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + fluquinconazol	50 + 100	1/2	90	60	+ 30

Tabla 8

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de fluquinconazol para controlar la mancha de la gluma de trigo (*Septoria nodorum*) son presentados en la Tabla 9.

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	50	-	0	-	-
fluquinconazol	100	-	75	-	-
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + fluquinconazol	50 + 100	1/2	95	75	+ 20

Tabla 9

6A

000083

Estos resultados demuestran un elevado efecto sinérgico de las mezclas del compuesto con fórmula (I) y de fluquinconazol en relaciones de 1/1, 1/2 ó 1/5 frente a mohos polvorientos de trigo y de cebada, moho marrón de trigo y manchas de la gluma. Estas mezclas hacen posible obtener excelentes resultados de eficacia en dosis agronómicas para la aplicación.

10

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de trifloxistrobina para controlar el moho polvoriento de trigo son presentados en la Tabla 10.

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	6	-	25		
	16	-	50	-	-
	25	-	75		
trifloxistrobina	16	-	30	-	-
	31	-	40		
	62	-	50		
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina	16 + 16	1/1	95	65	+ 30
	25 + 62	1/2,5	95	87,5	+ 8
	6 + 31	1/5	85	55	+ 30

Tabla 10

Los resultados obtenidos para una mezcla del compuesto con fórmula (I) de acuerdo con la invención y de trifloxistrobina para controlar el moho polvoriento de cebada son presentados en la Tabla 11.

15

Ingrediente(s) activo(s)	Dosis para aplicación (g/ha)	Relación	Eficacia observada (%)	Eficacia teórica (%)	Nivel de sinergia
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona	16	-	50	-	-
	25	-	75		

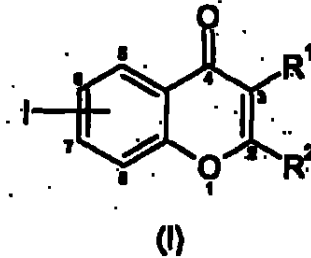
trifloxistrobina	16	-	0	-	-
	62	-	0		
2-etoxi-6-yodo-3-propilbenzopiran-4-ona + trifloxistrobina	16 + 16	1/1	75	50	+ 25
	25 + 62	1/2,5	85	75	+ 10

Tabla 11

Estos resultados demuestran un elevado efecto sinérgico de las mezclas del compuesto con fórmula (I) y de trifloxistrobina en relaciones de 1/1, 1/2,5 ó 1/5 frente a mohos polvorientos de trigo y de cebada (sobre cepas sensibles a compuestos de tipo estrobilurina).

REIVINDICACIONES

1. El compuesto con fórmula (I):



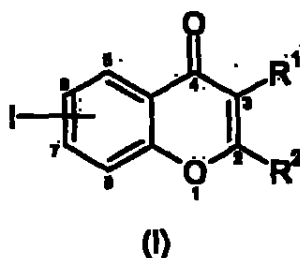
5 en la que:

- El átomo de yodo está colocado en la posición 5, 6, 7 u 8;
- R¹ es elegido entre un átomo de halógeno, un radical alquilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir;
- 10 • R² es elegido entre un radical alquilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros, que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, un átomo de halógeno, el radical ciano, el radical -W-R³;
- 15 • W es elegido entre oxígeno, azufre o el radical -NR⁴;
- R³ y R⁴, que son idénticos o diferentes, son elegidos, Independientemente el uno del otro, entre el átomo de hidrógeno, un radical alquilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un radical alcoxi, un radical amino, un carbociclo o un heterociclo de 3 a
- 20 7 miembros que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, R³ y R⁴ pueden formar en conjunto un heterociclo de 5 a 7 miembros que puede ser saturado, no saturado o aromático, y que también puede comprender otro heteroátomo;
- y sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, en forma pura o en la forma
- 25 de mezclas, en cualquier proporción, incluyendo la(s) mezcla(s) racémica(s), sus posibles N-óxidos, sales de adición con un ácido, y sus posibles complejos metálicos o metaloides; siendo R³ diferente al radical metilo o al radical butilo cuando el yodo está en la posición 6, cuando R¹ es el radical n-propilo y cuando W representa oxígeno.

30 2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, para el cual el átomo de yodo

está en la posición 6.

3. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 y 2, para el cual R^2 es un radical $-W-R^3$.
- 5
4. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 3, para el cual W representa oxígeno.
- 10
5. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, para el cual R^3 es un radical alquilo C_1-C_6 , un radical alquenilo C_1-C_6 o un radical alquinilo C_1-C_6 .
- 15
6. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, para el cual R^1 es un radical n-propilo.
7. El método para preparar un compuesto con fórmula (I)

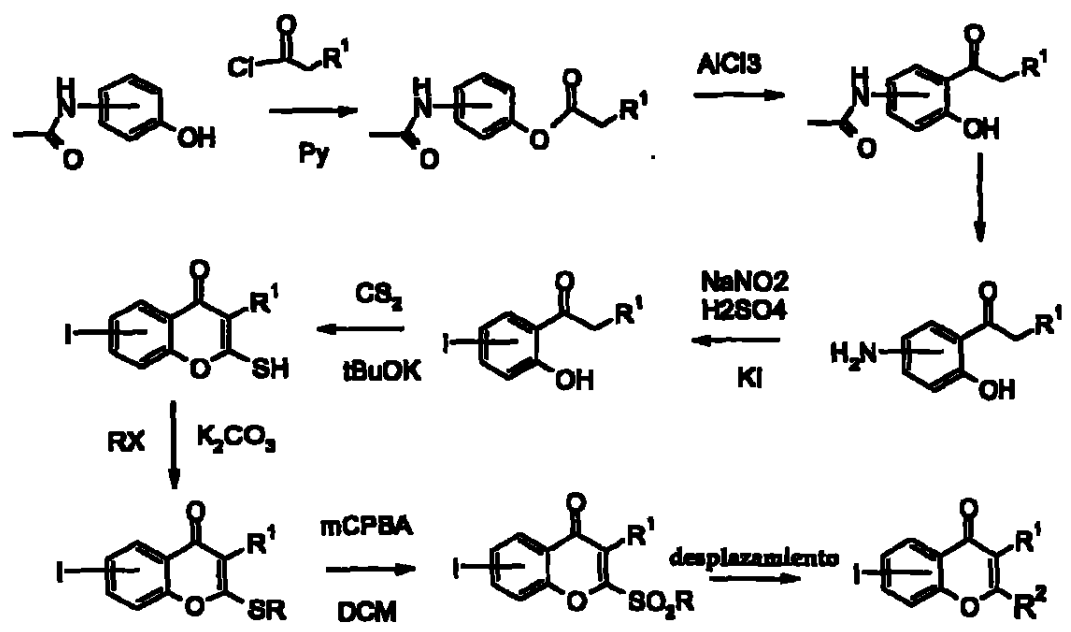


en la que:

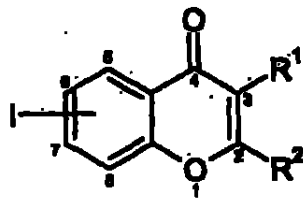
- El átomo de yodo está colocado en la posición 5, 6, 7 u 8;
- 20 • R^1 es elegido entre un átomo de halógeno, un radical alquilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir;
- R^2 es elegido entre un radical alquilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un radical alquenilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros, que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, un átomo de halógeno, el radical ciano, el radical $-W-R^3$;
- 25 • W es elegido entre oxígeno, azufre o el radical $-NR^4$;
- R^3 y R^4 , que son idénticos o diferentes, son elegidos, independientemente el uno del otro, entre el átomo de hidrógeno, un radical alquilo C_1-C_6 sustituido o sin sustituir,
- 30

un radical alquenilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir y un radical alquinilo C₁-C₈ sustituido o sin sustituir, un radical alcoxi, un radical amino, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, R³ y R⁴ pueden formar en conjunto un heterociclo de 5 a 7 miembros que puede ser saturado, no saturado o aromático, y que también puede comprender otro heteroátomo;

y sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, en forma pura o en la forma de mezclas, en cualquier proporción, incluyendo la(s) mezcla(s) racémica(s), sus posibles N-óxidos, sales de adición con un ácido, y sus posibles complejos metálicos o metaloides; que comprende las siguientes etapas:



9. La composición fungicida que comprende
a) un compuesto con fórmula (I):



(I)

15

en la que:

- El átomo de yodo está colocado en la posición 5, 6, 7 u 8;

- R^1 es elegido entre un átomo de halógeno, un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir;
 - R^2 es elegido entre un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros, que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, un átomo de halógeno, el radical ciano, el radical $-W-R^3$;
 - W es elegido entre oxígeno, azufre o el radical $-NR^4$;
 - 10 • R^3 y R^4 , que son idénticos o diferentes, son elegidos, independientemente el uno del otro, entre el átomo de hidrógeno, un radical alquilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alquenoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir y un radical alquinoilo C_1-C_8 sustituido o sin sustituir, un radical alcoxi, un radical amino, un carbociclo o un heterociclo de 3 a 7 miembros que está sustituido o sin sustituir y que puede ser saturado, no saturado o aromático, R^3 y R^4 pueden formar en conjunto un heterociclo de 5 a 7 miembros que puede ser saturado, no saturado o aromático, y que también puede comprender otro heteroátomo;
 - 15 y sus posibles isómeros geométricos y/u ópticos, en forma pura o en la forma de mezclas, en cualquier proporción, incluyendo la(s) mezcla(s) racémica(s), sus posibles N-óxidos, sales de adición con un ácido, y sus posibles complejos metálicos o metaloides;
 - 20 b) al menos otro compuesto fungicida.
10. La composición de acuerdo con la reivindicación 9, que comprende un compuesto
- 25 con fórmula (I) en el cual el átomo de yodo está en la posición 6.
11. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 9 y 10, que comprende un compuesto con fórmula (I) en el cual R^2 es un radical $-W-R^3$.
- 30 12. La composición de acuerdo con la reivindicación 11, que comprende un compuesto con fórmula (I) en el cual W representa oxígeno.
13. La composición de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 11 y 12, que comprende un compuesto con fórmula (I) en el cual R^3 es un radical elegido entre
- 35 un radical alquilo C_1-C_8 , un radical alquenoilo C_1-C_8 o un radical alquinoilo C_1-C_8 .

14. La composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 9 a 13, que comprende un compuesto con fórmula (I) en el cual R¹ es un radical alquilo C₁-C₈.
- 5 15. La composición de acuerdo con la reivindicación 14, que comprende un compuesto con fórmula (I) en el cual R¹ es un radical n-propilo.
16. La composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 9 a 15, que comprende, como compuesto b) un compuesto fungicida elegido entre
10 b1) compuestos capaces de inhibir el transporte de electrones en la cadena respiratoria de oxidoreductasa mitocondrial de ubiquinol:ferricitocromo-c de organismos fúngicos fitopatógenos, o
b2) los compuestos capaces de inhibir la biosíntesis de ergosterol.
- 15 17. La composición de, acuerdo con la reivindicación 16, que comprende como compuesto b1) un compuesto fungicida elegido entre derivados de estrobilurina, fenamidona o famoxadona.
- 20 18. La composición de acuerdo con la reivindicación 17, que comprende un derivado de estrobilurina elegido entre azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina.
- 25 19. La composición de acuerdo con la reivindicación 16, que comprende como compuesto b2) un compuesto fungicida tipo triazol.
20. La composición de acuerdo con la reivindicación 19, que comprende un compuesto tipo triazol elegido entre bromuconazol, epoxiconazol, fluquinconazol, procloraz, prolioconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol.
- 30 21. La composición de acuerdo con la reivindicación 16, que comprende como compuesto b) un compuesto elegido entre ciprodinilo, dinocap, fenpropidina, fenpropimorfo, fosetilo, iprovalicarb, quinoxifeno, espiroamina.
- 35 22. El método para controlar hongos fitopatógenos de cultivos en una localización que está infectada o que puede estar infectada por ellos, que comprende la aplicación

en dicha localización de al menos un compuesto con fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7.

- 5 23. El método para controlar hongos fitopatógenos de cultivos en una localización que está infectada o que puede estar infectada por ellos, que comprende la aplicación en dicha localización de al menos una composición de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 21.

PATENT COOPERATION TREATY

RECEIVED

13 NOV 2003

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

PCT

To:

BALMEFREZOL, Ludovic ✓
AVENTIS CROPSOENCE S.A.
14-20 Rue Pierre Baizet
F-69009 LYON
FRANCE

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

Date of mailing
(day/month/year) 11.11.2003

Applicant's or agent's file reference
PM01029

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.
PCT/EP02/09418

International filing date (day/month/year)
31.07.2002

Priority date (day/month/year)
03.08.2001

Applicant
AVENTIS CROPSOENCE S.A. 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.

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

Name and mailing address of the international
preliminary examining authority:



European Patent Office
D-80298 Munich
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d
Fax: +49 89 2399 - 4485

Authorized Officer

Ullrich, J
Tel. +49 89 2399-8048



PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT
(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PM01029	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/PEAA16)	
International application No. PCT/EP02/09418	International filing date (day/month/year) 31.07.2002	Priority date (day/month/year) 03.08.2001
International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC C07D311/56		
Applicant AVENTIS CROPS SCIENCE S.A. 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 opinion 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 Rule 68.2(a)(II) 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 07.01.2003	Date of completion of this report 11.11.2003	
Name and mailing address of the International preliminary examining authority:  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523858 apmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Authorized Officer Friebel, F Telephone No. +49 89 2399-8552	

**INTERNATIONAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. **PCT/EP02/09418**

79
- 400093

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

1-31 as originally filed

Claims, Numbers

1-23 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)).

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

6. Additional observations, if necessary:

75
44794

**INTERNATI NAL PRELIMINARY
EXAMINATION REPORT**

International application No. **PCT/EP02/09418**

**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	
	No: Claims	1-23
Inventive step (IS)	Yes: Claims	
	No: Claims	1-23
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-23
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

point V:

The present application relates to iodobenzopyran-4-one derivatives having fungicidal activity. The characteristic structural feature of the compounds claimed is a iodo substitution at position 5, 6, 7 or 8 and substituents at the positions 2 and 3 of the benzopyrane skeleton (radical R^1 , R^2).

Closest prior art is the reference **WO 97/13762 (D1)**, already discussed in the 2nd paragraph on page 1 of the application. This reference deals with the same type of heterocyclic fungicides then the present application; the generic formula (I) of D1 is broader in scope and embraces the subject-matter of the present application. The Applicant is right that this document mainly concentrates on the bromo substituted derivatives, however, there are also examples disclosing specific iodobenzopyran-4-ones: Examples 122 and 195; these have been excluded by way of a disclaimer added at the end of Claim 1 of the present application. The Applicant is apparently of the opinion that this imparts novelty and further wants to rely on an inventive selection in that he argues that D1 does not indicate that the two iodinated compounds disclosed therein can (?) possess properties which are superior to the other derivative, in particular the bromine derivatives.

As concerns novelty it is to be noted that the two iodine derivates of D1 do not constitute an accidental disclosure which could be circumvented by adding a disclaimer to establish novelty. A teaching of a prior art document is not reduced to its working examples. In the instant case the now claimed iodobenzopyran-4-ones are unambiguously disclosed in D1 and therefore no longer new (Art.33(2) PCT).

Now turning to inventive step (Art.33(3) PCT), a look at the dependent claims 2 to 7 reveals that the preferred compounds are characterized by the following:

iodine atom in the 6-position

R^2 is the radical $-W-R^3$ with W preferably being oxygen and R_3 inter alia alkyl

R^1 is preferably n-propyl

This preferred sub-set of compounds corresponds to the prior art derivatives 122 and 195 which are therefore not at all accidental but already point in the direction the Applicant now wants to claim.

0000006
77

process claim 8:

relevant to the subject-matter of the method claim is the synthesis rout disclosed on page 11 of D1. The key steps as for instance the ring closure of the α -acylated phenol precursor using the CS_2 /base reagent are the same as in the instant case.

fungicidal compositions: Claims 9 to 21:

as already pointed out in the first W.O. the document D1 relates to the same technical field. Fungicidal compositions are in particular mentioned on page 6 of D1 and in the middle of this page it is explicitly said that the prior art compositions can comprise one or more additional active ingredient as for example a fungicidal compound.

In response to the 2nd Written Opinion the Applicant argued that D1 only constitutes a general disclosure as concerns the benzopyranones in combination with further active agents. On the other hand, the pertinent paragraph on page 6 of D1 clearly refers to compounds having fungicidal properties. For the art skilled person this constitutes a strong incentive to combine the compounds claimed with further fungicidal active ingredients.

method for controlling phytopathogenic fungi: Claims 22, 23:

see the paragraph bridging pages 5 and 6 of D1.

In conclusion, the subject-matter of the claims on file is not novel or at least not inventive over D1; Art.33(2) (3) PCT.

As concerns formal matters, the following is to be noted:

- in the description and in the claims the lower range for an alkenyl as well as for an alkynyl radical always extends to C_{11} , this is not possible, when entering into the reg./nat.phase the application should be amended accordingly.
- according to Claim 1 the R^3 stands inter alia for an alkoxy radical this however embraces - depending on the meaning of W - peroxy compounds or derivatives with a S-O substructure. It is questionable that this is really intended.

RECU D.P.I.

PATENT COOPERATION TREATY

23 OCT. 2003

Lb

000087 10

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BAYER CROPSCIENCE S.A.
14-20 rue Pierre Baizet
F-69009 LYON
France

Date of mailing (day/month/year)

16 October 2003 (16.10.03)

Applicant's or agent's file reference

PM01029

IMPORTANT NOTIFICATION

International application No.

PCT/EP02/09418

International filing date (day/month/year)

31 July 2002 (31.07.02)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

AVENTIS CROPSCIENCE S.A.
55 avenue René Cassin
F-69009 LYON
France

State of Nationality

FR

State of Residence

FR

Telephone No.

33 4 72 85 26 62

Facsimile No.

33 4 72 85 28 43

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

BAYER CROPSCIENCE S.A.
16, rue Jean-Marie Leclair
F-69009 Lyon
France

State of Nationality

FR

State of Residence

FR

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

Please note that the name of agent has been changed too.

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) 338.89.75

Authorized officer

A. ZOLTANSKI (Fax : 338 89 75)

Telephone No. (41-22) 338 8808

PATENT COOPERATION TREATY

70p
572/98

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

BAYER CROPSCIENCE S.A.
14-20 rue Pierre Baizet
F-69009 LYON
France

Date of mailing (day/month/year) 16 October 2003 (16.10.03)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference PM01029	
International application No. PCT/EP02/09418	International filing date (day/month/year) 31 July 2002 (31.07.02)

1. The following indications appeared on record concerning:

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

Name and Address

State of Nationality

State of Residence

Telephone No.

Facsimile No.

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

CARBONNE, Stéphane
47, rue de Cuire
Apt no 6
F-69004 Lyon
France

State of Nationality

FR

State of Residence

FR

Telephone No.

Facsimile No.

Teleprinter No.

3. Further observations, if necessary:

Additional applicant/inventor for the purposes of US only.

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) 338.89.75

Authorized officer

A. ZOLTANSKI (Fax : 338 89 75)

Telephone No. (41-22) 338 8808

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

PATENTE DE INVENCION

MODELO DE UTILIDAD

USUARIO RADICADOR

- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.
- Descripción de la invención.
- Dibujos de ser estos pertinentes.
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas. X

() ()
(X) ()
(X) ()
() ()

COMPLETA ()

INCOMPLETA ()

DISEÑO INDUSTRIAL ()

- Indicación 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 fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.
- Comprobante de pago de las tasas establecidas

() ()
() ()
() ()
() ()

COMPLETA ()

INCOMPLETA ()

ESQUEMA DE TRAZADO ()

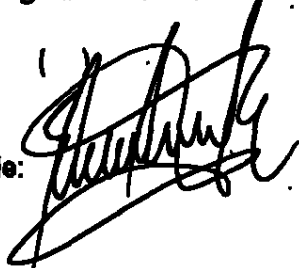
- Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud.
- Representación gráfica del esquema de trazado
- Comprobante de pago de las tasas establecidas.

() ()
() ()
() ()
() ()

COMPLETA ()

INCOMPLETA ()

Firma Responsable:



Fecha:

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 04019469 00000000

Folios: 98

Fecha (RIB): 2004-03-03 16:43:28

Tramite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NNCI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES



126
81

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
ALVARO CORREA ORDONEZ
Apoderado
BAYER CROPS SCIENCE S.A.

Oficio N°
04932

ASUNTO:	Radicación N°	04-19469
	Solicitud internacional	PCT/EP02/09418
	Fecha inicio fase nacional	03/03/2004
	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 Única 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, correspondiente al inventor PREUSS RAINER KARL. Anexar documentos para aclarar. (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 Única N° 10 de 2001.

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

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 13 de Mayo 2004.

