

Doctor

José Luis Salazar

Director de División de Nuevas Creaciones (C)

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 11-156928- -00010-0000

Fecha: 2013-09-04 16:44:09 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR  
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI  
Act. 523 RESPUESTA Folios: 37

Referencia: Expediente No. 11.156.928

Solicitud de Patente de Invención titulada: "Derivados de N-cicloalquil-N-bencil pirazol(tio)carboxamida fungicida y N-ciloalquil-N-(fusionado)bencil pirazol(tio) carboxamidas fungicidas"

Solicitante: Bayer CropScience AG

**RESPUESTA AL AUTO NOTIFICADO POR FIJACIÓN EN LISTA**  
**DEL 30 DE ABRIL DE 2013, OFICIO NO. 7619 (EXAMEN DE FONDO)**

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, doy respuesta al auto emanado por ese Despacho dentro del término de prórroga solicitado en mi memorial 11-156928-00006-0000 de fecha 24 de julio de 2013:

**1. Objeciones del Examinador**

Su Despacho plantea las siguientes observaciones en relación con la presente solicitud:

**1.1. Título**

El título no corresponde con el objeto de la solicitud porque el termino fungicida abarca un sinnúmero de compuestos, además no se está mencionando el otro anillo, fenil o piridil que

hace parte de la estructura central en el nombre de la solicitud, por lo cual se sugiere al Solicitante hacer las correcciones necesarias.

#### 1.1 Reivindicaciones

1.1.1. El uso de la reivindicación 22 no es patentable de acuerdo con el Art 14.

1.1.2. El método de la reivindicación 21 corresponde al uso del compuesto de fórmula (I), mencionado en la reivindicación 1 para controlar hongos fitopatógenos de los cultivos.

Es evidente que la llamada etapa de "aplicar una cantidad eficaz...", del compuesto de las reivindicaciones 1 - 12 en el suelo..." corresponde a la forma de usar los compuestos de fórmula (I), aunque en su preámbulo se reclame como método. Se le aclara al solicitante que un método cuya única etapa corresponde a una aplicación, dicha aplicación es un uso.

Por lo tanto dicho método no es patentable de acuerdo con el artículo 14.

1.1.3. Las reivindicaciones 1 - 12 no se encuentran debidamente soportadas en la descripción puesto que en las realizaciones preferidas sólo hace referencia aparentemente a la preparación y actividad de los compuestos mencionados en la tabla 1, lo cual no evidencia la actividad de todos los compuestos sino que se hace una generalización de manera especulativa. Se sugiere restringir la solicitud a una razonable cantidad de acuerdo al tipo de compuestos que ha sido sintetizado y probado, es decir, que se encuentran debidamente soportados en el capítulo descriptivo. Teniendo en cuenta la descripción en los ejemplos se encuentra y a continuación presenta los sustituyentes que considera su Despacho se encuentran soportados en la solicitud y continúa diciendo:

El solicitante debe definir específicamente la materia y el alcance de la invención a través de las características técnicas esenciales que se encuentren enteramente soportadas en la descripción.

1.1.4. Teniendo en cuenta que el objeto de invención está definido por los compuestos de fórmula I, como fungicidas, después de una comparación con el estado del arte se encontró que dicha fórmula no se puede considerar el elemento unificador que relaciona todos los procedimientos de la invención, puesto que el compuesto de fórmula I está divulgado en el documento D1 (Pág. 1 y 2) y documento D2 (Págs. 2 y Pág 11, líneas 8 - 21). Por lo tanto el concepto común no es inventivo y no se cumple el requisito de unidad

de invención.

1.1.5. La reivindicación 19 hace referencia a una composición pero no se mencionan los componentes y las proporciones de los mismos, por lo tanto se sugiere mencionar cuales son los componentes y sus proporciones. Además no se encuentra debidamente sustentada puesto que en las realizaciones preferidas no se menciona la actividad de dichas composiciones con sus respectivas proporciones.

1.1.6. La reivindicación 20 menciona un procedimiento pero no se menciona las condiciones, tales como solventes, reactivos, temperatura, presión entre otros de los pasos que allí se mencionan, dichas condiciones deben estar debidamente sustentadas en la descripción para que no se presente una ampliación de materia.

## 1.2 Unidad de Invención

Su Despacho considera que la presente invención posee cuatro grupos inventivos diferentes:

1. Compuestos de fórmula I, cuando Y es N originando un sustituyente piridil y composiciones (reivindicaciones 1 - 12 y 19).
2. Compuestos de fórmula I, cuando Y es CR5 originando un sustituyente fenil y composiciones (reivindicaciones 1 - 12 y 19).
3. Compuestos de formula (IIb), (IIc') y procedimiento de preparación del compuesto de formula (I): ruta a y ruta b. (reivindicaciones 13, 14 y 20)
4. Compuestos de formula (Iid), (Iie), (IIIf), (IIIg) y procedimiento de preparación del compuesto de formula (I): ruta c, d, e y f. (reivindicaciones 13, 14 y 20).

## 1.3 Novedad

El Examinador plantea que, después de realizada la búsqueda de anterioridades, encontró documentos que afectan la novedad de las reivindicaciones 1, 3, 4, 10 - 12 y 19 de la presente solicitud.

Particularmente, el Examinador considera que los documentos WO200612022 (D1), WO2009016220 (D2) y WO2007087 (D3) afectan la novedad de la presente solicitud por cuanto:

4

*“Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1, es posible concluir que las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente en D1 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 1 con la anterioridad D1, se concluye que el compuesto de fórmula (I) descrito en la reivindicación 1, ya era conocido en el estado de la técnica.*

*En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.*

*Las reivindicaciones dependientes 3, 4, 10 - 12 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas (...)*

*Teniendo en cuenta el grupo inventivo 2, es posible concluir que las características esenciales del compuesto de la reivindicación 1, habían sido divulgadas previamente y de manera independiente en D2 y D3 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 1 con cada una de las anterioridades D2 y D3, se concluye que el compuesto de fórmula (I) descrito en la reivindicación 1 cuando Y es -CR5, ya era conocido en el estado de la técnica.*

*En consecuencia, la reivindicación 1 carece de novedad, según lo divulgado de forma independiente en el documento D2 y el documento D3.*

*Las reivindicaciones dependientes 2, 4, 10 - 12 no mencionan alguna característica que haga nueva a la composición de la reivindicación 1, por lo cual se considera que no son nuevas.*

*La reivindicación 19 consiste en una composición fungicida que comprende como ingrediente activo, un compuesto de fórmula (I), donde Y es N, debidamente definida (FI. 181). (...)*

*Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1, es posible concluir que las características esenciales de la composición de la reivindicación 19, habían sido divulgadas previamente en D1 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 1 con la anterioridad D1, se concluye que la composición descrita en la reivindicación 19 ya era conocida en el estado de la técnica.*

*En consecuencia, la reivindicación 19 carece de novedad, según lo divulgado en el documento D1.*

*La reivindicación 19 consiste en una composición fungicida que comprende como ingrediente activo, un compuesto de fórmula (I), donde Y es -CR5(FIs. 181).(...)*

*Teniendo en cuenta el grupo inventivo 2, es posible concluir que las características*

*esenciales de la composición de la reivindicación 19, habían sido divulgadas previamente y de manera independiente en D2 y D3 porque de acuerdo con la tabla anterior donde se comparan las características técnicas de la reivindicación 19 con cada una de las anterioridades D2 y D3, se concluye que la composición descrita en la reivindicación 19, ya era conocido en el estado de la técnica.*

*En consecuencia, la reivindicación 19 carece de novedad, según lo divulgado de forma independiente en el documento D2 y el documento D3."*

#### 1.4 Nivel Inventivo

Sobre el requisito del nivel inventivo, el Examinador establece que una persona del nivel técnico medio, versada en la materia, ensayaría las soluciones que se proponen en los documentos WO200612022 (D1), WO2009016220 (D2) y WO2007087 (D3) y llegaría de manera obvia a la solución que se propone en la presente solicitud. Particularmente, el Examinador considera que las reivindicaciones 5 - 9 carecen de nivel inventivo debido a las enseñanzas contenidas en los documentos D1, D2 y D3.

El Examinador establece:

*"La reivindicación 5 consiste en un compuesto de fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde X1 representa un flúor y Y es N(FI. 136). (...)*

*Teniendo en cuenta el grupo inventivo 1, el documento D1 es considerado el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 5, porque divulga un compuesto de fórmula I g. 1, línea 31 a Pág. 2, líneas 1 - 3), donde A representa (A13) (...)*

*La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 5 y el compuesto del documento D1 consiste en la definición del radical  $X^1$  es F, mientras que en D1 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en D1.*

*El efecto que lograría las diferencias estructurales, en cuanto a especificar más un sustituyente de la estructura central, antes mencionadas en el compuesto de fórmula I de la reivindicación 5, en cuanto a su eficiente acción como fungicidas, no puede ser determinado toda vez que no existe alguna evidencia que indique que dichas diferencias estructurales, otorgan al compuesto ahora reivindicado una ventaja técnica sobre los compuestos ya conocidos en la anterioridad D1.*

*Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a*

*los compuestos conocidos según D1 para que presente una mayor actividad respecto a los compuestos ya conocidos y una eficacia al menos equivalente a la ya conocida.*

*Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivará de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 5 de la presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 toda vez que las diferencias se limitan en seleccionar un halógeno para definir un solo sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad fungicida y de evitar el desarrollo de cepas resistentes.*

*Puesto que la reivindicaciones dependientes 6 - 9 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas. (...)*

*La reivindicación 5 consiste en un compuesto de fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde X1 representa un flúor y Y es CR5 (FI. 136). (...)*

*Teniendo en cuenta el grupo inventivo 2o, los documentos D1 y D2 son considerados el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 5, porque: D2 divulga un compuesto de fórmula (I) (...)*

*La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 5 y el compuesto del documento D2 consiste en la definición del radical Xa que se especifica que solo es F, mientras que en D2 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en D2.*

*La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 5 y el compuesto del documento D3 consiste en la definición del radical X1 que se especifica que solo es F, mientras que en D3 se menciona que es un halógeno, simplemente se selecciona el halógeno de lo ya divulgado en D3.*

*El efecto que lograría las diferencias estructurales, en cuanto a especificar más y seleccionar un sustituyente de la estructura central, antes mencionadas en el compuesto de fórmula I de la reivindicación 5, en cuanto a su eficiente acción como fungicidas, no puede ser determinado toda vez que no existe alguna evidencia que indique que dichas diferencias estructurales, otorgan al compuesto ahora reivindicado una ventaja técnica sobre los compuestos ya conocidos en la anterioridad D1 o D2.*

*Por lo tanto, el problema técnico objetivo a resolver consiste en plantear una alternativa a los compuestos conocidos según D1 o D2 para que presenten una mayor actividad respecto a los compuestos ya conocidos y una eficacia al menos equivalente a la ya conocida.*

*Teniendo en cuenta lo expuesto anteriormente, la personas de nivel medio versada en la materia derivara de manera obvia los compuestos descritos en la reivindicación 5 de la*

presente invención a partir de las enseñanzas del documento D1 o D2 toda vez que las diferencias se limitan en seleccionar un halógeno de lo ya divulgado, para definir él un solo sustituyente sin cambiar los anillos centrales de la estructura, sin que ese hecho confiera una mayor eficiencia en su actividad fungicida y de evitar el desarrollo de cepas resistentes.

Puesto que la reivindicaciones dependientes 6 - 9 no mencionan características inventivas adicionales, tampoco pueden ser consideradas inventivas (...)"

## 2. Argumentos a favor de la patentabilidad de la solicitud

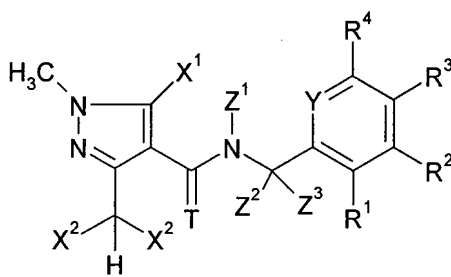
### 2.1 Título

En referencia con la observación en relacionada con el título, el solicitante ha decidido modificar el título de la presente solicitud por:

*"Derivados de N-cicloalquil-N-bencil pirazol(tio)carboxamida fungicida y N-cicloalquil-N-(fusionado)bencil pirazol(tio) carboxamidas fungicidas".*

### 2.2. Reivindicaciones

En relación con las observaciones planteadas por su Despacho a las reivindicaciones el solicitante ha decidido presentar un nuevo capítulo reivindicatorio el cual se ha limitado al segundo grupo definido por su Despacho, es decir, al compuesto de fórmula (I)



(I)

cuando Y es CR<sup>5</sup> originando un sustituyente fenilo y composiciones. De los otros grupos considerados por su Despacho se presentan solicitudes divisionales. Las reivindicaciones 19, 21 y 22 se han eliminado.

La solicitud tal como se presentó describía compuestos en donde:

Y representa CR<sup>5</sup> o N;

T representa S o O;

X<sup>1</sup> y X<sup>2</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o de flúor;

Z<sup>1</sup> representa un ciclopropilo no sustituido o un ciclopropilo sustituido por un grupo alquilo;

Z<sup>2</sup> y Z<sup>3</sup>, representan independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo; o

Z<sup>3</sup> y R<sup>1</sup> junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo de 5 ó 6 miembros, sustituido o sin sustituir;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo halogenoalquilo alcoxi; halogenoalcoxi; halogenoalquilsulfanilo; cicloalquilo; bicicloalquilo, trialquilsililo; arilo; ariloxi; arilalquilo; halogenoarilo, arilhalogenoalcoxi; fenoxi o dos sustituyentes vecinos R junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo saturado de 5 ó 6 miembros sustituido o sin sustituir; o

R<sup>1</sup> y Z<sup>3</sup> junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo de 5 ó 6 miembros, sustituido o sin sustituir.

El solicitante considera que los nuevos datos (**datos adicionales I**) muestran nuevos compuestos activos en donde:

Z<sup>2</sup> representa alcóxicarbonilo;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> o R<sup>5</sup> representan pentafluoro-λ<sup>6</sup>-sulfanilo; dialquilamino; alcóxialquilo; alquilo sustituido por un fenilo sustituido, alquilsulfanilo; alqueno; halogenocicloalquilo, cicloalquilo sustituido con fenilo o cicloalquilo sustituido o sin sustituir.

## 2.2 Unidad de invención

Tal como se mencionó arriba, el solicitante ha dirigido la presente invención al grupo que su Despacho ha denominado como 2. De los otros grupos se presentan solicitudes divisionales.

## 2.3 Novedad y nivel inventivo

La novedad de una solicitud está legalmente definida en el Artículo 16 de la Decisión 486

así: “una invención se considerará nueva, cuando no está comprendida en el estado de la técnica. El estado de la técnica comprenderá todo lo que haya sido accesible al público por una descripción escrita u oral, utilización, comercialización o cualquier otro medio antes de la fecha de presentación de la solicitud de patente o, en su caso de la prioridad reconocida...”

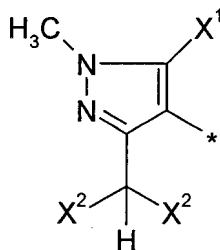
En virtud de la anterior definición, consideramos que los documentos D1, D2 o D3 no constituyen documentos del arte previo que afecten la novedad de la presente solicitud.

En cuanto al nivel inventivo éste se encuentra definido en el Artículo 18 de la Decisión 486 y se establece cuando “si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica”.

Contrario a lo que plantea el Examinador, el documento del arte previo citado no afecta el nivel inventivo de la presente solicitud por cuanto no es posible derivar la presente invención a partir de las enseñanzas presentadas en los documentos D1, D2 o D3.

A continuación se explica tanto la novedad como el nivel inventivo de las nuevas reivindicaciones del nuevo capítulo reivindicatorio allegado junto con este escrito, es decir, dirigido al segundo grupo inventivo ( $Y = CR^5$ ), considerando que el primer grupo inventivo ( $Y = N$ ) será objeto de una solicitud divisional.

Su Despacho plantea que el segundo grupo inventivo difiere de los compuestos específicamente descritos en D2 y D3 por las combinaciones específicas de los sustituyentes del grupo funcional pirazol:



Ninguno de los compuestos específicamente descritos en D2 o D3 tiene un grupo funcional pirazol sustituido por  $X1 = Cl$  o  $F$  y por  $-CH(X2)_2$  en donde  $X2$  es  $Cl$  o  $F$ .

El solicitante ha mostrado en la solicitud tal como se presentó, datos comparativos que muestran que los compuestos de la invención, que comparten dicha combinación específica en los sustituyentes del grupo funcional pirazol, tienen una actividad biológica mucho mejor que los compuestos estructuralmente mas cercanos descritos en los documentos D2 y D3 (ver ejemplo R de la solicitud tal como se presentó).

D3 (WO2007/087906) se podría considerar como el documento del estado de la técnica más cercano. Los compuestos actualmente reivindicados de la fórmula (I) difieren de los compuestos conocidos de D3 (compuestos 240-246, página 34; 482-495, página 40) porque ellos poseen un átomo de cloro o flúor como sustituyente "X<sup>1</sup>", en lugar de un átomo de hidrógeno.

El solicitante presenta **datos adicionales II** que muestran que el reemplazo de un sustituyente de hidrógeno en dicha posición por un átomo de cloro o flúor es responsable de una mayor eficiencia inesperada.

De hecho, muy buena eficacia (al menos 85%) con relación al total se observó cuando X1 = F o Cl, mientras que se observó que la eficacia era nula (0%) a débil (menor del 50%) con los mismos compuestos difiriendo solo en el sustituyente X1 = H, cuando ambos grupos poseen el fragmento CHF2.

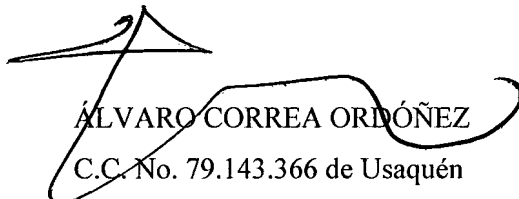
La materia objeto del segundo grupo inventivo es una selección de D2 y D3 que es nueva e inventiva.

### **3. Solicitudes concedidas en otros países para esta misma invención.**

A manera informativa, pongo en conocimiento del Examinador que la invención se ha considerado como patentable en Europa. Aún cuando entiendo que estas decisiones de ninguna manera obligan al Despacho para decidir de igual forma, considero que por tratarse de una pregunta fáctica la determinación de la existencia de novedad y nivel inventivo, las decisiones de otras oficinas de patentes constituyen un antecedente persuasivo en la materia. Por favor note que en los resultados del examen de la EPC, anexos al presente escrito, el examinador explica claramente los fundamentos que encontró para considerar la presente invención como nueva y con nivel inventivo.

En virtud de lo anterior, solicito que se acepten las razones expuestas en el presente documento y en consecuencia, se otorgue el privilegio de patente de invención para el invento que se tramita en este expediente.

Atentamente,

  
ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ  
C.C. No. 79.143.366 de Usaquén  
T.P. 20.281

Anexos:

- Datos de prueba (I y II)
- Capítulo reivindicatorio modificado
- Recibo presentación tres solicitudes divisionales
- Recibos por reivindicaciones adicionales
- Tres solicitudes divisionales
- Resultados del examen realizado por la EPC y reivindicaciones aceptadas (EP).

BM\_RAC/BOGDMS-#1664448-V1-P2011\_000039-MEMORIAL\_DE\_RESPUESTA\_AUTO\_DE\_FONDO.DOC

### **Additional data I**

The tests are performed as disclosed in the application as filed for *Venturia inaequalis*, *Botrytis cinerea*, *Puccinia triticina*, *Fusarium nivale*, *Phakospora pachyrhizi*, *Blumeria graminis*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Alternaria solani*, *Leptosphaeria nodorum*, *Pyrenophora teres*, *Fusarium graminearum*.

The protocols for *Alternaria brassicae*, *Uromyces appendiculatus*, *Pyricularia oryzae* and *Septoria tritici* are disclosed below

Table 1 shows the chemical structure of the new tested compounds.

Tables 2a and 2b show the efficiency obtained with these compounds against several pathogens. Said tables show the data observed with several tests, and disclosed the observed good (at least 70%) to total (100%) efficiency.

#### **in vivo test on *Alternaria brassicae* (Leaf spot of crucifers)**

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, and then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Radish plants ("Pernod Clair" variety), sown in starter cups on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 17°C, are treated at the cotyledon stage by spraying with the active ingredient prepared as described above. Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying the cotyledons with an aqueous suspension of *Alternaria brassicae* spores (50 000 spores per ml). The spores are collected from a 15-day-old culture. The contaminated radish plants are incubated at 20°C and at 100% relative humidity.

Grading (% of efficacy) is carried out 6 days after the contamination, in comparison with the control plants.

#### **In vivo preventive test on *Uromyces appendiculatus* (bean rust)**

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, and then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Bean plants ("Saxa" variety), sown in starter cups on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 24°C, are treated at the 2-leaf stage (9 cm height) by spraying with the active

ingredient prepared as described above. Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying the leaves with an aqueous suspension of *Uromyces appendiculatus* spores (150 000 spores per ml). The spores are collected from infected plants and are suspended in water containing 2.5 ml/l of Tween 80 at 10%. The contaminated bean plants are incubated for 24 hours at 20°C and at 100% relative humidity, and then for 10 days at 20°C and at 70-80% relative humidity.

Grading (% of efficacy) is carried out 11 days after the contamination, in comparison with the control plants.

In vivo preventive test on *Pyricularia oryzae* (rice blast)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, and then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Rice plants ("Koshihikari" variety), sown in starter cups on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 26°C, are treated at the 2-leaf stage (10 cm height) by spraying with the active ingredient prepared as described above. Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying the leaves with an aqueous suspension of *Pyricularia oryzae* spores (40 000 spores per ml). The spores are collected from a 15-day-old culture and are suspended in water containing 2.5 g/l of gelatin. The contaminated rice plants are incubated at 25°C and at 80% relative humidity.

Grading (% of efficacy) is carried out 6 days after the contamination, in comparison with the control plants.

In vivo test on *Septoria tritici* (Wheat Leaf Spot)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Wheat plants (Scipion variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

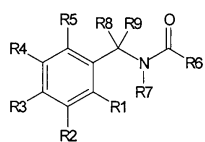
After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of cryopreserved *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) spores (500 000



spores per ml). The contaminated wheat plants are incubated for 72 hours at 18°C and at 100% relative humidity, and then for 21 to 28 days at 90% relative humidity.

Grading (% of efficacy) is carried out 21 to 28 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Table 1



| N°  | R1                       | R2     | R3     | R4                                  | R5             | R6                                                   | R7          | R8  | R9 |
|-----|--------------------------|--------|--------|-------------------------------------|----------------|------------------------------------------------------|-------------|-----|----|
| 200 | fluoro                   | H      | H      | H                                   | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 201 | prop-1-en-2-yl           | H      | H      | fluoro                              | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 202 | prop-1-en-2-yl           | H      | fluoro | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 203 | methylsulfanyl           | H      | H      | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 204 | 4-(3-methoxypentan-3-yl) | H      | H      | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 205 | dimethylamino            | H      | H      | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 206 | 4-(1-ethoxypropyl)       | H      | H      | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 207 | prop-1-en-2-yl           | H      | chloro | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 208 | prop-1-en-2-yl           | H      | H      | chloro                              | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 209 | prop-1-en-2-yl           | H      | H      | CH3                                 | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 210 | prop-1-en-2-yl           | chloro | H      | H                                   | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 211 | 2-methoxypropan-2-yl     | H      | H      | chloro                              | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 212 | H                        | chloro | H      | pentafluoro-λ <sup>6</sup> sulfanyl | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H   | H  |
| 213 | prop-1-en-2-yl           | H      | H      | chloro                              | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | CH3 | H  |



|     |                                   |                 |   |        |                |                                                      |             |   |   |
|-----|-----------------------------------|-----------------|---|--------|----------------|------------------------------------------------------|-------------|---|---|
| 214 | (3-methylbutyl)sulfanyl           | H               | H | chloro | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 215 | 4-[(3,3-dimethylbutyl)sulfanyl]   | H               | H | chloro | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 216 |                                   | trifluoromethyl | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 217 | fluoro                            | fluoro          | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 218 | 4-[2-(2-chlorophenyl)cyclopropyl] | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 219 | 2-phenylcyclopropyl               | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 220 | 4-(2,2-dichlorocyclopropyl)       | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 221 | 4-[2-(4-chlorophenyl)cyclopropyl] | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 222 | 4-(2,2-dibromocyclopropyl)        | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 223 | 4-[2-(3-chlorophenyl)cyclopropyl] | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 224 | 4-[2-(4-methylphenyl)cyclopropyl] | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 225 | fluoro                            | CH3             | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 226 | chloro                            | chloro          | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 227 | 2-cyclopropylethyl                | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 228 | 2-cyclopentylethyl                | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 229 | 2-cyclohexylethyl                 | H               | H | H      | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |



|     |                                      |                |   |        |                |                                                      |             |   |   |
|-----|--------------------------------------|----------------|---|--------|----------------|------------------------------------------------------|-------------|---|---|
| 230 | 4-[3-methyl-3-(4-methylphenyl)butyl] | H              | H | CH3    | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 231 | 2-cyclopentylethyl                   | H              | H | chloro | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 232 | fluoro                               | chloro         | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 233 | fluoro                               | prop-1-en-2-yl | H | H      | prop-1-en-2-yl | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 234 | 4-(2-methylbut-3-en-2-yl)            | H              | H | chloro | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |
| 235 | 4-(2-methylbut-3-en-2-yl)            | H              | H | CH3    | H              | 3-(difluoromethyl)-5-fluoro-1-methyl-1H-pyrazol-4-yl | cyclopropyl | H | H |

Biological activity:

17



| Compounds | Sphaerotheca fuliginea (500 ppm) | Sphaerotheca fuliginea (100 ppm) | Alternaria brassicae (500 ppm) | Alternaria brassicae (100 ppm) | Alternaria solani (500 ppm) | Alternaria solani (100 ppm) | Uromyces appendiculatus (500 ppm) | Uromyces appendiculatus (100 ppm) | Botrytis cinerea (500 ppm) | Botrytis cinerea (100 ppm) | Leptosphaeria nodorum (500 ppm) | Pyrenophora teres (500 ppm) | Pyrenophora teres (100 ppm) | Puccinia tritici (500 ppm) | Puccinia tritici (100 ppm) | Pyricularia oryzae | Blumeria graminis (500 ppm) | Septoria tritici (500 ppm) | Septoria tritici (100 ppm) |
|-----------|----------------------------------|----------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|-----------------------------|-----------------------------|-----------------------------------|-----------------------------------|----------------------------|----------------------------|---------------------------------|-----------------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|--------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|
| 200       | 100%                             | 100%<br>100%<br>83%              |                                |                                | 95%                         | 93%                         | 100%                              | 100%                              | 98%                        | 100%<br>96%                | 95%<br>100%                     | 100%<br>100%                | 97%                         | 100%<br>100%               |                            |                    | 100%                        | 100%                       |                            |
| 201       | 95%                              | 100%                             |                                |                                | 90%                         | 93%                         | 100%                              | 100%                              |                            | 100%                       | 95%<br>100%                     | 100%<br>100%                |                             | 100%<br>100%               |                            |                    | 100%                        | 71%                        |                            |
| 202       | 95%                              | 94%                              |                                |                                | 95%                         | 90%                         | 100%                              | 100%                              |                            | 99%                        | 94%<br>93%                      | 100%<br>100%                |                             | 100%<br>100%               |                            |                    | 100%                        | 100%                       |                            |
| 203       |                                  | 88%                              |                                |                                | 100%                        | 94%                         | 95%                               | 98%                               | 100%                       | 100%                       | 100%<br>83%                     | 100%<br>100%                |                             | 70%<br>100%                |                            | 89%<br>%           | 100%                        | 100%                       |                            |
| 204       | 95%                              | 100%                             |                                |                                | 100%                        | 94%                         | 97%                               | 95%                               |                            | 100%                       | 94%<br>86%                      | 100%<br>88%                 |                             | 100%<br>100%               |                            | 70%<br>%           | 100%                        | 100%                       |                            |
| 205       | 85%                              |                                  |                                |                                | 95%                         |                             |                                   |                                   | 100%                       |                            | 95%<br>93%                      | 100%<br>100%                |                             | 95%<br>100%                |                            | 89%<br>%           | 100%                        | 100%                       |                            |
| 206       | 100%                             |                                  |                                |                                | 90%                         |                             |                                   |                                   | 93%                        |                            | 90%<br>89%                      | 100%<br>100%                |                             | 78%<br>100%                |                            |                    | 100%                        | 100%                       |                            |
| 207       | 100%                             | 100%                             |                                |                                | 94%                         | 93%                         | 100%                              | 100%                              | 100%                       | 95%                        | 95%<br>100%                     | 100%                        |                             | 95%<br>100%                |                            |                    | 100%                        |                            |                            |
| 208       | 98%                              | 100%                             | 98%                            |                                |                             | 94%                         | 100%                              | 100%                              | 100%                       | 99%                        |                                 |                             |                             | 100%                       |                            | 83%<br>%           |                             | 100%                       |                            |
| 209       | 100%                             |                                  | 97%                            |                                |                             |                             | 100%                              |                                   | 88%                        |                            | 86%                             | 100%                        |                             | 100%                       | 100%                       |                    | 90%                         | 100%<br>95%                |                            |
| 210       | 100%                             | 100%                             |                                |                                |                             | 95%                         | 100%                              | 100%                              | 100%                       | 86%                        | 83%                             | 100%<br>100%                |                             | 100%<br>100%               |                            |                    | 100%                        | 100%                       |                            |
| 211       | 100%                             | 100%                             |                                |                                |                             | 94%                         | 100%                              | 100%                              |                            |                            | 83%                             | 100%<br>94%                 |                             | 100%<br>100%               |                            | 70%<br>%           |                             | 100%<br>100%               |                            |
| 212       | 100%                             | 93%                              | 100%                           |                                |                             | 100%                        | 100%                              | 98%                               | 100%                       |                            |                                 | 100%                        |                             | 98%                        |                            |                    |                             | 100%                       |                            |
| 213       | 100%                             | 100%                             |                                |                                |                             | 96%                         |                                   | 100%                              |                            | 100%                       | 80%                             | 100%                        |                             | 100%                       |                            |                    | 100%                        | 86%                        |                            |
| 214       | 100%                             |                                  |                                |                                |                             |                             | 100%                              |                                   |                            |                            |                                 |                             |                             | 88%                        |                            |                    |                             | 97%                        |                            |
| 215       | 100%                             |                                  | 100%                           |                                |                             |                             | 100%                              |                                   | 100%                       |                            |                                 |                             |                             | 83%                        |                            |                    |                             | 100%                       |                            |
| 216       | 100%                             |                                  | 90%                            |                                |                             |                             | 100%                              |                                   | 83%                        |                            |                                 | 100%<br>93%                 |                             | 100%<br>100%               |                            | 97%<br>%           | 100%                        | 100%                       |                            |
| 217       | 100%                             | 100%                             | 100%                           |                                |                             | 100%                        | 100%                              | 100%                              | 100%                       | 100%                       | 100%                            | 100%                        |                             | 100%<br>100%               |                            | 83%<br>%           | 100%                        | 100%<br>96%                |                            |
| 218       |                                  | 100%                             |                                | 100%                           |                             |                             |                                   | 98%                               |                            |                            |                                 |                             |                             |                            | 78%                        |                    |                             |                            | 100%                       |
| 219       |                                  | 100%                             |                                |                                |                             |                             |                                   | 94%                               |                            |                            |                                 |                             | 93%                         |                            | 89%                        |                    |                             |                            | 97%                        |
| 220       | 100%                             |                                  | 86%                            |                                |                             |                             | 100%                              |                                   | 99%                        |                            |                                 | 97%                         |                             | 98%                        |                            |                    |                             | 100%                       |                            |



| Compounds | Sphaerotheca fuliginea (500 ppm) | Sphaerotheca fuliginea (100 ppm) | Alternaria brassicae (500 ppm) | Alternaria brassicae (100 ppm) | Alternaria solani (500 ppm) | Alternaria solani (100 ppm) | Uromyces appendiculatus (500 ppm) | Uromyces appendiculatus (100 ppm) | Botrytis cinerea (500 ppm) | Botrytis cinerea (100 ppm) | Leptosphaeria nodorum (500 ppm) | Pyrenophora teres (500 ppm) | Pyrenophora teres (100 ppm) | Puccinia tritici (500 ppm) | Puccinia tritici (100 ppm) | Pyricularia oryzae (500 ppm) | Blumeria graminis (500 ppm) | Septoria tritici (500 ppm) | Septoria tritici (100 ppm) |
|-----------|----------------------------------|----------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|-----------------------------|-----------------------------|-----------------------------------|-----------------------------------|----------------------------|----------------------------|---------------------------------|-----------------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|------------------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|
| 221       |                                  | 100%                             |                                |                                |                             |                             |                                   |                                   |                            |                            |                                 |                             | 97%                         |                            | 83%                        |                              |                             |                            | 97%                        |
| 222       |                                  | 100%                             |                                |                                |                             |                             |                                   | 88%                               |                            |                            |                                 |                             | 93%                         |                            | 89%                        |                              |                             |                            | 97%                        |
| 223       |                                  | 100%                             |                                |                                |                             |                             |                                   | 89%                               |                            |                            |                                 |                             | 93%                         |                            | 72%                        |                              |                             |                            | 93%                        |
| 224       |                                  | 100%                             |                                |                                |                             |                             |                                   |                                   |                            |                            |                                 |                             | 97%                         |                            | 83%                        |                              |                             |                            | 93%                        |
| 225       |                                  | 100%                             |                                | 100%                           |                             | 95%                         |                                   | 100%                              |                            | 100%                       | 100%                            | 100%                        | 100%                        | 100%                       | 98%                        |                              | 100%                        | 100%                       | 100%                       |
| 226       |                                  | 100%                             |                                | 94%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            | 90%                        |                                 |                             | 97%                         |                            | 94%                        |                              |                             |                            | 92%                        |
| 227       |                                  | 100%                             |                                | 93%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            |                            |                                 |                             | 97%                         |                            | 94%                        |                              |                             |                            | 93%                        |
| 228       |                                  | 100%                             |                                | 98%                            |                             |                             |                                   |                                   |                            | 100%                       |                                 |                             | 100%                        |                            | 94%                        |                              |                             |                            | 93%                        |
| 229       |                                  | 100%                             |                                | 97%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            |                            |                                 |                             | 97%                         |                            | 81%                        |                              |                             |                            | 93%                        |
| 230       |                                  | 100%                             |                                | 88%                            |                             |                             |                                   |                                   |                            | 100%                       |                                 |                             |                             |                            | 75%                        |                              |                             |                            | 86%                        |
| 231       |                                  | 100%                             |                                | 88%                            |                             |                             |                                   | 94%                               |                            | 100%                       |                                 |                             | 88%                         |                            | 98%                        |                              |                             |                            | 71%                        |
| 232       |                                  | 100%                             |                                | 93%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            |                            |                                 |                             | 97%                         |                            | 100%                       |                              |                             |                            | 100%                       |
| 233       |                                  | 100%                             |                                | 80%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            | 91%                        |                                 |                             | 100%                        |                            | 98%                        |                              |                             |                            | 97%                        |
| 234       |                                  | 100%                             |                                | 80%                            |                             |                             |                                   | 100%                              |                            |                            |                                 |                             | 92%                         |                            | 100%                       |                              |                             |                            |                            |



Table 2b

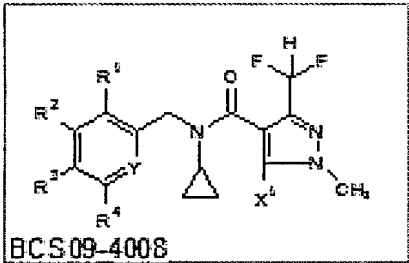
| Compounds | Fusarium<br>nivale<br>(500 ppm) | Fusarium<br>graminearum<br>(500ppm) | Venturia<br>inaequalis<br>(100 ppm) | Phakospora<br>pachyrhizi<br>(100 ppm) |
|-----------|---------------------------------|-------------------------------------|-------------------------------------|---------------------------------------|
| 200       | 94%                             |                                     | 100%                                |                                       |
| 201       | 100%                            |                                     | 100%                                | 100%                                  |
| 202       | 100%                            | 71%                                 | 100%                                | 99%                                   |
| 203       |                                 |                                     | 100%                                |                                       |
| 204       | 86%                             |                                     | 100%                                | 93%                                   |
| 205       | 80%                             |                                     |                                     |                                       |
| 206       | 100%                            |                                     |                                     |                                       |
| 207       | 93%                             |                                     | 100%                                | 94%                                   |
| 208       | 100%                            |                                     | 99%                                 |                                       |
| 209       | 100%                            |                                     |                                     |                                       |
| 210       | 100%                            | 83%                                 | 99%                                 | 100%                                  |
| 211       | 100%                            |                                     | 100%                                | 100%                                  |
| 212       | 96%                             |                                     |                                     |                                       |
| 213       | 100%                            |                                     | 100%                                | 76%                                   |
| 216       | 100%                            |                                     |                                     |                                       |
| 217       | 100%                            |                                     | 100%                                | 99%                                   |
| 225       | 100%                            |                                     | 100%                                | 99%                                   |



**Additional data II**

The tests are performed as disclosed in the application as filed for *Botrytis cinerea*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Leptosphaeria nodorum*, and identically to the test disclosed for *Puccinia triticina* for *Puccinia recondita*.

**Results**



**Efficacy at 500 ppm on *Botrytis cinerea***

| Compound                                                  | X1 | Efficacy |
|-----------------------------------------------------------|----|----------|
| R1 = CF3, R4 = Cl, Y = CF                                 | F  | 97       |
|                                                           | H  | 25       |
| R1 = Br, R4 = Br, Y = CH                                  | F  | 100      |
|                                                           | H  | 0        |
| R1 = Br, R4 = F, Y = CH                                   | F  | 100      |
|                                                           | H  | 0        |
| R1 = Br, Y = CH                                           | F  | 100      |
|                                                           | H  | 25       |
| R1 = iPr, R4 = Cl, Y = CH<br>and Z1 = 2-methylcyclopropyl | F  | 100      |
|                                                           | H  | 50       |

**Efficacy at 500 ppm on *Puccinia recondita***

| Compound                | X1 | Efficacy |
|-------------------------|----|----------|
| R1 = Br, Y = CF         | F  | 100      |
|                         | H  | 20       |
| R1 = Br, R4 = F, Y = CH | F  | 100      |
|                         | H  | 45       |



Efficacy at 500 ppm on *Sphaerotheca fuliginea*

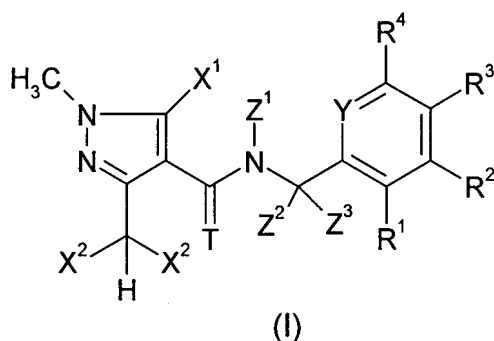
| Compound                                          | X1 | Efficacy |
|---------------------------------------------------|----|----------|
| R1 = Cl, R3 = Me, R4 = Me, Y = CH                 | F  | 95       |
|                                                   | H  | 15       |
| R1 = F, R4 = F, Y = CH                            | F  | 95       |
|                                                   | H  | 0        |
| R4 = Br, Y = N                                    | F  | 85       |
|                                                   | H  | 0        |
| R1 = OMe, R4 = Br, Y = CH                         | F  | 95       |
|                                                   | H  | 30       |
| R1 = Me, R4 = Me, Y = CH                          | F  | 100      |
|                                                   | Cl | 100      |
|                                                   | H  | 35       |
| R1 = OMe, R4 = Cl, Y = CH                         | F  | 100      |
|                                                   | H  | 30       |
| R1 = SiMe3, Y = CH<br>and Z1 = 2methylcyclopropyl | F  | 100      |
|                                                   | H  | 15       |

Efficacy at 500 ppm or 100 ppm on *Leptosphaeria nodorum*

| Compound                          | X1 | Efficacy (concentration) |
|-----------------------------------|----|--------------------------|
| R1 = C#CH (ethynyl), Y = CH       | F  | 89 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 10 (500 ppm)             |
| R1 = cPr, R4 = cPr, Y = CH        | F  | 95 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 30 (500 ppm)             |
| R1 = Cl, R3 = Me, R4 = Me, Y = CH | F  | 100 (500 ppm)            |
|                                   | H  | 50 (500 ppm)             |
| R1 = CF3, R4 = Br, Y = CH         | F  | 95 (100 ppm)             |
|                                   | H  | 0 (100 ppm)              |
| R1 = cPr, R4 = Cl, Y = CH         | F  | 94 (100 ppm)             |
|                                   | H  | 11 (100 ppm)             |
| R1 = Br, Y = N                    | F  | 90 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 20 (500 ppm)             |
| R1 = I, R4 = Br, Y = CH           | F  | 89 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 20 (500 ppm)             |
| R1 = OMe, R4 = Cl, Y = CH         | F  | 95 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 0 (500 ppm)              |
| R1 = F, R4 = Cl, Y = CF           | F  | 95 (500 ppm)             |
|                                   | H  | 10 (500 ppm)             |

# REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



en donde

- Y representa CR<sup>5</sup>;
- T representa S u O ;
- X<sup>1</sup> y X<sup>2</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o de flúor ;
- Z1 representa un ciclopropilo no sustituido o un ciclopropilo sustituido con hasta 2 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); o halogenoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- Z<sup>2</sup> y Z<sup>3</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) sustituido o sin sustituir ; un átomo de halógeno; alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>) sustituido o sin sustituir ; alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-carbonilo sustituido o sin sustituir; o  
Z<sup>3</sup> y R<sup>1</sup> junto con los átomos consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido o

sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y  $Z^2$  es como se describe en la presente memoria; o

- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$ , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; sulfanilo; pentafluoro- $\lambda$ 6-sulfanilo; alquilo( $C_1$ - $C_8$ ) sustituido o sin sustituir; halogenoalquilo ( $C_1$ - $C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil( $C_1$ - $C_8$ )-amino sustituido o sin sustituir; dialquil( $C_1$ - $C_8$ )-amino sustituido o sin sustituir; alcoxi( $C_1$ - $C_8$ ) sustituido o sin sustituir; halogenoalcoxi ( $C_1$ - $C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi ( $C_1$ - $C_8$ )-alquilo ( $C_1$ - $C_8$ ); alquil( $C_1$ - $C_8$ )-sulfanilo sustituido o sin sustituir; halogenoalquil ( $C_1$ - $C_8$ )sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo( $C_2$ - $C_8$ ) sustituido o sin sustituir; halogenoalquenilo  $C_2$ - $C_8$  que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueniloxi( $C_2$ - $C_8$ ) sustituido o sin sustituir; halogenoalqueniloxi ( $C_2$ - $C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo( $C_3$ - $C_7$ ) sustituido o sin sustituir; halogenocicloalquilo ( $C_3$ - $C_7$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo ( $C_3$ - $C_7$ )-alquilo- $(C_1$ - $C_8)$  sustituido o sin sustituir; cicloalquilo  $C_3$ - $C_7$ -alquenilo- $C_2$ - $C_8$  sustituido o sin sustituir; alquilo ( $C_1$ - $C_8$ )-cicloalquilo ( $C_3$ - $C_7$ )sustituido o sin sustituir; tri(alquil( $C_1$ - $C_8$ ) sustituido o sin sustituir)sililo; tri(alquil ( $C_1$ - $C_8$ )sustituido o sin sustituir)silil-alquilo ( $C_1$ - $C_8$ ); arilo que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; ariloxi que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; aril-alquilo ( $C_1$ - $C_8$ )que puede estar sustituido con hasta 7 grupos Q; o

Dos sustituyentes vecinos R junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo saturado de 5 ó 6 miembros sustituido o sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y los otros sustituyentes R son como se describen en la presente memoria; o

- $R^1$  y  $Z^3$  junto con los átomos consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido o sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y  $R^2$  a  $R^5$  son como se describen en la presente memoria;
- Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; alquilo( $C_1-C_8$ ); alcoxi( $C_1-C_8$ ); alquil ( $C_1-C_8$ )sulfanilo; halogenoalquilo ( $C_1-C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi ( $C_1-C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; tri-alquil( $C_1-C_8$ )sililo o tri-alquil( $C_1-C_8$ )sililo-alquilo( $C_1-C_8$ );

así como sales, de los mismos.

2. Un compuesto de acuerdo la reivindicación 1, en el que T representa O.
3. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2 donde  $X^1$  representa un átomo de flúor.
4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 donde  $X^2$  representa un átomo de flúor.
5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde  $Z^1$  representa un ciclopropilo sin sustituir.
6. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 donde  $Z^2$  y  $Z^3$  representan independientemente un átomo de hidrógeno o un metilo.
7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 donde  $Z^2$  representa un átomo de hidrógeno y  $Z^3$  representa un átomo de hidrógeno o un metilo.

8. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$ , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo( $C_1-C_8$ ) sustituido o sin sustituir ; halogenoalquilo ( $C_1-C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo( $C_3-C_7$ ) sustituido o sin sustituir; tri(alquil ( $C_1-C_8$ ))sililo; o alquilsulfanilo ( $C_1-C_8$ ) sustituido o sin sustituir.

9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 donde el sustituyente  $R^1$  representa un átomo de halógeno; alquilo( $C_1-C_8$ ); halogenoalquilo ( $C_1-C_8$ )que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo ( $C_3-C_7$ ); tri(alquil( $C_1-C_8$ ))sililo o halógenoalquil( $C_1-C_8$ )sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en donde los sustituyentes  $R^1$  y  $R^5$ , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de halógeno; alquilo( $C_1-C_8$ ); halogenoalquilo ( $C_1-C_8$ ) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo ( $C_3-C_7$ ); tri(alquil( $C_1-C_8$ ))sililo o halógenoalquil( $C_1-C_8$ )sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

BM\_RAC/BOGDMS-#1663243-v1-P2011\_000039-Nuevo\_capitulo\_reivindicatorio.docx



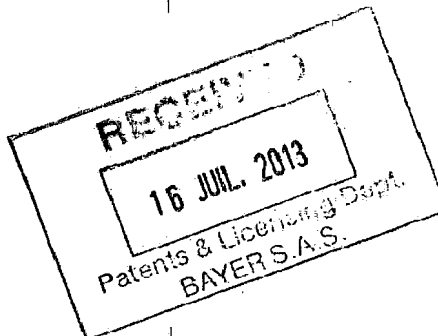
CC  
DOP: 10/11/2013

SCAN

European Patent Office  
Postbus 5818  
2280 HV Rijswijk  
NETHERLANDS  
Tel: +31 70 340 2040  
Fax: +31 70 340 3016



Guillon, Carole  
Bayer S.A.S.  
Patents & Licensing Department  
14 Impasse Pierre Baizet  
CS 99163  
69263 Lyon Cedex 09  
FRANCE



Formalities Officer  
Name: Hurenkamp, Jaap  
Tel: +31 70 340 - 2447  
or call  
+31 (0)70 340 45 00

Substantive Examiner  
Name: Menchaca, Roberto  
Tel: +31 70 340 - 9524

|                                               |                                |                    |
|-----------------------------------------------|--------------------------------|--------------------|
| Application No.<br>10 721 444.7 - 1451        | Ref.<br>BCS 09-4008 PCT - EPO2 | Date<br>10.07.2013 |
| Applicant<br>Bayer Intellectual Property GmbH |                                |                    |

4.10.11.2013

#### Communication pursuant to Article 94(3) EPC

The examination of the above-identified application has revealed that it does not meet the requirements of the European Patent Convention for the reasons enclosed herewith. If the deficiencies indicated are not rectified the application may be refused pursuant to Article 97(2) EPC.

You are invited to file your observations and insofar as the deficiencies are such as to be rectifiable, to correct the indicated deficiencies within a period

of 4 months

from the notification of this communication, this period being computed in accordance with Rules 126(2) and 131(2) and (4) EPC. One set of amendments to the description, claims and drawings is to be filed within the said period on separate sheets (R. 50(1) EPC).

If filing amendments, you must identify them and indicate the basis for them in the application as filed. Failure to meet either requirement may lead to a communication from the Examining Division requesting that you correct this deficiency (R. 137(4) EPC).

**Failure to comply with this invitation in due time will result in the application being deemed to be withdrawn (Art. 94(4) EPC).**

Registered letter

EPO Form 2001 12.10CSX

Date 10.07.2013

Sheet 2

Application No.: 10 721 444.7



Menchaca, Roberto  
Primary Examiner  
**For the Examining Division**

Enclosure(s): 3 page/s reasons (Form 2906)

Datum  
Date 10.07.2013  
Date

Blatt  
Sheet 1  
Feuille

Anmelde-Nr:  
Application No: 10 721 444.7  
Demande n°:

The examination is being carried out on the **following application documents**

**Description, Pages**

1-76 as published

**Claims, Numbers**

1-20 received on 23-11-2012 with letter of 20-11-2012

**1 Document**

Reference is made to the following document; the numbering will be adhered to in the rest of the procedure:

WO 2007/087906 A1 (BAYER CROPSCIENCE SA [FR]; MANSFIELD  
D2 DARREN [DE]; COQUERON PIERRE-YVES) 9 August 2007 (2007-08-09),  
cited in the application page 1

**2 Article 123(2) EPC**

The applicant has amended the claims with letter of 20.11.2012 to limit the claimed subject-matter to the second invention as defined in the IPER. Thus, present claim 1 is only directed to phenyl-containing pyrazole carboxamide derivatives of formula (I) (i.e. the option Y=N has been removed). Originally filed claims 2 and 3, having become superfluous, have also been deleted.

The amendments made by the applicant do not seem to go beyond the content of the application as filed and are therefore compliant with the provisions of Article 123(2) EPC.

**3 Novelty**

None of the prior art documents anticipates neither the phenyl-containing pyrazole carboxamide derivatives of formula (I) as defined in present claim 1 nor the synthetic intermediates of formula (IIb) to (IIg), as respectively defined in present claims 11 to 16.

Datum  
Date 10.07.2013  
Date

Blatt  
Sheet 2  
Feuille

Anmelde-Nr.  
Application No: 10 721 444.7  
Demande n°

The subject-matter of independent claims 1 and 11-20, respectively directed at the referred compounds, processes for their preparation and their use for controlling phytopathogenic fungi of crops, is therefore novel over the prior art in the sense of Article 54(2) EPC.

Dependent claims 2-10 fulfill, as such, the requirements of the EPC with respect to novelty (Article 54(2) EPC).

#### 4 Inventive step

D2 can be regarded as the closest prior art to the presently claimed invention as it describes structurally close-related phenyl-containing pyrazole carboxamide derivatives to those presently claimed for use in controlling phytopathogenic fungi of crops (see, e.g. compounds of formula I-A<sup>13</sup> on pages 34-40).

The presently claimed compounds of formula (I) only differ from the known compounds of D2 in that they further possess a chlorine or fluorine atom as substituent "X<sup>1</sup>". In contrast thereto, the corresponding compounds of D2 (see, e.g. compounds 240-246, page 34; 482-495, page 40) possess a hydrogen substituent in said position.

The comparative experimental data submitted by the applicant on 25.06.2013 show an unexpected efficacy increase in the fungicide activity of the compounds having a chlorine or fluorine atom as substituent "X<sup>1</sup>" (i.e. those presently claimed) with respect to the related compounds having said position free (i.e. those known from D2). The claimed compounds show an efficacy in the range of 85%-100% while the efficacy of the compounds from the closest prior art D2 is in the range of 0-50%.

The problem to be solved by the present invention may therefore be regarded as the provision of further phenyl-containing pyrazole carboxamide derivatives having improved properties for use as fungicides.

Even though the presence of a fluorine atom in said position is hinted in D2 for other related compounds (see, e.g. compounds 235-239, page 34; 378-391, page 37), the skilled person would not expect the significant technical improvement that the incorporation of a fluorine or chlorine atom in the compounds at stake would bring.

The radical enhancement of the fungicide activity due to the incorporation of a halogen atom in position "X<sup>1</sup>" can therefore be regarded as an unexpected technical feature that confers an inventive step to the claimed subject-matter (see experimental results on pages 5-6, additional data submitted on 25.06.2013).

The subject-matter of present claims 1-20 is therefore deemed to involve an inventive step in the sense of Article 56 EPC.

Datum  
Date 10.07.2013  
Date

Blatt  
Sheet 3  
Feuille

Anmelde-Nr.  
Application No: 10 721 444.7  
Demande n°:

## 5 Pending issues

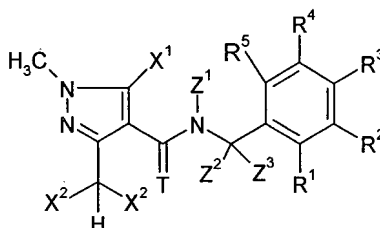
The applicant is requested to bring the description into conformity with the amendments made to the claims. In particular, subject-matter no longer pertaining to the invention should be removed from the description.

# Bayer CropScience

Allowed claims for BCS 09-4008 EP



1. A compound of formula (I)



(I)

wherein

- T represents S or O ;
- $X^1$  and  $X^2$  which can be the same or different, represent a chlorine or a fluorine atom ;
- $Z^1$  represents a non substituted cyclopropyl or a cyclopropyl substituted by up to 2 atoms or groups which can be the same or different and which can be selected in the list consisting of halogen atoms ; cyano ;  $C_1$ - $C_8$ -alkyl ; or  $C_1$ - $C_8$ -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ;
- $Z^2$  and  $Z^3$ , which can be the same or different, represent a hydrogen atom ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkyl ; substituted or non substituted  $C_2$ - $C_8$ -alkenyl ; substituted or non substituted  $C_2$ - $C_8$ -alkynyl ; cyano ; isonitrile ; nitro ; a halogen atom ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkoxy ; substituted or non substituted  $C_2$ - $C_8$ -alkenyloxy ; substituted or non substituted  $C_2$ - $C_8$ -alkynyloxy ; substituted or non substituted  $C_3$ - $C_7$ -cycloalkyl ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylsulfanyl ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylsulfonyl ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylsulfinyl ; amino ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylamino ; substituted or non substituted di- $C_1$ - $C_8$ -alkylamino ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkoxycarbonyl ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylcarbamoyl ; substituted or non substituted di- $C_1$ - $C_8$ -alkylcarbamoyl ; or substituted or non substituted N- $C_1$ - $C_8$ -alkyl- $C_1$ - $C_8$ -alkoxycarbamoyl ; or  
 $Z^3$  and  $R^1$  together with the consecutive carbon atoms to which they are linked form a substituted or non substituted 5-, 6- or 7-membered, partly saturated, carbo- or hetero-cycle comprising up to 3 heteroatoms and  $Z^2$  is as herein described; or  
 $Z^2$  and  $Z^3$  together with the carbon atom to which they are linked form a substituted or non substituted  $C_3$ - $C_7$  cycloalkyl ;
- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  and  $R^5$ , which can be the same or different, represent a hydrogen atom; a halogen atom ; nitro ; cyano ; isonitrile ; hydroxyl ; sulfanyl ; amino ; pentafluoro- $\lambda^6$ -sulfanyl ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkyl ;  $C_1$ - $C_8$ -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkylamino ; substituted or non substituted di- $C_1$ - $C_8$ -alkylamino ; substituted or non substituted  $C_1$ - $C_8$ -alkoxy ;  $C_1$ - $C_8$ -halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ;



$C_1-C_8$ -alkoxy- $C_1-C_8$ -alkyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylsulfanyl ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylsulfanyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_2-C_8$ -alkenyl ;  $C_2-C_8$ -halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_2-C_8$ -alkynyl ;  $C_2-C_8$ -halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_2-C_8$ -alkenyloxy ;  $C_2-C_8$ -halogenoalkenyloxy comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_2-C_8$ -alkynyloxy ;  $C_2-C_8$ -halogenoalkynyloxy comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_3-C_7$ -cycloalkyl ;  $C_3-C_7$ -halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_3-C_7$ -cycloalkyl- $C_1-C_8$ -alkyl ; substituted or non substituted  $C_3-C_7$ -cycloalkyl- $C_2-C_8$ -alkenyl ; substituted or non substituted  $C_3-C_7$ -cycloalkyl- $C_2-C_8$ -alkynyl ; substituted or non substituted  $C_3-C_7$ -cycloalkyl- $C_3-C_7$ -cycloalkyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyl- $C_3-C_7$ -cycloalkyl ; formyl ; formyloxy ; formylamino ; carboxy ; carbamoyl ; N-hydroxycarbamoyl ; carbamate ; (hydroxyimino)- $C_1-C_8$ -alkyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylcarbonyl ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylcarbamoyl ; substituted or non substituted di- $C_1-C_8$ -alkylcarbamoyl ; N-(substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyloxy)carbamoyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkoxycarbamoyl ; N-(substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyl)-(substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkoxy)-carbamoyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkoxycarbonyl ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkoxycarbonyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylaminocarbonyl ; di-substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylaminocarbonyl ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylcarbonyloxy ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylcarbonyloxy comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylcarbonylamino ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylcarbonylamino comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylaminocarbonyloxy ; substituted or non substituted di- $C_1-C_8$ -alkylaminocarbonyloxy ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyloxycarbonyloxy ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylsulfinyl ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylsulfinyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkylsulfonyl ;  $C_1-C_8$ -halogenoalkylsulfonyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkoxyimino ; ( $C_1-C_8$ -alkoxyimino)- $C_1-C_8$ -alkyl ; substituted or non substituted ( $C_1-C_8$ -alkenyloxyimino)- $C_1-C_8$ -alkyl ; ( $C_1-C_8$ -alkynyloxyimino)- $C_1-C_8$ -alkyl ; a (benzyloxyimino)- $C_1-C_8$ -alkyl ; tri(substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyl)silyl ; tri(substituted or non substituted  $C_1-C_8$ -alkyl)silyl- $C_1-C_8$ -alkyl ; benzyloxy which can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylsulfanyl which can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylamino which can be substituted by up to 5 groups Q ; aryl which can be substituted by up to 7 groups Q ; aryloxy which can be substituted

by up to 7 groups Q ; arylamino which can be substituted by up to 7 groups Q ; arylsulfanyl which can be substituted by up to 7 groups Q ; aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>alkyl which can be substituted by up to 7 groups Q ; aryl-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkenyl which can be substituted by up to 7 groups Q ; aryl-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkynyl which can be substituted by up to 7 groups Q ; pyridinyl which can be substituted by up to 4 groups Q ; pyridinyloxy which can be substituted by up to 4 groups Q ; aryl-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl which can be substituted by up to 7 groups Q ; or

Two vicinal substituents R together with the consecutive carbon atoms to which they are linked form a substituted or non substituted 5- or 6-membered, saturated, carbo- or hetero-cycle comprising up to 3 heteroatoms and the other substituents R are as herein-described; or

- R<sup>1</sup> and Z<sup>3</sup> together with the consecutive carbon atoms to which they are linked form a substituted or non substituted 5-, 6- or 7-membered, partly saturated, carbo- or hetero-cycle comprising up to 3 heteroatoms, and R<sup>2</sup> to R<sup>5</sup> are as herein-described;
- Q, which can be the same or different, represents a halogen atom ; cyano ; nitro ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylsulfanyl ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; tri(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alkylsilyl or tri(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)alkylsilyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl ; as well as salts, N-oxydes, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof.

2. A compound according to claim 1 wherein T represents O.

3. A compound according to any one of claims 1 to 2 wherein X<sup>1</sup> represents a fluorine atom.

4. A compound according to any one of claims 1 to 3 wherein X<sup>2</sup> represents a fluorine atom.

5. A compound according to any one of claims 1 to 4 wherein Z<sup>1</sup> represents a non substituted cyclopropyl.

6. A compound according to any one of claims 1 to 5 wherein Z<sup>2</sup> and Z<sup>3</sup> independently represent a hydrogen atom or a methyl.

7. A compound according to any one of claims 1 to 6 wherein Z<sup>2</sup> represents a hydrogen atom and Z<sup>3</sup> represents a hydrogen atom or a methyl.

8. A compound according to any one of claims 1 to 7 wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> and R<sup>5</sup>, which can be the same or different, represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; substituted or non substituted C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ;

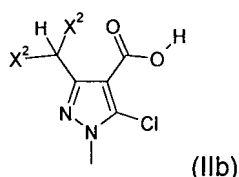


substituted or non substituted C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl ; tri(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)silyl ; or substituted or non substituted C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylsulfanyl.

9. A compound according to any one of claims 1 to 8 wherein the substituent R<sup>1</sup> represents a halogen atom ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl ; tri(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)silyl or C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkylsulfanyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different.

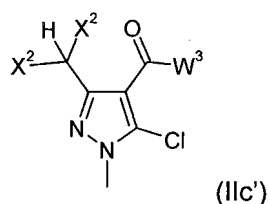
10. A compound according to any one of claims 1 to 9 wherein the substituents R<sup>1</sup> and R<sup>5</sup>, which can be the same or different, represent a halogen atom; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl ; C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different ; C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-cycloalkyl; tri(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)silyl or C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalkylsulfanyl comprising up to 9 halogen atoms which can be the same or different.

11. A compound of formula (IIb)



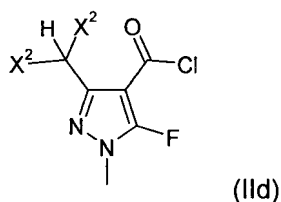
wherein X<sup>2</sup> represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom;

12. A compound of formula (IIc')



wherein X<sup>2</sup> represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom; and W<sup>3</sup> represent a halogen atom, preferably a chlorine atom.

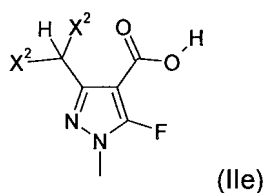
13. A compound of formula (IIId)



wherein X<sup>2</sup> represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom;

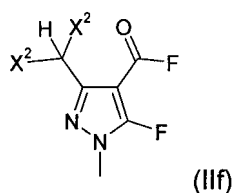


14. A compound of formula (IIe)



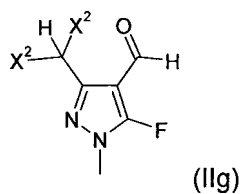
wherein  $X^2$  represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom.

15. A compound of formula (IIf)



wherein  $X^2$  represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom.

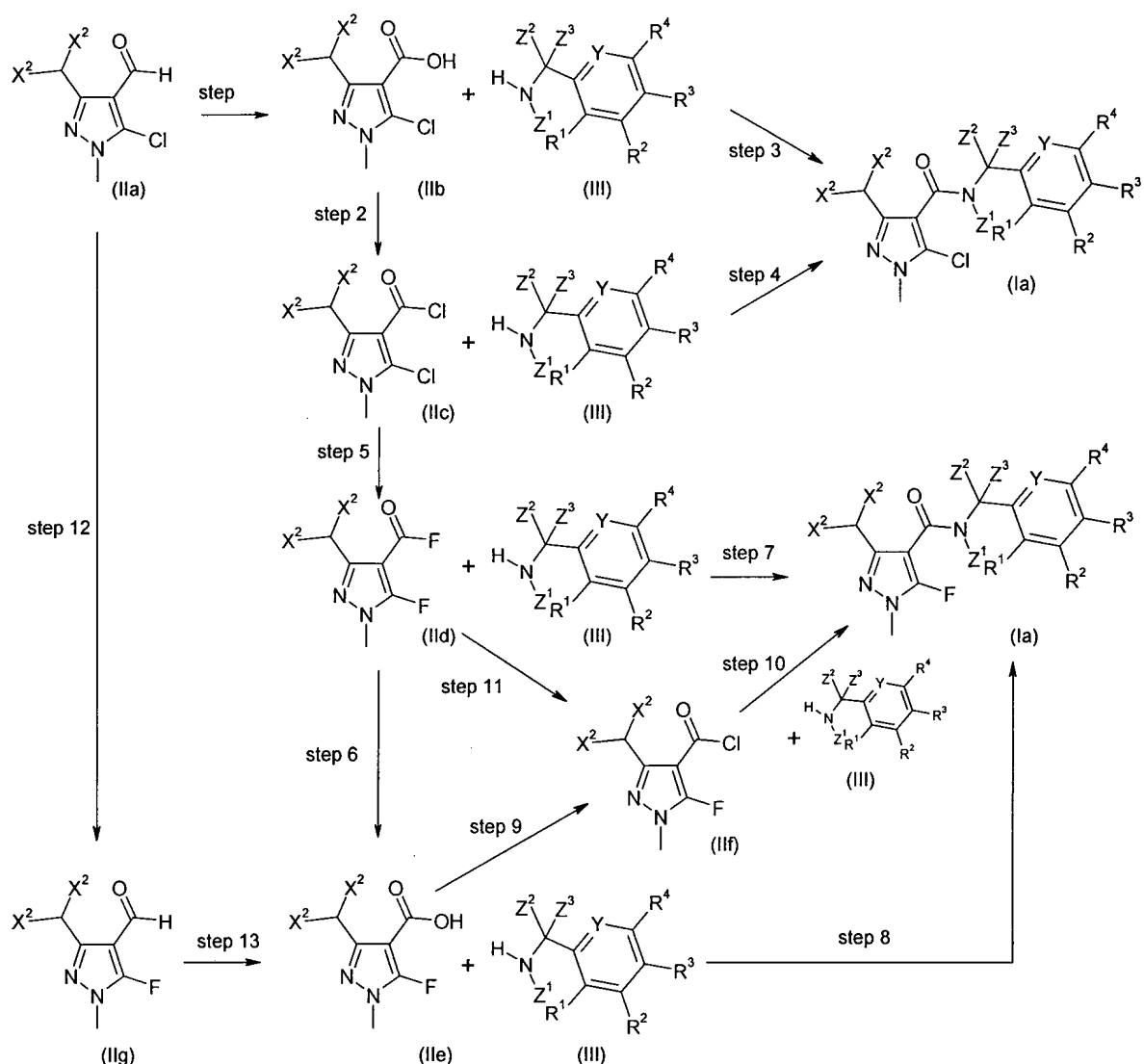
16. A compound of formula (IIg)



wherein  $X^2$  represents a chlorine or a fluorine atom, preferably a fluorine atom.

17. A composition, particularly a fungicide composition, comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of formula (I) according to claims 1 to 10 and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

18. A process for the preparation of a compound of formula (I) according to claims 1 to 10 and of compounds according to claims 11 to 16, according to the following scheme :



wherein

Y represents CR<sup>5</sup>;

Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup>, Z<sup>3</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> and X<sup>2</sup> are as defined in claims 1 to 10.

19. A method for controlling phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a compound according to claims 1 to 10 or a composition according to claim 17 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves and/or the fruit of plants or to the seeds of plants.

20. Use of compounds of formula (I) according to claims 1 to 10 or a composition according to claim 17 for controlling phytopathogenic fungi of crops or/and for the reduction of mycotoxins in plants and part of plants and/or as insecticide, and/or as nematocide.