



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION
- PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL -

04-111386

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO "FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOS, COMO MEJORADORES DE LA ACTIVIDAD DE INSECTICIDAS"

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE SYNGENTA LIMITED y SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO European Regional Centre, Priestly Road, Surrey Research Park,
Guildford, Surrey GU2 7YH, REINO UNIDO y
Schwarzwaldalle 215, CH-4058 Basilea, SUIZA

74. APODERADO DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

22. BOGOTA, D.C.,

PETITORIO



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación: 04111306 00000000

Folios: 68

Fecha (PVP): 2004-11-05 14:10:43

Trámite: 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC

Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE

①

☒ Patente de Invención☐ Patente de Modelo de Utilidad☐ Capítulo I☒ Capítulo II

②

SOLICITANTE (71)

Nombre: SYNGENTA LIMITED y
SYNGENTA PARTICIPATIONS AGDirección: European Regional Centre, Priestly Road,
Surrey Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH, REINO
UNIDO y

Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, SUIZA

Nacionalidad o Domicilio: Surrey, REINO UNIDO y
Basilea, SUIZALugar de Constitución: Surrey, REINO UNIDO y
Basilea, SUIZA

Teléfono

Fax

E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO (74)

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección: CARRERA 9 No. 93-09

Teléfono: 610 74 80 Fax 610 07 08

E-mail: acastell@mpart.net.co

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Número: 39778.654 TPA 70.819

④

INVENTOR (ES) (72)

Nombre: VER ANEXO # 1

Dirección: VER ANEXO # 1

Nacionalidad o Domicilio: VER ANEXO # 1

⑤

PCT (88)

Solicitud Internacional No

PCT/GB03/02210

Fecha

22/06/2003

Publicación Internacional No.

WO 03/099012 A1

Fecha

04/12/2003

⑥

Título (84)

"FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOs, COMO MEJORADORES DE LA ACTIVIDAD DE
INSECTICIDAS"

⑦

Clasificación Internacional (61)

A01N 57/20

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(71) Número de Solicitud

SI ☒NO ☐

GB

23/06/2002

0211924.8

⑨

Comprobante de pago No

04784,670

Fecha

Octubre 28, 2004

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

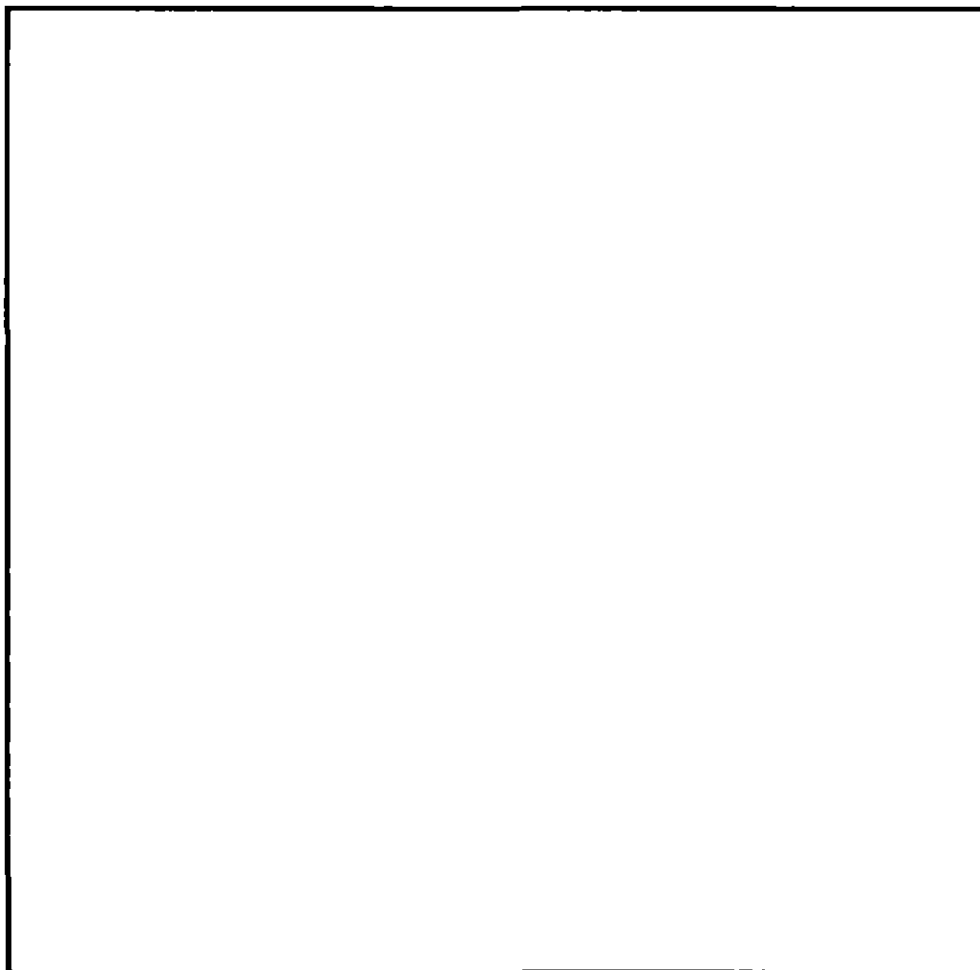
10

Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, si fuere el caso
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud Internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud Internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Copia del examen preliminar Internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA)
- ☒ Traducción del examen preliminar Internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredita la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☐ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☒ De ser el caso modificaciones efectuadas a la solicitud Internacional - NUEVO JUEGO REIVINDICATORIO PRESENTADO EN LA CONTESTACION AL IPER
- ☐ Otros

11

FIGURA CARACTERISTICA.



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA

C O No 30.779.854 Usaquén - TPA 70.819 C.B.J

05 NOV. 2004

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
A B O G A D O S
Carrera 8 No. 83-09
Apartado 8349
Bogotá, D.C. COLOMBIA

ANEXO No. 1

INVENTORES

NOMBRE	DIRECCION	NACIONALIDAD
1 DAVID STOCK	Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell Berkshire RG42 8EY GRAN BRETAÑA	Británica
2 CATHERINE JULIA PIPER	Jealott's Hill International Research Centre, Bracknell Berkshire RG42 8EY GRAN BRETAÑA	Británica
3. JULIE LYNNE RAMSAY	Jealott's Hill International Research Centre Bracknell Berkshire RG42 8EY, GRAN BRETAÑA	Británica
4. MARK STEVEN BIRCHMORE	Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel SUIZA	Británica
5 PATRICK JOSEPH MULQUEEN	Jealott's Hill International Research Centre Bracknell Berkshire RG42 8EY GRAN BRETAÑA	Británica
6 RICHARD BRIAN PERRY	Jealott's Hill International Research Centre Bracknell Berkshire RG42 8EY GRAN BRETAÑA	Británica

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
 Radicacion : 84111386 00000000 Folios: 68
 Fecha (AMP): 2004-11-05 14:10:43
 Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
 Dependencia: 2028 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

MIT 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 84,570
 FECHA : OCTUBRE 28 DE 2004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No PAGO	FECHA PGO	Vr PAGO
ALVARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-a	21258049	28/10/2004	3,705,000 00

***** C O N C E P T O *****

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50003-01-01	SOLICITUDES	
		110 PTC SOLICITUD DE PATENTE DE INVEN	422,000 00
		TOTAL :	\$ 422,000 00

SOM CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE :  _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No _____

5

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.
A B O G A D O S
Carrera 9 No. 83-09
Apartado 8349
Bogotá, D C. - COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E S D

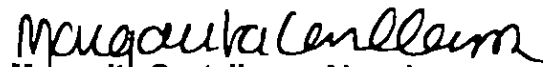
Ref PODER confiendo por la sociedad SYNGENTA LIMITED

Yo, XIMENA CASTELLANOS ABONDANO, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente manifiesto a Uds que sustituyo en la Dra **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió SYNGENTA LIMITED, Con domicilio en Surrey, REINO UNIDO. _____ debidamente legalizado por Apostilla bajo el No G201564 el día 4 de Julio, 2003, con las mismas facultades que me fueron confendadas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, para "FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOS, COMO MEJORADORES DE LA ACTIVIDAD DE INSECTICIDAS".-

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
C C No 39 773 330 de Usaquén
T P A No 58 236 del C S J
Carrera 9 No 93-09 - Bogotá, D C
Teléfonos 6107420 - 6107480


Margarita Castellanos Abondano
C C No 39.779 654 de Usaquén
T P A No 70 819 del C S J
Carrera 9 No 93-09 - Bogotá, D C
Teléfonos 6107420 - 6107480

Bogotá, D C
XCAMCA /gcb.
4953-FNPCT

AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL
 (Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)
 Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
 de esta ciudad compareció personalmente:
Ximeno Castellano
 identificado con C.C. **3.297.963**
 expedida en **Waco** y tarjeta profesio-
 nal de abogado(a) No **458238** del Consejo
 Superior de la Judicatura, con documento di-
 rigido a **Superintendencia**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es
 suya

Ximeno Castellano
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **15 OCT 2004**

AUTORIZÓ ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO

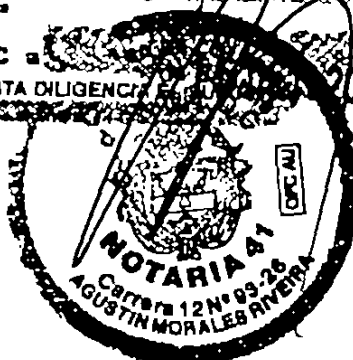


AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL
 (Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)
 Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
 de esta ciudad compareció personalmente:
Marcos Castellano
 identificado con C.C. **3.297.963**
 expedida en **Waco** y tarjeta profesio-
 nal de abogado(a) No **458238** del Consejo
 Superior de la Judicatura, con documento di-
 rigido a **Superintendencia**
 y declaró que la firma puesta en este escrito es
 suya

Marcos Castellano
 Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **15 OCT 2004**

AUTORIZÓ ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



COLOMBIA

PODER

El (os) SYNGENTA LIMITED
Domiciliados en Priestly Road, Surrey
Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH
Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o
MARGARITA CASTELLANOS A. abogadas con oficinas en
la Carrera 9 No. 83-09 Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad
Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para
que nos representen ante cualesquiera autoridades o
personas de los órdenes administrativo, contencioso -
administrativo y judicial en todo lo relacionado con los
siguientes actos y gestiones.

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos
industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio,
colectivas o defensivas y de denominaciones de origen,
depósito de nombres y enseñas comerciales; su renovación,
prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o
domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de
uso de esos derechos, b) Para la obtención de registros
sanitarios; c) Acciones de oposición, observación,
cancelación, nulidad; medidas cautelares y en general los
juicios civiles, penales, administrativos o contencioso -
administrativos que promovamos o se nos promuevan,
pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados
sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar,
renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados
judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 2 de Julio del 2003

en Bracknell, Reino Unido

por SYNGENTA LIMITED

(El notario debe suscribir el documento en la página siguiente)

(Se requiere legalización consular)

Registered Office:

SYNGENTA LIMITED
EUROPEAN REGIONAL CENTRE
PRIESTLY ROAD
SURREY RESEARCH PARK
GUILDFORD
SURREY GU2 7YH
UNITED KINGDOM

I (we) the undersigned SYNGENTA LIMITED
Of
- REINO UNIDO

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA
CASTELLANOS A. and for MARGARITA CASTELLANOS
a. attorneys residing at Carrera 9 No. 83-09, Bogotá-
Colombia, to
and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, (or
which purpose we authorize the said attorneys to represent
us before any authorities, or persons, specially those,
administrative, contentious and judicial, in all matters
concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of
trademarks, service, collective and defensive marks, and of
designations of origin; the deposit of trade names and
emblems; its renewal, extension, recordal of assignments,
change of name or domicile, voluntary cancellation, and the
registration of licenses of use of the above rights, b) For the
obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition,
cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in
general the civil, criminal and administrative suits related to
those rights; actions and suits instituted by us or against us;
and that in all the above matters they may substitute this
power of attorney, compromise, desist, cancel, receive,
renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact,
in or out of court.

Given and signed this 2nd JULY 2003
in BRACKNELL, UK

by Joanna Chandler

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization required)

JOANNA CHANDLER.

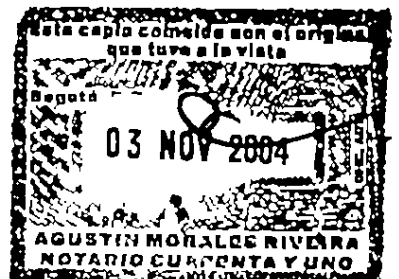
AUTHORISED SIGNATORY.

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 83-09- P.O. Box 8349 Bogotá, Colombia
Tels: (571) 610 76 80 / 40 / 80 Fax (571) 610 87 88 - email: avcastellanos@bogota.net.co

XC/...



COLOMBIA

CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 3 de Jul del año 2003
compareció (eron) personalmente
a quienes conozco como la(s) persona(s) que firma(n) en
representación de la Sociedad (Compañía denominada
Certifico SYNGENTA LIMITED
a) Que es una sociedad/Compañía legalmente
constituida y existente de acuerdo con las leyes de
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el
presente poder están comprendidos dentro del objeto
social de la mencionada Sociedad /Compañía.
d) Que el Sr Joanna Chandler
está autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior
está probado por medio de los siguientes documentos, que
certifico he visto" Estatutos de constitución

(Ciudad) Egham

(Estado) Surrey

Hoy 3 del Julio del 2003

(Notario Público)

"Los documentos debe identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL (Corporation)

On this 3 day of July of 2003
personally appeared JOANNA CHANDLER
whom I know to be the person(s) who signed this
document as representative(s) of the Corporation
/Company named SYNGENTA LTD
I certify
a) That Syngenta is a corporation (Company legally
constituted and in existence in accordance with the
laws of England & Wales
b) That the domicile of said Corporation/Company is GUINNESS
c) That the purpose or purposes for which the present
Power of Attorney is granted are comprised within
the object set forth in the charter of the mentioned
Corporation/Company
d) That Mr JOANNA CHANDLER
is (are) authorized to grant the present Power of Attorney
The aforementioned was duly proven through the
following documents and I duly certify having seen them:
Certificate of Incorporation
(City) Egham

(State) Surrey

EXECUTION
Certified, Verified and Authenticated
of the Town Of Egham In Surrey
This 3rd Day of July 2003

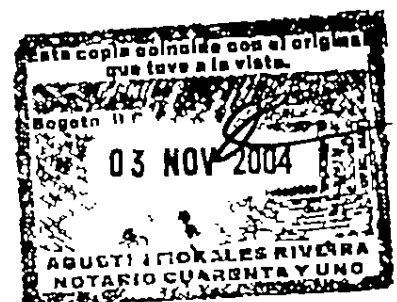
KENNETH GREENWOOD
NOTARY PUBLIC
WYRNE ENGLAND FREEMAN
(Notary Public)
"Documents must be identified with date and origin"

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 93-89 P.O.Box 6349 Bogotá, Colombia
Tel: (571) 610 74 20 / 60 / 60 Fax (571) 610 07 06 e-mail: alvarocastellanos@netnet.net.co

XC/cas



APOSTILLE

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

UNITED KINGDOM OF GREAT BRITAIN AND NORTHERN IRELAND

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

This public document / Le présent acte public

- 2 Has been signed by K Greenwood
a été signé par
3. Acting in the capacity of Notary Public
agissant en qualité de
- 4 Bears the seal/stamp of The Said Notary Public
est revêtu du sceau/timbre de

Certified/Attesté

- 5 at London/à Londres

6. the/le 04 July 2003

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

8. Number/sous No G201564

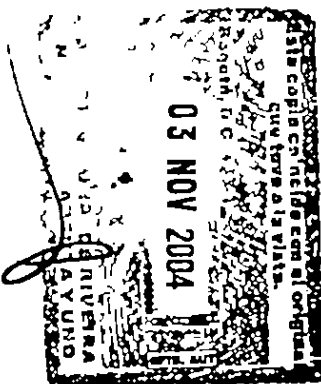
- 9 Stamp:
timbre:

10. Signature: J Ireland



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

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



-----TRADUCCION OFICIAL No 03-0718-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello de la Traductora e Intérprete Oficial , según Resoluciones 2755/68 y 01144/97 del Ministerio de Justicia.

(Anexo a un documento de poder de Syngenta Limited)

AUTENTICACIÓN

Certificado, verificado y autenticado en el pueblo de Egham en Surrey

Hoy día 3 de Julio de 2003

(fdo) ilegible

Kenneth Greenwood – Notario Público

Horne, Engall and Freeman

(Sello en oblea roja)

APOSTILLA

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

1 País. Reino Unido de Gran Bretaña e Irlanda del Norte

Este documento público

2 ha sido firmado por K. Greenwood

3 actuando en su carácter de Notario Público

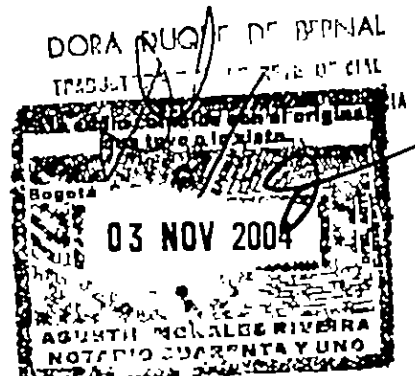
4 lleva el sello de dicho Notario Público

Certificado

5 En Londres 6 el día 4 de Julio de 2003

7 por el Secretario de Estado Principal de Su Majestad para Asuntos

Exteriores y de la Comunidad



8 No G201564

9 Sello

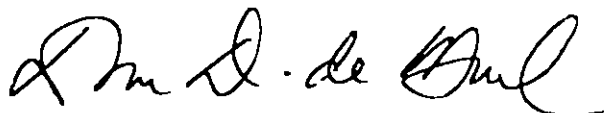
10 Firma. J Ireland

(fdo) ilegible

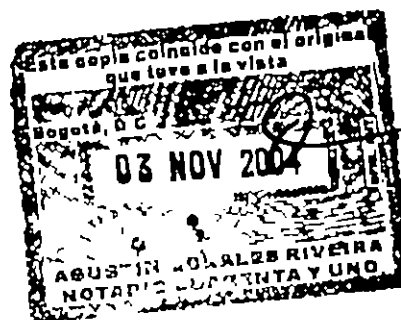
Por el Secretario de Estado

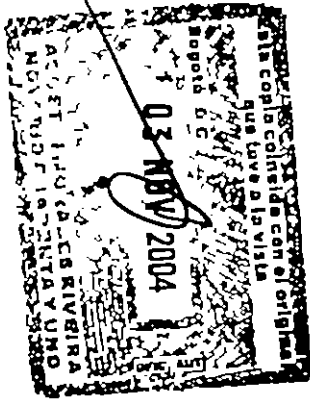
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, D C , Julio 24, 2003



DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
NEX. 02755/68 Y 01144/97 MINISTRO
REP. DE COLOMBIA





MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERNALES

me
009710

CUYA FISHA TP RECE EN EL
DOCUMENTO LEGALIZADO
LAS FUENTES DE INFORMACION

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 JUL 25 P 12 02

lea
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D C

ALVARO CASTELLANOS M & CIA.
 ABOGADOS
 Carrera 9 No. 93-09
 Apartado 6349
 Bogotá, D.C. - COLOMBIA

Señor

Jefe de la División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo

E S D

Ref PODER confiendo por la sociedad SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al plé de mi firma, atentamente manifiesto a Uds que sustituyo en la Dra **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió SYNGENTA PARTICIPATIONS AG., con domicilio en Basilea, SUIZA. _____

debidamente legalizado por Apostilla bajo el No 8117 el día 1° de Abril, 2004 con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, para "FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOS, COMO MEJORADORES DE LA ACTIVIDAD DE INSECTICIDAS" -

Del Señor Jefe,

Acepto


Ximena Castellanos Abondano
 C C No 38 773 330 de Usaquén
 T P A No 58 238 del C S J
 Carrera 9 No 93-09 - Bogotá, D C
 Teléfonos 6107420 - 6107480


Margarita Castellanos Abondano
 C C No 39 779 654 de Usaquén
 T P A No 70 819 del C S J
 Carrera 9 No 93-09 - Bogotá, D C
 Teléfonos 6107420 - 6107480

Bogotá, D C
 XCAMCA /gcb.
 4953-FNPCT

**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C RC mod. Decr 2282 de 1989, art. 1 mod. 38)
Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
de esta ciudad compareció personalmente
Antonio Castellanos
identificado con C C *30.973.333*
expedida en *1986* y tarjeta profesio-
nal de abogado(a) No *58.286* del Consejo
Superior de la Judicatura, con documento di-
recto a *50000000*
y declaró que la firma puesta en este escrito es
suya

Antonio Castellanos
Firma del declarante

En Bogotá D C a *15* de *Oct* de *2004*

AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL *31* de *Oct* de *2004*

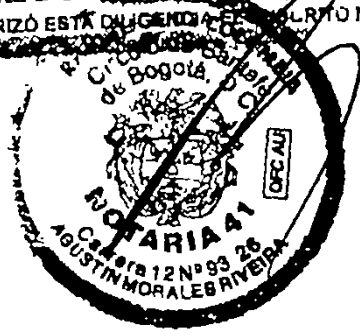


**AUTENTICACION DE FIRMA
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**
(Art. 84 C RC mod. Decr 2282 de 1989, art. 1 mod. 38)
Ante el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo
de esta ciudad compareció personalmente:
Ma. Rosalva Castellanos
identificado con C C *30.973.333*
expedida en *1986* y tarjeta profesio-
nal de abogado(a) No *58.286* del Consejo
Superior de la Judicatura, con documento di-
recto a *50000000*
y declaró que la firma puesta en este escrito es
suya

Ma. Rosalva Castellanos
Firma del declarante

En Bogotá D C a *15* de *Oct* de *2004*

AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL *31* de *Oct* de *2004*



PODER

El (los) Gregory W. Warren
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A. abogados con oficinas en la Carrera 9 No. 83-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales, registro de marcas de fábrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales, su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos, b) Para la obtención de registros sanitarios, c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales.

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

en Research Triangle Park, Carolina
del Norte 27709
por Gregory W. Warren

(El notario debe suscribir el documento en la página siguiente)

(Se requiere legalización consular)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned Gregory W. Warren
Syngenta Participations AG

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA CASTELLANOS A. and /or MARGARITA CASTELLANOS A. attorneys residing at Carrera 9 No. 83-09 Bogotá- Colombia, to prosecute

and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following:

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin, the deposit of trade names and ensigns, its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation and the registration of licenses of use of the above rights b) For the obtention of Sanitary registrations, c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses; and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights; actions and suits instituted by us or against us, and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court.

Given and signed this 24th March 2004

In Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren *Gregory W. Warren*

(Notary shall execute on the other side)

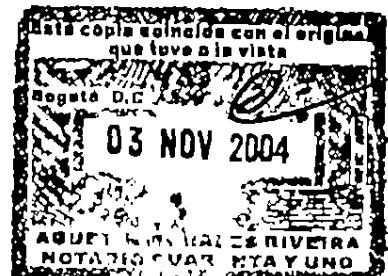
(Consular legalization required)

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 83-09 - P.O. Box 8346 Bogotá, Colombia
Tels.: (571) 810 74 20 / 80 / 80 Fax: (571) 810 07 06 e-mail: acastellanos@impact.net.co

XCTm



CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)

Hoy 24 de Marzo del año 2004

compareció (eron) personalmente Gregory W Warren a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en representación de la Sociedad (Compañía denominada Certificado Syngenta Participations AG

- a) Que es una sociedad/Compañía legalmente constituida y existente de acuerdo con las leyes de
- b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza
- c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el presente poder están comprendidos dentro del objeto social de la mencionada Sociedad /Compañía.
- d) Que el Sr Gregory W Warren está autorizado para otorgar el presente poder. Lo anterior está probado por medio de los siguientes documentos, que certifico he visto*

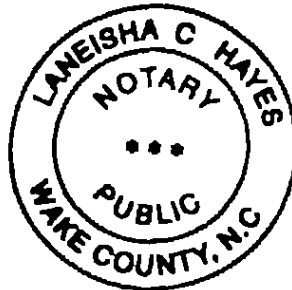
(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C HAYES

*Los documentos debe identificarse con fecha y origen

**NOTARIAL (Corporation)**

On this 24th day of March of 2004 personally appeared Gregory W Warren whom I know to be the person(s) who signed this document as representative(s) of the Corporation /Company named Syngenta Participations AG

I certify

- a) That Syngenta Participations AG is a corporation (Company legally constituted and in existence in accordance with the laws of Basel, Switzerland
- b) That the domicile of said Corporation/Company is Basel Switzerland
- c) That the purpose or purposes for which the present Power of Attorney is granted are comprised within the object set forth in the charter of the mentioned Corporation/Company
- d) That Mr Gregory W Warren is (are) authorized to grant the present Power of Attorney. The aforementioned was duly proven through the following documents and I duly certify having seen them* on the 24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North Carolina 27709

(City) Research Triangle Park

(State) North Carolina, 27709

this 24th day of March of the year 2004

(Notary Public)

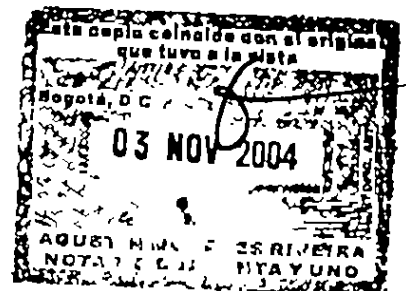
Laneisha C Hayes
 "Documents must be identified with date and origin
 3/24/04 - Research Triangle Park, North Carolina 27709 - Syngenta Biotech, Inc

ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 8 No. 83-09 - P.O. Box 8346 Bogotá, Colombia
 Tels. (571) 610 74 20 / 80 / 80 Fax (571) 610 97 06 e-mail: accastell@procel.net.co

X006m





Wake County Register of Deeds
Post Office Box 1897
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M Riddick
Register Of Deeds

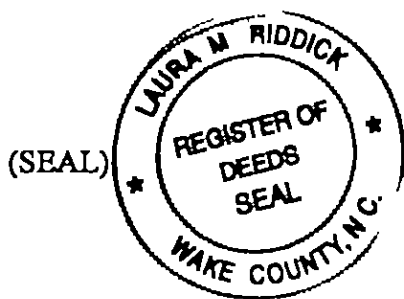
STATE OF NORTH CAROLINA

WAKE COUNTY

**CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT
NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY
AT TIME OF SIGNATURE**

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Lancisha C Hayes WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS, AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING

IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004

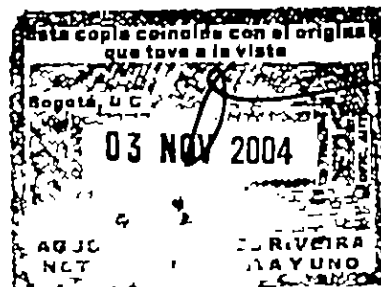


A handwritten signature of Laura M. Riddick in cursive script.

REGISTER OF DEEDS

A handwritten signature, likely of the Deputy/Assistant, in cursive script.

DEPUTY / ASSISTANT



APOSTILLE
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

1 COUNTRY UNITED STATES OF AMERICA

2 This Public Document
has been signed by CARLA N. BROWN

3 acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS
LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS

4 bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

CERTIFIED

5 at Raleigh, North Carolina

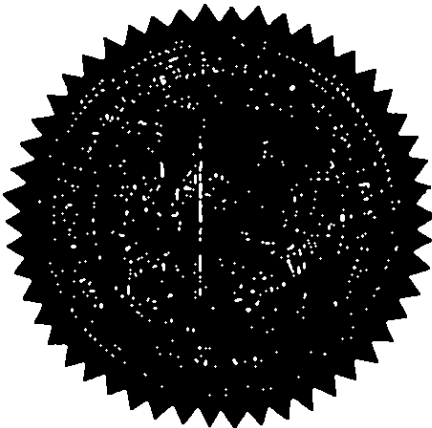
6 the 1ST DAY OF APRIL, 2004

7 by Deputy Secretary of State, State of North Carolina

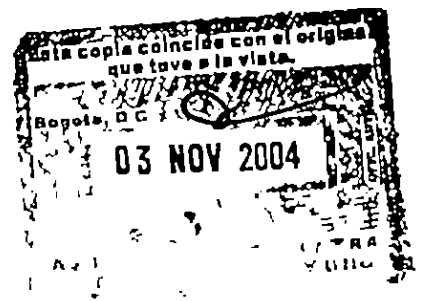
8 No. 8117

9 Seal/Stamp

10 Signature



Rodney Medlock



-----TRADUCCION OFICIAL No -040417-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificacion

lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res 2755/68 y

01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente -----

------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta

Participations AG)

(fdo) ilegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

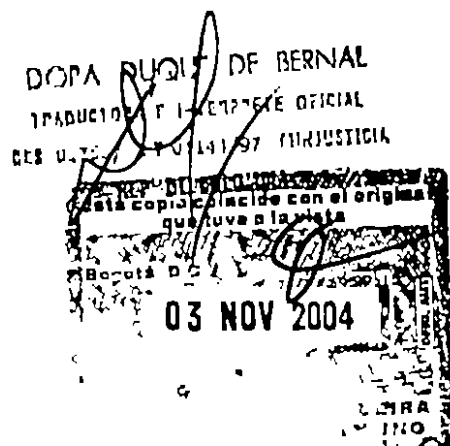
CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado
antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C
Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Publico
debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake,
Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dars plena fe y crédito a
sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia
letra

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sello de oficio,
hoy día 30 de Marzo de 2004

Laura M Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible



Delegado

APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

- 1 País Estados Unidos de América
- 2 Este documento público ha sido firmado por CARLA N BROWN
- 3 actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras
- 4 lleva el sello de Laura M Riddick, Registrador de Escrituras
- Condado de Wake, Carolina del Norte

CERTIFICADO

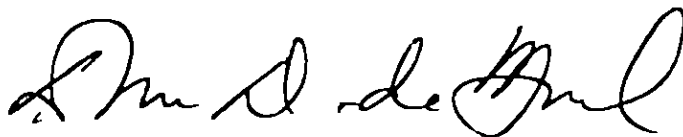
- 5 En Raleigh Carolina del Norte
- 6 el día 1 de Abril de 2004
- 7 por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
- 8 No 8117
- 9 Sello (sello en oblea ocre)

10 Firma

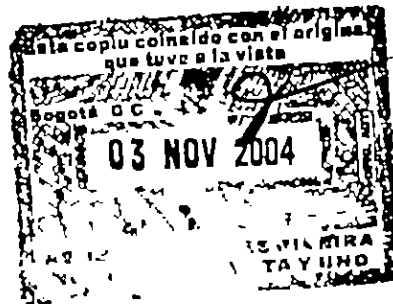
(fdo) Rodney S Maddox

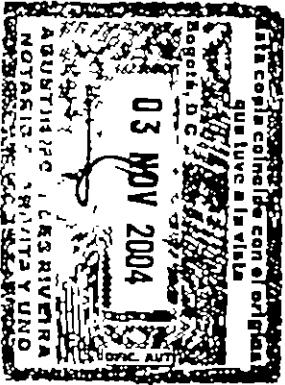
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004



DORA DUQUE DE BERNAL
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
 RES. 02755/68 Y 01144/97 TAJINJUSTICIA
 REP DE COLOMBIA





MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

719997

Dora Duque
CUYA FIRMA APTA DEBE EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE SUJETA
AL TEXTO

2 2 42

UES

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
4 December 2003 (04.12.2003)

PCT

(10) International Publication Number
WO 03/099012 A1

(51) International Patent Classification⁷ A01N 57/20
57/20, 57/14, 53/08, 51/00, 47/38, 45/02, 43/90, 43/68,
43/56, 43/36

Syngenta Limited Jealott's Hill International Research
Centre, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB) PERRY,
Richard, Brian [GB/GB] Syngenta Limited, Jealott's
Hill International Research Centre, Bracknell, Berkshire
RG42 6EY (GB).

(21) International Application Number PCT/GB03/02210

(22) International Filing Date 22 May 2003 (22.05.2003)

(74) Agent WATERMAN, John, Richard Intellectual
Property Department, Syngenta Limited, P.O. Box 3538,
Jealott's Hill Research Centre, Bracknell RG42 6YA (GB).

(25) Filing Language English

(26) Publication Language English

(30) Priority Data 0211924 6 23 May 2002 (23.05.2002) GB

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

(71) Applicants (*for all designated States except US*) SYN-
GENTA LIMITED [GB/GB], European Regional Centre,
Pricotley Road, Surrey Research Park, Guildford Surrey
GU2 7YH (GB) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG
[CH/CH], Schwarzwaldallee 215 CH-4058 Basel (CH).

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

(72) Inventors and

(75) Inventors/Applicants (*for US only*) STOCK, David
[GB/GB] Syngenta Limited, Jealott's Hill International
Research Centre, Bracknell Berkshire RG42 6EY (GB).
PIPER, Catherine, Julia [GB/GB] Syngenta Limited,
Jealott's Hill International Research Centre Bracknell
Berkshire RG42 6EY (GB). RAMSAY, Julie, Lynne
[GB/GB] Syngenta Limited Jealott's Hill International
Research Centre, Bracknell, Berkshire RG42 6EY (GB).
BIRCHMORE, Mark, Steven [GB/CH] Syngenta
Crop Protection AG Schwarzwaldallee 215 CH-4058
Basel (CH). MULQUEEN, Patrick, Joseph [GB/GB],

Published

— with international search report

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

(54) Title: PHOSPHONATES AND DERIVATIVES THEREOF AS ENHANCERS OF THE ACTIVITY OF INSECTICIDES

(57) Abstract An insecticidal composition having as an adjuvant a phosphonate or an alkoxyated derivative or dimer
thereof Preferred phosphonates are bis-(2-ethylhexyl)-2ethylhexylphosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-octylphosphonate and
bis-(butyl)-butylphosphonate.

WO 03/099012 A1

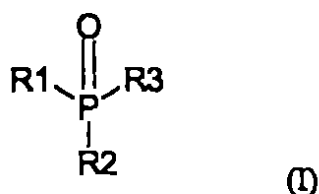
PHOSPHONATES AND DERIVATIVES THEREOF AS ENHANCERS OF THE ACTIVITY OF INSECTICIDES

The present invention relates to a composition and in particular to an insecticidal composition, more particularly an insecticidal composition containing an organic phosphonate adjuvant.

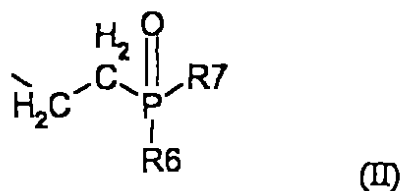
USP 2927014 discloses the use of a range of organic phosphonate and phosphinate compounds as herbicides WO 9304585 discloses the use of certain organic phosphinate and phosphonate compounds as adjuvants to enhance the activity of certain herbicides WO 9418837 teaches the use of a specific phosphonate, bis (2-ethyl hexyl) 2-ethylhexyl phosphonate, as adjuvant to improve the bioperformance of specified herbicides. In WO9800021 there is disclosed that certain phosphonate or phosphinate compounds provide improved fungicidal activity in combination with certain fungicides such as fluquinconazole and azoxystrobin.

The applicants have now found that insecticide activity can be surprisingly enhanced by the use of an organic phosphonate adjuvant.

According to the present invention there is provided an insecticidal composition comprising an insecticide and a phosphonate or an alkoxyated derivative or dimer thereof having the formula (I)



wherein R^1 and R^2 are independently an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n-\text{OR}^5$ wherein R^4 is hydrogen, methyl or ethyl, n is from 0 to 50 and R^5 is hydrogen or an alkyl group containing from 1 to 20 carbon atoms, and R^3 is (i) an alkyl or alkenyl group containing from 4 to 20 carbon atoms (ii) optionally substituted phenyl or (iii) a group of formula (II)



wherein R^6 is an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^5$ as herein defined and R^7 an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^5$ as herein defined.

The term "alkyl" as used herein, including when used in expressions such as "alkoxy" includes linear or branched chain alkyl groups. Optional substituents which may be present in optionally substituted phenyl include C_{1-4} alkyl and halogen.

Certain compounds of formula (I) may contain or exist in the form of dimers and such dimers are included in the scope of the present invention.

Optional alkoxylation of an ester group is represented by the group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^5$ as herein defined. It is preferred that the value of n is from 0 to 10 and more preferably from 0 to 5. If a range of degrees of alkoxylation is present, n may represent an average value and is not necessarily an integer. Similarly, mixed alkoxylation may take place such that different values of R^4 are present in the group $-[OCH_2CHR^4]_n$. It is preferred that R^5 is an alkyl group containing from 1 to 8 carbon atoms. If n is 0, the group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^5$ becomes alkoxy and when n is 0 therefore the group $-OR^5$ is suitably alkoxy containing from 4 to 20 carbon atoms.

It is preferred that each of the groups R^1 and R^2 are alkoxy groups containing from 4 to 10 carbon atoms and R^3 is an alkyl group containing from 4 to 10 carbon atoms. Suitable phosphonates are disclosed in WO 98/00021 and the present invention also includes equivalents wherein the relevant alkyl chain length is lower than that disclosed in WO 98/00021. It is especially preferred that each of R^1 , R^2 and R^3 contain from 4 to 8 carbon atoms. Preferred phosphonates are bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-octylphosphonate and bis-(butyl)-butylphosphonate.

The compositions of the invention may also contain mixtures. Thus the compositions may comprise two or more organic phosphonate compounds of the invention and/or other additives (normally termed adjuvants) which can be surfactants and/or oils.

The insecticidal active ingredient in the composition of the invention may include one or more of

(a) Acetylcholine Esterase Inhibitors. These work as inhibitors of acetylcholine esterase. Acetylcholine esterase cleaves the ester functionality of the neurotransmitter acetylcholine in the CNS hence preventing repeated stimulation of the acetylcholine receptor. The enzyme has a nucleophilic serine residue at the active site which catalyses the hydrolysis of the ester,

generating choline and the acetylated enzyme which is rapidly hydrolysed back to its active form. The insecticidal acetylcholine esterase inhibitors acylate this serine residue with a group which is hydrolysed at a much slower rate than acetate, hence blocking the action of this enzyme. This results in hyperexcitation of the insect cholinergic nervous system
5 resulting in convulsions and death. Representative insecticides having this mode of action include organophosphorus insecticides

Organophosphorus insecticides are divided into six sub-classes according to the exact nature of the phosphorus functional group (phosphates, phosphonates, phosphoramidates, phosphorothiolates, phosphorothioates and phosphorodithiolates), but all contain an
10 electrophilic phosphorus atom with a good leaving group attached. They can also be classified by the nature of the leaving group (aliphatic, phenoxy or aryloxy). The P=S compounds are metabolised in insects to P=O compounds which are much more active, whereas mammals tend to cleave the P-OR bonds more rapidly leading to greater selectivity. Specific examples include chlorpyrifos, pirimiphos-methyl, diazinon, profenofos, methidathion, terbufos dimethoate and fosfthiazate and carbamate insecticides such as
15 pirimicarb, benfuracarb, carbaryl and aldicarb,

(b) Acetylcholine Agonists

Acetylcholine is a major neurotransmitter in the CNS, responsible for passing on nerve impulses at synapses and it also mediates muscle stimulation at the nerve-muscle
20 interface. Two major sub-types of the acetylcholine receptor have been classified according to which natural product binds best – muscarine or nicotine. A series of insecticides are available which act by this mechanism and include the nitromethylenes which are of relatively low toxicity to mammals but show potent, broad-spectrum activity on insects with systemic activity. Nitromethylenes are active on both sucking and chewing pests and are
25 active both through stomach and contact action. These nitromethylene insecticides (also called neo-nicotinoids) include imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram, clothianidin, thiacloprid, thiamethoxam, MTT-446 (from Mitsui). Another chemical in this class is spinosad which is a mixture of spinosyn and spinosyn B. The spinosyns also act at the nicotinic receptor, though the effects they produce are somewhat different to that of the
30 nitromethylenes,

(c) Chloride Channel Disruptors

These compounds work by disrupting the action of gamma-aminobutyric acid (GABA), the major inhibitory neurotransmitter in the CNS. GABA is released from the pre-synaptic membrane and crosses the synapse where it binds to the GABA receptor. This receptor is coupled to a chloride ion channel that is opened in the presence of GABA. This opening allows the net influx of chloride ions into the polarised nerve cell hence reducing the potential across the nerve membrane (since at rest the inside of the nerve membrane is more positive than the outside). This means that when the nerve fires, the change in potential is smaller than in the absence of GABA and hence the nerve impulse is effectively dampened.

GABA agonists include the avermectins that are macrocyclic natural products that can disrupt a variety of chloride ion channels. They actually mimic the action of GABA resulting in permanent opening of the chloride ion channels resulting in insect paralysis. Abamectin, emamectin (usually as a salt form) and milbemectin are examples of this chemistry. Examples of GABA antagonists include the fiprils exemplified by fipronil and the older compounds such as the "cyclodienes" organochlorine compounds such as endosulfan.

d) Sodium Channel Disruptors

Sodium channels are vital for nerve transmission. At rest a nerve membrane will have a potential difference of approximately 60 mV across it by virtue of the fact that there are more sodium ions on the outside than on the inside. When a nerve impulse travels along the cell, sodium ion channels open in the membrane allowing sodium ions to flood into the cell inducing a positive peak of potential to flow along the nerve cell. Normally these channels close very quickly and sodium ions are pumped out of the cell to restore the resting potential. Sodium channel disruptors hold these channels open for longer periods preventing re-polarisation. Type-I pyrethroids (and veratrum alkaloids) prevent re-polarisation for 0.01-0.1 seconds, which results in multiple-spike firing of neurons leading to convulsions, whereas type-II pyrethroids can prevent re-polarisation for minutes or longer leading to lack of coordination. Pyrethroid chemistries are examples of this mode of action. Pyrethroids are synthetic analogues of natural products from Chrysanthemum flowers of which pyrethrin-I is typical. They can be classed into two types according to the alcohol portion. Type-I pyrethroids are the first generation and tend to be rather photochemically unstable. Type-II pyrethroids are derived from gamma-cyano-3-phenoxybenzyl alcohol and are about 10x more potent. Some type-II pyrethroids can have an altered acid portion too, incorporating a phenyl

ring. This chemistry includes tefluthrin, permethrin, bifenthrin, α -cypermethrin, deltamethrin, β -cyfluthrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, esfenvalerate and tau-fluvalinate. Other Na channel disruptors include Indoxacarb,

(e) Respiration Inhibitors

5 These include chemical classes such as (i) Site-1 inhibitors for example fenpyroximate, fenazacum, tebufenpyrad, tolfenpyrad and pyrimidifen and uncouplers. Uncouplers have the effect of uncoupling respiration from ATP production. The proteins in the respiratory electron transport chain use the energy produced from respiration to pump protons across the inner mitochondrial membrane. ATP synthase then uses this pH gradient
10 to drive the synthesis of ATP. Uncouplers are lipophilic weak acids that are able to diffuse through membranes in both neutral and anionic forms and hence can ferry protons across the inner mitochondrial membrane. This destroys the pH gradient and hence removes the driving force for ATP synthesis. Chlorfenapyr is an example of an insecticide of this type;

(f) Octopamine Agonists

15 Octopamine is another neurotransmitter in the insect CNS (not present in vertebrates). It regulates behavioural arousal in the insect. Octopamine binding to the receptor leads to the increased production of c-AMP, which initiates neuronal excitation. Amides cause over stimulation of these processes resulting in behaviour such as convulsions and continuous flight.

20 An example of an octopamine agonist is Amitraz;

(g) Insect growth regulators - IGR's

Benzoyl ureas are examples of this mode of action. These compounds inhibit the biosynthesis of chitin, the polysaccharide that is the major structural component (~ 50%) of insect exoskeletons. When the insect comes to moult, in the presence of these compounds there
25 is insufficient chitin to complete the construction of the new exoskeleton and hence the insect will die during or immediately after moult. These compounds are not actually "growth regulators" in a hormonal sense, but the term was coined due to the misshapen bodies of the dead insects treated with these compounds. These compounds work best on insects that moult often (e.g. lepidoptera), but their use has been limited because they are only taken up
30 by ingestion and activity is growth stage dependent hence they tend to be slow acting. However this also leads to a very clean environmental toxicity profile and hence these

compounds are often used in IPM programs. Examples of insecticides of this class include diflubenzuron, flufenoxuron, chlorfluazuron, hexaflumuron, lufenuron, and novaluron. Others insect growth regulator chemistries (with different effects to the benzoyl ureas) include buprofezin, pyriproxyfen, cyromazine, tebufenoside, methoxyfenoside and etoxazole,

5 (h) Other modes of action

In this sector there are a number of significant insecticide chemistries which have new modes of action (or ill-defined modes of action). These include diafenthiuron, pymetrozine and propargite.

Preferred insecticides include chlorpyrifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram, clothianidin, thiacloprid, thiamethoxam, MTI-446 (from Mitsui), spinosad, abamectin, emamectin benzoate, fipronil, λ -cyhalothrin, χ -cyhalothrin, indoxacarb, fenpyroximate, tebufenpyrad, chlorfenapyr, lufenuron, cyromazine, diafenthiuron, and pymetrozine. Compositions of the present invention are particularly suitable for the insecticides thiamethoxam, spinosad, abamectin, emamectin, benzoate, fipronil, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, indoxacarb, fenpyroximate, tebufenpyrad, chlorfenapyr, lufenuron, cyromazine, diafenthiuron, and pymetrozine.

The compositions of the invention may contain an active ingredient that is capable of systemic movement in the plant or a contact insecticide, particularly if the pest targets are cryptic feeders (such as leaf miner).

20 The compositions are particularly useful in combating certain insect classes such as chewing pests for example Lepidoptera, and sucking pests such as aphid spp.

Surprisingly it has been found that the compositions of the invention have no undue phytotoxic effects on host plants at acceptable rates of use.

Both mixtures of compounds of formula (I) and mixtures of insecticides may be used in the composition of the present invention. Compositions of the present invention may contain further additives conventionally incorporated in insecticidal compositions including further adjuvant(s) such as surfactants and insecticide synergists or other components such as anti-freeze agents, polymers, stickers, photoprotectants, mineral oils, plant oils and derivatives. A number of insecticide synergists are known to those skilled in the art and a specific example is piperonyl butoxide.

The compound of formula (I) may be added to an insecticidal composition at the tank mix stage and compositions of the invention include such tank-mix compositions which are

dilute and ready for application. Alternatively the compound of formula (I) may be incorporated into a concentrated composition that is designed to be diluted prior to application. The nature of the compound of formula (I) may vary depending on the nature of the substituents from a liquid to a solid and from slightly water soluble to highly water insoluble. One skilled in the art will be able to use conventional techniques to provide compositions of the invention which are for example solids or liquids carried on a suitable solid support, including for example wettable powders (WP or SP-soluble powder), wettable granules (WG-water dispersible granule or SG-soluble granule), dispersions of solids or liquids in liquids such as suspension concentrates, oil based suspension concentrates, oil flowables, such as SC (suspension concentrate) or OF (oil miscible flowable), emulsions and mixtures such as EW (emulsion in water), EO (emulsion in oil), SE (suspension-emulsion), solutions such as EC (emulsifiable concentrate), DC (dispersible concentrate), UL (ultra-low volume liquid), SL (soluble liquid) and special formulations such as microencapsulated compositions. Preferred compounds of formula (I) are generally oily liquids with limited water solubility. These can therefore be easily incorporated into solutions in oils by typical mixing, optionally in combination with one or more emulsifiers or absorbed onto solid carriers such as clays or silicas for incorporation into dry products. Similarly, compounds of formula (I) which are oily liquids may be used to prepare dispersions of an insecticide in the compound of formula (I) or to prepare solutions containing the compound of formula (I) and an insecticide or to prepare mixed dispersion systems where for example the insecticide is present as a suspension concentrate and the compound of formula (I) is present as an oil-in-water emulsion. Other combinations will occur to those skilled in the art.

Adjuvants are normally applied as a percentage of the spray volume applied per hectare. Water volume per hectare is normally about 200l/ha but can vary from 50 to greater than 3000 for special applications in top fruit. Adjuvants are nominally applied at volumes of from 0.05% to 1.0% of the spray volume per hectare. Taking 200 l/ha as an average, typical rates of adjuvant will therefore be in the region of 100g (0.05%) to 2000g (1.0%) per hectare. Typical insecticide rates range from 10g/ha to 5kg. Therefore one skilled in the art will expect ratios which cover these typical use rates for both active and adjuvant. These relate directly to ratio (by weight) of insecticide to the compound of formula (I) from 50:1 to 1:400. It is preferred that ratio by weight of the insecticide to the compound of formula (I) is from 25:1 and 1:25 and especially 10:1 and 1:10.

Although it is contemplated that these compositions will generally be applied diluted in water for application to a target crop, the scope of the present invention includes the use of formulations of the invention in ultra-low-volume form, for example in arid areas. The compositions of the invention may also be used for example in bark penetration formulations where there is a desire to enable rapid penetration of an insecticide through tree bark. In addition the compositions of the invention may be used for the treatment and protection of plant seeds using formulations known to the skilled person.

The present invention is illustrated by the following Examples.

EXAMPLE 1

The activity of a range of insecticides combined with 0.5% bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate (BEEP) was compared with a corresponding formulation containing no bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate in a test of curative control of L1/L2 *Liriomyza huidobriensis*, leaf miner. The results are set out in Table 1 and show % control of this leaf miner within bean leaves.

Table 1

Rate ppm	thiamethoxam		chlorfenvpyr		Fipronil		spinosad	
	Alone	+ BEEP	Alone	+ BEEP	Alone	+ BEEP	Alone	+ BEEP
Control	0	0	0	0	0	0	0	0
400	0	20	0	100	60	100	42	100
600	0	43	15	100	69	100	73	100
800	0	63	0	100	66	100	82	100
1000	12	68	28	100	83	100	81	100

Rate ppm	Abamectin	
	Alone	+ BEEP
Control	0	0
3.13	27	99
6.25	48	100
12.5	74	100
25	96	100

Rate ppm	cypromazine	
	Alone	+ BEEP
Control	0	0
25	27	28
50	57	83
100	81	100
200	100	100

5

EXAMPLE 2

The activity of lambda-cyhalothrin, profenofos and indoxacarb combined with 0.5 % bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate (BEEP) was compared with a corresponding formulation containing no bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate in a feeding/contact test against *Plutella xylostella*. The results are set out in Table 2 and show % control.

10

Table 2

Lambda-cyhalothrin		
Rate	Alone	+ BEEP
Control	21	11
0.31ppm	54	100
0.63ppm	66	100
1.25ppm	83	100
2.5ppm	95	100
Profenofos		
Rate	Alone	+ BEEP
Control	21	11
12.5ppm	16	65
25ppm	41	95
50ppm	95	100
100ppm	100	100
Indoxacarb		
Rate	Alone	+ BEEP
Control	15	20
0.16ppm	32	57
0.31ppm	26	80
0.63ppm	32	98
1.25ppm	80	100

EXAMPLE 3

The activity of lambda-cyhalothrin, as Karate 10CS with 0.5% bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate (BERP) was compared with a Karate 10CS containing no bis (2-ethylhexyl)-2-ethylhexyl phosphonate in a translaminar test (3 day assessment time) against

5 R2 *Myzus persicae* The results are set out in Table 3 and show % control.

Table 3

Rate ppm	Lambda-cyhalothrin as Karate 10CS	
	Alone	+ BERP
Control	10	4
62	41	72
125	45	98
250	26	98

EXAMPLE 4

The activity of thiamethoxam as Actara 25WG with bis(2-ethylhexyl) octyl phosphonate (BEOP) at 0.5% was compared with Actara containing no bis(2-ethylhexyl) octyl phosphonate in a translaminar test (3 day assessment time) against *Aphis gossypii*. The

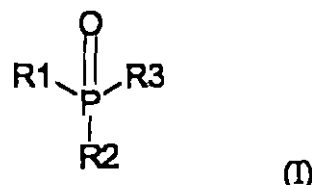
10 results are set out in Table 4 and show % control.

Table 4

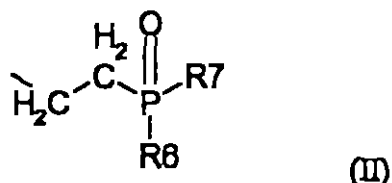
Rate ppm	thiamethoxam as Actara 25WG	
	Alone	+ BEOP
Control	11	3
15.6	45	45
31.2	68	48
62.5	72	96

CLAIMS

- 1 An insecticidal composition comprising an insecticide and a phosphonate or an
5 alkoxylated derivative or dimer thereof having the formula (I)



- wherein R^1 and R^2 are independently an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ wherein R^4 is hydrogen, methyl or ethyl, n is from 0 to 50 and R^5 is hydrogen or an alkyl group containing from 1 to 20 carbon atoms, and R^3 is (i) an alkyl or alkenyl group containing from 4 to 20 carbon atoms
10 (ii) optionally substituted phenyl or (iii) a group of formula (II)



- wherein R^6 is an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ as herein defined and R^7 an alkoxy group containing from 4 to
15 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ as defined for R^1 and R^2

- 2 An insecticidal composition according to claim 1 wherein R^1 and R^2 are alkoxy groups containing from 4 to 10 carbon atoms and R^3 is an alkyl group containing from 4 to 10 carbon atoms
20
3 An insecticidal composition according to claim 2 wherein R^1 , R^2 and R^3 contain from 4 to 8 carbon atoms
4 An insecticidal composition according to claim 3 wherein the phosphonate is bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-octylphosphonate or bis-
25 (butyl)-butylphosphonate

5 An insecticidal composition according to claim 4 wherein the phosphonate is bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate.

6 An insecticidal composition according to any preceding claim wherein the insecticide
5 is selected from chlorpyrifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram, clothianidin, thiacloprid, thiamethoxam, MTI-446, spinosad, abamectin, emamectin benzoate, fipronil, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, indoxacarb, fenpyroximate, tebufenpyrad, chlorfensapyr, lufenuron, cyromazine, diafenthiuron, and pymetrozine.

10

15

FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOS, COMO MEJORADORES DE LA ACTIVIDAD DE INSECTICIDAS

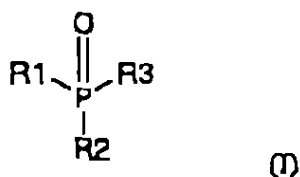
La presente invención se refiere a una composición y en particular, a una composición insecticida, más particularmente, una composición insecticida que contiene un adyuvante de fosfonato orgánico

La Patente Norteamericana 2927014 describe el uso de un rango de compuestos de fosfonato y fosfinato orgánicos como herbicidas La WO 9304585 describe el uso de ciertos compuestos orgánicos de fosfinato y fosfonato como adyuvantes para mejorar la actividad de ciertos herbicidas La WO 9418837 describe el uso de un fosfonato específico, el fosfonato de bis (2-etil hexil) 2-etilhexilo, como adyuvante para mejorar el biorendimiento de herbicidas específicos En la WO9800021 se divulga que ciertos compuestos de fosfonato o fosfinato proveen una actividad fungicida mejorada en combinación con ciertos fungicidas tales como fluquinconazol y azoxiestrobina

Los solicitantes han descubierto ahora que la actividad insecticida puede mejorarse sorprendentemente, mediante el uso de un adyuvante de fosfonato orgánico

AF
211647

De acuerdo con la presente invención se provee una composición insecticida que comprende un insecticida y un fosfonato o un derivado alcoxlado o un dímero del mismo que tiene la fórmula (I)



$$\begin{array}{c} \text{H}_2 \\ | \\ \text{H}_2\text{C}-\text{C}-\text{P}(\text{R}_6)(\text{R}_7) \\ || \\ \text{O} \end{array} \quad (III)$$

La alcoxilación opcional de un grupo éster está representada por el grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como el que se define aquí. Se prefiere que el valor de n sea de 0 a 10 y más preferiblemente de 0 a 5. Si está presente un rango de grados de alcoxilación, n puede representar un valor promedio y no ser necesariamente un número entero. De manera similar, la alcoxilación mixta puede ocurrir de modo que estén presentes diferentes valores de R^4 en el grupo

$-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n$ Se prefiere que R^5 sea un grupo alquilo que contenga de 1 a 8 átomos de carbono. Si n es 0, el grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ se convierte en alcoxi y cuando n es 0 entonces el grupo $-\text{OR}^5$ es convenientemente alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono.

Se prefiere que cada uno de los grupos R^1 y R^2 sean grupos alcoxi que contengan de 4 a 10 átomos de carbono y que R^3 sea un grupo alquilo que contenga de 4 a 10 átomos de carbono. Los fosfonatos apropiados se describen en la WO98/00021 y la presente invención incluye también equivalentes, en donde la longitud de la cadena alquilo relevante es menor que la que se describe en la WO98/00021. Se prefiere especialmente que cada uno de R^1 , R^2 y R^3 contenga de 4 a 8 átomos de carbono. Los fosfonatos preferidos son bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato, bis-(2-etilhexil)-octilfosfonato y bis-(butil)-butilfosfonato.

Las composiciones de la invención pueden contener también mezclas. Por lo tanto, las composiciones pueden comprender dos o más compuestos de fosfonato orgánico de la invención y/o otros aditivos (normalmente denominados "adyuvantes") que pueden ser agentes tensoactivos y/o aceites.

El ingrediente insecticida activo en la composición de la invención puede incluir uno o más de

(a) Inhibidores de Acetilcolina Esterasa. Estos actúan como inhibidores de la acetilcolina esterasa. La acetilcolina esterasa disocia la funcionalidad éster de la acetilcolina neurotransmisora en el SNC, lo cual evita la estimulación repetida del receptor acetilcolina. La enzima tiene un residuo serina nucleofílico en el sitio activo, que cataliza la hidrólisis del éster, generando colina y la enzima acetilada, la cual es rápidamente hidrolizada nuevamente a su forma activa. Los inhibidores insecticidas de acetilcolina esterasa acilan este residuo serina con un grupo que es hidrolizado a un régimen mucho más lento que el acetato, bloqueando de esta

manera la acción de esta enzima. Esto da como resultado hiperexcitación del sistema nervioso colinérgico del insecto, lo cual da como resultado convulsiones y muerte. Los insecticidas representativos que tienen este modo de acción incluyen insecticidas organofosforados.

Los insecticidas organofosforados se dividen en seis subclases, de acuerdo con la naturaleza exacta del grupo funcional fosforado (fosfatos, fosfonatos, fosforamidatos, fosforotiolatos, fosforotioatos y fosforoditiolatos), pero todos ellos contienen un átomo de fósforo electrofílico con un buen grupo saliente adhiriendo. Pueden clasificarse también de acuerdo a la naturaleza del grupo saliente (alifático, fenoxi o aniloxi). Los compuestos $P=S$ son metabolizados en los insectos a compuestos $P=O$ que son mucho más activos, mientras que los mamíferos tienden a disociar los enlaces $P-OR$ más rápidamente, lo cual conduce a una selectividad superior. Ejemplos específicos incluyen insecticidas de clorpirrifos, pirimifos-metilo, diazinon, profenofos, metidation, terbufos dimetoato y foztiazato y carbamato tales como pirimicarb, benfuracarb, carbarilo y aldicarb.

(b) Agonistas de Acetilcolina

La acetilcolina es un neurotransmisor importante del SNC, responsable de transmitir impulsos nerviosos en la sinapsis y también intermediar en la estimulación muscular en la interfase de nervio-musculo. Dos sub-tipos importantes del receptor acetilcolina han sido clasificados de acuerdo con cual producto natural se adhiere mejor - muscarina o nicotina. Se encuentran disponibles una serie de insecticidas que actúan mediante este mecanismo y que incluyen los nitrometilenos, que son de una toxicidad relativamente baja para los mamíferos, pero que muestran una potente actividad de amplio espectro sobre los insectos con actividad sistémica. Los nitrometilenos son activos tanto en las plagas succionadoras como en las masticadoras y son activos, tanto a través del estómago como por acción de contacto. Estos insecticidas de nitrometileno

(denominados también neo-ynicotinoides) incluyen imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, clotianidina, tiacloprid, tiametoxam, MTI-446 (de Mitsui). Otro producto químico de esta clase es espinosad, que es una mezcla de espinosina y espinosina B. Las espinosinas actúan también en el receptor nicotínico, aunque los efectos que producen son algo diferentes de los de los nitrometilenos,

(c) Disociadores del Canal Cloruro

Estos compuestos actúan disociando la acción del ácido gamma-aminobutírico (GABA), que es el neurotransmisor inhibitorio principal en el SNC. El GABA es liberado a partir de la membrana pre-sináptica y cruza la sinapsis, donde se une al receptor GABA. Este receptor está acoplado a un canal iónico cloruro que se abre en presencia de GABA. Esta abertura permite la afluencia neta de los iones cloruro, dentro de la célula nerviosa polarizada, reduciendo el potencial a través de la membrana nerviosa (debido a que, en reposo, el interior de la membrana nerviosa es más positivo que el exterior). Esto significa que cuando el nervio se inflama, el cambio de potencial es menor que en ausencia de GABA y por lo tanto el impulso nervioso es eficazmente modulado.

Los agonistas GABA incluyen las avermectinas, que son productos macrocíclicos naturales que pueden disociar una variedad de canales iónicos clorúricos. En realidad, imitan la acción de GABA, lo cual da como resultado una permanente apertura de los canales iónicos clorúricos, lo cual da como resultado la parálisis del insecto. La abamectina, emamectina (usualmente en forma de sal) y la milbemectina son ejemplos de esta química. Ejemplos de antagonistas de GABA incluyen los fitoalexígenos ejemplificados por fipronil y los compuestos más antiguos, tales como los compuestos organoclorados "ciclodienos" tales como endosulfano.

d) Disociadores del Canal Sódico

Los canales sódicos son vitales para la transmisión nerviosa. En reposo, una membrana nerviosa tendrá una diferencia de potencial de aproximadamente 60 mV a través de la misma, en virtud del hecho de que hay más iones sodio en la parte exterior que en la interior. Cuando un impulso nervioso pasa a lo largo de la célula, se abren los canales iónicos sódicos en la membrana, lo cual permite que los iones sodio inunden la célula, lo cual induce un pico de potencial positivo que fluye a lo largo de la célula nerviosa. Normalmente, estos canales se cierran muy rápidamente, y los iones sodio son bombeados fuera de la célula para restaurar el potencial de reposo. Los disociadores del canal sódico mantienen estos canales abiertos por períodos más prolongados evitando la re-polarización. Los piretroides de tipo I (y los alcaloides veratrum) evitan la re-polarización durante 0,01 - 0,1 segundos, causando la *polineuritis de las neuronas*, lo cual produce convulsiones, mientras que los piretroides de tipo II pueden evitar la re-polarización durante minutos o por más tiempo, lo cual produce falta de coordinación. La química de los piretroides constituye un ejemplo de este modo de acción. Los piretroides son análogos sintéticos de productos naturales de flores de crisantemo, entre los cuales es típica la piretrina-I. Pueden clasificarse en dos tipos, de acuerdo con la porción alcohólica. Los piretroides de tipo I son la primera generación y tienden a ser más bien fotoquímicamente inestables. Los piretroides de tipo II derivan del alcohol gama-ciano-3-fenoxibencilico y son aproximadamente 10 veces más potentes. Algunos piretroides de tipo II pueden tener también una porción ácida alterada, que incorpora un anillo fenilo. Esta química incluye reflutrina, permetrina, bifentrina, α -cipermetrina, deltametrina, β -ciflutrina, lambda-cihalotrina, gama-cihalotrina, esfenvalerato y tau-fluvalinato. Otros disociadores del canal Na incluyen Indoxacarb,

(e) Inhibidores de la Respiración

Estos incluyen clases químicas tales como (i) Inhibidores del sitio 1, por ejemplo, fenpiroximato, fenazaquin, tebufenpirad, tolfenpirad y pinmidifen y desacopladores. Los desacopladores tienen el efecto de desacoplar la respiración de la producción de ATP. Las proteínas en la cadena de transporte electrónica respiratoria usan la energía producida por la respiración para bombear protones a través de la membrana mitocondrial interna. La ATP sintasa usa entonces este gradiente de pH para dirigir la síntesis de ATP. Los desacopladores son ácidos lipofílicos débiles que son capaces de difundirse a través de las membranas, tanto en las formas neutras como en las aniónicas y de esta manera pueden transportar protones a través de la membrana mitocondrial interna. Esto destruye el gradiente de pH y remueve de esta manera la fuerza impulsora para la síntesis de ATP. El clorfenapir es un ejemplo de un insecticida de este tipo.

(f) Agonistas de Octopamina

La octopamina es otro neurotransmisor en el SNC de los insectos (que no está presente en los vertebrados). Regula el conductismo de excitación en el insecto. La unión de la octopamina al receptor conduce a la producción incrementada de c-AMP, lo cual inicia la excitación neuronal. Las amidas causan la hiperestimulación de estos procesos, lo cual da como resultado un conductismo de convulsiones y vuelo continuo.

Un ejemplo de un agonista de octopamina es Amitraz,

(g) Reguladores del desarrollo de insectos - IGR

Las benzoi ureas son ejemplos de este modo de acción. Estos compuestos inhiben la biosíntesis de quitina, el polisacárido que es el componente estructural principal (~ 50%) del exoesqueleto de los insectos. Cuando el insecto llega a la muda, en presencia de estos compuestos hay una insuficiencia de quitina para completar la construcción del nuevo exoesqueleto y como consecuencia, el insecto morirá, durante o inmediatamente después de la muda. Estos compuestos

no son en realidad "reguladores del desarrollo" en un sentido hormonal, sino que el término fue acuñado debido a la deformación de los cuerpos de los insectos muertos, tratados con estos compuestos. Estos compuestos actúan mejor en insectos que mudan a menudo (por ejemplo los lepidópteros), pero su uso ha sido limitado debido a que solamente son recogidos por ingestión y la actividad depende de la etapa de desarrollo y por consiguiente tienden a ser de acción lenta. Sin embargo, esto conduce también a un perfil de toxicidad ambiental muy limpio y por lo tanto estos compuestos se usan a menudo en programas de IPM. Entre los ejemplos de insecticidas de esta clase se incluyen diflubenzuron, flufenoxuron, clorfluazuron, hexaflumuron, lufenuron y novaluron. Otra química reguladora del desarrollo de los insectos (con efectos diferentes de los de las benzoil ureas) incluye buprofezin, pinproxifen, ciromazina, tebufenosida, metoxifenosida y etoxazol.

(h) Otros modos de acción

En este sector existen una cantidad de químicas insecticidas significativas que tienen nuevos modos de acción (o modos de acción mal definidos). Estos incluyen diafenthiuron, pimetrozina y propargita.

Los insecticidas preferidos incluyen clorpirifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, clotianidín, tiacloprid, tiametoxam, MTI-446 (de Mitsui), espinosad, abamectina, benzoato de emamectina, fipronil, λ -cihalotrina, χ -cihalotrina, indoxacarb, fenpiroximato, tebufenpirad, clorfenapir, lufenuron, ciromazina, diafenthiuron, y pimetrozina. Las composiciones de la presente invención son particularmente apropiadas para los insecticidas tiametoxam, espinosad, abamectina, benzoato de emamectina, fipronil, λ -cihalotrina, χ -cihalotrina, indoxacarb, fenpiroximato, tebufenpirad, clorfenapir, lufenuron, ciromazina, diafenthiuron, y pimetrozina.

Las composiciones de la invención pueden contener un ingrediente activo capaz de movimiento sistémico en la planta o un insecticida de contacto, particularmente si la plaga objetivo consiste en insectos de alimentación críptica, tales como "leaf miner" (insectos que comen el parénquima de las hojas)

Las composiciones son particularmente útiles para combatir ciertas clases de insectos, tales como plagas masticadoras, por ejemplo, lepidópteros, y plagas succionadoras, tales como especies de áfidos

Sorprendentemente, se ha hallado que las composiciones de la invención no tienen efectos fitotóxicos indeseables sobre las plantas huésped, a regímenes de uso aceptables

Tanto las mezclas de compuestos de fórmula (I), como las mezclas de insecticidas, pueden usarse en la composición de la presente invención. Las composiciones de la presente invención pueden contener otros aditivos, que se incorporan convencionalmente a las composiciones insecticidas que incluyen otros adyuvantes, tales como agentes tensoactivos y sinérgicos insecticidas u otros componentes, tales como agentes anti-congelantes, polímeros, elementos engomados, fotoprotectores, aceites minerales, aceites vegetales y derivados. Son conocidos por los expertos en la materia, una variedad de sinérgicos insecticidas y un ejemplo específico de los mismos es el butóxido de piperonilo.

El compuesto de la fórmula (I) puede agregarse a una composición insecticida, en la etapa de mezcla de tanque y las composiciones de la invención incluyen las composiciones de mezcla de tanque que se diluyen y están listas para la aplicación. Alternativamente, el compuesto de la fórmula (I) puede incorporarse a una composición concentrada que está diseñada para ser diluida antes de la aplicación. La naturaleza del compuesto de la fórmula (I) puede variar, dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, desde un líquido hasta un sólido y desde ligeramente soluble en agua hasta altamente insoluble en agua. Un

experto en la materia tendrá la capacidad de usar técnicas convencionales para proporcionar composiciones de la invención, que son por ejemplo, sólidos o líquidos transportados sobre un soporte sólido apropiado, que incluyen por ejemplo polvos humectables (polvo soluble- WP o SP), gránulos humectables (gránulos dispersables en agua- WG o gránulos solubles- SG), dispersiones de sólidos o líquidos, en líquidos tales como, concentrados de suspensiones, concentrados de suspensiones a base de aceite, fluidos oleosos, tales como SC (concentrado de suspensión) u OF (fluido miscible en aceite), emulsiones y mezclas tales como EW (emulsión en agua), EO (emulsión en aceite), SE (suspensión-emulsión), soluciones tales como EC (concentrado emulsionable), DC (concentrado dispersable), UL (líquido de volumen ultra bajo), SL (líquido soluble) y formulaciones especiales tales como composiciones microencapsuladas. Los compuestos preferidos de fórmula (I) son generalmente líquidos oleosos, con limitada solubilidad en agua. Estos, pueden por lo tanto, incorporarse fácilmente a las soluciones en aceite, mediante una mezcla típica, opcionalmente, en combinación con uno o más emulsionantes o absorbidos sobre portadores sólidos tales como arcilla o sílice, para su incorporación a productos secos. De manera similar, pueden usarse los compuestos de fórmula (I), que son líquidos oleosos, para preparar dispersiones de un insecticida en el compuesto de la fórmula (I) o para preparar soluciones que contienen el compuesto de fórmula (I) y un insecticida o para preparar sistemas de dispersiones mixtas, en los cuales, por ejemplo, el insecticida está presente en forma de un concentrado en una suspensión y el compuesto de la fórmula (I) está presente en forma de una emulsión de aceite en agua. Los expertos en la materia serán aptos para efectuar otras combinaciones.

Los aditivos se aplican normalmente como un porcentaje del volumen del rocío aplicado por hectárea. El volumen de agua por hectárea es normalmente de

aproximadamente 200 l/ha pero puede variar desde 50 a más de 3000 para aplicaciones especiales a frutas selectas. Los adyuvantes se aplican nominalmente a volúmenes de desde 0,05% a 1,0% del volumen de rocío por hectárea. Tomando 200 l/ha como promedio, los regímenes típicos de adyuvante, estarán por lo tanto en la región de 100 g (0,05%) a 2000 g (1,0 %) por hectárea. Los regímenes típicos de insecticidas están en un rango de 10 g/ha a 5 kg. Por lo tanto, un experto en la materia, esperará relaciones que cubran estos regímenes de uso típicos, tanto para el principio activo como para el adyuvante. Estas, se refieren directamente a la relación (en peso) de insecticida a compuesto de la fórmula (I), desde 50:1 a 1:400. Se prefiere que la relación en peso del insecticida al compuesto de fórmula (I) sea de 25:1 y 1:25 y especialmente de 10:1 y 1:10.

Aunque se ha contemplado que estas composiciones se aplicarán generalmente diluidas en agua, para ser aplicadas a un cultivo objetivo, el alcance de la presente invención incluye el uso de las formulaciones de la invención, en forma de un volumen ultra-bajo, como por ejemplo, en áreas áridas. Las composiciones de la invención pueden usarse también, por ejemplo, en formulaciones para penetración de cortezas, donde se desea la rápida penetración de un insecticida a través de la corteza del árbol. Además, las composiciones de la invención pueden usarse para el tratamiento y protección de semillas de plantas, usando formulaciones conocidas por el experto en la materia.

La presente invención se ilustra mediante los ejemplos siguientes:

EJEMPLO 1

La actividad de un rango de insecticidas, en combinación con 0,5% de fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-etilhexilo (BEEP), se comparó con una formulación correspondiente, que no contenía fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-etilhexilo en una prueba de control curativo de L1/L2 *Linomyza huidobrensis*, "leaf miner". Los

resultados se indican en la Tabla 1 y muestran un porcentaje de control de este "leaf miner", dentro de hojas de alubias

Tabla 1

Régimen ppm	tiametoxam		clorfenpir		Fipronil		espinosad	
	Solo	+BEEP	Solo	+BEEP	Solo	+BEEP	Solo	+BEEP
Control	0	0	0	0	0	0	0	0
400	0	20	0	100	60	100	42	100
600	0	43	15	100	69	100	73	100
800	0	63	0	100	66	100	82	100
1000	12	68	28	100	83	100	81	100

Régimen ppm	Abamectina	
	Solo	+BEEP
Control	0	0
3,13	27	99
6,25	48	100
12,5	74	100
25	96	100

Régimen ppm	cipromazina	
	Solo	+BEEP
Control	0	0
25	27	28
50	51	83
100	81	100
200	100	100

EJEMPLO 2

La actividad de lambda-cihalotrina, profenofos e indoxacarb combinada con 0,5% de fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-etilhexilo (BEEP) se comparó con una correspondiente formulación que no contenía fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-etilhexilo en una prueba de alimentación/contacto contra *Plutella xylostella*. Los resultados se indican en la Tabla 2 y muestran el porcentaje de control.

Tabla 2

	Lambda-cihalotrina	
Régimen	Solo	+BEEP
Control	21	11
0,31 ppm	54	100
0,63 ppm	66	100
1,25 ppm	83	100
2,5 ppm	95	100
	Profenofos	
Régimen	Solo	+BEEP
Control	21	11
12,5 ppm	16	65
25 ppm	41	95
50 ppm	95	100
100 ppm	100	100
	Indoxacarb	
Régimen	Solo	+BEEP
Control	15	20
0,16 ppm	32	57
0,31 ppm	26	80
0,63 ppm	32	98
1,25 ppm	80	100

EJEMPLO 3

La actividad de lambda-cihalotrina, como Karate 10CS con 0,5% de fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-hetilhexilo (BEEP) se comparó con un Karate 10CS que no contenía fosfonato de bis (2-etilhexil)-2-hetilhexilo en un ensayo translaminar (tiempo de verificación 3 días) contra R2 *Myzus persicae*. Los resultados se indican en la Tabla 3 y muestran el porcentaje de control

Tabla 3

Régimen ppm	Lambda-cihalotrina como Karate 10CS	
	Solo	+BEEP
Control	10	4
62	41	72
125	45	98
250	26	98

EJEMPLO 4

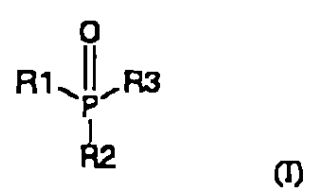
La actividad de tiametoxam como Actara 25WG con 0,5% de fosfonato de bis (2-etilhexil)octilo (BEOP) a 0,5%, se comparó con Actara que no contenía fosfonato de bis(2-etilhexil)octilo en un ensayo translaminar (tiempo de verificación 3 días) contra *Aphis gossypii*. Los resultados se indican en la Tabla 4 y muestran el % de control

Tabla 4

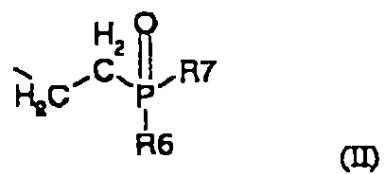
Régimen	Tiametoxam como Actara 25 WG	
	Solo	+BEOP
Control	11	3
15,6	45	45
31,2	68	48
62,5	72	96

REIVINDICACIONES

1 Una composición insecticida que comprende un insecticida y un fosfonato o un derivado alcoxlado o un dimero del mismo que tiene la fórmula



en la cual R¹ y R² son independientemente un grupo alcoxi que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono o un grupo -[OCH₂CHR⁴]_n-OR⁵ donde R⁴ es hidrógeno, metilo o etilo, n es de 0 a 50 y R⁵ es hidrógeno o un grupo alquilo que contiene desde 1 a 20 átomos de carbono, y R³ es (i) un grupo alquilo o alquenilo que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono, (ii) fenilo opcionalmente sustituido o (iii) un grupo de fórmula (II)



en el cual R⁶ es un grupo alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono o un grupo -[OCH₂CHR⁴]_n-OR⁵ tal como se define aquí, y R⁷ es un grupo alcoxi que contiene 4 a 20 átomos de carbono o un grupo -[OCH₂CHR⁴]_n-OR⁵ tal como se definió para R¹ y R²

2 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 1 en la cual R¹ y R² son grupos alcoxi que contienen desde 4 a 10 átomos de carbono y R³ es un grupo alquilo que contiene desde 4 hasta 10 átomos de carbono

3 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 2 en la cual R^1 , R^2 y R^3 contienen desde 4 a 8 átomos de carbono

4 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 3 en la cual el fosfonato es bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato, bis-(2-etilhexil)-octilfosfonato o bis-(butil)-butilfosfonato

5 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 4 en la cual el fosfonato es bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato

6 Una composición insecticida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en la cual el insecticida está seleccionado de clorpirrifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, clotianidina, tiacloprid, tiametoxam, MTI-446, espinosad, abamectina, benzoato de emamectina, fipronil, lambda-cihalotrina, gama-cihalotrina, indoxacarb, fenpiroximato, tebufenpirad, clorfenapir, lufenuron, ciromazina, diafenthiuron, y pimetrozina

PATENT COOPERATION TREATY

46

From the
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

PCT

To WATERMAN, John, Richard Intellectual Property Department Syngenta Limited P O Box 3538 Bracknell RG42 6YA GRANDE BRETAGNE		IPD AGROCHEMICALS ATTORNEY INITIALS <i>SRW</i> - 4 AUG 2004 NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF THE INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT (PCT Rule 71 1) 02 08 2004
Applicant's or agent's file reference PPD 70055AWO		IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/GB 03/02210	International filing date (day/month/year) 22 05 2003	Priority date (day/month/year) 23 05 2002
Applicant SYNGENTA LIMITED et al		

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

4 REMINDER

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

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

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

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

Name and mailing address of the International preliminary examining authority  European Patent Office D-80298 Munich Tel +49 89 2399 0 Tx 523656 epmu d Fax +49 89 2399 4485	Authorized Officer Roche, S Tel +49 89 2399-8031
---	--

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference PPD 70055AWO		FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/PEA/16)	
International application No. PCT/GB 03/02210	International filing date (day/month/year) 22 05 2003	Priority date (day/month/year) 23 05 2002	
International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC A01N57/20			
Applicant SYNGENTA LIMITED et al			
1 This International preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36 2 This REPORT consists of a total of 5 sheets including this cover sheet. ☒ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e. sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 807 of the Administrative Instructions under the PCT) These annexes consist of a total of 4 sheets.			
3. This report contains indications relating to the following items. I ☒ Basis of the opinion II ☐ Priority III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability IV ☐ Lack of unity of invention V ☒ Reasoned statement under Rule 66.2(a)(II) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability, citations and explanations supporting such statement VI ☐ Certain documents cited VII ☐ Certain defects in the international application VIII ☐ Certain observations on the international application			
Date of submission of the demand 23 12 2003		Date of completion of this report 02 08 2004	
Name and mailing address of the international preliminary examining authority  European Patent Office D-80298 Munich Tel. +49 89 2399 0 Tx. 523858 apmu d Fax: +49 89 2399 4485		Authorized Officer Molina de Alba, J Telephone No. +49 89 2399-7823 	

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No PCT/GB 03/02210

I Basis of the report

- 1 With regard to the **elements** of the international application (*Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rules 70.16 and 70.17)*)

Description, Pages

3-10 as originally filed
1, 2 filed with telefax on 20.05.2004

Claims, Numbers

1-7 filed with telefax on 20.05.2004

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

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

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of the international search (under Rule 23.1(b))
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b))
- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3)

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

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

- 4 The amendments have resulted in the cancellation of:

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

- 5 ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed (Rule 70.2(c))

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

- 6 Additional observations, if necessary

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

1 Statement

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

2 Citations and explanations

see separate sheet

INTERNATIONAL PRELIMINARY

International application No PCT/GB 03/02210

EXAMINATIVE REPORT - SEPARATE SHEET

1) The amendments filed by the Applicant with fax of 20 05 2004 do not go beyond the disclosure of the application as filed. The amendments are therefore allowable (Article 34(2)(b) PCT)

2) Reference is made to the following documents

D3 WO 94 18837 A (SCHERING AG, MACH MARTIN (DE), FISCHER BERND (DE), BOHNER JUERGEN) 1 September 1994 (1994-09-01) cited in the application

D4 EP-A-0 025 179 (BAYER AG) 18 March 1981 (1981-03-18)

3) The present application relates to an insecticidal composition containing a phosphonate or an alkoxyate derivative or a dimer thereof as adjuvant

4) Re Item V

3.1 Novelty (Art. 33(2) PCT)

No document in the available prior art discloses a composition comprising an insecticidal compound and a phosphonate of Formula (I) as described in the application. The subject-matter of present claims 1-7 is therefore novel.

3.2 Inventive Step (Art. 33(3) PCT)

D4 is considered to represent the closest state of the art. This document discloses (cf. abstract) a family of phosphonates as adjuvants for insecticidal compositions. Independent Claim 1 differs from **D4** in that the adjuvant for the insecticidal composition is a different phosphonate derivative. The problem to be solved by the present application can therefore be regarded as **providing an alternative adjuvants for insecticides**.

D3 teaches (cf. abstract and examples 1-13) the use of the specific compound bis(2-ethylhexyl)2-ethylhexyl phosphonate, as adjuvant to improve the bioperformance of specified herbicides.

Considering the structural and functional differences between herbicides and insecticides, it is not possible to predict the effect that a herbicidal enhancer will have on an insecticide. Therefore, the skilled person would not be motivated to combine documents **D4** and **D3**. The enhancing effect shown by the compounds of Formula (I) on several families of

insecticides, as illustrated in the examples of the description, is thus surprising and constitutes a basis for the acknowledgement of an inventive step

3.3 Industrial applicability (Art. 33(4) PCT)

Is acknowledged for claims 1-7

- 1 -

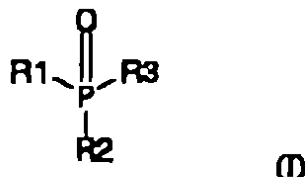
PHOSPHONATES AND DERIVATIVES THEREOF AS ENHANCERS OF THE ACTIVITY OF INSECTICIDES

The present invention relates to a composition and in particular to an insecticidal composition, more particularly an insecticidal composition containing an organic phosphonate adjuvant.

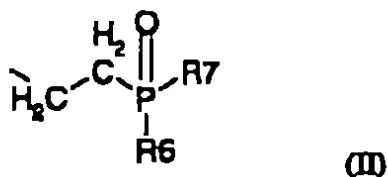
USP 2927014 discloses the use of a range of organic phosphonate and phosphinate compounds as herbicides. WO 9304585 discloses the use of certain organic phosphonate and phosphonate compounds as adjuvants to enhance the activity of certain herbicides. WO 9418837 teaches the use of a specific phosphonate, bis (2-ethyl hexyl) 2-ethylhexyl phosphonate, as adjuvant to improve the bioperformance of specified herbicides. In WO9800021 there is disclosed that certain phosphonate or phosphinate compounds provide improved fungicidal activity in combination with certain fungicides such as fluquinconazole and azoxystrobin. US4976769 discloses phosphates as herbicide and insecticide activators. In US60933679 tertiary ammonium carboxylates are disclosed as enhancers for agricultural chemicals. EP25179A discloses insecticidal compositions containing phosphonates.

The applicants have now found that insecticide activity can be surprisingly enhanced by the use of an organic phosphonate adjuvant.

According to the present invention there is provided an insecticidal composition comprising an insecticide and a phosphonate or an alkoxyated derivative or dimer thereof having the formula (I)



wherein R¹ and R² are independently an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group -[OCH₂CHR⁴]_n-OR⁵ wherein R⁴ is hydrogen, methyl or ethyl, n is from 0 to 50 and R⁵ is hydrogen or an alkyl group containing from 1 to 20 carbon atoms, and R³ is (i) an alkyl or alkenyl group containing from 4 to 20 carbon atoms (ii) optionally substituted phenyl or (iii) a group of formula (II)



AMENDED SHEET

Empf zeit: 20/05/2004 14:31

EMP 111 : 068 P 004

20-05-2004

- 2 -

wherein R^6 is an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^3$ as herein defined and R^7 an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^3$ as herein defined

The term "alkyl" as used herein, including when used in expressions such as "alkoxy" includes linear or branched chain alkyl groups. Optional substituents which may be present in optionally substituted phenyl include C_{1-4} alkyl and halogen.

Optional alkoxylation of an ester group is represented by the group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^3$ as herein defined. It is preferred that the value of n is from 0 to 10 and more preferably from 0 to 5. If a range of degrees of alkoxylation is present, n may represent an average value and is not necessarily an integer. Similarly, mixed alkoxylation may take place such that different values of R^4 are present in the group $-[OCH_2CHR^4]_n$. It is preferred that R^3 is an alkyl group containing from 1 to 8 carbon atoms. If n is 0, the group $-[OCH_2CHR^4]_n-OR^3$ becomes alkoxy and when n is 0 therefore the group $-OR^3$ is suitably alkoxy containing from 4 to 20 carbon atoms.

It is preferred that each of the groups R^1 and R^2 are alkoxy groups containing from 4 to 10 carbon atoms and R^3 is an alkyl group containing from 4 to 10 carbon atoms. Suitable phosphonates are disclosed in WO 98/00021 and the present invention also includes equivalents wherein the relevant alkyl chain length is lower than that disclosed in WO 98/00021. It is especially preferred that each of R^1 , R^2 and R^3 contain from 4 to 8 carbon atoms. Preferred phosphonates are bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-octylphosphonate and bis-(butyl)-butylphosphonate.

The compositions of the invention may also contain mixtures. Thus the compositions may comprise two or more organic phosphonate compounds of the invention and/or other additives (normally termed adjuvants) which can be surfactants and/or oils.

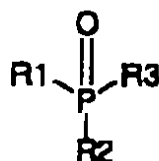
The insecticidal active ingredient in the composition of the invention may include one or more of:

(a) Acetylcholine Esterase Inhibitors. These work as inhibitors of acetylcholine esterase. Acetylcholine esterase cleaves the ester functionality of the neurotransmitter acetylcholine in the CNS hence preventing repeated stimulation of the acetylcholine receptor. The enzyme has a nucleophilic serine residue at the active site which catalyses the hydrolysis of the ester,

- 11 -

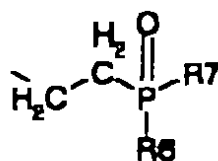
CLAIMS

- 1 An insecticidal composition comprising an insecticide and a phosphonate or an alkoxylated derivative or dimer thereof having the formula (I)



(I)

wherein R^1 and R^2 are independently an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ wherein R^4 is hydrogen, methyl or ethyl, n is from 0 to 50 and R^5 is hydrogen or an alkyl group containing from 1 to 20 carbon atoms, and R^3 is (i) an alkyl or alkenyl group containing from 4 to 20 carbon atoms (ii) phenyl (optionally substituted by C_{1-4} alkyl or halogen) or (iii) a group of formula (II)



(II)

wherein R^6 is an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ as herein defined and R^7 an alkoxy group containing from 4 to 20 carbon atoms or a group $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ as defined for R^1 and R^2 ; and when n is 0 the group $-\text{OR}^5$ is alkoxy containing from 4 to 20 carbon atoms.

- 2 An insecticidal composition according to claim 1 wherein R^1 and R^2 are alkoxy groups containing from 4 to 10 carbon atoms and R^3 is an alkyl group containing from 4 to 10 carbon atoms.
- 3 An insecticidal composition according to claim 2 wherein R^1 , R^2 and R^3 contain from 4 to 8 carbon atoms.
- 4 An insecticidal composition according to claim 3 wherein the phosphonate is bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate, bis-(2-ethylhexyl)-octylphosphonate or bis-(butyl)-butylphosphonate.

- 12 -

5. An insecticidal composition according to claim 4 wherein the phosphonate is bis-(2-ethylhexyl)-2-ethylhexylphosphonate
6. An insecticidal composition according to any preceding claim wherein the insecticide
5 is selected from chlorpyrifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram, clothianidin, thiacloprid, thiamethoxam, MTI-446, spinosad, abamectin, emamectin benzoate, fipronil, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, indoxacarb, fenpyroximate, rebufenpyrad, chlorfenapyr, lufenuron, cyromazine, diafenthiuron, and pymetrozine
- 10 7. An insecticidal composition according to any preceding claim wherein the composition contains an insecticide synergist, preferably piperonyl butoxide.

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES
PCT
NOTIFICACIÓN DE TRANSMISIÓN DE INFORME DE EXAMEN
INTERNACIONAL PRELIMINAR

De la Autoridad de la Oficina Examinadora Preliminar Internacional

A WATERMAN, John, Richard
 Intellectual Property Dept
 SYNGENTA LIMITED
 P O Box 3538
 Bracknell RG 42 6YA
 GRAN BRETAÑA

Fecha de franqueo (día/mes/año) 02 08 2004

Número de legajo del solicitante o agente
 PPD 70055/WO

NOTIFICACIÓN IMPORTANTE

Solicitud Internacional No
 PCT/GB03/02210

Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 22 05 2003

Fecha de prioridad (día/mes/año) 23 05 2002

Solicitante
 SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al

- 1 Por la presente, el solicitante queda notificado de que esta Autoridad de la Oficina Examinadora Internacional Preliminar transmite por este medio el Informe de examen preliminar Internacional y sus anexos, en caso de haberlos, establecidos en la solicitud Internacional
- 2 Se envía una copia del informe y sus anexos, en caso de haberlos, a la Oficina Internacional para su comunicación a todas las Oficinas elegidas
- 3 En los casos en que así lo requieran las Oficinas elegidas, la Oficina Internacional preparará una traducción al Inglés del Informe (pero no de sus anexos) y enviará dicha traducción a dichas Oficinas

4 RECORDATORIO

El solicitante debe ingresar a la fase nacional ante cada Oficina elegida realizando ciertos trámites (presentación de traducciones y pago de aranceles nacionales) en un plazo de 30 días de la fecha de prioridad (o más tarde en algunas Oficinas) (Artículo 39(1)) (véase también el recordatorio enviado por la Oficina Internacional con el Formulario PCT/IB/301)

Cuando una Oficina elegida requiera una traducción de la solicitud internacional, dicha traducción debe contener una traducción de todos los anexos del informe de examen preliminar internacional. Es responsabilidad del solicitante preparar y entregar dicha traducción directamente a cada Oficina elegida en cuestión.

Para más detalles con respecto a los plazos aplicables y los requerimientos de las Oficinas elegidas, véase el Tomo II de la Guía del Solicitante PCT.

La atención del solicitante debe dirigirse al artículo 33 (5) que provee que los criterios de la novedad, paso inventivo y aplicabilidad industrial que se describen en el artículo 33 (2) a (4) meramente sirven a los propósitos del Examen Preliminar Internacional y que "cualquier estado contratante puede aplicar los criterios adicionales o diferentes para los propósitos de decidir, en ese estado, si los inventos reivindicados son patentables o no" (ver también artículo 27 (5)). Tales criterios adicionales pueden relacionarse, por ejemplo, a las exenciones a la patentabilidad, requisitos para permitir la descripción, claridad y soporte para las reivindicaciones.

Nombre y dirección postal del IPEA/
Oficina Europea de Patentes,
D-80298 Munich
Tel +49 89 2399 – 0 Tx 523656 epmu d
Fax +49 89 2399 - 4485

Funcionario Autorizado
Roche, S
Tel +49 89 2399-8048

TRATADO DE COOPERACION DE PATENTES
PCT
INFORME DEL EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL
(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

Archivo de referencia del solicitante o del Agente PPD 70055/WO		PARA ACCIÓN POSTERIOR	Ver Notificación de Transmisión del Informe Preliminar Internacional (Formato PCT/IPEA/416)
Solicitud Internacional No. PCT/GB 03/02210	Fecha de presentación Internacional (día/mes/año) 22.05.2003	Fecha de prioridad (día/mes/año) 23.05.2002	
Clasificación Internacional de Patente (CIP) o Clasificación Nacional y CIP A01N57/20			
Solicitante SYNGENTA LIMITED et al			
1 Este Informe de examen preliminar Internacional ha sido preparado por esta Autoridad Examinadora Preliminar Internacional y se transmite al solicitante de acuerdo con el Artículo 36. 2 Este INFORME consiste en un total de <u> 5 </u> hojas incluyendo esta carátula ☒ Este Informe también se acompaña de los ANEXOS esto es hojas de descripción reivindicaciones y/o dibujos que han sido modificados y son la base de este Informe y/o hojas que contienen rectificaciones hechas ante esta Autoridad (ver Regla 70.18 y Sección 807 de las Instrucciones Administrativas según el PCT) Estos anexos consisten en un total de <u> 4 </u> hojas			
3 Este Informe contiene indicaciones relacionadas con los siguientes ítems I ☒ Base del Informe II ☐ Prioridad III ☐ No establecimiento de opinión con respecto a novedad nivel inventivo y aplicación Industrial IV ☐ Carencia de unidad de la invención V ☒ Declaración razonada según artículo 35(2) con relación a la novedad nivel inventivo o aplicación Industrial citas y explicaciones que apoyan tal declaración VI ☐ Ciertos documentos citados VII ☐ Ciertos defectos en la solicitud internacional VIII ☐ Ciertas observaciones sobre la solicitud internacional			

Fecha de presentación de la solicitud de examen 23.12.2003	Fecha de completamiento de este Informe 02.08.2004
Nombre y dirección de correo del IPEA Oficina de Patentes Europea D-80288 Munich Tel. +49 89 2399 0 Tx. 523656 apmu d Fax +49 89 2399 4465	Funcionario autorizado Molina de Alba J Teléfono No. +49 89 2399-7823

Forma PCT/IPEA/409 (Carátula) (Enero 2004)

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud Internacional No.
PCT/CB 03/02210

I Base del Informe

- 1 Con relación a los elementos de la Solicitud Internacional (las páginas reemplazadas que han sido presentadas a la oficina receptora en respuesta a la invitación con respecto al Art. 14 están referidas en este Informe "originalmente presentadas" y no se anexan a este Informe ya que estas no contienen modificaciones (Reglas 70.16 y 70.17):

Descripción páginas

- 3-10 como originalmente se presentó
1,2 presentada con telefax el 20.05.2004

Reivindicaciones Nos.

- 1.7 presentada con telefax el 20.05.2004

- 2 Con relación al idioma todos los elementos antes marcados se pusieron a disposición y se suministraron a esta autoridad en el idioma en el que se presentó la solicitud internacional a menos que se indique de otra forma en este punto

Estos elementos se pusieron a disposición o se suministraron a esta autoridad en el siguiente idioma el cual es

- ☐ el idioma de una traducción suministrada para fines de investigación internacional (según la Regla 23.1(b)).
☐ el idioma de publicación de la solicitud internacional (bajo la Regla 43.3(b)).
☐ el idioma de la traducción suministrada para fines de examen preliminar internacional (bajo la Regla 55.2 y/o 55.3).

- 3 Con relación a descubierta en la solicitud internacional el examen preliminar internacional se llevó a cabo con base en la lista de secuencia

- ☐ contenida en la solicitud internacional en forma escrita
☐ presentada junto con la solicitud internacional en forma legible en computadora
☐ suministrada con posterioridad a esta autoridad en forma escrita
☐ suministrada luego a esta autoridad en forma legible en computadora
☐ la declaración de que el listado de secuencia escrito suministrado posteriormente no va más allá del descubrimiento en la solicitud internacional que se presentó
☐ la declaración de que la información grabada en forma legible en computadora es idéntica a la lista de secuencia escrita que ha sido suministrada

- 4 Las reformas han dado como resultado la cancelación de

- ☐ la descripción páginas _____
☐ las reivindicaciones Nos. _____
☐ los dibujos hojas/fig. _____

- 5 ☐ Este Informe ha sido establecido como el (parte de) las modificaciones no han sido hechas ya que se considera que han ido más allá de lo revelado que fue presentado como se indica en la casilla suplementaria (Regla 70.2(c)).
(Toda hoja de reemplazo que contenga modificaciones de esta naturaleza debe indicarse en el punto 1 y adjuntarse al presente informe.)
6 Observaciones adicionales si es necesario

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud Internacional No.
PCT/GB 03/02210

V Declaración razonada bajo el artículo 35(2) con relación a la novedad, nivel inventivo o aplicación industrial citas y explicaciones que apoyan tal declaración

- 1

Declaración

Novedad (N)

Si

Reivindicaciones

1 7

No

Reivindicaciones
- Nivel inventivo (IS)

Si

Reivindicaciones

1-7

No

Reivindicaciones

Aplicación industrial (IA)

Si

Reivindicaciones

1 7

No

Reivindicaciones

2

Citas y explicaciones
ver hoja separada

INFORME DEL EXAMEN**Solicitud Internacional No PCT/GB 03/02210****PRELIMINAR INTERNACIONAL – HOJA APARTE**

- 1) Las correcciones presentadas por el Solicitante con fax del 20 05 2004 no van más allá de la divulgación de la solicitud al ser presentada. Las correcciones son por lo tanto aceptables. (Artículo 34(2)(b) PCT)
- 2) Se hace referencia a los siguientes documentos
D3 WO 94 18837 A (SCHERING AG, MACH MARTIN (DE), FISCHER BERND (DE), BOHNER JUERGEN) 1º de septiembre de 1994 (1994-09-01) citados en la solicitud

D4 EP-A-0 025 179 (BAYER AG) 18 de marzo de 1981 (1981-03-18)
- 3) La presente solicitud se refiere a una composición insecticida que contiene un fosfonato o un derivado alcoxilado o un dimero del mismo como adyuvante.
- 4) **Re Item V**

3.1 Novedad (Art. 33(2) PCT)

Ninguno de los documentos en el arte previo disponible divulga una composición que comprende un compuesto insecticida y un fosfonato de la Fórmula (1) como se describe en la solicitud. La materia de las presentes reivindicaciones 1-7 es por lo tanto novedosa.

3.2 Actividad Inventiva (Art. 33(3) PCT)

D4 se considera que representa el estado del arte más próximo. Este documento divulga (cf resumen) una familia de fosfonatos de la Fórmula I como adyuvantes para composiciones insecticidas. La reivindicación 1 independiente difiere de **D4** ya que el adyuvante para la composición insecticida es un derivado de fosfonato diferente. El problema a resolver en la presente solicitud puede por lo tanto considerarse como suministro de adyuvantes alternativos para insecticidas.

D3 enseña (cf. resumen y ejemplos 1-13) el uso del compuesto específico bis(2-etilhexil)2-etilhexil fosfonato, como adyuvantes para mejorar la biorendimiento de herbicidas especificados. Considerando las diferencias estructurales y funcionales entre herbicidas e insecticidas, no es posible predecir el efecto que tiene un intensificador herbicida en un insecticida. Por lo tanto, el experto en el arte no estaría motivado para combinar los documentos D4 y D3. El efecto intensificador mostrado por los compuestos de la Fórmula (I) en varias familias de insecticidas, como se ilustra en los ejemplos de la descripción, es de esta manera sorprendente y constituye una base para el reconocimiento de una actividad inventiva.

3.3 Aplicación Industrial (Art. 33(4) PCT)

Es reconocida para las reivindicaciones 1-7

PÁGINAS Y NUEVO JUEGO REIVINDICATORIO PRESENTADO EN LA
CONTESTACIÓN AL IPER

**"FOSFONATOS Y DERIVADOS DE LOS MISMOS, COMO MEJORADORES DE
LA ACTIVIDAD DE INSECTICIDAS"**

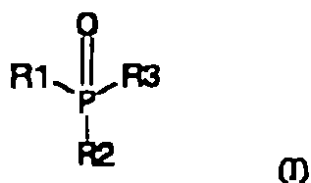
La presente invención se refiere a una composición y en particular, a una composición insecticida, más particularmente, una composición insecticida que contiene un adyuvante de fosfonato orgánico

La Patente Norteamericana 2927014 describe el uso de un rango de compuestos de fosfonato y fosfinato como herbicidas. La WO 9304585 describe el uso de ciertos compuestos orgánicos de fosfinato y fosfonato como adyuvantes para mejorar la actividad de ciertos herbicidas. La WO 9418837 describe el uso de un fosfonato específico, el fosfonato de bis (2-etil hexil) 2-etilhexilo, como adyuvante para mejorar el biorendimiento de herbicidas específicos. En la WO9800021 se divulga que ciertos compuestos de fosfonato o fosfinato proveen una actividad fungicida mejorada en combinación con ciertos fungicidas tales como fluquinconazol y azoxiestrobina. La Patente Norteamericana 4976769 describe fosfatos como activadores herbicidas e insecticidas. En la Patente Norteamericana 60933679 se describen carboxilatos de amonio terciario como mejoradores para productos químicos agrícolas. La Patente Europea EP25179A describe composiciones insecticidas que contienen fosfonatos.

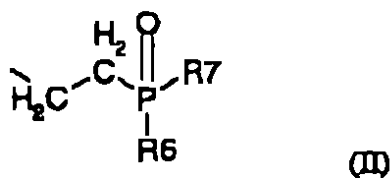
AF
211646

Los solicitantes han descubierto ahora que la actividad insecticida puede mejorarse sorprendentemente, mediante el uso de un adyuvante de fosfonato orgánico.

De acuerdo con la presente invención se provee una composición insecticida que comprende un insecticida y un fosfonato o un derivado alcoxlado o un dímero del mismo que tiene la fórmula (I)



en la cual R^1 y R^2 son independientemente un grupo alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ donde R^4 es hidrógeno, metilo o etilo, n es de 0 a 50 y R^5 es hidrógeno o un grupo alquilo que contiene 1 a 20 átomos de carbono, y R^3 es (i) un grupo alquilo o alquenilo que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono (ii) fenilo opcionalmente sustituido o (iii) un grupo de fórmula (II)



en el cual R^6 es un grupo alcoxi que contiene 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como se define aquí, y R^7 es un grupo alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como el que se define aquí

El término "alquilo" tal como se usa aquí, incluye, cuando se usa en expresiones tales como "alcoxi", grupos alquilo de cadena lineal o ramificada. Los sustituyentes opcionales que pueden estar presentes en fenilo opcionalmente sustituido incluyen alquilo C_{1-4} y halógeno

La alcoxilación opcional de un grupo éster está representada por el grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como el que se define aquí. Se prefiere que el valor de n sea de 0 a 10 y más preferiblemente de 0 a 5. Si está presente un rango de grados de alcoxilación, n puede representar un valor promedio y no ser necesariamente un número entero. De manera similar, la alcoxilación mixta puede ocurrir de modo que estén presentes diferentes valores de R^4 en el grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n$. Se prefiere que R^5 sea un grupo alquilo que contenga de 1 a 8 átomos de carbono. Si n es 0, el grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ se convierte en alcoxi y cuando n es 0 entonces el grupo $-\text{OR}^5$ es convenientemente alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono.

Se prefiere que cada uno de los grupos R^1 y R^2 sean grupos alcoxi que contengan de 4 a 10 átomos de carbono y que R^3 sea un grupo alquilo que contenga de 4 a 10 átomos de carbono. Los fosfonatos apropiados se describen en la WO98/00021 y la presente invención incluye también equivalentes, en donde la longitud de la cadena alquilo relevante es menor que la que se describe en la WO98/00021. Se prefiere especialmente que cada uno de R^1 , R^2 y R^3 contenga de 4 a 8 átomos de carbono. Los fosfonatos preferidos son bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato, bis-(2-etilhexil)-octilfosfonato y bis-(butil)-butilfosfonato.

Las composiciones de la invención pueden contener también mezclas. Por lo tanto, las composiciones pueden comprender dos o más compuestos de fosfonato orgánico de la invención y/o otros aditivos (normalmente denominados "adyuvantes") que pueden ser agentes tensoactivos y/o aceites.

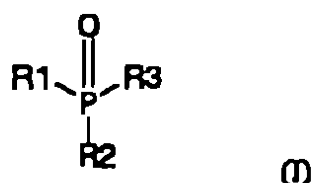
El ingrediente insecticida activo en la composición de la invención puede incluir uno o más de

(a) Inhibidores de Acetilcolina Esterasa. Estos actúan como inhibidores de la acetilcolina esterasa. La acetilcolina esterasa disocia la funcionalidad éster de la

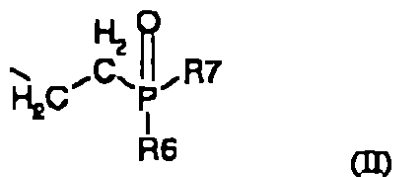
acetilcolina neurotransmisora en el SNC, lo cual evita la estimulación repetida del receptor acetilcolina. La enzima tiene un residuo serina nucleofílico en el sitio activo, que cataliza la hidrólisis del éster,

REIVINDICACIONES

1 Una composición insecticida que comprende un insecticida y un fosfonato o un derivado alcoxilado o un dímero del mismo que tiene la fórmula



en la cual R^1 y R^2 son independientemente un grupo alcoxi que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ donde R^4 es hidrógeno, metilo o etilo, n es de 0 a 50 y R^5 es hidrógeno o un grupo alquilo que contiene desde 1 a 20 átomos de carbono, y R^3 es (i) un grupo alquilo o alquenilo que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono, (ii) fenilo (opcionalmente sustituido con alquilo C_{1-4} o halógeno) o (iii) un grupo de fórmula (II)



en el cual R^6 es un grupo alcoxi que contiene de 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como se define aquí, y R^7 es un grupo alcoxi que contiene 4 a 20 átomos de carbono o un grupo $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^4\text{]}_n\text{-OR}^5$ tal como se definió para R^1 y R^2 , y cuando n es 0 el grupo $-\text{OR}^5$ es alcoxi que contiene desde 4 a 20 átomos de carbono

2 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 1 en la cual R^1 y R^2 son grupos alcoxi que contienen desde 4 a 10 átomos de carbono y R^3 es un grupo alquilo que contiene desde 4 hasta 10 átomos de carbono

3 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 2 en la cual R^1 , R^2 y R^3 contienen desde 4 a 8 átomos de carbono

4 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 3 en la cual el fosfonato es bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato, bis-(2-etilhexil)-octilfosfonato o bis-(butil)-butilfosfonato

5 Una composición insecticida de acuerdo con la reivindicación 4 en la cual el fosfonato es bis-(2-etilhexil)-2-etilhexilfosfonato

6 Una composición insecticida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en la cual el insecticida está seleccionado de clorpirrifos, profenofos, pirimicarb, imidacloprid, acetamiprid, nitenpiram, clotianidina, tiacloprid, tiametoxam, MTI-446, espinosad, abamectina, benzoato de emamectina, fipronil, lambda-cihalotrina, gama-cihalotrina, indoxacarb, fenpiroximato, tebufenpirad, clorfenapir, lufenuron, ciromazina, diafenthiuron, y pimetozina

7 Una composición insecticida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes en la cual la composición contiene un insecticida sinérgico, preferiblemente butóxido de piperonilo

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
 Radicación 04111386 00000000 Folios 68
 Fecha (AMD) 2004 11-05 14 10 43
 Trámite 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAC
 Dependencia 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

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

Firma Responsable

Claudia M. Neva

Fecha

2020

Bogotá D C

Doctor(a) A

MARGARITA CASTELLANOS

Apoderado(a)

SYNGENTA LIMITED Y SINGENTA PARTICIPATIONS AG

10900

REFERENCIA	Radicación N°	04-111386
	Solicitud internacional	PCT/GB03/02210
	Fecha inicio fase nacional	2004-12-23
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Folios	001

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

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

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


ALIX CARMENZA CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones

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

202063 26 NOV 2004