



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 360 119**

51 Int. Cl.:

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/36 (2006.01)

A01N 37/22 (2006.01)

A01N 43/10 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05751644 .5**

96 Fecha de presentación : **16.06.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1761128**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.03.2007**

54 Título: **Desinfectante para combatir hongos fitopatógenos.**

30 Prioridad: **21.06.2004 DE 10 2004 029 972**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.06.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.06.2011

73 Titular/es: **Bayer CropScience Aktiengesellschaft
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es: **Kneen, Geoff;
Suty-Heinze, Anne;
Dahmen, Peter;
Araki, Yasuo;
Shigyo, Takuma y
Elbe, Hans-Ludwig**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

ES 2 360 119 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

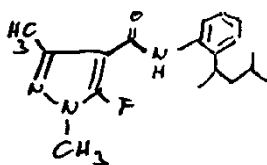
Desinfectante para combatir hongos fitopatógenos

La presente invención se refiere al uso de carboxamidas fungicidamente eficaces para el tratamiento de semilla según la reivindicación 1, así como a un procedimiento según la reivindicación 4.

Ya se sabe que determinadas carboxamidas poseen propiedades fungicidas. Así, por ejemplo, se conocen *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)-tiofen-3-il]-1-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida (documento EP-A 0 737 682), *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (documento WO 03/010149) y *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-1-metil-4-trifluorometil-1*H*-pirrol-carboxamida (documento WO 02/38542) respectivamente para combatir hongos fitopatógenos mediante aplicación foliar como agentes de pulverización. Todavía no se ha divulgado el uso de estos compuestos para el tratamiento de semilla para la protección contra la infestación de hongos fitopatógenos.

El documento DE1567211 describe el uso de determinadas oxatiin-carboxamidas como fungicidas para semilla contra *Rhizoctonia solani*.

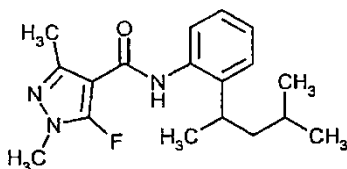
Se ha encontrado ahora que las carboxamidas de fórmula general (I)



pueden usarse muy bien para el tratamiento (desinfección) de semilla contra la infestación por *Rhizoctonia solani*.

Las carboxamidas que pueden usarse para el tratamiento de semilla se definen mediante la fórmula (I). La fórmula (I) comprende las siguientes carboxamidas que van a usarse preferiblemente para el tratamiento de semilla:

(I-2) *N*-[2-(1,3-Dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida de fórmula



(conocida por el documento WO 03/010149)

Los principios activos según la invención poseen muy buenas propiedades fungicidas y pueden usarse en el tratamiento de semillas para combatir *Rhizoctonia solani*. Los principios activos según la invención son adecuados en el tratamiento de semilla para combatir *Rhizoctonia solani*.

Como organismos patógenos de enfermedades fúngicas son de mencionar *Rhizoctonia solani*, *Rh. solani* f. *paroketea*, *Rh. solani* forma *specialis*, *Rh. solani* var. *cedri-deodarae*, *Rh. solari* var. *fuchsiae*, *Rh. solani* var. *hortensis*.

La buena tolerancia por parte de las plantas de los principios activos que pueden usarse en las concentraciones necesarias para combatir enfermedades de las plantas permite un tratamiento de la semilla. Por tanto, los principios activos según la invención pueden usarse como desinfectantes.

Una gran parte del daño provocado por hongos fitopatógenos en las plantas de cultivo ya se produce por la infestación de la semilla durante el almacenamiento y después de la introducción de la semilla en el suelo, así como durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es especialmente crítica ya que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son especialmente sensibles y ya un pequeño daño puede conducir a la muerte de toda la planta. Por tanto, existe un interés especialmente grande en proteger la semilla y la planta que va a germinar mediante el uso de agentes adecuados.

La lucha contra hongos fitopatógenos que dañan las plantas después del despunte se realiza en primer lugar mediante el tratamiento del suelo y las partes vegetales aéreas con productos fitosanitarios. Debido a las dudas respecto a una posible influencia de los productos fitosanitarios en el medio ambiente y la salud de los seres humanos y animales, se están haciendo esfuerzos para reducir la cantidad de principios activos aplicados.

Desde hace tiempo se conoce la lucha contra hongos fitopatógenos mediante el tratamiento de las semillas de las

plantas y es objeto de mejoras continuas. No obstante, en el tratamiento de las semillas resulta una serie de problemas que no siempre pueden resolverse de manera satisfactoria. Así, se desea desarrollar un procedimiento para proteger la semilla y la planta que va a germinar que haga innecesario la aplicación adicional de productos fitosanitarios después de la siembra o después del despunte de las plantas o por lo menos la reduzca claramente.

5 Además, se desea optimizar la cantidad de principio activo usado para proteger lo mejor posible la semilla y la planta que va a germinar de la infestación por hongos fitopatógenos, pero sin dañar la propia planta mediante el principio activo usado. Los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían incluir especialmente las propiedades fungicidas intrínsecas de plantas transgénicas para conseguir una protección óptima de la semilla y de la planta que va a germinar con un gasto mínimo de productos fitosanitarios.

10 Por tanto, la presente invención también se refiere especialmente a un procedimiento para proteger la semilla y las plantas que van a germinar de la infestación por hongos fitopatógenos mediante el tratamiento de la semilla con un agente según la invención.

La invención también se refiere al uso de los agentes según la invención para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y las plantas que van a germinar de hongos fitopatógenos.

15 Una de las ventajas de la presente invención es que, debido a las propiedades sistémicas especiales de los agentes según la invención, el tratamiento de la semilla con estos agentes no sólo protege la propia semilla de hongos fitopatógenos, sino también las plantas resultantes de las mismas después del despunte. De esta manera, el tratamiento inmediato del cultivo puede suprimirse en el momento de la siembra o poco después.

20 Igualmente, también se considera ventajoso que las mezclas según la invención también puedan usarse especialmente en semillas transgénicas.

Los agentes según la invención son adecuados para la protección de semilla de cualquier especie de plantas que se utilice en la agricultura, en el invernadero, en silvicultura o en jardinería. A este respecto se trata especialmente de semilla de cereales (como trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, judía, café, remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, hortalizas (como tomate, pepino, cebollas y lechuga), césped y plantas ornamentales. Tiene especial importancia el tratamiento de la semilla de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz y arroz.

25 En el marco de la presente invención, el agente según la invención se aplica solo o en una formulación adecuada sobre la semilla. Preferiblemente, la semilla se trata en un estado en el que sea tan estable que no pueda aparecer ningún daño durante el tratamiento. En general, el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Normalmente se usa semilla que se separó de la planta y se liberó de mazorcas, cáscaras, tallos, envoltura, lana o pulpa. Así puede usarse, por ejemplo, semilla que se cosechó, se limpió y se secó hasta un contenido de humedad inferior al 15 % en peso. Alternativamente también puede usarse semilla que, después de secarse, se trató, por ejemplo, con agua y luego se secó de nuevo.

30 En general, en el tratamiento de la semilla debe tenerse en cuenta que la cantidad del agente según la invención y/u otros aditivos aplicados sobre la semilla se elija de tal manera que no se influya la germinación de la semilla o no se dañe la planta resultante de la misma. Esto debe tenerse en cuenta sobre todo en principios activos que puedan mostrar efectos fitotóxicos a determinadas dosis.

Los agentes según la invención pueden aplicarse directamente, es decir, sin contener otros componentes y sin tener que estar diluidos. Generalmente se prefiere aplicar los agentes sobre la semilla en forma de una formulación adecuada. El experto conoce formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas y se describen, por ejemplo, en los siguientes documentos: documentos US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430 A, US 5.876.739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

40 Las combinaciones de principios activos que pueden usarse según la invención pueden convertirse en las formulaciones de desinfectante habituales como disoluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, compuestos acuosos u otras masas de revestimiento para semilla, así como formulaciones de ULV.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida mezclando los principios activos o las combinaciones de principios activos con aditivos habituales como, por ejemplo, sustancias de relleno habituales como disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

50 Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran todos los colorantes habituales para tales fines. A este respecto pueden usarse tanto pigmentos poco solubles en agua como también colorantes solubles en agua. Como ejemplos son de mencionar los colorantes conocidos bajo las designaciones rodamina B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

55 Como humectantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran todas las sustancias que promueven la humectación habituales para la formulación de

principios activos agroquímicos. Preferiblemente pueden usarse alquilnaftalensulfonatos como diisopropil o diisobutil-naftalen-sulfonatos.

Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferiblemente pueden usarse dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados son de mencionar especialmente polímeros de bloque de óxido de etileno-óxido de propileno, alquilfenolpoliglicoléteres, así como triestirilfenolpoliglicoléteres y sus derivados fosfatados o sulfatados. Dispersantes aniónicos adecuados son especialmente sulfonatos de lignina, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

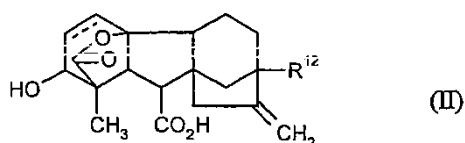
Como antiespumantes, en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención pueden estar contenidas todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferiblemente pueden usarse antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

Como conservantes, en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención pueden estar presentes todas las sustancias que pueden usarse para tales fines en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo son de mencionar diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran todas las sustancias que pueden usarse para tales fines en agentes agroquímicos. Preferiblemente se consideran derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y ácido silícico altamente disperso.

Como adhesivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran todos los aglutinantes habituales que pueden usarse en desinfectantes. Preferiblemente son de mencionar polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

Como giberelinas que pueden estar contenidas en las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención se consideran preferiblemente sustancias de fórmula

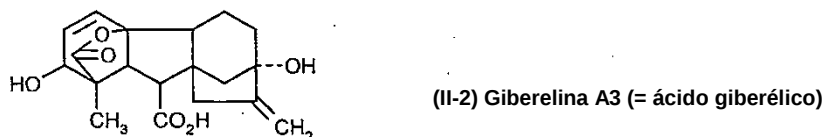
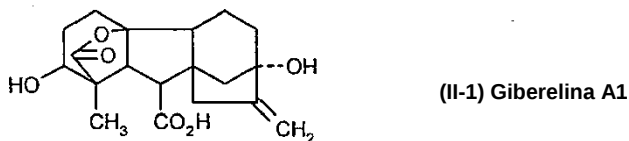


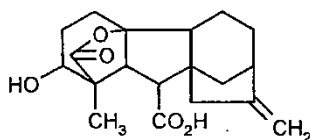
en la que

R^{12} representa hidrógeno o hidroxilo y

la línea de rayas indica que en la posición del anillo está contenido o un enlace sencillo C-C o un doble enlace C=C.

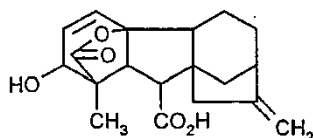
Como ejemplos de giberelinas de fórmula (II) son de mencionar:





(II-3) Gibberelina A4

y



(II-4) Gibberelina A7

Se prefiere especialmente el ácido giberélico de fórmula (II-2).

- 5 Las giberelinas de fórmula (II) son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", tomo 2, Springer Verlag, Berlín-Heidelberg-Nueva York, 1970, páginas 401-412).

10 Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención pueden usarse directamente o después de la dilución previa con agua para el tratamiento de semilla del tipo más variado. Por tanto, pueden usarse concentrados o las preparaciones que pueden obtenerse a partir de éstos mediante dilución con agua para la desinfección de la semilla de cereales como trigo, cebada, centeno, avena y tritical, así como de la semilla de maíz, arroz, colza, guisantes, judías, algodón, girasoles y remolachas o también de semilla de hortalizas de la naturaleza mas variada. Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención o sus preparaciones diluidas también pueden usarse para desinfectar semilla de plantas transgénicas. A este respecto también pueden producirse efectos sinérgicos adicionales en interacción con las sustancias formadas mediante expresión.

15 Para el tratamiento de semilla con las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención o las preparaciones preparadas a partir de éstas mediante adición de agua se consideran todos los aparatos de mezcla que pueden usarse normalmente para la desinfección. En particular, en el caso de la desinfección de procede de forma que la semilla se introduce en una mezcladora, se añade la cantidad respectivamente deseada de formulaciones de desinfectante bien como tales o bien después de la dilución previa con agua y se mezclan hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Dado el caso le sigue un proceso de secado.

20 La dosis de las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención puede variarse dentro de un mayor intervalo. Depende del contenido respectivo de principios activos en las formulaciones y de la semilla. Las dosis de la combinación de principios activos se encuentran en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferiblemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

25 La buena acción fungicida de los principios activos que pueden usarse según la invención en el tratamiento de semilla se deduce a partir de los siguientes ejemplos.

Ejemplos de aplicación

Ejemplos

Prueba con *Rhizoctonia solani* (algodón) / tratamiento de la semilla

30 La aplicación de los principios activos se realiza como desinfectantes secos. Se preparan extendiendo el principio activo respectivo con polvo de roca dando una mezcla de polvo fino que garantiza una distribución uniforme sobre la superficie de la semilla.

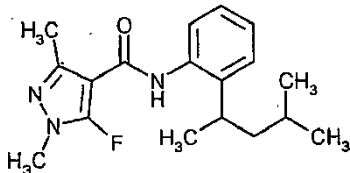
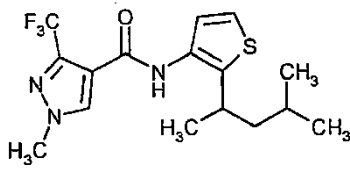
Para la desinfección, la semilla se agita durante 3 minutos con el desinfectante en una botella de vidrio cerrada.

35 La semilla se siembra en bandejas de semillero con 2 × 50 granos en tierra normalizada. Entre la semilla se esparce perlita (5 ml/bandeja de semillero) infectada con *Rhizoctonia solani*, se cubre con Lecaton y a continuación se cultiva en invernadero a una temperatura de aproximadamente 22 °C y diariamente 15 horas de luz.

Después de 7-8 días se realiza la evaluación de todas las plantas emergidas y enfermas. La acción se calcula según Abbot. A este respecto, 0 % significa un grado de acción que se corresponde con el del control, mientras que un grado de acción del 100 % significa que no se observa infestación.

40

Tabla A

Prueba con <i>Rhizoctonia solani</i> (algodón) / tratamiento de semilla		
Principio activo	Dosis de principio activo en g/100 kg de semilla	Grado de acción en %
	50	100
 (Ejemplo comparativo, no se encuentra bajo la invención)	50	100

Ejemplo B (Ejemplo comparativo, no se encuentra bajo la invención)

Prueba con *Pyrenophora graminea* (cebada) / tratamiento de semilla / experimento en campo

Tipo de cereal:	Cebada de verano
Tamaño de las parcelas:	2 m ²
Cantidad de semilla por parcela:	40 g
Número de repeticiones:	3
Estadio de desarrollo en la evaluación:	Principio de la espigación

La aplicación de los principios activos se realiza como formulación habitual en el comercio.

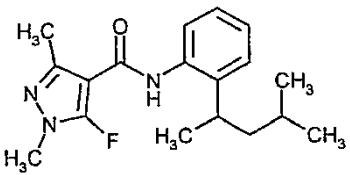
- 5 Para la desinfección, el preparado se dispone en un vaso de desinfectante y se coloca sobre un agitador de desinfectante. Se añade la semilla infectada y se agita aproximadamente 2-3 min hasta la homogeneización.

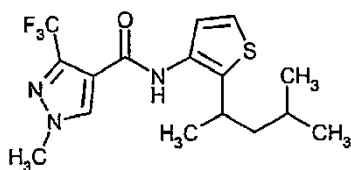
La siembra en el campo abierto se realiza después de la preparación de la tierra habitual en la práctica en un momento que se favorezca la infestación con la enfermedad.

- 10 La evaluación se realiza en un momento en el que los síntomas de la enfermedad pueden apreciarse completamente y muy marcadamente. A este respecto, 0 % significa un grado de acción que se corresponde con el del control, mientras que un grado de acción del 100 % significa que no se observa infestación.

15

Tabla B

Prueba con <i>Pyrenophora graminea</i> (cebada) / tratamiento de semilla / experimento en campo		
Principio activo	Dosis de principio activo en g/100 kg de semilla	Grado de acción en %
	10	97



10

97

La infestación se encontró en el 10,1 % en la variedad de cebada de verano "Frisia".

Ejemplo C

Prueba con *Rhizoctonia solani* (arroz) / tratamiento de semilla

- 5 Se pone en remojo semilla de arroz (variedad Koshihikari) durante 10 días a 15 °C en agua destilada, se transfiere a agua fresca y se pone en remojo con ventilación durante 1 día a 32 °C. Después, la semilla se seca durante algunas horas a temperatura ambiente. Se disuelven 7,6 mg de la sustancia de prueba en 200 µl de acetona en un recipiente de ensayo, se añade una alícuota de la semilla (correspondientemente a 3,8 g de semilla seca), se mezclan y se aspira la acetona. La semilla se siembra en tierra en un recipiente de plástico de 7,5 cm de diámetro y se cultiva en la oscuridad en una estufa de incubación durante 3 días a 32 °C con alta humedad del aire. A continuación se cultivan las plantas de semillero durante 2 semanas en invernadero a 21 °C de promedio. Cada 5 plantas de semillero se transfieren a 5 recipientes de plástico con un diámetro de 12 cm y se cultivan en el invernadero durante 5-6 semanas a 25 °C de promedio. Se colocan micelios de *Rhizoctonia solani* que se cultivaron sobre granos de cebada estéril en el pie de las plantas de arroz (separados 5 cm de la superficie de la tierra) y se incuban en una cámara de vidrio con alta humedad del aire a 27 °C de promedio.

7 días después de la inoculación se evalúa el grado de infección y se calcula el grado de acción.

Criterios para la evaluación de la infestación con la enfermedad (tasa de infestación)

Tasa de infestación	Extensión vertical de la enfermedad de la planta (cm)
0	0
0,5	< 1,5
1	3-5
2	6-11
3	12
4	13-23
5	> 24

$$\text{Grado de acción (\%)} = \left(1 - \frac{\text{tasa de inf estación de las plantas tratadas}}{\text{tasa de inf estación del control sin tratar}} \right) \times 100$$

20

Tabla C

Prueba con <i>Rhizoctonia solani</i> (arroz) / tratamiento de semilla		
Principio activo	Dosis de principio activo en g/100 kg de semilla	Grado de acción en %
	200	91

Ejemplo D (ejemplo comparativo, no se encuentra bajo la invención)

Prueba con *Ustilago nuda* (cebada) / tratamiento de semilla / experimento en campo

Tipo de cereal:	Cebada de verano
Cantidad de semilla por parcela:	40 g
Tamaño de las parcelas:	2 m ²
Número de repeticiones:	3
Estadio de desarrollo:	Principio hasta la mitad de la floración

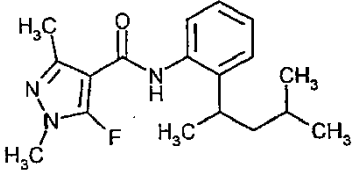
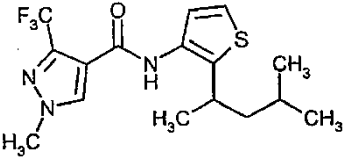
La aplicación de los principios activos se realiza como formulación habitual en el comercio.

- 5 Para la desinfección, el preparado se dispone en un vaso de desinfectante y se coloca sobre un agitador de desinfectante. Se añade la semilla infectada y se agita aproximadamente 2-3 min hasta la homogeneización.

La siembra en el campo abierto se realiza después de la preparación de la tierra habitual en la práctica en un momento que se favorezca la infestación con la enfermedad.

- 10 La evaluación se realiza en un momento en el que los síntomas de la enfermedad pueden apreciarse completamente y muy marcadamente. A este respecto, 0 % significa un grado de acción que se corresponde con el del control, mientras que un grado de acción del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

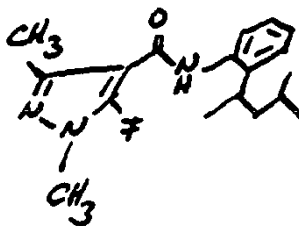
Tabla D

Prueba con <i>Ustilago nuda</i> (cebada) / tratamiento de semilla / experimento en campo		
Principio activo	Dosis de principio activo en g/100 kg de semilla	Grado de acción en %
	10	100
	10	99

La infestación se encontró en el 10,1 % en la variedad de cebada de verano "Frisia".

REIVINDICACIONES

1.- Uso de carboxamidas de fórmula general (I)



para el tratamiento (desinfección) de semilla contra la infestación por *Rhizoctonia solani*.

- 5 2.- Uso según la reivindicación 1 para el tratamiento de semilla de arroz contra la infestación por *Rhizoctonia solani*.
- 3.- Uso según la reivindicación 1 para el tratamiento de semilla de algodón contra la infestación por *Rhizoctonia solani*.
- 4.- Procedimiento para combatir *Rhizoctonia solani*, caracterizado porque se trata semilla con al menos una carboxamida de fórmula (I) según la reivindicación 1.
- 10 5.- Procedimiento según la reivindicación 4 para combatir *Rhizoctonia solani* en semilla de arroz.
- 6.- Procedimiento según la reivindicación 4 para combatir *Rhizoctonia solani* en semilla de algodón.