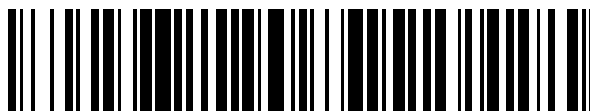


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 385 390**

51 Int. Cl.:

A01N 47/24 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 37/50 (2006.01)

A01N 37/36 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **03708204 .7**

96 Fecha de presentación: **10.03.2003**

97 Número de publicación de la solicitud: **1484973**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **15.12.2004**

54 Título: **Procedimiento para inmunizar plantas frente a bacteriosis**

30 Prioridad:
11.03.2002 DE 10210473
13.02.2003 US 447096 P

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
24.07.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
24.07.2012

73 Titular/es:
BASF SE
67056 Ludwigshafen, DE

72 Inventor/es:
KÖHLE, Harald;
CONRATH, Uwe;
HERMS, Stefan;
SCHLUNDT, Troy;
JOHNSON, Neil y
STAMMLER, Gerd

74 Agente/Representante:
Carvajal y Urquijo, Isabel

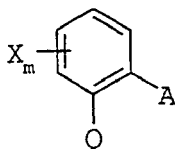
ES 2 385 390 T3

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

Procedimiento para inmunizar plantas frente a bacteriosis

La presente invención se refiere a un procedimiento para inmunizar plantas frente a bacteriosis, que se caracteriza porque se tratan las plantas, el suelo o las simientes con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula I



I

5

en la que

X significa halógeno, alquilo C₁-C₄ o trifluorometilo;

m significa 0 ó 1;

10 Q significa C(=CH-CH₃)-COOCH₃, C(=CH-OCH₃)-COOCH₃, C(=N-OCH₃)-CONHCH₃, C(=N-OCH₃)-COOCH₃ o N(-OCH₃)-COOCH₃;

A significa -O-B, -CH₂O-B, -CH₂S-B, -OCH₂-B, -CH=CH-B, -C≡C-B, -CH₂O-N=C(R¹)-B o -CH₂O-N=C(R¹)-C(R²)=N-OR³,

siendo

15 B fenilo, naftilo, heteroarilo de 5 miembros o 6 miembros o heterociclilo de 5 miembros o 6 miembros, que contiene de uno a tres átomos de N y/o un átomo de O o S o uno o dos átomos de O y/o S, no estando sustituidos los sistemas de anillo o estando sustituidos con de uno a tres restos R^a:

20 R^a ciano, nitro, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alquiloxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, fenilo, fenoxilo, bencilo, benciloxilo, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros, C(=NOR^a)-OR^b u OC(R^a)₂-C(R^b)=NOR^b

no estando sustituidos a su vez los restos cíclicos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^b:

25 R^b ciano, nitro, halógeno, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, fenilo, fenoxilo, feniltio, bencilo, benciloxilo, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros o C(=NOR^a)-OR^b;

R^a, R^b hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R¹ significa hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄;

35 R² significa fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilcarbonilo de 5 ó 6 miembros o heteroarilsulfonilo de 5 ó 6 miembros, no estando sustituidos los sistemas de anillo o estando sustituidos con de uno a tres restos R^a, alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alquilcarbonilo C₁-C₁₀, alquenilcarbonilo C₂-C₁₀, alquinilcarbonilo C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀ o C(R^a)=NOR^b, no estando sustituidos los restos hidrocarbonados de estos grupos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^c:

40 siendo R^c ciano, nitro, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo

5 C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquiloxilo C₃-C₆, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heterociclioxilo de 5 ó 6 miembros, bencilo, benciloxilo, fenilo, fenoxilo, feniltio, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros y heteroariltio, pudiendo estar los grupos cíclicos a su vez parcial o completamente halogenados o pudiendo portar de uno a tres restos R^a; y

R³ significa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, no estando sustituidos los restos hidrocarbonados de estos grupos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^c;

10 que se absorbe por las plantas o las simientes. Además, la invención se refiere en general al uso de los compuestos de fórmula I para inmunizar plantas frente a bacteriosis.

15 Las bacterias aparecen preferiblemente en regiones climáticas templadas y cálido-húmedas como patógenos de enfermedades (bacteriosis) en numerosas plantas de cultivo. Por estas enfermedades se genera en ocasiones un daño económico elevado. En general se conocen, por ejemplo, la muerte provocada por diferentes especies de *Erwinia* de plantaciones frutales completas ("tizón" en el caso de la pera y la manzana), así como la podredumbre húmeda en patatas y muchas otras plantas, diferentes tumores vegetales desencadenados por agrobacterias y las necrosis provocadas por *Xanthomonas* en diferentes especies de hortalizas, arroz, trigo y cítricos. Se temen especialmente las bacteriosis provocadas por *Pseudomonas*, en particular en hortalizas, árboles frutales y tabaco.

20 Los fungicidas convencionales, que intervienen en las operaciones metabólicas específicas de los hongos, no tienen un efecto según lo esperado frente a bacteriosis. Por tanto, sólo puede combatirse con la utilización de antibióticos (por ejemplo estreptomycin, blastidina S o kasugamicina), lo que sin embargo se pone en práctica sólo con poca frecuencia: la utilización extensa de antibióticos en la agricultura es controvertida, puesto que en estos antibióticos básicamente se emplean los mismos mecanismos de acción que contra los patógenos bacterianos en la medicina y veterinaria. Por consiguiente pueden favorecer el desarrollo de resistencias. Además los antibióticos son caros debido a sus estructuras moleculares complejas en la mayoría de los casos y sólo pueden producirse de manera biotecnológica.

Por tanto, un principio distinguido sería el aprovechamiento o la estimulación de las defensas propias de la planta.

En el documento EP-A 420 803 se describe el efecto inmunizador de derivados de benzo-1,2,3-tiazol frente a diferentes microorganismos fitopatógenos. Por el documento WO-A 96/37493 se conoce un efecto similar de los piridiltiazoles. Sin embargo, el efecto de estas sustancias es en muchos casos insuficiente.

30 Por tanto, la presente invención se basaba en el objetivo de proporcionar un procedimiento, que puede usarse ampliamente, no interfiere con los instrumentos frente a bacteriosis en los seres humanos y los animales, inocuo desde el punto de vista ecológico y toxicológico, no daña las plantas y aún así provoca una inmunización eficaz frente a fitobacteriosis.

35 De manera correspondiente se encontró el procedimiento definido al principio. Las sustancias activas usadas se conocen como fungicidas y en parte también como insecticidas (documentos EP-A 178 826; EP-A 253 213; WO-A 93/15046; WO-A 95/18789; WO-A 95/21153; WO-A 95/21154; WO-A 95/24396; WO-A 96/01256; WO-A 97/15552). Hasta la fecha no se han producido consecuencias con respecto a la estimulación del "sistema inmunitario" vegetal, que conduce a una resistencia frente a bacteriosis.

40 La buena compatibilidad con las plantas de las sustancias activas de fórmula I en las concentraciones necesarias para la lucha contra enfermedades de las plantas permite un tratamiento de las partes de superficie de las plantas, así como un tratamiento de las plantas y la simiente y del suelo.

En el procedimiento según la invención la sustancia activa se absorbe por la planta o bien a través de la superficie de las hojas o bien a través de las raíces y se distribuye en la savia por toda la planta.

45 Por tanto, el efecto de protección tras la aplicación del procedimiento según la invención aparece no sólo en las partes de la planta que se pulverizaron directamente, sino que la resistencia de toda la planta frente a bacteriosis es elevada.

En una forma de realización preferida del procedimiento se tratan las partes de superficie de la planta con una formulación de la sustancia activa I.

50 La producción de las sustancias activas usadas en el procedimiento según la invención se conoce por los documentos citados al principio. Para el procedimiento según la invención se prefieren especialmente las sustancias activas con los siguientes significados de los sustituyentes, y concretamente en cada caso solas o en combinación:

Se prefieren especialmente para el procedimiento según la invención sustancias activas I, en las que Q representa $C(=CHOCH_3)-COOCH_3$, $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$ o $N(-OCH_3)-COOCH_3$.

Significados preferidos para B en la fórmula I son fenilo, piridilo, pirimidinilo, triazolilo y pirazolilo.

5 Para el procedimiento según la invención se prefieren especialmente las sustancias activas de fórmulas II a VIII, en las que

V significa OCH_3 y $NHCH_3$, en particular OCH_3 ,

Y significa CH y N, y

T y Z independientemente entre sí significan CH y N.

10 Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que Q representa $N(-OCH_3)-COOCH_3$, son los compuestos descritos en los documentos WO-A 93/15046 y WO-A 96/01256.

Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que Q representa $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 178 826 y EP-A 278 595.

Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que Q representa $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 253 213 y EP-A 254 426.

15 Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que Q representa $C(=N-OCH_3)-CONHCH_3$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 398 692, EP-A 477 631 y EP-A 628 540.

Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que Q representa $C(=CH-CH_3)-COOCH_3$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 280 185 y EP-A 350 691.

20 Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que A representa $-CH_2O-N=C(R^1)-B$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 460 575 y EP-A 463 488.

Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que A representa $-O-B$, son los compuestos descritos en los documentos EP-A 382 375 y EP-A 398 692.

25 Sustancias activas preferidas de fórmula I, en las que A representa $-CH_2O-N=C(R^1)-C(R^2)=N-OR^3$, son los compuestos descritos en los documentos WO-A95/18789, WO-A95/21153, WO-A95/21154, WO-A97/05103 y WO-A97/06133.

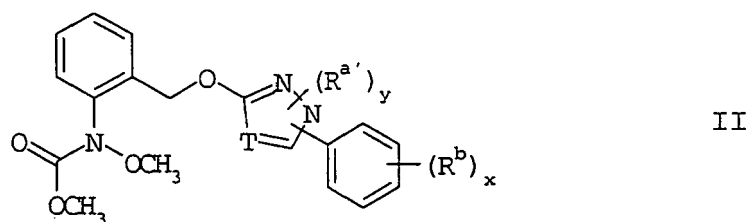
En particular se prefieren las sustancias activas de fórmula I, en las que Q representa $N(-OCH_3)-COOCH_3$,

A representa CH_2-O- y

B representa 3-pirazolilo o 1,2,4-triazolilo, pudiendo portar B uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo

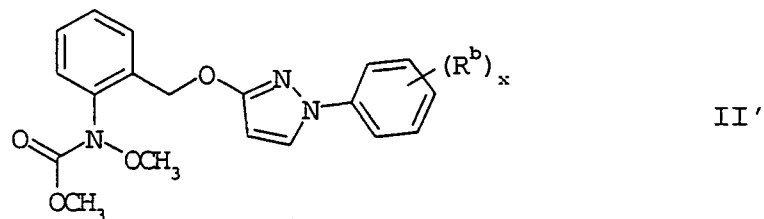
- halógeno, metilo y trifluorometilo, y
- 30 • fenilo y piridilo, en particular 2-piridilo, pudiendo estar sustituidos estos restos con de 1 a 3 restos R^b .

Estas sustancias activas se describen mediante la fórmula II,

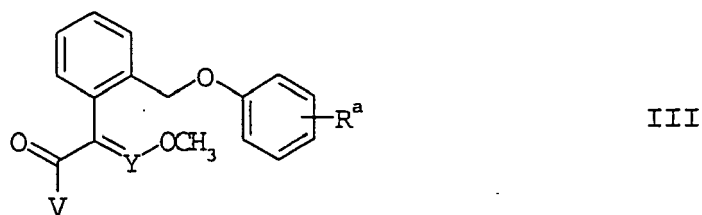


en la que $R^{a'}$ significa cloro, metilo o trifluorometilo, R^b tiene el significado indicado para la fórmula I y x significa 1 ó 2 e y significa 0 ó 1.

En particular se prefieren también las sustancias activas de fórmula II'.



Además se prefieren las sustancias activas de fórmula III



- 5 en la que V representa OCH₃ o NHCH₃ e Y representa N, y R^a significa halógeno, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄ o halogenoalcoxilo C₁-C₄.

Se prefieren especialmente las sustancias activas de fórmula III, en la que V representa OCH₃ y R^a representa halógeno, metilo, dimetilo o trifluorometilo, en particular representa metilo.

Con respecto a su uso, se prefieren especialmente los compuestos agrupados en las siguientes tablas.

10

Tabla I

N.º	T	(R ^{a'}) _y	Posición del grupo fenilo-(R ^b) _x	(R ^b) _x	Bibliografía
I-1	N	-	1	2,4-Cl ₂	WO-A 96/01256
I-2	N	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256
I-3	CH	-	1	2-Cl	WO-A 96/01256
I-4	CH	-	1	3-Cl	WO-A 96/01256
I-5	CH	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256
I-6	CH	-	1	4-CH ₃	WO-A 96/01256
I-7	CH	-	1	H	WO-A 96/01256
I-8	CH	-	1	3-CH ₃	WO-A 96/01256

(continuación)

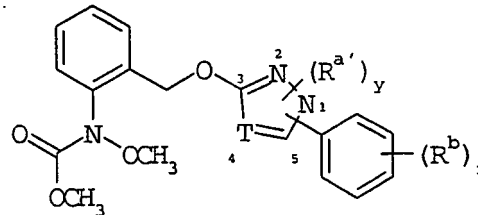
					
N.º	T	(R ^a) _y	Posición del grupo fenilo-(R ^b) _x	(R ^b) _x	Bibliografía
I-9	CH	5-CH ₃	1	3-CF ₃	WO-A 96/01256
I-10	CH	1-CH ₃	5	3-CF ₃	WO-A 99/33812
I-11	CH	1-CH ₃	5	4-Cl	WO-A 99/33812
I-12	CH	1-CH ₃	5	-	WO-A 99/33812

Tabla II

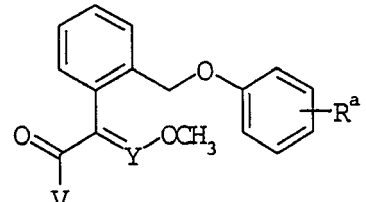
					
N.º	V	Y	R ^a	Bibliografía	
II-1	OCH ₃	N	2-CH ₃	EP-A 253 213	
II-2	OCH ₃	N	2,5-(CH ₃) ₂	EP-A 253 213	
II-3	NHCH ₃	N	2,5-(CH ₃) ₂	EP-A 477 631	
II-4	NHCH ₃	N	2-Cl	EP-A 477 631	
II-5	NHCH ₃	N	2-CH ₃	EP-A 477 631	
II-6	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCF ₃	EP-A 628 540	
II-7	NHCH ₃	N	2-Cl, 4-OCF ₃	EP-A 628 540	
II-8	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₃)=NOCH ₃	EP-A 11 18 609	
II-9	NHCH ₃	N	2-Cl, 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₃)=NOCH ₃	EP-A 11 18 609	
II-10	NHCH ₃	N	2-CH ₃ , 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₂ CH ₃)=NOCH ₃	EP-A 11 18 609	
II-11	NHCH ₃	N	2-Cl, 4-OCH(CH ₃)-C(CH ₃)=NOCH ₂ CH ₃	EP-A 11 18 609	

Tabla III

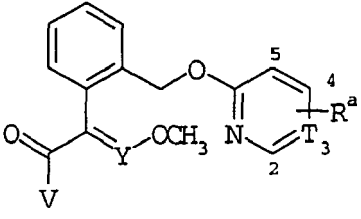
					
N.º	V	Y	T	R ^a	Bibliografía
III-1	OCH ₃	CH	N	2-OCH ₃ , 4-CF ₃	WO-A 96/16047
III-2	OCH ₃	CH	N	2-OCH(CH ₃) ₂ , 4-CF ₃	WO-A 96/16047
III-3	OCH ₃	CH	CH	2-CF ₃	EP-A 278 595
III-4	OCH ₃	CH	CH	3-CF ₃	EP-A 278 595
III-5	NHCH ₃	N	CH	3-Cl	EP-A 398 692
III-6	NHCH ₃	N	CH	3-CF ₃	EP-A 398 692
III-7	NHCH ₃	N	CH	3-CF ₃ , 5-Cl	EP-A 398 692
III-8	NHCH ₃	N	CH	3-Cl, 5-CF ₃	EP-A 398 692

Tabla IV

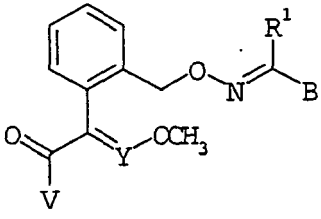
					
N.º	V	Y	R ¹	B	Bibliografía
IV-1	OCH ₃	CH	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 370 629
IV-2	OCH ₃	CH	CH ₃	(3,5-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 370 629
IV-3	NHCH ₃	N	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	WO-A 92/13830
IV-4	NHCH ₃	N	CH ₃	(3-OCF ₃)C ₆ H ₄	WO-A 92/13830
IV-5	OCH ₃	N	CH ₃	(3-OCF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 460 575
IV-6	OCH ₃	N	CH ₃	(3-CF ₃)C ₆ H ₄	EP-A 460 575
IV-7	OCH ₃	N	CH ₃	(3,4-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 460 575
IV-8	OCH ₃	N	CH ₃	(3,5-Cl ₂)C ₆ H ₃	EP-A 463 488

Tabla V

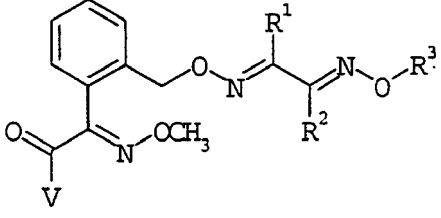
					
N.º	V	R ¹	R ²	R ³	Bibliografía
V-1	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 95/18789
V-2	OCH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO-A 95/18789
V-3	OCH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	WO-A 95/18789
V-4	NHCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	WO-A 95/18789
V-5	NHCH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/18789
V-6	NHCH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 95/18789
V-7	NHCH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	WO-A 95/18789
V-8	NHCH ₃	Cl	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	WO-A 98/38857
V-9	NHCH ₃	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	WO-A 98/38857
V-10	NHCH ₃	CH ₃	CH ₂ C(=CH ₂)CH ₃	CH ₃	WO-A 97/05103
V-11	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₃	WO-A 97/05103
V-12	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	WO-A 97/05103
V-13	NHCH ₃	CH ₃	CH=C(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	WO-A 97/05103
V-14	NHCH ₃	CH ₃	O-CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO-A 97/06133
V-15	NHCH ₃	CH ₃	O-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	WO-A 97/06133
V-16	NHCH ₃	CH ₃	C(CH ₃)=NOCH ₃	CH ₃	WO-A 97/15552

Tabla VI

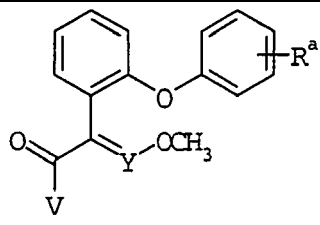
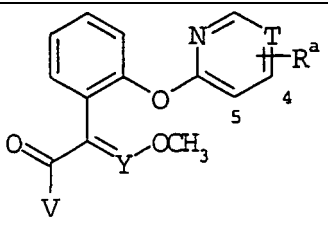
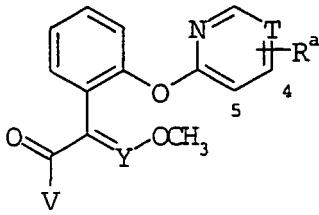
				
N.º	V	Y	R ^a	Bibliografía
VI-1	NHCH ₃	N	H	EP-A 398 692
VI-2	NHCH ₃	N	3-CH ₃	EP-A 398 692
VI-3	NHCH ₃	N	2-NO ₂	EP-A 398 692
VI-4	NHCH ₃	N	4-NO ₂	EP-A 398 692
VI-5	NHCH ₃	N	4-Cl	EP-A 398 692
VI-6	NHCH ₃	N	4-Br	EP-A 398 692

Tabla VII

					
N.º	V	Y	T	R ^a	Bibliografía
VII-1	OCH ₃	CH	N	4-O-(2-CN-C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-2	OCH ₃	CH	N	4-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-3	OCH ₃	CH	N	4-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	EP-A 382 375
VII-4	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-Cl-C ₆ H ₄)	GB-A 22 53 624
VII-5	NHCH ₃	N	N	4-O-(2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃)	GB-A 22 53 624
VII-6	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄)	GB-A 22 53 624
VII-7	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-CH ₃ , 3-Cl-C ₆ H ₃)	GB-A 22 53 624
VII-8	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-CH ₃ -C ₆ H ₄), 5-F	WO-A 98/21189
VII-9	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-Cl-C ₆ H ₄), 5-F	WO-A 98/21189

(continuación)

						VIII
N.º	V	Y	T	R ^a	Bibliografía	
VII-10	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-CH ₃ , 3-Cl-C ₆ H ₃), 5-F	WO-A 98/21189	
VII-11	NHCH ₃	N	N	4-O-(2-Cl, 3-CH ₃ -C ₆ H ₃), 5-F	WO-A 98/21189	

5 Los compuestos I aumentan la resistencia de las plantas frente a bacteriosis. Tienen una importancia especial para la lucha contra bacterias en diferentes plantas de cultivo tales como hortalizas, árboles frutales y tabaco, así como en las semillas de estas plantas.

Especialmente son adecuados para la lucha contra las siguientes enfermedades de las plantas:

especies de *Pseudomonas* en tabaco, patatas, tomates y legumbres y, en particular,

especies de *Erwinia* en frutas, hortalizas y patatas.

10 Los compuestos de fórmula III, en particular el compuesto II-1, son especialmente adecuados para la lucha contra las especies de *Erwinia*.

15 Los compuestos I se usan tratando las plantas, simientes o la tierra que deben protegerse frente a la plaga bacteriana, con una cantidad eficaz de las sustancias activas. La aplicación tiene lugar antes de la infección de las plantas o semillas por parte de las bacterias. De este modo se registra una vulnerabilidad claramente reducida de la planta frente a bacteriosis.

Las cantidades de utilización se encuentran, en el caso de la aplicación en la fitoprotección según el tipo de patógeno y de la planta, entre 0,01 y 2,0 kg de sustancia activa por ha.

En el caso del tratamiento de la simiente, son necesarias en general cantidades de sustancia activa de desde 0,001 hasta 0,1 g, preferiblemente de 0,01 a 0,05 g por cada kilogramo de simiente.

20 Los compuestos I pueden convertirse en sus formulaciones habituales para los fungicidas, por ejemplo disoluciones, emulsiones, suspensiones, polvos finos, polvos, pastas y gránulos. La forma de aplicación depende del respectivo propósito de uso; en cualquier caso debe garantizar una distribución fina y uniforme del compuesto según la invención.

25 Las formulaciones se producen de manera conocida, por ejemplo mezclando la sustancia activa con disolventes y/o vehículos, en caso de que se desee usando emulsionantes y dispersantes, pudiendo usarse en el caso del agua como diluyente también otros disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como sustancias auxiliares se tienen en cuenta esencialmente las habituales también en el caso de los fungicidas.

30 Las formulaciones contienen en general entre el 0,01 y el 95% en peso, preferiblemente entre el 0,1 y el 90% en peso de la sustancia activa. Las sustancias activas se utilizan a este respecto en una pureza del 90% al 100%, preferiblemente del 95% al 100% (según el espectro de RMN).

Ejemplos de formulaciones son:

I. Se mezclan concienzudamente 5 partes en peso de un compuesto según la invención con 95 partes en peso de caolín de partícula fina. De este modo se obtiene un producto para espolvorear, que contiene el 5% en peso de la sustancia activa.

- II. Se mezclan concienzudamente 30 partes en peso de un compuesto según la invención con una mezcla de 92 partes en peso de gel de ácido silícico en polvo y 8 partes en peso de aceite de parafina, que se pulverizó sobre la superficie de este gel de ácido silícico. De este modo se obtiene una preparación de la sustancia activa con buena adherencia (contenido en sustancia activa del 23% en peso).
- 5 III. Se disuelven 10 partes en peso de un compuesto según la invención en una mezcla, que está compuesta por 90 partes en peso de xileno, 6 partes en peso del producto de adición de desde 8 hasta 10 moles de óxido de etileno a 1 mol de N-monoetanolamida del ácido oleico, 2 partes en peso de la sal de calcio del ácido dodecilbenzolsulfónico y 2 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino (contenido en sustancia activa del 9% en peso).
- 10 IV. Se disuelven 20 partes en peso de un compuesto según la invención en una mezcla, que está compuesta por 60 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 5 partes en peso del producto de adición de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 5 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino (contenido en sustancia activa del 16% en peso).
- 15 V. Se mezclan bien 80 partes en peso de un compuesto según la invención con 3 partes en peso de la sal de sodio del ácido diisobutilnaftaleno-alfa-sulfónico, 10 partes en peso de la sal de sodio de un ácido ligninosulfónico de una lejía residual de sulfito y 7 partes en peso de gel de ácido silícico en polvo y se muelen en un molino de martillos (contenido en sustancia activa del 80% en peso).
- 20 VI. Se mezclan 90 partes en peso de un compuesto según la invención con 10 partes en peso de N-metil- α -pirrolidona y se obtiene una disolución, que es adecuada para su uso en forma de gotas muy pequeñas (contenido en sustancia activa del 90 Ges.-%).
- 25 VII. Se disuelven 20 partes en peso de un compuesto según la invención en una mezcla, que está compuesta por 40 partes en peso de ciclohexanona, 30 partes en peso de isobutanol, 20 partes en peso del producto de adición de 7 moles de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol y 10 partes en peso del producto de adición de 40 moles de óxido de etileno a 1 mol de aceite de ricino. Mediante el vertido y la distribución fina de la disolución en 100000 partes en peso de agua se obtiene una dispersión acuosa, que contiene un 0,02% en peso de la sustancia activa.
- 30 VIII. Se mezclan bien 20 partes en peso de un compuesto según la invención con 3 partes en peso de la sal de sodio del ácido diisobutilnaftaleno- α -sulfónico, 17 partes en peso de la sal de sodio de un ácido ligninosulfónico de una lejía residual de sulfito y 60 partes en peso de gel de ácido silícico en polvo y se muelen en un molino de martillos. Mediante la distribución fina de la mezcla en 20000 partes en peso de agua se obtiene un caldo de pulverización, que contiene un 0,1% en peso de la sustancia activa.
- 35 Las formas de aplicación acuosas pueden prepararse habitualmente a partir de concentrados de emulsión, pastas o polvos reticulables (polvo de pulverización, dispersiones en aceite) mediante la adición de agua. Para la producción de emulsiones, pastas o dispersiones en aceite pueden homogeneizarse las sustancias como tales o disueltas en un aceite o disolvente, por medio de agentes reticulantes, de adhesión, dispersantes o emulsionantes en agua. Pero también pueden producirse a partir de la sustancia activa concentrados compuestos por agentes reticulantes, de adhesión, dispersantes o emulsiones y posiblemente disolvente o aceite, que son adecuados para la dilución con agua. Las concentraciones de sustancia activa en las preparaciones listas para usar pueden hacerse variar en grandes intervalos. En general se encuentran entre el 0,0001 y el 10%, preferiblemente entre el 0,01 y el 1%.
- 40 Las sustancias activas pueden usarse también con buen resultado en el procedimiento de volumen ultrabajo (ULV, *Ultra-Low-Volume*), siendo posible producir formulaciones con más del 95% en peso de sustancia activa o incluso la sustancia activa sin aditivos.
- A las sustancias activas se les pueden añadir aceites de diferente tipo, herbicidas, otros fungicidas, otros plaguicidas, bactericidas, dado el caso también no hasta inmediatamente antes de la aplicación (mezcla de tanque). Estos agentes pueden mezclarse con los agentes según la invención en una razón en peso de 1:10 a 10:1.
- 45 La indicación del efecto de inducción de resistencia de las sustancias activas I frente a bacterias puede tener lugar como impresión en el envase o en hojas de datos de producto. La indicación también puede tener lugar en preparaciones que pueden usarse en combinación con las sustancias activas I.
- La inducción de resistencia también puede ser una indicación que esté sujeta a una autorización administrativa de las sustancias activas I.
- 50 El efecto de los compuestos de fórmula I pudo mostrarse mediante los siguientes ensayos:

Ejemplos de aplicación para la inducción de resistencia frente a bacterias

Material vegetal

5 Para los ensayos se cultivaron plantas de tabaco (*Nicotinia tabacum* cv. *Xanthi-nc*) a 25°C, una humedad del aire del 59% y un periodo de luz diario de 16 horas (concentración cuántica 150-200 $\mu\text{M/s}^{-1}/\text{m}^2$) durante de 6 a 8 semanas en tierra para trasplantar (tierra unitaria de tipo ED 73). Se abonó una parte de las plantas una vez a la semana, añadiendo al agua de riego un abono para flores comercial (el 10% de nitrógeno total, el 9% de fosfato; el 7% de potasio) en la dosificación recomendada.

Aplicación del principio activo

10 Se pulverizó la sustancia activa como disolución acuosa 0,1 mM (diluciones con dimetilsulfóxido [DMSO] al 1% v/v) sobre las plantas o se infiltró directamente con ayuda de una cánula de inyección muy delgada en el tejido foliar. Se trataron las plantas control de manera análoga con disoluciones sin sustancia activa. Para minimizar la influencia de varianzas biológicas en algunos ensayos se trató en cada caso la mitad de una hoja (a la izquierda o a la derecha del nervio central) con disolución de sustancia activa, la otra mitad de la misma hoja con disoluciones control.

Tras la aplicación y también tras la posterior inoculación con *Pseudomonas syringae* se mantuvieron las plantas en la cámara de cultivo.

15 Inoculación / infección y determinación de la resistencia

20 Se infectaron las plantas u hojas de tabaco a las que se les aplicó la sustancia activa tal como se describió anteriormente con *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* (cepa DC3000; origen: Brian Staskawicz, Universidad de California, Berkeley, CA) o *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (Colección Alemana de Microorganismos y Cultivos Tipo, Braunschweig, Alemania). Para ello se cultivaron las bacterias durante 1 día a 30°C en medio King B, se centrifugaron, se lavaron y se ajustaron en una disolución de MgCl_2 10mM a una densidad de 10^5 ufc ml^{-1} . Se infiltraron directamente en el tejido foliar aproximadamente 200 μl (2×10^4 ufc ml^{-1}) de este inóculo a través de pequeñas lesiones en la hoja, en las que se insertó una cánula.

La semana siguiente se determinó la aparición de necrosis foliares como consecuencia de la infección. La ausencia de síntomas necróticos es característico a este respecto de la resistencia inducida del tejido foliar.

25 Determinación del crecimiento bacteriano

Para cuantificar la población bacteriana se cortaron en cada caso dos fragmentos de hoja (\varnothing 1 cm) de zonas de hojas infectadas y se homogeneizaron en 500 μl de agua estéril. Se sembró en placa una serie de diluciones de las mismas en agar King B y tras 2 días de incubación a 30°C a partir del número de colonia formadas I se calculó a densidad de la población de partida (ufc) por disco foliar.

30 **Ejemplo de aplicación**

Resistencia aumentada frente a *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 (interacción incompatible) y formación retardada de síntomas patológicos, producidos por *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (interacción compatible) en hojas de tabaco tras el tratamiento con la sustancia activa I-5.

Ejemplo 1: Inmunización frente a *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (interacción compatible)

35 Mediante la aplicación (de 24 a 48 horas antes de la inoculación) con una preparación al $\leq 0,01\%$ de la sustancia activa I-5 se inhibe en el caso de una combinación huésped-patógeno compatible el crecimiento bacteriano y se reduce la aparición de síntomas patológicos.

40 La evolución de la cinética de crecimiento de *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* tras inocular medio King B con una colonia mostró en presencia o ausencia de la sustancia activa I-5, que la sustancia activa en sí no tiene ninguna influencia sobre el crecimiento bacteriano *in vitro*.

El efecto observado se basa por tanto en una estimulación de la resistencia o las defensas propias de la planta con respecto al patógeno.

Tabla A: Crecimiento de *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* en hojas de tabaco inoculadas

Tiempo [h]	Bacterias ($\times 10^6$ células/ml (disco foliar ⁻¹))	
	Sustancia activa I-5	Control
0	0	0
16	0,3	0,3
24	1,2	3,3
48	1,4	3,7

Ejemplo 2: Inmunización frente a *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 (interacción incompatible)

5 También en el caso de una interacción incompatible (es decir, la planta reacciona por sí misma rápidamente a los patógenos invasores con la formación de necrosis (“de defensa”), con la que sin embargo las zonas de tejido infectadas mueren, se reduce enormemente la aparición de síntomas.

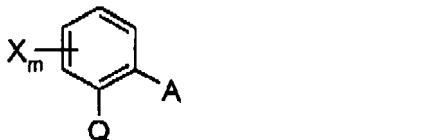
Tabla B: Evolución de la plaga en hojas de tabaco tras la inoculación de un espacio intercostal con *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000

Tiempo [h]	Alteraciones de las hojas (% de superficie del espacio intercostal)			
	Sustancia activa I-5		Control	
	Síntomas de marchitamiento	Necrosis	Síntomas de marchitamiento	Necrosis
0	0	0	0	0
24	0	0	100	0
48	0	5	-	100
72	0	8	-	100
144	0	15	-	100
168	0	20	-	100

10 Tras la aplicación de la preparación de la sustancia activa I-5, las pocas zonas necróticas se limitaban directamente a los puntos de inoculación en las lesiones en las hojas. Las hojas de las plantas control estaban marchitas tras 24 h y tras 48 habían muerto completamente.

REIVINDICACIONES

1. Procedimiento para inmunizar plantas frente a bacteriosis, caracterizado porque se tratan las plantas, el suelo o las semillas con una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula I,



5 en la que

X es halógeno, alquilo C₁-C₄ o trifluorometilo;

m es 0 ó 1:

Q es C(=CH-CH₃)-COOCH₃, C(=CH-OCH₃)-COOCH₃, C(=N-OCH₃)-CONHCH₃, C(=N-OCH₃)-COOCH₃ o N(-OCH₃)-COOCH₃:

10 A es -O-B, -CH₂O-B, -OCH₂-B, -CH=CH-B, -C≡C-B, -CH₂O-N=C(R¹)-B o -CH₂O-N=C(R¹)-C(R²)=N-OR³, siendo

B fenilo, naftilo, heteroarilo de 5 miembros o 6 miembros o heterociclilo de 5 miembros o 6 miembros, que contiene de uno a tres átomos de N y/o un átomo de O o S o uno o dos átomos de O y/o S, no estando sustituidos los sistemas de anillo o estando sustituidos con de uno a tres restos R^a:

15 R^a ciano, nitro, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alquiloxicarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, fenilo, fenoxilo, bencilo, benciloxilo, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros, C(=NOR^α)-OR^β u OC(R^α)₂-C(R^β)=NOR^β,

20 no estando sustituidos a su vez los restos cíclicos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^b:

25 R^b ciano, nitro, halógeno, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, fenilo, fenoxilo, feniltio, bencilo, benciloxilo, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros o C(=NOR^α)-OR^β;

R^α, R^β hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R¹ es hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, halogenoalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄;

30 R² es fenilo, fenilcarbonilo, fenilsulfonilo, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroarilcarbonilo de 5 ó 6 miembros o heteroarilsulfonilo de 5 ó 6 miembros, no estando sustituidos los sistemas de anillo o estando sustituidos con de uno a tres restos R^a; alquilo C₁-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₁₀, alquinilo C₂-C₁₀, alquilcarbonilo C₁-C₁₀, alquenilcarbonilo C₂-C₁₀, alquinilcarbonilo C₃-C₁₀, alquilsulfonilo C₁-C₁₀ o C(R^α)=NOR^β, no estando sustituidos los restos hidrocarbonados de estos grupos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^c:

35 siendo R^c ciano, nitro, amino, aminocarbonilo, aminotiocarbonilo, halógeno, alquilo C₁-C₆, halogenoalquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfoxilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilamino C₁-C₆, dialquilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, dialquilaminotiocarbonilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxilo C₂-C₆,

40 cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo xilo C₃-C₆, heterociclilo de 5 ó 6 miembros, heterociclilo xilo de 5 ó 6 miembros, bencilo, benciloxilo, fenilo, fenoxilo, feniltio, heteroarilo de 5 ó 6 miembros, heteroariloxilo de 5 ó 6 miembros y heteroariltio, pudiendo estar los grupos cíclicos a su vez parcial o completamente halogenados o pudiendo portar de uno a tres restos R^a; y

R³ es hidrógeno,

alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, no estando sustituidos los restos hidrocarbonados de estos grupos o estando sustituidos con de uno a tres restos R^c;

que se absorbe por las plantas o las semillas.

5 2. Procedimiento según la reivindicación 1, en el que se usa una sustancia activa de fórmula I, en la que Q representa C(=CH-OCH₃)-COOCH₃, C(=N-OCH₃)-COOCH₃ o N(-OCH₃)-COOCH₃.

3. Procedimiento según las reivindicaciones 1 ó 2, significando el índice m cero y teniendo los sustituyentes en la fórmula I el siguiente significado:

A -O-B, -CH₂O-B, -CH₂O-N=C(R¹)-B o CH₂-O-N=C(R¹)-C(R²)=N-OR³;

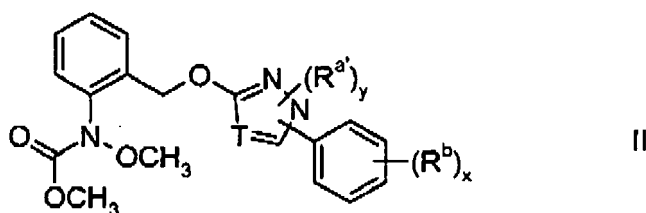
10 B fenilo, piridilo, pirimidinilo, pirazolilo, triazolilo, estando sustituidos estos sistemas de anillo con uno o dos restos R^a;

siendo R² alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₁₀, cicloalquilo C₃-C₆, no estando sustituidos estos grupos o estando sustituidos con uno o dos restos R^b;

15 R^b alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₆, halogenoalcoxilo C₁-C₆, bencilo, fenilo o fenoxilo; o fenilo, que no está sustituido o está sustituido con uno o dos restos R^a; y

R³ alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₁₀ o alquino C₂-C₁₀.

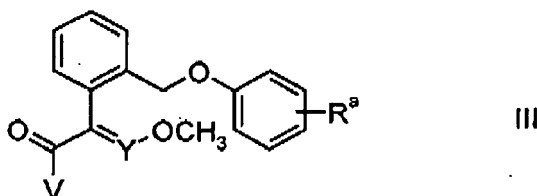
4. Procedimiento según las reivindicaciones 1 a 3, en el que se usa una sustancia activa de fórmula II



20 en la que T significa un carbono o un átomo de nitrógeno, R^a significa cloro, metilo o trifluorometilo, R^b tiene el significado indicado para la fórmula I y x significa 1 ó 2 e y significa cero o 1.

5. Procedimiento según la reivindicación 4, en el que se usa una sustancia activa de fórmula II, en la que T representa CH y R^b representa Cl así como x significa 1 e y significa cero.

6. Procedimiento según las reivindicaciones 1 a 3, en el que se usa una sustancia activa de fórmula III



25 en la que V representa OCH₃, Y representa N y R^a representa metilo o dimetilo.

7. Procedimiento según la reivindicación 6, en el que se usa una sustancia activa de fórmula III, en la que R^a representa metilo.

8. Procedimiento según las reivindicaciones 1 a 7, para inmunizar frente a especies de *Erwinia*.

9. Procedimiento según las reivindicaciones 1 a 8, en el que se tratan las plantas.

10. Procedimiento según las reivindicaciones 1 a 8, en el que se tratan las semillas.

11. Uso de los compuestos de fórmula I, II o III según las reivindicaciones 1 a 7, para inmunizar plantas frente a bacteriosis.