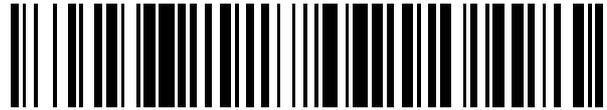


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 410 816**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/40** (2006.01)  
**A01N 43/32** (2006.01)  
**A01N 43/40** (2006.01)  
**A01N 43/32** (2006.01)  
**A01N 59/26** (2006.01)  
**A01N 57/12** (2006.01)  
**A01N 43/32** (2006.01)  
**A01N 59/26** (2006.01)  
**A01N 57/12** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.04.2005 E 05746280 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.03.2013 EP 1732386**

54 Título: **Composición fungicida que comprende un derivado de piridilmetilbenzamida y un derivado de quinona**

30 Prioridad:

**06.04.2004 EP 04356046**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**03.07.2013**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE SA (100.0%)  
16, RUE JEAN-MARIE LECLAIR  
69009 LYON CEDEX 09, FR**

72 Inventor/es:

**LATORSE, MARIE-PASCALE;  
WEGMANN, THOMAS y  
GOUOT, JEAN-MARIE**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 410 816 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

Composición fungicida que comprende un derivado de piridilmetilbenzamida y un derivado de quinona

5 La presente invención se refiere a composiciones fungicidas novedosas que comprenden un derivado de piridilmetilbenzamida y un derivado de quinona. La presente invención también se refiere a un procedimiento para combatir hongos fitopatógenos mediante la aplicación en el sitio infestado, o propenso a infestarse, de dicha composición.

10 La solicitud de patente europea EP-A-1056723 divulga de forma genérica, la posibilidad de combinar derivados de piridilmetilbenzamida con productos fungicidas conocidos para desarrollar una actividad fungicida.

La solicitud de patente internacional WO 02/069713 divulga mezclas fungicidas que comprenden un derivado de piridilmetilbenzamida y ácido fosforoso o uno de sus derivados.

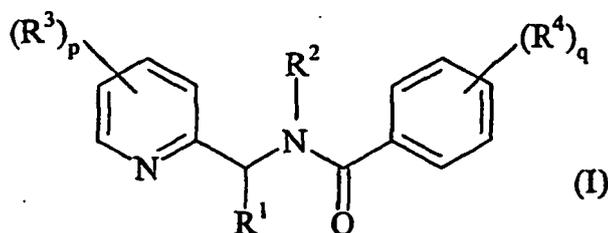
15 La solicitud de patente internacional WO 2004/008857 divulga mezclas fungicidas que comprenden un derivado de quinona y ácido fosforoso o uno de sus derivados.

20 Algunas de las mezclas mencionadas anteriormente han mostrado un efecto sinérgico. De todas las maneras, siempre es de gran interés en agricultura usar mezclas plaguicidas novedosas que muestren un efecto sinérgico con el fin de evitar o de controlar el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos o a las mezclas de ingredientes activos conocidos usados por los agricultores, minimizando mientras las dosis de los productos químicos dispersados en el medio ambiente y reduciendo los costes del tratamiento.

25 Los inventores hemos encontrado ahora algunas composiciones fungicidas novedosas que poseen las características mencionadas anteriormente.

En consecuencia, la presente invención se refiere a una composición que comprende:

30 a) un derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I):



en la que:

- 35
- R<sup>1</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo opcionalmente sustituido o un grupo acilo opcionalmente sustituido;
  - R<sup>2</sup> puede ser un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo opcionalmente sustituido;
  - R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro, -SF<sub>5</sub>, un grupo trialkilsililo, un grupo amino opcionalmente sustituido, un grupo acilo o un grupo E, OE o SE, en los que E puede ser un grupo alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalqueno, arilo o heterociclilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido;
  - p representa 0, 1, 2, 3 o 4;
  - q representa 0, 1, 2, 3 o 4;
- 45

y sus isómeros ópticos y/o geométricos, tautómeros y sales de adición con un ácido o una base agrícolamente aceptables;

y  
b) 5,10-dihidro-5,10-dioxonafto[2,3-b]-1,4-ditiina-2,3-dicarbonitrilo;

50 en una proporción en peso (a)/(b) de 0,01 a 10.

El 5,10-dihidro-5,10-dioxonafto[2,3-b]-1,4-ditiina-2,3-dicarbonitrilo es un fungicida derivado de quinona que también se conoce como ditianona.

55 En el contexto de la presente invención:

- el término halógeno significa bromo, cloro, yodo o flúor.
- el término alquilo significa un grupo hidrocarburo saturado lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;
- 5 - el término alqueno significa un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y una insaturación en forma de doble enlace;
- el término alquino significa un grupo hidrocarburo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y una insaturación en forma de triple enlace;
- el término alcoxi significa un grupo alquiloxi lineal o ramificado que contiene de 1 a 6 átomos de carbono;
- 10 - el término acilo significa un grupo formilo o un grupo alcoxycarbonilo lineal o ramificado que contiene de 2 a 6 átomos de carbono;
- el término cicloalquilo significa un grupo hidrocarburo cíclico saturado que contiene de 3 a 8 átomos de carbono;
- el término arilo significa un grupo fenilo o naftilo;
- 15 - el término heterociclilo significa grupo cíclico saturado, parcialmente saturado, insaturado o aromático que contiene de 3 a 8 átomos, que pueden ser átomos de carbono, átomos de nitrógeno, átomos de azufre o átomos de oxígeno. Ejemplos de dicho heterociclilo pueden ser piridilo, pirdinilo, quinolilo, furilo, tienilo, pirrolilo, oxazolinilo;
- la expresión "opcionalmente sustituido" significa que el grupo al que se refiere dicha expresión puede estar sustituido con uno o más grupos, que pueden ser halógeno, alquilo, alcoxi, hidroxilo, nitro, amino, ciano o acilo.
- 20

La composición según la presente invención proporciona un efecto sinérgico. Este efecto sinérgico permite una reducción de las sustancias químicas esparcidas en el medio ambiente y una reducción de los costes del tratamiento fungicida.

En el contexto de la presente invención, la expresión "efecto sinérgico" está definida por Colby según el artículo titulado "Calculation of the synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations" Weeds, (1967), 15, páginas 20-22.

Este último artículo menciona la fórmula:

$$E = x + y - \frac{x * y}{100}$$

en la que E representa el porcentaje de inhibición de la enfermedad esperado para la combinación de los dos fungicidas en dosis definidas (por ejemplo igual a x e y, respectivamente), x es el porcentaje de inhibición de la enfermedad observado para el compuesto (I) en una dosis definida (igual a x), y es el porcentaje de inhibición de la enfermedad observado para el compuesto (II) en una dosis definida (igual a y). Si el porcentaje de inhibición observado para la combinación es superior a E, existe un efecto sinérgico.

En el contexto de la presente invención, la expresión "efecto sinérgico", significa también el efecto definido por la aplicación del procedimiento de Tamme "Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides", Netherlands Journal of Plant Pathology, 70(1964), páginas 73-80.

La composición según la presente invención comprende un derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I).

Preferentemente, la presente invención se refiere a una composición que comprende un derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I) en la que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación de forma que:

- 50 - con respecto a R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo opcionalmente sustituido. Más preferentemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo. Incluso más preferentemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden ser ambos átomos de hidrógeno.
- con respecto a R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo amino opcionalmente sustituido, un grupo acilo o un grupo E, OE o SE, en los que E puede ser un alquilo, un cicloalquilo, un fenilo o un grupo heterociclilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido; Más preferentemente, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo nitro o un grupo halogenoalquilo. Incluso más preferentemente, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de cloro, un grupo nitro o un grupo trifluorometilo.
- 55
- 60 - con respecto a p, p puede ser 1 o 2. Más preferentemente, p puede ser 2.
- con respecto a q, q puede ser 1 o 2. Más preferentemente, q puede ser 2;

y sus posibles tautómeros y sales de adición con un ácido o una base agrícolamente aceptables.

Más preferentemente, el derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I) presente en la composición de la presente invención es:

- un compuesto (Ia) que es 2,6-dicloro-N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]benzamida; o
- un compuesto (Ib) que es N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]-2-fluoro-6-nitrobenzamida; o
- un compuesto (Ic) que es N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]-2-metil-6-nitrobenzamida;

y sus posibles tautómeros y sales de adición con un ácido o una base agrícolamente aceptables

La composición según la presente invención comprende al menos un derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I) (a) y ditianona (b) en una proporción en peso (a)/(b) de 0,01 a 10; preferentemente de 0,05 a 1; incluso más preferentemente de 0,1 a 0,6.

La composición de la presente invención puede comprender también un tercer ingrediente activo fungicida (c).

El ingrediente activo fungicida (c) puede seleccionarse de entre azaconazol, azoxistrobina, (Z)-N-[(ciclopropilmetoxiimino)-2,3-difluoro-6-(trifluorometil)bencil]-2-fenilacetamida, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, bifenilo, bitertanol, blasticidina-S, boscalid, borax, bromuconazol, bupirimato, sec-butilamina, polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbendazim, carboxina, carpropamida, quinometionato, clorotalonilo, clozolinato, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, diclofluanid, diclorofeno, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat metilsulfato, difenzoquat, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorf, diniconazol, dinobuton, dinocap, difenilamina, dodemorf, acetato de dodemorf, dodina, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etoxiquina, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fempiclonilo, fenoxanilo, fenpropidina, fenpropimorf, fentina, hidróxido de fentina, acetato de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, formaldehído, fosetil, fosetil-aluminio, fosetil-sodio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, acetatos de guazatina, hexaclorobenceno, hexaconazol, sulfato de 8-hidroxiquinolina, sulfato de hidroxiquinolina-potasio, himexazol, ciazofamida, sulfato de imazalilo, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, kasugamicina, hidrato del clorhidrato de kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, maneb, mepanipirim, mepronilo, cloruro mercúrico, óxido mercúrico, cloruro mercurioso, metalaxilo, metalaxilo-M, metam-sodio, metam, metconazol, metasulfocarb, isotiocianato de metilo, metiram, metominostrobina, mildiomicina, miclobutanilo, nabam, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octililona, ofurace, ácido oleico, oxadixilo, oxina-cobre, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazolato, penconazol, pencicuron, pentaclorofenol, pentaclorofenólido de sodio, laurato de pentaclorofenilo, acetato de fenilmercurio, 2-fenilfenólido de sodio, 2-fenilfenol, ftalida, picoxistrobina, piperalina, polioxina, polioxina B, polioxina, polioxirim, probenazol, procloraz, procimidona, clorhidrato de propamocarb, propamocarb, propiconazol, propineb, protioconazol, pirazofos, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, piroquilona, quinoxifeno, quintoceno, siltiofam, espiroxamina, azufre, aceites de alquitrán, tebuconazol, tecnaceno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamid, tiofanato-metilo, tiram, tolclofos-metilo, toliifluanida, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triflorina, triticonazol, validamicina, vinclozolona, zineb, ziram, zoxamida, ácido fosforoso, piraclostrobina y simeconazol.

El tercer ingrediente activo fungicida puede seleccionarse preferentemente de entre un derivado de ácido fosfórico, el propio ácido fosfórico o sales de metales alcalinos, de metales alcalinotérreos o sales metálicas de los mismos. Más preferentemente, el compuesto fungicida adicional puede elegirse de modo que sea fosetil-aluminio.

Cuando el tercer ingrediente activo (c) tal como se ha definido anteriormente está presente en la composición, este compuesto puede estar presente en una cantidad de proporciones en peso (a) : (b) : (c) de 0,01 : 1 : 0,1 a 10 : 1 : 10; las proporciones del compuesto (a) y del compuesto (c) varían independientemente una de otra. Preferentemente, la proporción en peso (a) : (b) : (c) puede ser de 0,05 : 1 : 1 a 1 : 1 : 8; más preferentemente de 0,1 : 1 : 2 a 0,6 : 1 : 5; las proporciones del compuesto (a) y del compuesto (c) varían independientemente una de otra.

Las composiciones siguientes pueden enumerarse para ilustrar de un modo no limitante la presente invención: compuesto (Ia) con ditianona; compuesto (Ia) con ditianona y fosetil-aluminio; compuesto (Ib) con ditianona; compuesto (Ib) con ditianona y fosetil-aluminio; compuesto (Ic) con ditianona; compuesto (Ic) con ditianona y fosetil-aluminio.

La composición según la presente invención puede comprender además otro componente adicional tal como un soporte, vehículo o carga agrícolamente aceptable.

En la presente memoria descriptiva, el término "soporte" designa un material natural o sintético, orgánico o inorgánico, con el cual se combina el material activo para facilitar la aplicación, de forma notable a las partes de la planta. Este soporte es, por lo tanto, generalmente inerte y deberá ser agrícolamente aceptable. El soporte puede

ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales o vegetales y sus derivados. Se pueden usar también mezclas de dichos soportes.

5 La composición puede comprender también otros componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender también un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos tensioactivos. Puede hacerse mención, por ejemplo, a sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es esencial, en general, cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferentemente, el contenido de tensioactivo puede estar comprendido entre el 5 % y el 40 % en peso de la composición.

Pueden incluirse también otros componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, estabilizantes, secuestrantes. De forma más general, los materiales activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que satisfaga las técnicas de formulación habituales.

20 En general, la composición según la invención puede contener entre el 0,05 y el 99 % (en peso) de material activo, preferentemente entre el 10 y el 70 % en peso.

25 Las composiciones según la presente invención pueden usarse en diversas formas, tales como en dispensador de aerosol, suspensión en cápsula, concentrado de niebla fría, polvo espolvoreable, concentrado emulsionante, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado fluidizable para el tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, gránulo, concentrado de niebla caliente, macrogránulo, microgránulo, polvo dispersable en aceite, concentrado fluidizable miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, varilla para plantas, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas recubiertas con un plaguicida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para tratamiento de semillas, concentrado de suspensión (concentrado fluidizable), líquido de volumen ultra bajo (ulv), suspensión de volumen ultra bajo (ulv), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo humectable.

35 Estas composiciones incluyen no sólo composiciones preparadas para aplicar a las plantas o las semillas que se desean tratar por medio de dispositivos adecuados, tales como dispositivos para pulverizar o espolvorear, sino también composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de su aplicación al cultivo.

40 Las composiciones fungicidas de la presente invención pueden usarse para controlar curativa o preventivamente hongos fitopatógenos de cultivos. De este modo, según otro aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento para controlar de forma preventiva o curativa hongos fitopatógenos de cultivos caracterizado porque se aplica una composición fungicida tal como se ha definido anteriormente en el presente documento a las semillas, la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca.

45 La composición, tal como se usa contra hongos fitopatógenos de cultivos, comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula general (I).

50 La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de composición según la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o propensos a aparecer en cultivos y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar dentro de un intervalo amplio dependiendo del hongo a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida según la invención.

55 Esta cantidad puede determinarse mediante ensayos de campo sistemáticos, que están dentro de la capacidad de un experto en la técnica.

60 El procedimiento de tratamiento según la presente invención es útil para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o plántulas para transplantar y plantas o plantas para transplantar. Este procedimiento de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El procedimiento de tratamiento según la invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o cañas, hojas, flores y frutos de las plantas implicadas.

65 Entre las plantas que pueden ser protegidas por medio del procedimiento según invención, pueden mencionarse algodón, lino, vides, cultivos frutales u hortícolas tales como *Rosaceae sp.* (por ejemplo frutas de pepita, tales como manzanas y peras, pero también frutas de hueso, tales como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*,

*Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por ejemplo árboles y plantaciones de bananas), *Rubiaceae sp.*, *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo limones, naranjas y pomelos), cultivos de leguminosas tales como *Solanaceae sp.* (por ejemplo tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo lechugas), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.*, *Papilionaceae sp.* (por ejemplo guisantes), *Rosaceae sp.* (por ejemplo fresas); cultivos de gran importancia tales como *Graminae sp.* (por ejemplo maíz, césped o cereales tales como trigo, arroz, cebada y triticales), *Asteraceae sp.* (por ejemplo girasol), *Cruciferae sp.* (por ejemplo colza), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo remolacha de mesa); cultivos hortícolas y silvícolas; así como homólogos de estos cultivos genéticamente modificados.

Entre las plantas y las posibles enfermedades de plantas protegidas por el procedimiento según la presente la invención, pueden mencionarse:

- trigo, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*), carbón hediondo (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* o *Tilletia indica*), septoriosis (*Septoria nodorum*) y carbón desnudo;
- trigo, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: cercosporiosis del cereal (*Tapesia yallundae*, *Tapesia acuiformis*), mal del piel (*Gaeumannomyces graminis*), foot blight (*F. culmorum*, *F. graminearum*), mancha negra (*Rhizoctonia cerealis*), mildiu polvoroso (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), royas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);
- trigo y cebada, con respecto a la lucha contra enfermedades bacterianas y víricas, por ejemplo mosaico amarillo de la cebada;
- cebada, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: mancha reticular (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), carbón desnudo (*Ustilago nuda*) y fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*);
- cebada, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas de la planta: cercosporiosis del cereal (*Tapesia yallundae*), mancha reticular (*Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), mildiu polvoroso (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), roya enana de la hoja (*Puccinia hordei*) y escaldadura (*Rhynchosporium secalis*);
- patata, con respecto a la lucha contra enfermedades del tubérculo (en particular *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), mildiu (*Phytophthora infestans*) y determinados virus (virus Y);
- patata, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las hojas: tizón temprano (*Alternaria solani*), mildiu (*Phytophthora infestans*);
- algodón, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de plantas jóvenes obtenidas a partir de semillas: caída de plántulas y podredumbre basal (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxysporum*) y podredumbre negra de la raíz (*Thielaviopsis basicola*);
- cultivos de producción de proteínas, por ejemplo guisantes, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: antracnosis (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y mildiu (*Peronospora pisi*);
- cultivos de producción de aceites, por ejemplo colza, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* y *Sclerotinia sclerotiorum*;
- maíz, con respecto a la lucha contra las enfermedades de las semillas: (*Rhizopus sp.*, *Penicillium sp.*, *Trichoderma sp.*, *Aspergillus sp.* y *Gibberella fujikuroi*);
- lino, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las semillas: *Alternaria linicola*;
- árboles forestales, con respecto a la lucha contra la caída de plántulas (*Fusarium oxysporum*, *Rhizoctonia solani*);
- arroz, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas: añublo (*Magnaporthe grisea*), mancha del borde de la vaina (*Rhizoctonia solani*);
- cultivos de leguminosas, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de plantas jóvenes obtenidas a partir de semillas: caída de plántulas y podredumbre basal (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium sp.*);
- cultivos de leguminosas, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas: moho gris (*Botrytis sp.*), mildius polvorosos (en particular *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Leveillula taurica*), fusariosis (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium roseum*), mancha foliar (*Cladosporium sp.*), mancha foliar por alternaria (*Alternaria sp.*), antracnosis (*Colletotrichum sp.*), mancha foliar por septoria (*Septoria sp.*), mancha negra (*Rhizoctonia solani*), mildius (por ejemplo *Bremia lactucae*, *Peronospora sp.*, *Pseudoperonospora sp.*, *Phytophthora sp.*);
- árboles frutales, con respecto a enfermedades de las partes aéreas: enfermedad por monilia (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), roña (*Venturia inaequalis*), mildiu polvoroso (*Podosphaera leucotricha*);
- vid, con respecto a enfermedades de las hojas: En particular moho verde (*Botrytis cinerea*), mildiu polvoroso (*Uncinula necator*), podredumbre negra (*Guignardia biwelli*) y mildiu (*Plasmopara viticola*);
- remolacha, con respecto a la lucha contra las siguientes enfermedades de las partes aéreas: tizón por cercospora (*Cercospora beticola*), mildiu polvoroso (*Erysiphe beticola*), mancha foliar (*Ramularia beticola*).

Preferentemente, la planta que puede ser protegida mediante el procedimiento según la invención es la vid.

La composición fungicida según la presente invención puede usarse también contra enfermedades fúngicas propensas a desarrollarse sobre o en el interior de la madera. El término "madera" significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de procesado de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada y madera contrachapada. El procedimiento para tratar madera según la invención consiste principalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos según la invención, o con una composición según la invención; esto incluye por ejemplo aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo que se aplica habitualmente en el tratamiento según la presente invención se encuentra de forma general y ventajosa entre 10 y 2.000 g/ha, preferentemente entre 50 y 1.500 g/ha, para aplicaciones de tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa que se aplica se encuentra, de forma general y ventajosa, entre 2 y 200 g por cada 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por cada 100 kg de semillas, en el caso de tratamiento de semillas. Se entiende claramente que las dosis indicadas anteriormente se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la técnica sabrá como adaptar las dosis de aplicación según la naturaleza del cultivo que se desea que tratar.

La composición fungicida según la presente invención se puede usar también en el tratamiento de organismos genéticamente modificados con los compuestos según la invención o composiciones agroquímicas según la invención. Las plantas genéticamente modificadas son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa esencialmente genes que confieren a la planta transformada propiedades agronómicas novedosas o genes que mejoran la calidad agronómica de la planta transformada.

Las composiciones según la invención también se pueden usar para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas en animales o seres humanos tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por trichophyton y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

La presente invención se ilustrará a continuación de forma no limitante con los ejemplos siguientes.

#### **Ejemplo 1: tratamiento de vides con una composición que comprende el compuesto la y ditianona**

Este ejemplo demuestra la actividad sinérgica de una mezcla de 2,6-dicloro-N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]benzamida (compuesto la) y ditianona contra el mildiu lanoso de la vid (*Plasmopara Viticola*) en una aplicación preventiva de 72 h.

Se cultivaron plantas de vid de la variedad Cabernet Sauvignon en suelo arenoso en macetas de plástico con una única planta por maceta. A la edad de dos meses (6 a 7 hojas desarrolladas), estas plantas se pulverizan con los dos fungicidas bien por separado o bien en mezcla. Los fungicidas aplicados en mezcla también se aplicaron individualmente en las mismas dosis que las usadas en las combinaciones.

Los fungicidas, bien por separado o bien en mezcla, se aplicaron a una tasa volumétrica de 250 l de agua por ha.

Se estudiaron dos proporciones del compuesto la: ditianona de 1:5 y 1:10. La mezcla del compuesto la con ditianona se había preparado con ditianona en forma de gránulos dispersables en agua (WG) a 750 g/kg y el compuesto la en forma de solución concentrada (SC) a 480 g/l.

Tres días después del tratamiento, se inoculó a cada planta, por pulverización, con una suspensión acuosa de esporangios de *Plasmopara viticola* obtenidos de hojas contaminadas. La concentración de esporangios fue aproximadamente de 100.000 unidades por ml.

Después de la contaminación las plantas se incubaron durante 7 días a 20 °C en una atmósfera saturada.

Siete días después de la contaminación, se evaluaron los síntomas en términos de la extensión de la superficie inferior de las hojas infectadas, mediante comparación con plantas no tratadas pero contaminadas.

La eficacia del tratamiento se calculó usando la fórmula de Abbott:

$$\text{Eficacia} = (\text{No tratada} - \text{Tratada} / \text{No tratada}) \times 100$$

Las concentraciones de los fungicidas por separado o en mezcla que proporcionan el 100 % de eficacia para cada componente se determinaron en base al modelo de curva sigmoideal de dosis/respuesta con sus intervalos de confianza.

Los análisis de los resultados se llevaron a cabo usando el modelo de Tammes (Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides, Neth.J. Plant Path. 70 (1964): 73-80) o el modelo de Colby.

Los resultados obtenidos se presentan en forma de valores de puntos, que corresponden al 100 % de destrucción de los patógenos y se disponen en un diagrama de isobola de Tammes que comprende en el eje de las abscisas las dosis del compuesto la expresadas en mg/l y en el eje de las ordenadas las dosis de ditianona también en mg/l.

Los resultados calculados que corresponde a la dosis eficaz que proporciona un 100 % de efecto contra la enfermedad para las proporciones que se han evaluado se presentan en la Tabla 1 siguiente.

Tabla 1

Proporción compuesto la : ditianona	1:2,5	1:5	1:10	Compuesto la solo	Ditianona sola
Dosis práctica para el 100 % de eficacia	19,6	9	4,7	28	77
Dosis teórica para el 100 % de eficacia	16	11,7	7,2	-	-

Estos resultados se han calculado en base a 4 repeticiones por factor según el procedimiento de Tammes considerando la eficacia del producto para un intervalo de proporciones.

Este ensayo de prevención frente al mildiu veloso de la vid muestra la actividad sinérgica de las composiciones que contienen compuestos A y B en proporciones de 1:5 y 1:10. Se ha demostrado que es necesaria menos cantidad de ambos compuestos para controlar prácticamente el 100 % de la enfermedad en comparación con las dosis teóricas de cada uno de los compuestos esperadas en la mezcla con solo efecto adicional.

También se demuestra la actividad sinérgica de la mezcla anterior cuando se analizan datos según el procedimiento de Colby. La Tabla 2 siguiente presenta los resultados obtenidos en base al uso del procedimiento de Colby para evaluar la actividad sinérgica de la mezcla de Compuesto la y ditianona según la invención.

Tabla 2

Dosis de compuestos la (en mg/l)	0,39	5
Dosis de ditianona (en mg/l)	3,9	50
Eficacia práctica (%)	44	97
Eficacia teórica (%)	34	91

El efecto sinérgico según el procedimiento de Colby se demuestra entre el compuesto la y ditianona para la proporción 1:10. La eficacia práctica de dos dosis fue mejor que su eficacia teórica.

### Ejemplo 2: tratamiento de vides con una composición que comprende el compuesto la, ditianona y fosetil-aluminio

Este ejemplo demuestra la actividad sinérgica de una mezcla de 2,6-dicloro-N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]benzamida (compuesto la), ditianona y fosetil-aluminio contra el mildiu lanoso de la vid (*Plasmopara Viticola*) en una aplicación preventiva de 72 h.

Se cultivaron plantas de vid de la variedad Cabernet Sauvignon en suelo arenoso en macetas de plástico con una única planta por maceta. A la edad de dos meses (6 a 7 hojas desarrolladas), estas plantas se pulverizan con los tres fungicidas bien por separado o bien en mezcla. Los fungicidas aplicados en mezcla también se aplicaron individualmente en las mismas dosis que las usadas en las combinaciones.

Los fungicidas, bien por separado o bien en mezcla, se aplicaron a una tasa volumétrica de 250 l de agua por ha.

Se estudiaron dos proporciones del compuesto la : ditianona : fosetil-Al de 0,4 : 1 : 4 y 0,4 : 1 : 8.

La mezcla de compuesto la con ditianona y fosetil-Al se había preparado con fosetil-Al en forma de gránulos dispersables en agua (WG) a 800 g/kg, compuesto la en forma de solución concentrada (SC) a 480 g/l y ditianona en forma de gránulos dispersables en agua (WG) a 750 g/kg.

Tres días después del tratamiento, se inoculó a cada planta por pulverización una suspensión acuosa de esporangios de *Plasmopara viticola* obtenidos de hojas contaminadas. La concentración de esporangios fue aproximadamente de 100.000 unidades por ml.

Después de la contaminación las plantas se incubaron durante 7 días a 20 °C en una atmósfera saturada.

Siete días después de la contaminación, se evaluaron los síntomas en términos de la extensión de la superficie inferior de las hojas infectadas, mediante comparación con plantas no tratadas pero contaminadas.

La eficacia del tratamiento se calculó usando la fórmula de Abbott:

$$\text{Eficacia} = (\text{No tratada} - \text{Tratada} / \text{No tratada}) \times 100$$

5 Las concentraciones de los fungicidas por separado o en mezcla que proporcionan el 100 % de eficacia para cada componente se determinaron en base al modelo de curva sigmoideal de dosis/respuesta con sus intervalos de confianza. Los análisis de los resultados se llevaron a cabo usando el modelo de Tammes (Isoboles, a graphic representation of synergism in pesticides, Neth.J. Plant Path. 70 (1964): 73-80) o el modelo de Colby.

10 Los resultados obtenidos se presentan en forma de valores de puntos, que corresponden al 100 % de destrucción de los patógenos y se disponen en un diagrama de isobola de Tammes que comprende en el eje de las abscisas las dosis del compuesto la/ditianona expresadas en mg/l y en el eje de las ordenadas las dosis de fosetil-Al también en mg/l.

15 Los resultados calculados que corresponden a la dosis eficaz que proporciona un 100 % de efecto contra la enfermedad para las proporciones que se han evaluado se presentan en la Tabla 3.

Proporción compuestos la : ditianona : fosetil-Al	0,4:1:4	0,4:1:8	Compuesto la/ditianona	Fosetil-Al solo
Dosis práctica para el 100 % de eficacia	49	53	86	> 2000
Dosis teórica para el 100 % de eficacia	82	77	-	-

Estos resultados se han calculado en base a 4 repeticiones por factor según el procedimiento de Tammes considerando la eficacia del producto para un intervalo de proporciones.

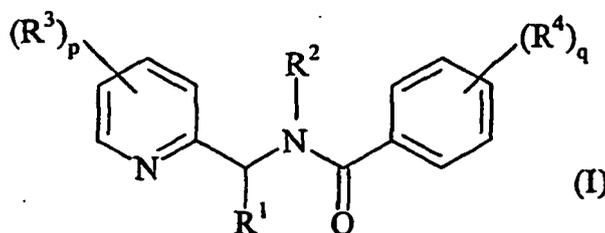
20 Este ensayo de prevención de mildiu polvoroso en vides viníferas muestra la actividad sinérgica de las composiciones que contienen la : ditianona : fosetil-aluminio en proporciones de 0,4 : 1 : 4 y 0,4: 1 : 8. Se ha demostrado que es necesaria menos cantidad de los tres compuestos para controlar prácticamente el 100 % de la enfermedad en comparación con las dosis teóricas de cada uno de los compuestos esperadas en la mezcla con solo efecto adicional.

25

## REIVINDICACIONES

1. Una composición que comprende:

5 a) un derivado de piridilmetilbenzamida de fórmula general (I):



en la que:

- 10
- R<sup>1</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo opcionalmente sustituido o un grupo acilo opcionalmente sustituido;
  - R<sup>2</sup> puede ser un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo opcionalmente sustituido;
  - R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden elegirse independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro, -SF<sub>5</sub>, un grupo trialkilsililo, un grupo amino opcionalmente sustituido, un grupo acilo o un grupo E, OE o SE, en el que E puede ser un grupo alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalqueno, arilo o heterociclilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido;
  - p representa 0, 1, 2, 3 o 4;
  - q representa 0, 1, 2, 3 o 4;

20 y sus isómeros ópticos y/o geométricos, tautómeros y sales de adición con un ácido o una base agrícolamente aceptables;

y

b) 5,10-dihidro-5,10-dioxonafto[2,3-b]-1,4-ditiina-2,3-dicarbonitrilo;

25 en una proporción (a)/(b) en peso de 0,01 a 10.

2. Una composición según la reivindicación 1, **caracterizada porque** R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> se eligen independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo opcionalmente sustituido.

30 3. Una composición según la reivindicación 2, **caracterizada porque** R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos átomos de hidrógeno.

35 4. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizada porque** R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> se eligen independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo nitro, un grupo amino opcionalmente sustituido, un grupo acilo, o un grupo E, OE o SE, en el que E puede ser un alquilo, un cicloalquilo, un fenilo o un grupo heterociclilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido.

5. Una composición según la reivindicación 4, **caracterizada porque** R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> se eligen independientemente uno de otro de modo que sean un átomo de halógeno, un grupo nitro o un grupo halogenoalquilo.

40 6. Una composición según la reivindicación 5, **caracterizada porque** el átomo de halógeno es un átomo de cloro y el grupo halogenoalquilo es un grupo trifluorometilo.

7. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizada porque** p y q se eligen independientemente uno de otro de modo que sean 1 o 2.

45

8. Una composición según la reivindicación 7, **caracterizada porque** p es 2.

9. Una composición según la reivindicación 7 u 8, **caracterizada porque** q es 2.

50 10. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizada porque** el compuesto de fórmula (I) se elige de modo que sea

- 55
- un compuesto (Ia) que es 2,6-dicloro-N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]benzamida; o
  - un compuesto (Ib) que es N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]-2-fluoro-6-nitrobenzamida; o
  - un compuesto (Ic) que es N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil]-2-metil-6-nitrobenzamida.

11. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, **caracterizada porque** la proporción (a)/(b) en peso es de 0,05 a 1.
- 5 12. Una composición según la reivindicación 11, **caracterizada porque** la proporción (a)/(b) en peso es de 0,1 a 0,6.
13. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 que además comprende un compuesto fungicida (c).
- 10 14. Una composición según la reivindicación 13, **caracterizada porque** el compuesto fungicida adicional está seleccionado entre derivados de ácido fosfórico, el propio ácido fosfórico o sales de metales alcalinos, de metales alcalinotérreos o sales metálicas de los mismos.
- 15 15. Una composición según la reivindicación 14, **caracterizada porque** el compuesto fungicida adicional es fosetil-aluminio.
16. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 13 a 15, **caracterizada porque** el compuesto (c) está presente en una cantidad de una proporción (a) : (b) : (c) en peso de 0,01:1:0,1 a 10:1:10; las proporciones del compuesto (a) y del compuesto (c) varían independientemente una de otra.
- 20 17. Una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, **caracterizada porque** además comprende un soporte, vehículo, carga y/o tensioactivo agrícolamente aceptable.
- 25 18. Un procedimiento para controlar de forma preventiva o curativa hongos fitopatógenos de cultivos, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 a las semillas, la planta y/o a los frutos de la planta o al suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca.
19. Un procedimiento según la reivindicación 18, **caracterizado porque** la planta es una vid.