

(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS
ESPAÑA



(11) Número de publicación: **2 477 465**

(51) Int. Cl.:

A01N 43/22 (2006.01)
A01N 25/18 (2006.01)
A01N 25/06 (2006.01)
A01P 7/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.05.2007 E 07795268 (7)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **04.06.2014 EP 2019589**

(54) Título: **Fumigantes de espinosina**

(30) Prioridad:

25.05.2006 US 808372 P
25.05.2006 US 808510 P

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

17.07.2014

(73) Titular/es:

DOW AGROSCIENCES, LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis Indiana 46268-1054, US

(72) Inventor/es:

BOUCHER, RAYMOND E., JR.;
DRIPPS, JAMES E. y
HERTLEIN, MARK

(74) Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 477 465 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

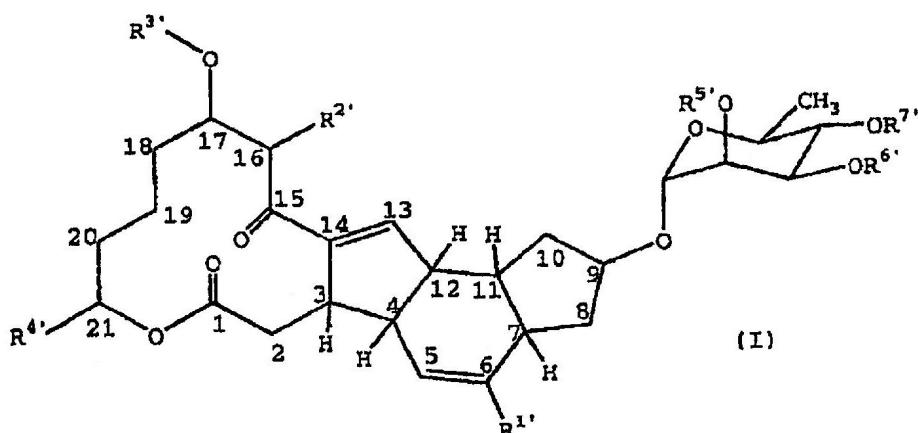
Fumigantes de espinosina

Antecedentes

- 5 Un método comúnmente usado para la eliminación de plagas es la fumigación. Los fumigantes se han usado ampliamente para la desinfestación, y la protección frente a la infestación, que se requiere para proteger plantas de invernadero, materiales en partículas (tales como grano) y otros productos almacenados (tales como tabaco y alimentos), y espacios (tales como edificios). Sin embargo, debido a la necesidad de una elevada volatilidad en el uso de fumigantes, sólo se pueden usar regularmente un pequeño número de compuestos químicos.
- 10 El término "fumigante" como se usa en esta memoria se refiere a una composición insecticida que se puede volatilizar en forma de gotitas de volúmenes ultra pequeños (humos) o vapores para controlar las plagas en contenedores de almacenamiento, edificios, invernaderos, barcos, automotores, productos almacenados, en alimentos, plantas, otros organismos vivos, o en cualquier zona cerrada que sea propensa al ataque de plagas, es decir, a la infestación por plagas. El término "fumigación" se refiere al uso de dichas composiciones insecticidas dispersas para el control de plagas.
- 15 El tamaño de las gotitas determina cómo las gotitas de pesticidas grandes permanecen suspendidas en el aire, el número de gotitas que se producirá a partir de un volumen dado de pesticida y el tamaño de la superficie o zona tratada que será recubierta por cada gotita. Se deben distinguir las siguientes categorías:
- a. Pulverizaciones gruesas, con gotitas que miden 400 micrómetros o más de diámetro;
 - b. Pulverizaciones finas, con gotitas de 100 a 400 micrómetros de diámetro;
 - 20 c. Neblinas, con gotitas de 50 a 100 micrómetros;
 - d. Aerosoles, nieblas, y nieblas o humos de ultra-bajo volumen (ULV) con partículas o gotitas comprendidas en el intervalo de 0,1 a 50 micrómetros de diámetros (que se producen mediante inyección del pesticida en descargas de aire caliente (niebla térmica), mediante mezcla con un gas licuado y liberado a través de un pequeño orificio (aerosol), atomizado a través de boquillas muy finas, o rotores de girado a alta velocidad).
- 25 f. Vapores, en los que todas las partículas son inferiores a 0,001 micrómetros de diámetro (producidas por generadores de calor).
- g. Gases.
- 30 EBERT, TIMOTHY A. ET AL: "Comparing greenhouse sprayers: The dose-transfer process" PEST MANAGEMENT SCIENCE, 60 (5), 507-513 CODEN: PMSCFC; ISSN: 1526-498X, 2004, XP002573174 evalúa tres pulverizadores para su efecto en la retención y eficacia: un pulverizador de alto volumen de dióxido de carbono en polvo, un nebulizador en frío DRAMM, un pulverizador de Sistemas de Pulverización Electrostáticos (ESS) con asistencia de aire. Los ingredientes activos usados eran espinosad y azadiractina. El follaje de las plantas se construyó en el invernadero usando semillas de soja conservadas en bote (*Glycine max* (L) Merrill et Pioneer 9392). La eficacia de la aplicación con espinosad se ensayó usando trips [trips de flores occidentales, *Frankliniella occidentalis* (Pergande)]
- 35 y ácaro (ácaro araña de dos motas, *tetranychus urticae* Koch) abundante en brotes y hojas. La eficacia de la aplicación con azadiractina se ensayó usando la abundancia de trips y pulgones (pulgón de soja, *Aphis glycines* Matsumura) en brotes y hojas. Las características de atomización de cada pulverizador se midieron usando un analizador de partículas por fase Doppler Aerométrico (PDPA) 100-1D. Se presentan los resultados de cuatro ensayos.
- 40 El documento WO 01/12156 A1 muestra formulaciones ectoparasitarias tópicas que comprenden un ectoparasiticida, preferiblemente un piretroide o una espinosina, un agente de propagación que es un alcanoato (C10-C20) de alquilo (C3-C6) ramificado, preferiblemente isopropil-miristato, y opcionalmente un agente de mezclamiento compatible con sistemas disolventes orgánicos, y métodos para controlar una infestación de ectoparásitos en ciertos animales que comprende la aplicación tópica de dichas formulaciones al animal.
- 45 La presente invención está dirigida a una alfombrilla eléctrica para el control de mosquitos que comprende un sustrato impregnado con espinetoram.
- La presente invención también proporciona una bobina combustible que comprende un portador combustible y espinetoram.
- 50 En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para el control de plagas de artrópodos que comprende vaporizar espireroram quemando una bobina combustible que comprende un portador combustible y espinetoram.
- La invención también proporciona un método para controlar plagas de artrópodos que comprende vaporizar espinetoram calentando una alfombrilla eléctrica que comprende un sustrato impregnado con espinetoram.

La composición de espinosina usada en la presente invención es espinetoram, o una de sus sales orgánicas solubles, disueltas o suspendidas en un portador líquido inerte.

- Los compuestos de espinosina consisten en un sistema de anillos 5,6,5-tricíclicos, fusionado a una lactona macrocíclica de 12 miembros, un azúcar neutro (ramnosa), y un aminoazúcar (forosamina) (véase Kirst et al. 5 (1991)). Los compuestos de espinosina naturales se pueden producir por medio de la fermentación de cultivos depositados como en NRRL 18719, 18537, 18538, 18539, 19743, 18395 y 18823 de la colección de cultivos de existencias de Midwest Area Northern Regional Research Center, Agricultural Research Service, United States Departament of Agriculture, 1815 North University Street, Peoria, III. 61604. Se describen también compuestos de 10 espinosina en las Patentes de EE.UU. Nº 5.496.931, 5.670.364, 5.591.606, 5.571.901, 5.202.242, 5.767.253, 5.840.861, 5.670.486 y 5.631.155. Se describen derivados de compuestos de espinosina naturales, algunas veces 15 denominados como espinosoides, en el documento US 6.001.981. Las espinosinas se pueden aislar en forma de sales que son también útiles en los métodos de esta invención. Las sales se preparan usando procedimientos estándares para la preparación de sales. Por ejemplo, las espinosinas se pueden neutralizar con un ácido apropiado para formar sales de adición de ácidos. Sales de adición de ácidos adecuadas representativas incluyen sales 15 formadas mediante reacción con o bien un ácido orgánico o inorgánico, por ejemplo, sulfúrico, clorhídrico, fosfórico, acético, succínico, cítrico, láctico, maleico, fumárico, cólico, pamoico, mágico, glutámico, canfórico, glutárico, glicólico, ftálico, tartárico, fórmico, láurico, esteárico, salicílico, metanosulfónico, bencenosulfónico, sóblico, pícrico, benzoico, cinámico y ácidos similares. Según se usa en esta memoria, el término "espinosina" incluye espinosoides y sales de adición de ácidos.
- 20 Compuestos de espinosina de interés para la práctica de la presente invención son 5,6-dihidro-3'-etoxi-espinosina J y 3'-etoxi-espinosina L. Estos dos compuestos se describen como ejemplos en A25 y A38 en la Patente de EE.UU. Nº 6.001.981. Estos son derivados de compuestos de espinosina naturales espinosina J y espinosina L.



Factor	R ^{1'}	R ^{2'}	R ^{3'}	R ^{4'}	R ^{5'}	R ^{6'}	R ^{7'}
Espinosa J	H	CH ₃	(CH ₃) ₂ N—	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃
Espinosa L	CH ₃	CH ₃	(CH ₃) ₂ N—	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃

- 25 El espinetoram (previamente conocido como DE-175) es una mezcla de 5,6-dihidro-3'-etoxi-espinosina J (componente principal) y 3'-etoxi-espinosina L, que se desarrolla por Dow AgroSciences. La mezcla se puede preparar etoxilando una mezcla de espinosina J y espinosina L, seguido de hidrogenación. El doble enlace 5,6 de la Espinosina J y su derivado 3'-etoxi se hidrogena mucho más fácilmente que el de la espinosina L y su derivado 3'-etoxi, debido al impedimento estérico del grupo metilo en el C-5 en la espinosina L y su derivado 3'-etoxi.
- 30 Sorprendentemente, las composiciones de espinetoram se pueden dispersar en concentraciones adecuadas para el control efectivo de plagas usando bobinas combustibles como bobinas para mosquitos y dispositivos del tipo alfombrilla.
- 35 Las composiciones de espinetoram usadas en la presente invención pueden ser soluciones o emulsiones de las espinosinas o una sal orgánica soluble de espinosinas en un disolvente no acuoso. Ejemplos de disolventes no acuosos adecuados son alquilalcoholes que tienen de 1 a 10 átomos de carbono tales como alcohol metílico, alcohol

etílico, alcohol n-propílico, alcohol isopropílico, alcohol n-butílico, alcohol sec-butílico, alcohol terc-butílico, alcohol isobutílico, alcohol amílico, alcohol hexílico, alcohol heptílico, alcohol octílico, alcohol nonílico, alcohol decílico, etc.; disolventes hidrocarbonados tales como hexano, octano, ciclopentano, benceno, tolueno, xilol, etc.; disolventes hidrocarbonados halogenados tales como tetracloruro de carbono, tricloroetileno, tetracloroetano, diclorobenceno.

- 5 etc; disolventes de éter tales como etiléter, butiléter, etilenglicol-dietiléter, etilenglicol-monoetiléter, etc.; disolventes de cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilpropilcetona, metilamilcetona, cilohexano, etc; disolventes de ésteres tales como etil-formato, metil-acetato, propil-acetato, fenil-acetato, etilenglicol-monoetiléter-acetato; etc; disolventes de alcoholes tales como alcohol de diacetona, etc.; disolventes hidrocarbonados de alto punto de ebullición.

- 10 Las bobinas combustibles son otros métodos bien conocidos para vaporizar materiales (por ejemplo, pesticidas, incienso, etc). Son patentes representativas que describen bobinas combustibles las Patentes de EE.UU. N° 3,248.287, 3,723.615, 3,819.823, 4,144.318, 5,657.574 y 6,419.898. Estos dispositivos son bobinas de un material sólido que se pueden quemar lentamente que contienen un ingrediente para el control de insectos tales como un repelente, un insecticida o un regulador del crecimiento del insecto. Cuando se queman, el calor vaporiza (y por lo tanto dispersa) el ingrediente para el control de insectos. Las pequeñas cantidades de humo ayudan también a dispersar el ingrediente para el control de insectos. Dichos dispositivos son unos medios usados convencionalmente para controlar los mosquitos. Las bobinas para mosquitos se usan a menudo para eliminar o repeler insectos voladores en viviendas. Las composiciones de bobinas para mosquitos tradicionales incluyen aproximadamente el 25% o más de un residuo procedente de la preparación de piretro conocido como pyrethrum marc, ya que se piensa que este material es un ingrediente necesario para producir una bobina para mosquitos aceptable. Además del pyrethrum marc, el agente de quemado o combustible principal usado para bobinas para mosquitos es harina de cáscara de coco, polvo de Tabu, serrín, hojas trituradas, corteza triturada, almidón, etc.

Los vaporizadores térmicos incluyen los del tipo alfombrilla en los que se usa una alfombrilla impregnada con una solución insecticida colocada sobre una placa caliente para vaporizar el insecticida en el aire ambiente. Véanse las Patentes de EE.UU. Nº 6.031.967 y 6.551.560. Dichos dispositivos se usan también convencionalmente en el control de mosquitos.

- En el caso en el que se use una bobina insecticida, el soporte inerte puede ser, por ejemplo, un compuesto de pyrethrum marc, polvo de Tabu (o polvo de hoja de *Machilus thunbergii*), polvo de tallo de piretrum, polvo de hoja de cedro, serrín (tal como serrín de pino), almidón y polvo de cáscara de coco. La dosis del ingrediente activo pueden ser entonces de 0,03% a 1% en peso. En el caso de que se use un soporte fibroso incombustible (alfombrilla), la dosis del material activo puede ser de 0,03% a 95% en peso.

La invención se puede usar, por ejemplo, para proteger granos almacenados, o alimentos almacenados tales como harina o comida o alimentos para animales.

- En una realización, la presente invención proporciona un método de desinfestación de productos agrícolas tales como tabaco mediante fumigación con espinosina. Una plaga principal de tabaco y productos de tabaco almacenados es el escarabajo del cigarrillo, *Laisoderma serricorne*. Durante los pasados 50 años, los fumigantes tóxicos tales como cianuro de hidrógeno, bromuro de metilo, y fosfuro de hidrógeno se han usado para fumigar tabaco y otros productos agrícolas para el control del escarabajo del cigarrillo y otros insectos de productos almacenados. El uso de estos y otros fumigantes ha llegado a estar cada vez más limitado durante los pasados años debido a la preocupación de las agencias reguladoras con respecto a la exposición de los trabajadores a pesticidas, residuos de pesticidas en productos agrícolas, inflamabilidad de los fumigantes, y contaminación de aire y agua.

El método de fumigación de esta invención se puede usar para el control de plagas de la Phylum Arthropoda.

- En una realización, la invención se puede usar para el control de plagas de Subphylum Hexapoda. Más específicamente, la invención se puede usar para el control de plagas de la Class Insecta. Por ejemplo, el método de fumigación de esta invención se puede usar para el control de Coleoptera (escarabajos), Dermaptera (tijeretas), Dictyoptera (cucarachas), Díptera (moscas auténticas), Hemíptera (chinches auténticas), Homóptera (pulgones, chinches, moscas blancas, chicharras), Hymenoptera (hormigas, avispas, y abejas), Isóptera (termitas), Lepidóptera (polillas y mariposas), Mallophaga (piojos masticadores), Orthoptera (saltamontes, langostas y grillos), Phthiraptera (piojos succionadores), Siphonaptera (pulgas) y Thysanoptera (trips).

- 50 En otra realización, el método de fumigación de esta invención se puede usar para el control de plagas de la Subphylum Chelicerata. Más específicamente, el método de fumigación de esta invención se puede usar para el control de plagas de la Class Arachnida. Por ejemplo, el método de fumigación de esta invención se puede usar para el control de Acarina (ácaros y garrapatas).

Ejemplo de formulación 1

- 55 Bobina combustible.

En primer lugar, se disuelven 0,5 g de espinetoram en 20 ml de acetona. La solución se agita uniformemente y se mezcla con 99,4 g de un portador para una bobina para mosquitos (una mezcla de polvo de alcanfor, polvo de

heces; harina de madera a 4:3:3). A esto se añadieron 120 ml de agua y la mezcla se amasó bien, seguido de moldeado y secado para obtener una bobina combustible.

Ejemplo de formulación 2

Bobina

- 5 En primer lugar, se disuelven 0,5 g de cada espinetoram en 20 ml de acetona. La solución se mezcla uniformemente con 99,4 g de un portador para bobinas para mosquitos (preparado mezclando polvo de Tabu, polvo de pyrethrum marc y harina de madera en la relación 4:3:3) con agitación. La mezcla se amasa bien con 120 ml de agua, se moldea y se seca para dar una bobina combustible

Ejemplo de formulación 3

- 10 Alfombrilla eléctrica

Se añade acetona a 0,5 g de espinetoram y 0,4 g de pipenil-butóxido para disolver los ingredientes para preparar una solución en una cantidad total de 10 ml. Se impregna uniformemente un sustrato para alfombrilla eléctrica (fibrillas de una mezcla de borra y pulpa de algodón que se endurecieron en una lámina) de 2,5 cm por 1,5 cm por 0,3 cm de espesor con la solución anterior para obtener una alfombrilla eléctrica.

- 15 Ejemplo de formulación 4

Agente de formación de humo por calor.

En primer lugar, se disuelven 100 mg de espinetoram en una cantidad adecuada de acetona. Se impregna una lámina cerámica porosa de 4,0 cm por 4,0 cm por 1,2 cm de espesor con la solución resultante para obtener un agente de formación de humo por calor.

- 20 Las alfombrillas calentadas eléctricamente impregnadas con espinosad han demostrado tener la capacidad de controlar los mosquitos adultos cuando se ensayan según los protocolos estándar (SANS Method 6136).

REIVINDICACIONES

- 1.- Una alfombrilla eléctrica para el control de mosquitos que comprende un sustrato impregnado con espinetoram.
- 2.- Una bobina combustible que comprende un portador combustible y espinetoram.
- 3.- Un método para el control de plagas de artrópodos que comprende vaporizar espinetoram quemando una bobina combustible que comprende un portador combustible y espinetoram.
- 5 4.- Un método para el control de plagas de artrópodos que comprende vaporizar espinetoram calentando una alfombrilla eléctrica que comprende un sustrato impregnado con espinetoram.