

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 535 751**

51 Int. Cl.:

<b>A01N 43/824</b>	(2006.01) <i>A01N 43/54</i>	(2006.01)
<b>A01N 43/836</b>	(2006.01) <i>A01N 43/76</i>	(2006.01)
<b>A01N 43/82</b>	(2006.01) <i>A01N 43/80</i>	(2006.01)
<b>A01P 13/02</b>	(2006.01) <i>A01N 43/86</i>	(2006.01)
<b>A01N 25/32</b>	(2006.01) <i>A01N 43/90</i>	(2006.01)
<b>A01N 37/46</b>	(2006.01) <i>A01N 47/36</i>	(2006.01)
<b>A01N 39/02</b>	(2006.01) <i>A01N 47/38</i>	(2006.01)
<b>A01N 43/18</b>	(2006.01)	
<b>A01N 43/42</b>	(2006.01)	
<b>A01N 43/50</b>	(2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.05.2001 E 10158917 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.04.2015 EP 2243364**

54 Título: **Herbicidas selectivos basados en heteroariloxi-acetamidas**

30 Prioridad:

**22.05.2000 DE 10025306**  
**24.08.2000 DE 10041619**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**14.05.2015**

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH**  
**(100.0%)**  
**Alfred-Nobel-Strasse 10**  
**40789 Monheim am Rhein , DE**

72 Inventor/es:

**FEUCHT, DIETER, DR.;**  
**DAHMEN, PETER, DR.;**  
**DREWES, MARK, DR.;**  
**PONTZEN, ROLF, DR. y**  
**KREMER, MATHIAS, DR.**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**Observaciones :**

**Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes**

**ES 2 535 751 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

Herbicidas selectivos basados en heteroariloxi-acetamidas

5 La invención se refiere a nuevas combinaciones de principios activos sinérgicos, herbicidas selectivos, que se componen de una heteroariloxi-acetamida conocida por una parte y por un compuesto de efecto herbicida conocido y dado el caso los compuestos de mejora de la compatibilidad con las plantas de cultivo por otra parte y se puedan usar con especial buen éxito para combatir malas hierbas selectivamente en distintos cultivos de plantas de aprovechamiento.

10 Las heteroariloxiacetamidas son como herbicidas efectivos especialmente contra malas hierbas monocotiledóneas objeto de una serie de solicitudes de patente (véase los documentos EP-A 5501 , EP-A 18497 , EP-A 29171 , EP-A 94514 , EP-A 100044 , EP-A 100045 , EP-A 161602 , EP-A 195237 , EP-A 348734 , EP-A 348737 , DE-A 4317323 ). Sin embargo el efecto de estos compuestos y/o su compatibilidad frente a plantas de cultivo no siempre es completamente satisfactorio.

15 Además se han conocido combinaciones de principios activos de heteroariloxi-acetamidas y otros compuestos de efecto herbicida para la consecución de un efecto sinérgico (véanse los documentos WO-A 94/02014, WO-A-96/07323, WO-A-96/11575, WO-A-96/17519, WO-A-98/08383, véase también los documentos US-A-5858920, US-A-5945379, US-A-5985797, EP-A 1123654, US-A 6001774) o bien a partir de heteroariloxi-acetamidas y compuestos que pueden mejorar la compatibilidad con plantas de cultivo de herbicidas (véase el documento DE-A 3418167, véase también el documento US-A-5858920). Sin embargo tampoco en estos productos de combinación son siempre completamente satisfactorias las propiedades de aplicación.

20 De forma sorprendente se ha encontrado finalmente que un principio activo conocido de una serie de heteroariloxi-acetamidas muestra efectos sinérgicos en relación al efecto frente a malas hierbas con aplicación conjunta con un compuesto de efecto herbicida conocido y dado el caso los compuestos de mejora de la compatibilidad con plantas de cultivo y/o mejora significativamente la compatibilidad con plantas de cultivo y de forma especialmente ventajosa se puede usar como preparado de combinación ampliamente efectivo para combatir de forma selectiva malas hierbas en cultivos de plantas de aprovechamiento como, por ejemplo, en algodón, cebada, maíz, patata, colza, arroz, soja, girasol, trigo y caña de azúcar.

Son objeto de la invención agentes herbicidas selectivos, caracterizados por un contenido efectivo en una combinación de principios activos constituida por

- 30 (a) el compuesto N-i-propil-N-(4-fluoro-fenil)- $\alpha$ -(5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-il-oxi)-acetamida (flufenacet)  
 ("principio activo del grupo 1") y  
 (b) el compuesto ácido 2-[4,5-dihidro-4-metil-4-(1-metiletil)-5-oxo-1H-imidazol-2-il]-5-(metoximetil)-3-piridincarboxílico (imazamox)  
 ("principio activo del grupo 2")

35 El principio activo del grupo 1 se describe en las solicitudes de patente o documentos de patente anteriormente indicadas.

Al principio activo del grupo 2 se puede asignar en correspondencia a su estructura química la siguiente clase de principios activos:

Imidazolinona (por ejemplo, imazamox)

40 Se ha encontrado ahora de forma sorprendente que las combinaciones de principios activos anteriormente definidas de las heteroariloxi-acetamidas y del principio activo del grupo 2 presenten una actividad herbicida especialmente alta con compatibilidad con plantas de aprovechamiento considerablemente buena y se puedan usar en distintos cultivos, de forma particular en cebada, patatas, maíz, arroz, soja y trigo para combatir de forma selectiva malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en ámbitos semi-selectivos y no selectivos.

45 De forma sorprendente la actividad herbicida de las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención es mayor que la suma de los efectos de principios activos individuales.

Se presenta por tanto un efecto sinérgico no previsible y no solo un complemento del efecto. Las nuevas combinaciones de principios activos son en muchos cultivos bien toleradas, las nuevas combinaciones de principios activos también combaten bien malas hierbas que de otro modo son difíciles de combatir. Las nuevas combinaciones de principios activos representan por tanto una ampliación valiosa de herbicidas.

50 El efecto sinérgico de las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención es especialmente remarcado en determinadas relaciones de concentración. Sin embargo se pueden variar las relaciones en peso de los principios activos en las combinaciones de principios activos en intervalos relativamente amplios. Por lo general

por 1 parte en peso de principio activo del grupo 1 corresponde de 0,01 a 1000 partes en peso, preferiblemente de 0,02 a 500 partes en peso y con especial preferencia de 0,05 a 100 partes en peso de principio activo del grupo 2.

Como ejemplos para las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención son de citar:

flufenacet + imazamox

5 De acuerdo con la invención, se pueden tratar todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entienden, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de tecnología genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas protegibles por el derecho de protección de variedades o las variedades de plantas no protegibles. Por partes de planta deben entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, citándose por ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenecen a las partes de planta también productos de cosecha así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de plantas y partes de planta con los principios activos se realiza directamente o mediante exposición a su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, vaporización, nebulización, dispersión, extensión y en material reproductivo, especialmente en semillas, además mediante envolturas de una o varias capas.

Entre las plantas obtenidas mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o mediante combinación de estos procedimientos son de destacar aquellas plantas que toleran las denominadas sustancias inhibitorias de 4-HPPD, EPSP y/o PPO, como por ejemplo plantas *Acuron*.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar, por ejemplo, en las siguientes plantas:

25 Malas hierbas dicotiledóneas de géneros: *Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.*

30 Malas hierbas dicotiledóneas de géneros: *Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.*

35 Malas hierbas monocotiledóneas de géneros: *Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.*

40 Malas hierbas monocotiledóneas de géneros: *Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.*

El uso de combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención no se ve limitado en modo alguno a estos géneros sino que se extiende de igual forma a otras plantas.

45 Las combinaciones de principios activos que se van a usar de acuerdo con la invención se pueden usar tanto en procedimientos de explotación convencionales (cultivos en filas con filas adecuadas) en cultivos de plantágenos (por ejemplo, vino, frutales, cítricos), así como en instalaciones industriales y sobre raíles, en carreteras y plazas, pero también para el tratamiento de rastrojos y en el procedimiento *Minimum-Tillage*. Estos son adecuados adicionalmente como agentes de quemado (muerte de la hierba, por ejemplo en patatas) o como defoliantes (por ejemplo, en algodón). Además son adecuados para el uso en barbechos. Otros ámbitos de uso son viveros, bosques, pastos y plantas ornamentales.

50 Las combinaciones de principios activos se pueden transformar en las formulaciones habituales como soluciones, emulsiones, polvos de pulverización, suspensiones, polvos, productos en polvo, pastas, polvos solubles, gránulos, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo y sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, así como microencapsulaciones de sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con diluyentes, como disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, como agentes emulsionantes y/o agentes dispersantes y/o agentes espumantes.

- 5 En el caso de uso de agua como agente diluyente, pueden usarse también, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftaleno, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafina, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

Se tienen en cuenta como vehículos sólidos:

- 15 por ejemplo, sales de amonio y polvos de rocas naturales como caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta: por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como éster de ácido graso y polioxietileno, éteres de alcohol graso y polioxietileno, por ejemplo, alquilaril-poliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina; como agentes de dispersión se tienen en cuenta: por ejemplo, lejías de lignina-sulfito y metilcelulosa.

Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

- 25 Se pueden usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Las formulaciones contienen en general entre 0,1 y 95 % en peso de principio activo, preferiblemente entre 0,5 y 90 %.

- 30 Las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar en general en forma de formulaciones listas para el uso. Los principios activos contenidos en las combinaciones de principios activos se pueden mezclar también en formulaciones individuales en la aplicación, es decir, en forma de mezclas en tanque.

- 35 Las nuevas combinaciones de principios activos se pueden usar como tales o en sus formulaciones además también en mezcla con otros herbicidas conocidos, siendo posibles además formulaciones listas para uso o mezclas en tanque. También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras contra ingesta por parte de pájaros, sustancias para el crecimiento, nutrientes de plantas y agentes de mejora de la estructura del suelo. Para determinados fines de aplicación, de forma particular en procedimientos post-emergencia, puede ser ventajoso absorber en las formulaciones como otros aditivos, aceites minerales o vegetales compatibles con plantas (por ejemplo, el preparado comercial "Oleo DuPont 11E") o sales de amonio como, por ejemplo, sulfato de amonio o rodanuro de amonio.

Las nuevas combinaciones de principios activos se pueden aplicar como tales, en forma de sus formulaciones o las formas de aplicación preparadas a partir de estas, como soluciones, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y gránulos listos para uso. La aplicación se lleva a cabo de forma habitual, por ejemplo, mediante vertido, rociado, pulverización, espolvoreo o dispersión.

- 45 Las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención se pueden aplicar antes y tras la emergencia de las plantas, por ejemplo, en pre-emergencia y post-emergencia. Estas se pueden incorporar también antes de la siembra al suelo.

Siempre se presenta un efecto sinérgico en herbicidas si el efecto herbicida de la combinación de principios activos es mayor que la de los principios activos aplicados individualmente.

- 50 El efecto que se espera para una combinación dada de dos herbicidas se puede calcular como sigue (véase COLBY, S.R. "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds 15, páginas 20 A 22 (1967):

si

X = % de daño con herbicida A (principio activo del grupo 1) en cantidad de aplicación de p kg/ha

y

Y = % de daño con herbicida B (principio activo del grupo 2) en cantidad de aplicación de q kg/ha,

y

E = el daño esperado de herbicidas A y B con cantidades de aplicación de p y q kg/ha,

5 entonces:

$$E = X + Y - (X * Y / 100)$$

Si el daño real es mayor que el calculado, entonces la combinación es sobreaditiva en cuanto a su efecto, es decir, presenta un efecto sinérgico.

10 Las combinaciones de principios activos de la presente invención presentan en realidad la propiedad de que su efecto herbicida encontrado es más fuerte que el calculado, lo que significa que las nuevas combinaciones de principios activos actúan sinérgicamente.

**REIVINDICACIONES**

1. Agente que contiene un contenido efectivo de una combinación de principios activos constituida por
  - (a) el compuesto N-i-propil-N-(4-fluoro-fenil)- $\alpha$ -(5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-il-oxi)-acetamida (flufenacet)
- 5        (“principio activo del grupo 1”) y
  - (b) el compuesto ácido 2-[4,5-dihidro-4-metil-4-(1-metiletil)-5-oxo-1H-imidazol-2-il]-5-(metoximetil)-3-piridincarboxílico (imazamox)
- 10        (“principio activo del grupo 2”).
2. Agente según la reivindicación 1, caracterizado porque a una parte en peso de principio activo del grupo 1 corresponden de 0,01 a 1000 partes en peso de principio activo o de los principios activos del segundo grupo de herbicidas (componente b)).
3. Uso de un agente según una de las reivindicaciones 1 a 2 para combatir plantas no deseadas.
4. Procedimiento para combatir plantas no deseadas, caracterizado porque se deja actuar agentes según una de las reivindicaciones 1 a 2 sobre las plantas no deseadas y/o su hábitat.
- 15        5. Procedimiento para la preparación de un agente herbicida, caracterizado porque se mezcla un agente según una de las reivindicaciones 1 a 2 con agentes tensioactivos y/o diluyentes.