

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 543 431**

51 Int. Cl.:

A01P 3/00 (2006.01)

A01N 25/04 (2006.01)

A01N 25/30 (2006.01)

A01N 45/02 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.10.2011 E 11773260 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.05.2015 EP 2629618**

54 Título: **Concentrados agroquímicos que contienen Isopirazam**

30 Prioridad:

21.10.2010 EP 10188309

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

19.08.2015

73 Titular/es:

**SYNGENTA LIMITED (100.0%)
European Regional Centre Priestley Road Surrey
Research Park
Guildford Surrey GU2 7YH, GB**

72 Inventor/es:

**STOCK, DAVID;
PERRY, RICHARD BRIAN;
RAMSAY, JULIA LYNNE y
BELL, GORDON ALASTAIR**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 543 431 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).

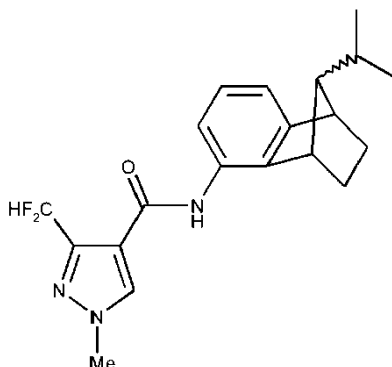
DESCRIPCIÓN

Concentrados agroquímicos que contienen Isopirazam.

La presente invención se refiere a composiciones que contienen Isopirazam, así como métodos de fabricación y utilización de las composiciones.

- 5 Los productos agroquímicos bioactivos se venden usualmente como formulaciones concentradas y antes de su utilización se diluyen con agua y se aplican subsiguientemente a las plantas, v.g. por pulverización. Tales formulaciones pueden incluir ingredientes además del ingrediente activo agroquímico para mejorar el producto, v.g. para favorecer la dispersión del agente en solución, para mejorar la absorción del agente por la planta, para aumentar la bioactividad del agente, o para mejorar la vida útil, etc.
- 10 Existen varios tipos diferentes de formulación que se utilizan comúnmente con productos agroquímicos bioactivos. Éstos incluyen concentrados solubles (SL), concentrados emulsionables (EC), concentrados en suspensión (SC), emulsión de aceite en agua (EW), polvo dispersable en agua (WP), gránulo dispersable en agua (WG), suspoemulsión (SE) y suspensión de microcápsulas (CS).
- 15 Algunos tipos de formulación, particularmente formulaciones distintas de concentrados emulsionables, se benefician notablemente de la presencia de un adyuvante, es decir un agente utilizado para mejorar la bioeficiencia (actividad) del producto agroquímico bioactivo. Los adyuvantes pueden variar notablemente en complejidad desde agentes tensioactivos simples a aceites mezclados multi-componentes.

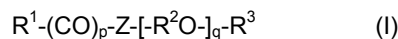
El Isopirazam es un producto de protección de las cosechas activo como fungicida y se describe por ejemplo en WO 04/035589 y WO 06/005612. Isopirazam tiene la estructura:



- 20 Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que la eficacia de Isopirazam se mejora por el uso con adyuvantes que contienen cadenas grasas alcoxiladas, v.g. comparado con otros adyuvantes utilizados comúnmente, y en particular los descritos a continuación.

Conforme a ello, en un primer aspecto, la invención proporciona una composición que comprende

- 25 a) un adyuvante, adyuvante que es un ácido graso alcoxilado o un alcohol graso alcoxilado, adyuvante que tiene la fórmula I:



en la cual

- 30 Z es O;
- R¹ es alquilo C₈-C₂₀ o alquenoilo C₈-C₂₀;
- cada R² es independientemente alquilo C₂-C₄;
- R³ es alquilo C₁-C₈;
- p es 0 ó 1; y
- 35 q es 2 a 40; y
- b) Isopirazam.

Preferiblemente, la composición es un concentrado agroquímico acuoso, v.g. un concentrado en suspensión.

Z es O. Preferiblemente, R³ es preferiblemente butilo.

Más preferiblemente, el adyuvante es uno en el que: Z es O, R¹ es alquilo C₈-C₂₀ o alquenilo C₈-C₂₀; R² es etilo; R³ es alquilo C₁-C₈; p es 0 y q es 2 a 40.

- 5 Más preferiblemente, el adyuvante es uno en el que: Z es O, R¹ es alquilo C₁₆-C₂₀ o alquenilo C₁₆-C₂₀; R² es etilo; R³ es butilo; p es 0 y q es 5 a 30.

- Usualmente, el adyuvante será una mezcla de las moléculas, v.g. en las cuales Z, R¹, R², R³, q y p pueden tener valores diferentes. Por ejemplo, al menos 50, 60, 70, 80, 90, o incluso 100% de las moléculas del adyuvante de la composición pueden ser moléculas conforme a la fórmula I. Por ejemplo, al menos 50, 60, 70, 80, 90, o incluso 100% de las moléculas del adyuvante pueden ser moléculas en las cuales R³ es alquilo C₁-C₈. En particular, existirá usualmente una distribución de longitudes de cadena de óxido de alquileo. Preferiblemente, el valor medio de q es 10 a 25, más preferiblemente 18 a 22, de modo aún más preferible aproximadamente 20. El término "medio" se refiere al valor medio modal. Al menos 50, 60, 70, 80, 90, o incluso 100% de las moléculas del adyuvante en la composición pueden ser moléculas en las cuales: Z es O, R¹ es C₁₆-C₂₀; R² es etilo; R³ es butilo; p es 0; y q tiene un valor medio de 18-22.
- 10
- 15

Una concentración alta de adyuvante puede ser deseable a fin de aumentar la eficacia de Isopirazam. Por ejemplo, el adyuvante puede estar presente en concentrados agroquímicos acuosos en una proporción de al menos 50 g/l, al menos 100 g/l, al menos 180 g/l, o al menos 230 g/l. Por ejemplo, el adyuvante puede ser 50-800 g/l del concentrado agroquímico acuoso, v.g. 100-500 g/l, v.g. 150-400 g/l.

- 20 Los adyuvantes de la presente invención se pueden preparar mediante técnicas convencionales, v.g. como se describe en WO 03/022048.

- La composición es preferiblemente una formulación de concentrado en suspensión (SC), v.g. una suspensión acuosa de partículas sólidas insolubles finamente divididas del ingrediente agroquímico activo. Las formulaciones SC se pueden preparar por molienda con bolas o perlas de un ingrediente activo agroquímico sólido en un medio adecuado para producir una suspensión de partículas finas del ingrediente activo agroquímico. El tamaño de partícula es típicamente de 0,2-15 micrómetros, por ejemplo de 0,5-5 micrómetros de diámetro de la mediana. El ingrediente activo agroquímico puede combinarse con otros ingredientes de formulación y añadirse a agua, o el mismo puede añadirse a agua que contiene ya otros ingredientes de formulación.
- 25

- La composición puede contener otros ingredientes encontrados en formulaciones agroquímicas comerciales, v.g. agentes tensioactivos, dispersantes, polímeros, agentes humectantes, otros estabilizadores de adyuvantes, modificadores de pH, agentes anticongelantes, agentes de suspensión, emulsionantes, agentes antiespumantes, agentes estabilizadores del pH, conservantes y análogos.
- 30

- En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para aumentar la eficacia de Isopirazam, que comprende utilizar un adyuvante como se define en esta memoria con Isopirazam. El método puede comprender incluir Isopirazam y el adyuvante en la misma composición. La composición puede ser un concentrado agroquímico acuoso o puede ser una composición preparada por el usuario final, v.g. por mezcla en un tanque de pulverización. Alternativamente, el método puede comprender aplicar Isopirazam y el adyuvante por separado a la diana de interés. La diana de interés será usualmente plantas, partes de las plantas, o el locus de las mismas.
- 35

- En un aspecto adicional, la invención proporciona el uso de un adyuvante como se define en esta memoria como adyuvante para Isopirazam.
- 40

En un aspecto adicional, la invención proporciona un método que comprende diluir en un tanque de pulverización la composición como se define en esta memoria.

- En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos por aplicación de Isopirazam y un adyuvante como se define en esta memoria a las plantas, partes de las plantas, o el locus de las mismas. El adyuvante e Isopirazam pueden aplicarse a la diana de interés por separado o simultáneamente, v.g. por estar presentes en la misma composición.
- 45

En un aspecto adicional, la invención proporciona un método para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos por aplicación de una composición de la invención a las plantas, partes de las plantas, o el locus de las mismas.

- 50 Preferiblemente, los microorganismos fitopatógenos son organismos fúngicos.

Se comprenderá que las cadenas alquilo y alquenilo pueden ser ramificadas o no ramificadas, y que los adyuvantes de la invención pueden derivarse de fuentes tanto naturales como sintéticas.

El Isopirazam existe como cuatro estereoisómeros como se describe en WO 06/005612 y WO 2008/113447. La invención puede practicarse utilizando cualquier ratio de los cuatro isómeros.

Todos los aspectos y características preferidas de la invención pueden combinarse entre sí, excepto donde esto sea evidentemente imposible.

5 Ejemplos

Los datos de ensayo se refieren a ensayo curativo contra Septoria tritici en el trigo. Las plantas de trigo en tiestos se inoculan de 3 a 5 días antes de la pulverización como se indica. El Isopirazam se formula como una formulación de concentrado en suspensión acuosa que contiene 250 g/l de Isopirazam. La formulación de concentrado en suspensión se diluye con agua antes de la pulverización a las concentraciones de Isopirazam que se muestran en las tablas. Cuando se incluye adyuvante, éste se usa al 0,1% p/v en la dilución de la pulverización, a no ser que se indique de otro modo. Un aditivo no adyuvante inerte se incluye en todos los tratamientos a fin de proporcionar retención de la pulverización. La aplicación de pulverización es 200 l/ha.

Se realizan tres evaluaciones por tiesto de trigo con 4 tiestos replicados totalmente aleatorizados. Los tres tiestos de réplica se evalúan visualmente y se les asigna una puntuación de gravedad de la enfermedad. La eficacia porcentual corresponde a la reducción en gravedad media de la enfermedad en los tiestos tratados, comparada con los tiestos sin tratar como porcentaje de la gravedad media de la enfermedad de los tiestos sin tratar. Los resultados se muestran en las Tablas 2 a 7 siguientes. Cada tabla representa un experimento paralelo.

Tabla 1

Adyuvante	Descripción
1	Oleil, 20 EO, protegido en el extremo con butilo
2	Ricinoleato etoxilato 20 EO
3	Ricinoleato etoxilato 3 EO
4	Monooleato de glicerilo 5 EO
5	Monooleato de glicerilo 10 EO
7	Trioleato de sorbitán 20 EO (Tween 85™)
7	Oleato de metilo (éster metílico no etoxilado de ácido oleico)
8	Etoxilato de alcohol alquílico C16-17, 20 EO
9	Alcohol oleílico 25 EO (Genapol 250™)
10	Etoxilato de alcohol oleílico alquílico C18-20, 20 EO
11	Oleil 10 EO (Brij 96™)
12	Isotridecanol 5 EO (Marlosol TA3050™)
13	Isotridecanol 9 EO (Marlosol TA3090™)

20 EO = unidad de etoxilato, el número de unidades de etoxilato indicado es un valor medio (moda) en cada caso.

Tabla 2

El tratamiento se realizó 4 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 18 días después de la inoculación.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	41

ES 2 543 431 T3

-	30	47
-	10	36
-	3	32
1	100	98
1	30	84
1	10	84
1	3	54
2	100	56
2	30	52
2	10	0,48
2	3	23
3	100	86
3	30	47
3	10	55
3	3	29

Tabla 3

El tratamiento se realizó 4 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 17 días después de la inoculación.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	8,9
-	30	10
-	10	-0,53
-	3	17,9
1	100	90
1	30	74
1	10	50
1	3	27

ES 2 543 431 T3

4	100	68
4	30	50
4	10	31
4	3	16
5	100	50
5	30	41
5	10	15
5	3	13
6	100	58
6	30	42
6	10	32
6	3	8,4

Tabla 4

El tratamiento se realizó 4 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 18 días después de la inoculación.

- 5 Los adyuvantes 7 y 8 se utilizaron al 0,2% p/v en la dilución de pulverización.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	25
-	30	29
-	10	39
-	3	41
1	100	96
1	30	85
1	10	77
1	3	57
7	100	98
7	30	66
7	10	21

ES 2 543 431 T3

7	3	21
8	100	86
8	30	78
8	10	32
8	3	21

Tabla 5

El tratamiento se realizó 3 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 19 días después de la inoculación.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	0,59
-	30	14
-	10	9,4
-	3	8,8
1	100	96
1	30	90
1	10	72
1	3	25
9	100	75
9	30	59
9	10	31
9	3	22
10	100	91
10	30	81
10	10	53
10	3	6,5

ES 2 543 431 T3

Tabla 6

El tratamiento se realizó 4 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 17 días después de la inoculación.

El adyuvante 7 se utilizó al 0,2% p/v en la dilución de pulverización.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	14
-	30	19
-	10	6,8
-	3	9,1
1	100	98
1	30	87
1	10	60
1	3	39
7	100	95
7	30	95
7	10	44
7	3	25
11	100	97
11	30	94
11	10	38
11	3	6,8

5

Tabla 7

El tratamiento se realizó 4 días después de la inoculación, y la evaluación se efectuó 18 días después de la inoculación.

Adyuvante	Concentración de Isopirazam (mg por litro)	% Eficacia
-	100	32
-	30	-18
-	10	15

ES 2 543 431 T3

-	3	5,1
1	100	99
1	30	89
1	10	47
1	3	53
12	100	71
12	30	12
12	10	2,2
12	3	-19
13	100	95
13	30	75
13	10	35
13	3	23

Los resultados muestran que la eficacia de Isopirazam es superior cuando se combina con adyuvantes alcoxlados protegidos terminalmente. (En los compuestos de fórmula I, el grupo R³ representa una "protección en el extremo" para el hidroxilo terminal del grupo [-R²O-]_q-H.)

REIVINDICACIONES

1. Una composición que comprende:

a) un adyuvante, adyuvante que es un ácido graso alcoxlado o un alcohol graso alcoxlado, adyuvante que tiene la fórmula I:



en la cual

Z es O;

R¹ es alquilo C₈-C₂₀ o alquenilo C₈-C₂₀;

cada R² es independientemente alquilo C₂-C₄;

10 R³ es alquilo C₁-C₈;

p es 0 ó 1; y

q es 2 a 40; y

b) Isopirazam.

15 2. Una composición conforme a la reivindicación 1, en la cual la composición es un concentrado agroquímico acuoso.

3. Una composición conforme a la reivindicación 2, en la cual la composición es un concentrado en suspensión.

4. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la cual R³ es butilo.

5. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en la cual: Z es O, R¹ es alquilo C₈-C₂₀ o alquenilo C₈-C₂₀; R² es etilo; R³ es alquilo C₁-C₈; p es 0; y q es 2 a 40.

20 6. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en la cual Z es O, R¹ es alquilo C₁₆-C₂₀ o alquenilo C₁₆-C₂₀; R² es etilo; R³ es butilo; p es 0; y q es 5 a 30.

7. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en la cual Z es O, R¹ es alquilo C₁₆-C₂₀ o alquenilo C₁₆-C₂₀; R² es etilo; R³ es butilo; p es 0; y q tiene un valor medio de 18-22.

25 8. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en la cual la concentración de adyuvante en la composición es al menos 100 g/l.

9. Una composición conforme a una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en la cual la concentración de adyuvante en la composición es al menos 180 g/l.

10. Un método para aumentar la eficacia de Isopirazam, que comprende utilizar un adyuvante como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 como adyuvante con Isopirazam.

30 11. Uso de un adyuvante como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 como adyuvante para Isopirazam.

12. Un método para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos por aplicación de Isopirazam y un adyuvante como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 a las plantas, partes de las plantas, o el locus de las mismas.

35 13. Un método para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos por aplicación de una composición como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 a las plantas, partes de las plantas, o el locus de las mismas.