

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 560 090**

51 Int. Cl.:

A01N 63/00 (2006.01)

A01N 47/06 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01N 43/38 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.06.2007 E 07725831 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.10.2015 EP 2040553**

54 Título: **Combinaciones de principios activos con propiedades insecticidas y acaricidas**

30 Prioridad:

16.06.2006 DE 102006027731

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

17.02.2016

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**FISCHER, REINER;
HUNGENBERG, HEIKE;
NAUEN, RALF;
SCHNORBACH, HANS-JÜRGEN y
THIELERT, WOLFGANG**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 560 090 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

Combinaciones de principios activos con propiedades insecticidas y acaricidas

5 La presente invención se refiere a nuevas combinaciones de principios activos que, por una parte, están constituidas por cetoenoles cíclicos conocidos y, por otra parte, por insectos benéficos (enemigos naturales) y que son muy adecuadas para combatir parásitos animales tales como insectos y/o acáridos no deseados.

Es ya conocido que determinados cetoenoles cíclicos poseen propiedades insecticidas y acaricidas. Estas sustancias tienen una actividad buena, pero en algunos casos dejan que desear en cantidades de aplicación reducidas.

10 Se conocen con actividad herbicida, insecticida o acaricida derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona bicíclicos no sustituidos (documentos EPA-355 599 y EP-A-415 211), así como derivados monocíclicos sustituidos de 3-aril-pirrolidin-2,4-diona (documentos EP-A-377 893 y EP-A-442 077).

15 Además, se conocen derivados de 3-arilpirrolidin-2,4-diona (documento EP-A-442 073) así como derivados de ácido tetrámico por los documentos EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, WO 95/01 997, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 97/ 43 275, WO 98/05 638, WO 98/06 721, WO 98/25 928, WO 99/16 748, WO 99/24 437, WO 99/43 649, WO 99/48 869, WO 99/55 673, WO 01/09 092, WO 91/17 972, WO 01/23 354, WO 01/74 770, WO 03/013 249, WO 2004/007 448, WO 2004/024 688, WO 04/065 366, WO 04/080 962, WO 04/111 042, WO 05/044 791, WO 05/044 796, WO 05/048 710, WO 05/049 596, WO 05/066 125, WO 05/092 897, WO 06/000 355, WO 06/029799, WO 06/056281, WO 06/056282, WO 06/089633 y DE-A-05 05 1325.

20 Además, ya se sabe que numerosos insectos benéficos se usan para combatir insectos y tetraníquidos "Knowing and recognizing; M.H. Malais, W.J. Ravensberg, publicado por Koppert B.V., Reed Business Information (2003)". Además, el uso de insectos benéficos solo no es siempre satisfactorio.

El uso de espiroclifeno en la denominada protección de plantas integrada se describe en Pflanzenschutznachrichten Bayer, Volumen 55, N° 2-3, 2002, páginas 211-236.

25 En Pflanzenschutznachrichten Bayer, Volumen 55, N° 2-3, 2002, páginas 255-266, se describe el uso de espiroclifeno con *Rodolia cardinalis* y los ácaros mesostigmata *Euseius stipulatus* y *Amblyseius californicus*.

En Pflanzenschutznachrichten Bayer, Volumen 58, N° 3, 2005, páginas 441-468, se describe el uso de espiromesifeno con *Encarsia formosa*, *Aphidius rhopalosiphi*, *Coccinella* spp., *Macrolophus caliginosus*, *Nesidiocoris tenuis*, *Orius* spp. y *Phytoseiulus* spp..

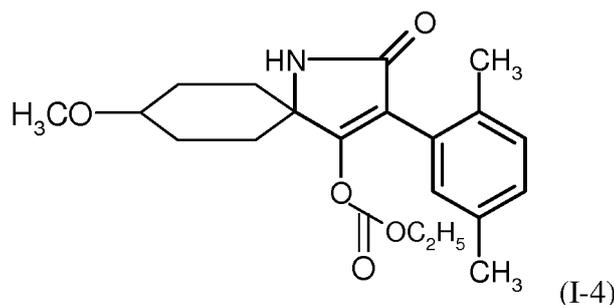
30 El uso de espiroclifeno en combinación con los ácaros mesostigmata *Typhlodromus pyri* o *Zetzellia mali* se describe en Pest Management Science, Volumen 59, 203, páginas 1321-1332.

J. Biol. Control, Volumen 20, N° 2, 2006, páginas 141-146, divulga el uso de espiromesifeno en combinación con insectos benéficos *Cyrtorhinus lividipennis*, *Tytthus parviceps* y *Microvelia douglassi*.

35 Horticultural Sciences, (01/06/2006), páginas 707-710, divulga que el espiromesifeno es compatible con *Neoseiulus californicus*, pero muestra toxicidad frente a *Phytoseiulus persimilis*.

Experimental and Applied Acarology, Kluwer Academic Publishers, DO, Volumen 38, N° 4, (01/04/2006), páginas 299-305, divulga la combinación de espiromesifeno con el insecto benéfico *Galendromus occidentalis*.

Se ha descubierto ahora que compuestos de la fórmula (I-4)



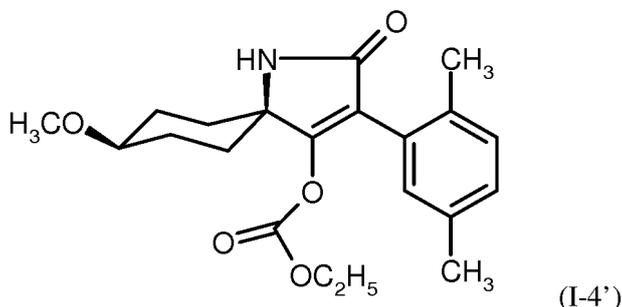
40 en combinación con insectos benéficos de la familia de los míridos (*Miridae*) poseen propiedades insecticidas y/o acaricidas muy buenas.

Sorprendentemente, el efecto insecticida y/o acaricida de las combinaciones de principio activo-insecto benéfico según la invención es mejor que los efectos del principio activo individual y de los insectos benéficos solos. Existe un aumento de la actividad no predecible.

- 5 Además, se ha encontrado que se pueden sustituir aplicaciones de principios activos desfavorables desde un punto de vista toxicológico y/o ecológico por las combinaciones de principio activo-insecto benéfico según la invención manteniendo un efecto comparable, lo que favorece sobre todo la seguridad del usuario y/o del medio ambiente. Además, se ha hallado que se pueden ahorrar series de pulverización.

Las combinaciones de principio activo-insecto benéfico según la invención contienen además de al menos un principio activo de la fórmula (I-4) al menos un insecto benéfico de la familia de los míridos (Miridae).

- 10 Son importantes combinaciones con insectos benéficos de la familia de los míridos (Miridae) y del isómero cis de la fórmula (I-4')



Además, las combinaciones de principio activo-insectos benéficos pueden contener también otros componentes de mezcla con actividad fungicida, acaricida o insecticida.

- 15 Los compuestos de la fórmula (I-4) son compuestos conocidos, cuya preparación se describe en patentes/solicitudes de patente (véanse, sobre todo, los documentos WO 97/01 535, WO 97/36 868, WO 98/05 638, WO 04/007 448).

- 20 Se pueden usar preferentemente insectos benéficos de la familia de los míridos en cultivos anuales tales como, por ejemplo hortalizas, melones, plantas ornamentales, maíz, pero también en plantas plurianuales tales como, por ejemplo, cítricos, frutas de pepita y de hueso, especias, coníferas y otras plantas ornamentales, así como en bosques cultivados.

Los cultivos descritos solo de manera general se diferencian y se especifican en detalle a continuación. Así, respecto a la aplicación, se entiende por hortalizas, por ejemplo, hortalizas de fruto e inflorescencias como hortalizas, por ejemplo, pimientos, pimientos picantes, tomates, berenjenas, pepinos, calabazas, calabacines, habas, judías verdes, judías enanas, guisantes, alcachofas;

- 25 pero también hortalizas de hoja, por ejemplo, lechuga, achicoria, endivias, berros, rúcula, valeriana, lechuga iceberg, puerro, espinaca, acelga;

además, hortalizas tuberosas, de raíz y tallo, por ejemplo, apio, remolacha de mesa, zanahorias, rabanitos, rábano picante, salsifís negros, espárrago, nabos, brotes de palmito, brotes de bambú, además hortalizas de bulbo, por ejemplo, cebollas, puerro, hinojo, ajo;

- 30 además hortalizas del género Brassica, tales como coliflor, brécol, colinabo, col lombarda, repollo, col verde, col rizada, col de Bruselas, col china.

Respecto a la aplicación, se entiende por cítricos cultivos plurianuales tales como, por ejemplo, naranjas, pomelos, mandarinas, limones, limas, naranjas amargas, kumquats, satsumas;

- 35 pero también frutos de pepita tales como, por ejemplo, manzanas, peras y membrillos y frutos de hueso tales como, por ejemplo, melocotones, nectarinas, cerezas, ciruelas, ciruelas damascenas, albaricoques; además vides, lúpulo, aceitunas, té y cultivos tropicales tales como, por ejemplo, mangos, papayas, higos, ananás, dátiles, plátanos, durianes (frutas apestosas), caquis, cocos, cacao, café, aguacates, lichis, maracuyas, guayabas, demás almendras y frutos de cáscara tales como, por ejemplo, avellanas, nueces, pistachos, marañones, nueces del Brasil, nueces pecana, nueces blancas, castañas, nueces americanas, nueces de macadamia, cacahuetes,

- 40 además también bayas tales como, por ejemplo, grosellas rojas, grosellas espinosas, frambuesas, moras, mirtilos, fresas, arándanos rojos, kiwis, arándanos americanos.

Respecto a la aplicación, se entiende por plantas ornamentales plantas anuales y plurianuales, por ejemplo, flores

cortadas tales como, por ejemplo, rosas, claveles, gerberas, lirios, margaritas, crisantemos, tulipanes, narcisos, anémonas, amapola, belladonas, dalias, azaleas, malvas,

pero también, por ejemplo, plantas de arriate, plantas de maceta y arbustos tales como, por ejemplo, rosas, damasquinas, pensamientos, geranios, fucsias, hibiscos, crisantemos, balsaminias, ciclámenes, violetas africanas, girasoles, begonias, además, por ejemplo, matorrales y coníferas tales como, por ejemplo, ficus, rododendros, píceas, abetos, pinos, tejos, enebros, pinos albares, adelfas.

Respecto a la aplicación, se entiende por especias plantas monoanuales o plurianuales tales como por ejemplo anís, chile, pimentón, pimienta, vainilla, mayorana, tomillo, clavo, enebros, canela, estragón, cilantro, azafrán, jengibre.

Son preferentes de la familia de los míridos (Miridae): *Atractotomus* spp., por ejemplo *Atractotomus mali*, *Blepharidopterus* spp., por ejemplo *Blepharidopterus angulatus*, *Camylomma* spp., por ejemplo *Camylomma verbasci*, *Deraeocoris* spp., *Macrolophus* spp., por ejemplo *Macrolophus caliginosus*, en cultivos tales como, por ejemplo, frutas de pepita, frutas de hueso, hortalizas, plantas ornamentales, coníferas y especias.

Las combinaciones de principio activo-insectos benéficos según la invención son adecuadas para combatir parásitos animales, preferentemente artrópodos y nematodos, particularmente insectos y/o tetraníquidos, en viticultura y en el cultivo de frutas, en agricultura y jardinería y en silvicultura. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o cada uno de los diversos estadios de desarrollo. Los parásitos mencionados anteriormente incluyen:

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigereilla immaculata*.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*. Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*. Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp.

Del orden de los fitápteros, por ejemplo, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp.

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,

ES 2 560 090 T3

Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

5 Del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp.

10 De la clase de los arácnidos, por ejemplo, Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp.

15 Los nematodos parásitos de plantas incluyen, por ejemplo, Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp.

20 Las combinaciones de principios activos pueden convertirse en las formulaciones habituales tales como soluciones, emulsiones, polvos humectables, suspensiones, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, gránulos, concentrados de suspensión-emulsión, materiales naturales y sintéticos impregnados con principios activos, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo mezclando los principios activos con diluyentes, es decir disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma.

25 En caso de usar agua como diluyente también es posible usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Como disolventes líquidos se consideran, esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceites minerales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes muy polares, tales como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua.

30 Como vehículos sólidos se consideran:

35 por ejemplo, sales de amonio y minerales naturales en polvo tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorilonita o tierra de diatomeas y minerales sintéticos en polvo, tales como ácido silícico muy disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para gránulos se consideran: por ejemplo, minerales naturales quebrados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y varas de tabaco; como emulsionantes y/o agentes espumantes se consideran: por ejemplo emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres polioxietilénicos de ácidos grasos, éteres polioxietilénicos de alcoholes grasos, por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, sulfonato de alquilo, sulfato de alquilo, sulfonato de arilo, así como hidrolizados de proteína; como dispersantes se consideran: por ejemplo, lejías sulfúricas de lignina de desecho y metilcelulosa.

40 En las formulaciones pueden usarse agentes de adherencia tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo) así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos posibles son aceites minerales y vegetales.

45 Pueden usarse colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica, y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

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

Las combinaciones de principios activos según la invención pueden presentarse en sus formulaciones comerciales y en las formas de aplicación preparadas a partir de dichas formulaciones en mezcla con otros principios activos como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas. Entre los insecticidas se incluyen, entre otras sustancias, por ejemplo, ésteres de ácido

fosfórico, carbamatos, ésteres de ácidos carboxílicos, hidrocarburos clorados, fenilureas, sustancias producidas por microorganismos.

También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos, tales como herbicidas o con fertilizantes y reguladores del crecimiento.

5 Las combinaciones de principios activos según la invención, en caso de usarlas como insecticidas, pueden presentarse además en mezcla con agentes sinérgicos en sus formulaciones comerciales y en las formas de aplicación preparadas a partir de dichas formulaciones. Los agentes sinérgicos son compuestos a través de los cuales se potencia la actividad de los principios activos, sin que el agente sinérgico añadido deba ser activo por sí mismo.

10 El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones comerciales habituales puede variar dentro de unos intervalos amplios. La concentración de principios activos en las formas de aplicación puede variar del 0,0000001 al 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,0001 y el 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de un modo habitual adaptado a las formas de aplicación.

15 Los principios activos pueden usarse como tales, en forma de concentrados o de las formulaciones habituales, tales como polvos, gránulos, soluciones, suspensiones, emulsiones o pastas.

La formulación mencionada puede prepararse de un modo conocido de por sí, por ejemplo mezclando los principios activos con al menos un disolvente o diluyente, un emulsionante, un agente dispersante y/o de unión o fijador, un repelente de agua, dado el caso secantes y estabilizadores UV y dado el caso colorantes y pigmentos, así como otros coadyuvantes de procesamiento.

20 De acuerdo con la invención se pueden tratar todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entiende, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos de biotecnología e ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden estar o no protegidas por los derechos de obtentor. Por partes de plantas se entienden todas las partes y órganos de las plantas subterráneos y aéreos, tales como brote, hoja, flor y raíz, enumerando a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, bulbos y rizomas. A las partes de las plantas, pertenecen también los productos cosechados, así como el material reproductivo vegetativo y generativo, por ejemplo, plantones, bulbos, rizomas, esquejes y semillas.

25 El tratamiento según la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, atomización, evaporación, nebulización, dispersión, aplicación con brocha y en el caso de material de reproducción, especialmente en el caso de semillas, además mediante recubrimiento con una o más capas.

30 Como ya se ha mencionado anteriormente, se pueden tratar según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se pueden tratar especies y variedades de plantas de origen natural u obtenidas mediante procedimientos convencionales de cultivo biológico, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética eventualmente en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. Los términos y expresiones "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se han explicado anteriormente.

De modo particularmente preferente, se tratan plantas según la invención de las variedades de plantas comerciales o que se encuentran en uso, respectivamente.

45 Según la especie de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") con el tratamiento según la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un refuerzo del efecto de las sustancias y agentes que pueden usarse según la invención, mejor crecimiento de plantas, tolerancia elevada frente a altas o bajas temperaturas, tolerancia elevada frente a sequedad o frente al contenido de sal del agua o el suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados que superan los efectos que realmente se esperan.

55 A las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas por ingeniería genética) que se tratan preferentemente según la invención pertenecen todas las plantas que, mediante la modificación por ingeniería genética, han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente

5 ventajas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades: mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas pueden mencionarse las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzana, pera, frutos cítricos y uvas viníferas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destaca especialmente la defensa aumentada de las plantas contra insectos por medio de toxinas generadas en las plantas, particularmente las que se producen en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF1, así como sus combinaciones) generadas en las plantas (en adelante "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), se destaca especialmente, también, el aumento de la tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glufosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades deseadas respectivas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se pueden mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (cultivadas convencionalmente con tolerancia a herbicida), se pueden mencionar también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo maíz). Naturalmente, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").

30 Las plantas mencionadas pueden tratarse de modo particularmente ventajoso con las combinaciones de principio activo-insectos benéficos según la invención. Los intervalos de preferencia indicados anteriormente para las combinaciones tienen también validez para el tratamiento de estas plantas. Se destaca particularmente el tratamiento de plantas con las combinaciones de principio activo-insectos benéficos mencionadas especialmente en el presente texto.

35 La buena actividad insecticida y acaricida de las combinaciones de principio activo-insectos benéficos según la invención se desprende de los ejemplos siguientes. Mientras que los principios activos por separado presentan debilidad en el efecto, las combinaciones de principio activo-insectos benéficos muestran un efecto que supera el efecto del principio activo solo.

Fórmula de cálculo para el grado de letalidad de una combinación de dos principios activos

40 El efecto que puede esperarse para una combinación dada de dos principios activos puede calcularse como sigue (véase S. R. Colby, "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", Weeds 15, páginas 20-22, 1967):

Si

45 X significa el grado de letalidad, expresado en % del control sin tratar, al usar el principio activo A en una cantidad de aplicación de m ppm o g/ha.

Y significa el grado de letalidad, expresado en % del control sin tratar, al usar el principio activo B en una cantidad de aplicación de n ppm o g/ha.

E significa el grado de letalidad, expresado en % del control sin tratar, al usar las sustancias activas A y B en cantidades de aplicación de m y n ppm o g/ha, entonces

$$E = X + Y - \frac{X \times Y}{100}$$

50 En caso de que el grado de letalidad insecticida real sea mayor que el calculado, la combinación es superaditiva en sus efectos destructores, es decir, existe un efecto sinérgico. En este caso, el grado de letalidad real observada debe ser mayor que el valor del grado de letalidad esperado calculado a partir de la fórmula anteriormente indicada

(E).

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo de Bemisia tabaci

- 5 Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para elaborar una preparación adecuada de principio activo se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades mencionadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 10 Se tratan hojas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están infectadas con moscas blancas (*Hemisia tabaci*) mediante pulverización con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

Después del tiempo deseado se añaden los míridos (*Macrolophus caliginosus*) en una cantidad definida.

- 15 Tras el periodo deseado se determina el grado de letalidad del parásito en %. A este respecto, el 100 % significa que todas las moscas blancas han sido destruidas; el 0 % que no se ha destruido ninguna mosca blanca. Los valores del grado de letalidad determinados se calculan según la fórmula de Colby.

En este ensayo, la siguiente combinación de principio activo-redúvidos según la presente solicitud muestra una actividad sinérgica reforzada en comparación con los componentes usados individualmente:

Tabla A

Insectos perjudiciales para las plantas

Ensayo de Hemisia tabaci

| Principio activo | Concentración en ppm o número de animales | Letalidad en % después de 14 ^d | |
|---|---|---|----------------|
| Ejemplo 1-4' | 0,16 | 0 | |
| Macrolophus caliginosus | 5 | 18,2 | |
| Ejemplo 1-4' + Macrolophus caliginosus | 0,16 + 5 animales | hall.* | calc.** |
| | | 72,7 | 18,2 |

*hall.= efecto hallado

** calc. = efecto calculado según la fórmula de Colby

- 20 **Ejemplo B (ejemplo comparativo)**

Ensayo de Myzus persicae

- Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 25 Para elaborar una preparación adecuada de principio activo se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades mencionadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) que estaban infestadas por el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) mediante pulverización con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

- 30 Las larvas de coccinélidos (*Coccinella septempunctata*) se añaden después del periodo deseado en una cantidad definida.

Tras el periodo deseado se determina el grado de letalidad del parásito en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los pulgones han sido exterminados; el 0 % que no se ha destruido ningún pulgón. Los valores del grado de letalidad determinados se calculan según la fórmula de Colby.

5 En este ensayo, la siguiente combinación de principio activo-insecto benéfico según la presente solicitud muestra una actividad sinérgica reforzada en comparación con los componentes usados individualmente:

Tabla B

Insectos perjudiciales para las plantas

Ensayo de Myzus persicae

| Principio activo | Concentración en ppm o número de animales | Letalidad en % después de 7 ^d | |
|---|---|--|----------------|
| Ejemplo 1-4' | 4 | 10 | |
| Coccinella septempunctata | 1 | 10 | |
| Ejemplo 1-4' + Coccinella septempunctata | 4 + 1 animal | hall.* | calc.** |
| | | 70 | 19 |

*hall.= efecto hallado

** calc. = efecto calculado según la fórmula de Colby

Ejemplo C (ejemplo comparativo)

10 Se tratan en cada caso tres manzanos de aproximadamente 25 años de edad (aproximadamente 2 m de altura de copa) de la variedad "Elan" en 3 replicaciones contra el pulgón lanífero del manzano, Eriosoma lanigerum. A este respecto, se prueba el principio activo (1-4') (150 OD) y el patrón comercial clotianidina (WG 50) en las cantidades de aplicación indicadas en presencia de la avispa parásita del pulgón lanífero (insecto benéfico) Aphelinus mali de forma comparativa. La aplicación se realiza con un aparato de atomización (atomizador) con una cantidad de aplicación de agua de 500 l/ha. Se llevan a cabo tanto solo una como también dos aplicaciones con un intervalo de 15 34 días.

La valoración se realiza los días 7, 30, 44, 52, 59, 66 y 73 después del primer tratamiento, valorando la eliminación de los parásitos adultos y en número de parásitos parasitados en cada una de 10 colonias según Abbott. A este respecto, el principio activo (1-4') después de solo un tratamiento se compara con el patrón después de dos tratamientos, dado que el principio activo (1-4') después de dos tratamientos muestra el 100 % de efecto y, por lo tanto, no había presencia de ningún alimento (presa) para el insecto benéfico.

20

| Cantidad de aplicación g/ha/m de altura de copa | Efecto (% según Abbott) | | | | | | |
|---|-------------------------|------|------|------|------|------|------|
| | Eriosoma lanigerum | | | | | | |
| | 7 d | 30 d | 44 d | 52 d | 59 d | 66 d | 73 d |
| Clotianidina 37,5 | 71 | 76 | 85 | 81,8 | 81,8 | 80 | 80 |
| (1-4') 75 | 48 | 95 | 99 | 99,4 | 98,2 | 98 | 98 |
| Agua de control | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

| Cantidad de aplicación g/ha/m de altura de copa | Parasitación por insectos benéficos (%) | | | | | | |
|---|---|------|------|------|------|------|------|
| | Aphelinus mali | | | | | | |
| | 7d | 30 d | 44 d | 52 d | 59 d | 66 d | 73 d |
| Clotianidina 37,5 | 0 | 0 | 0 | 1 | 10 | 24 | 50 |
| (I-4') 75 | 0 | 0 | 0 | - | 35 | 54 | 90 |
| Agua de control | 0 | 0 | 1 | 3 | 51 | 75 | 97 |

5 Se tratan perales de aproximadamente 3 m de altura de la variedad "Conferencia" en 4 replicaciones frente a la psila del peral, *Psylla piri*. A este respecto se usa el principio activo (1-4') (100 OD) y el patrón comercial amitraz (UL 400) en las cantidades de aplicación indicadas. La aplicación se realiza con un aparato de pulverización de mochila, dispersándose 1000 l/ha de agua. El insecto benéfico *Anthocoris nemoralis* interviene 14 días después del tratamiento.

La valoración se realiza 4, 8 y 14 días después del tratamiento, valorándose la eliminación de las ninfas L-1 y de las ninfas L-4 en las ramas.

| Cantidad de aplicación g/ha/m de altura de copa | Efecto (% según Abbott) | | | | | | Número de <i>Anthocoris nemoralis</i> | | |
|---|-------------------------|------|------|------|------|------|---------------------------------------|----|-----|
| | <i>Psylla piri</i> | | | | | | 4d | 8d | 14d |
| | L-1 | L-4 | L-1 | L-4 | L-1 | L-4 | | | |
| | 4 d | 4 d | 8 d | 8 d | 14 d | 14 d | | | |
| Amitraz 400 | 23,6 | 0,0 | 41,0 | 44,6 | 41,8 | 44,4 | | | 5 |
| (I-4') 75 | 62,7 | 91,4 | 69,5 | 98,4 | 76,6 | 99,3 | | | 12 |
| Control | | | | | | | 0 | 0 | 15 |

10 **Ejemplo D (Ejemplo comparativo)**

Ensayo de concentraciones límite/ tratamiento de insectos del suelo de plantas transgénicas

Insecto de ensayo: **Diabrotica balteata - Larvas en el suelo**

Disolvente: 7 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

15 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente, se añade la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

20 La preparación de principios activos se vierte sobre el suelo. A este respecto, la concentración del principio activo no tiene prácticamente ningún papel en la preparación, es determinante solo la cantidad en peso de principio activo por unidad de volumen de suelo, que se indica en ppm (mg/l). Se rellenan macetas de 0,25 l con el suelo y se dejan en reposo a 20 °C.

25 Inmediatamente después de la preparación se disponen en cada maceta 5 granos de maíz pregerminados de la variedad YIELD GUARD (marca comercial de Monsanto Comp., Estados Unidos). Después de 2 días se disponen en el suelo tratado los insectos de ensayo correspondientes. Después de otros 7 días se determina el grado de actividad del principio activo contando las plantas de maíz emergentes (1 planta = 20 % de actividad).

Ejemplo E (Ejemplo comparativo)

Ensayo de *Heliothis virescens* – tratamiento de plantas transgénicas

Disolvente: 7 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

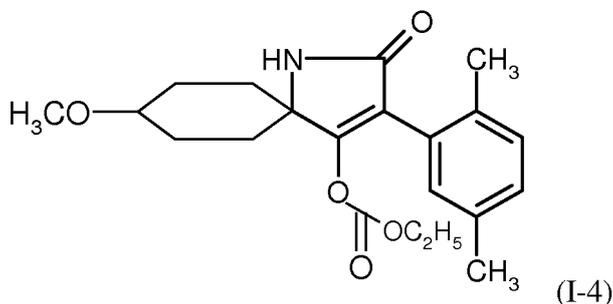
- 5 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y la cantidad indicada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

- 10 Se tratan brotes de soja (*Glycine max*) de la variedad Roundup Ready (marca comercial de Monsanto Comp. Estados Unidos) mediante inmersión en la preparación de principios activos a la concentración deseada y se infestan con orugas del brote de tabaco (*Heliothis virescens*) mientras las hojas están todavía húmedas.

Tras el periodo deseado se determina la eliminación de los insectos.

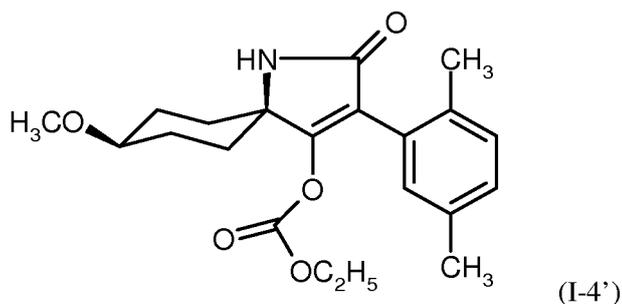
REIVINDICACIONES

1. Uso del compuesto de la fórmula (I-4)



en combinación con insectos benéficos de la familia de los miridos (Miridae) para combatir parásitos animales.

5 2. Uso según la reivindicación 1, teniendo el compuesto la estructura siguiente



3. Uso según las reivindicaciones 1 o 2 en combinación con *Macrolophus caliginosus*.

10 4. Procedimiento para combatir parásitos animales, caracterizado porque el compuesto de la fórmula (I-4) según la reivindicación 1 o el compuesto de la fórmula (I-4') según la reivindicación 2 e insectos benéficos tal como se definen en la reivindicación 1 se dejan actuar sobre parásitos animales y/o su hábitat.

5. Procedimiento para la reducción de series de pulverización (número de aplicaciones por temporada) mediante el uso del compuesto de la fórmula (I-4) según la reivindicación 1 o del compuesto de la fórmula (I-4') según la reivindicación 2 e insectos benéficos según la reivindicación 1.

15 6. Procedimiento para reducir los residuos totales de insecticidas y/o de acaricidas en el producto cosechado y en el medio ambiente mediante el uso del compuesto de la fórmula (I-4) según la reivindicación 1 o del compuesto de la fórmula (I-4') según la reivindicación 2 e insectos benéficos según la reivindicación 1.