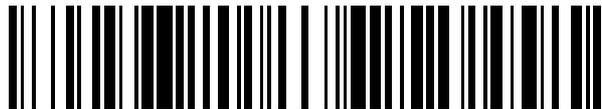


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 563 754**

51 Int. Cl.:

A01N 25/04 (2006.01)

A01N 25/30 (2006.01)

A01N 57/10 (2006.01)

A01N 57/14 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.05.2010 E 10786567 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.02.2016 EP 2440060**

54 Título: **Composición fungicida que comprende tolclofos-metilo**

30 Prioridad:

08.06.2009 US 184983 P

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

16.03.2016

73 Titular/es:

**SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
27-1, Shinkawa 2-chome Chuo-ku
Tokyo 104-8260, JP**

72 Inventor/es:

**TSUDA, NAOKI y
SEITZ, MICHAEL E.**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 563 754 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Composición fungicida que comprende tolclofos-metilo

5 Campo de la invención

La presente invención se refiere a una composición fungicida que comprende tolclofos-metilo como principio activo.

Técnicas anteriores

10 Tolclofos-metilo es un compuesto fungicida y se conoce en The Pesticide Manual 13ª Edición, p. 979-980 publicado por British Crop Protection Council.

15 Las formulaciones de suspensión acuosa que contienen tolclofos-metilo se proporcionan en el mercado y se aplican a cultivos (véase el documento EP-A 0 145 141).

Para la aplicación de tratamientos de semillas de tolclofos-metilo, las formulaciones anteriores no son satisfactorias con estabilidad, debido a que las partículas sólidas se aglomeran en la formulación durante el almacenamiento.

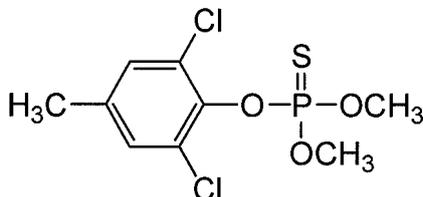
20 Sumario de la invención

La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende tolclofos-metilo como principio activo, específicamente, una composición fungicida que comprende tolclofos-metilo, fosfato de polioxietilen poliarilfenol, copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno, éter de alcohol graso de polioxietileno y agua.

25 De acuerdo con la presente invención, la composición fungicida puede proporcionar una suspensión estable.

Descripción detallada de la invención

30 En la presente invención, tolclofos-metilo es un ingrediente fungicida, y el nombre químico es O-2,6-dicloro-p-tolil O,O-dimetil fosforotioato de fórmula:



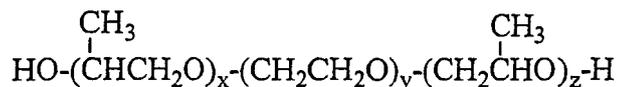
35 Se puede obtener en el mercado, y se proporciona, por ejemplo, por parte de Sumitomo Chemical Company, Limited.

El contenido de tolclofos-metilo en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 30 % a un 70 % en peso, preferentemente de un 40 % a un 55 % en peso.

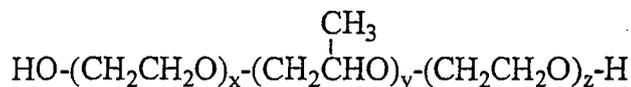
40 El fosfato de polioxietilen poliarilfenol es un tensioactivo aniónico que es una sal de ácido de éster de fosfato de poliarilfenol polioxietilenado. Los ejemplos normales incluyen sales de fosfato de polioxietilen triestirilfenol. Los ejemplos normales de la sal son sales de calcio, sodio, potasio, amonio y trietanolamina. Entre ellos, se usan preferentemente fosfato de polioxietilen triestiril fenol de potasio y fosfato de polioxietilen triestiril fenol de trietanolamina. Estos tensioactivos aniónicos se encuentran disponibles comercialmente en Stepan Company of Northfield, Illinois, con el nombre comercial de "Stepac TSP"; y en Rhodia Incorporated of Cranbury, Nueva Jersey, con el nombre comercial de "Soprophor".

50 El contenido de fosfato de polioxietilen poliarilfenol en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,3 a un 5 % en peso, preferentemente de un 1 % a un 5 % en peso, más preferentemente de un 1 a un 3 % en peso. Todos los números en porcentaje en peso se calculan sobre una base de un 100 %, a menos que se indique lo contrario.

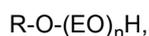
55 El copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno también se denomina copolímero de bloques de óxido de etileno (EO) y óxido de propileno (PO) y se conoce bien como tensioactivo no iónico. Los ejemplos de copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno son $(PO)_x-(EO)_y$, $(EO)_x-(PO)_y$, $(PO)_x-(EO)_y-(PO)_z$ y $(EO)_x-(PO)_y-(EO)_z$. Entre ellos, se usa preferentemente $(PO)_x-(EO)_y-(PO)_z$, concretamente



y (EO)_x-(PO)_y-(EO)_z, concretamente



- 5 El peso molecular medio del copolímero de bloques de óxido de etileno y óxido de propileno está generalmente dentro del intervalo de 1000 a 20000. Los copolímeros de bloques están comercialmente disponibles en BASF Corporation de Florham Park, Nueva Jersey, con el nombre comercial de "Pluronic"; y en Stepan Company con el nombre comercial de "Step-Flow".
- 10 El contenido de copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,5 % a un 5 % en peso, preferentemente de un 1 % a un 3 % en peso, más preferentemente de un 1 % a un 2 % en peso.
- 15 El éter de alcohol graso de polioxietileno es un tensioactivo no iónico que es un alcohol graso polioxialquilado. También se conoce como éter de polioxialquilen alquilo y normalmente se proporciona por medio de la fórmula:



- 20 donde R es un alquilo superior (por ejemplo, C10-C22) que puede contener uno o más dobles enlaces carbono-carbono, en otras palabras, R puede ser alquenoilo, (EO)_n es polioxietileno y n es de 2 a 30. Se puede producir por medio de adición de óxido de etileno a un alcohol graso. Los ejemplos normales de éter de alcohol graso de polioxietileno incluyen lauril éter de polioxietileno, octil éter de polioxietileno, miristil éter de polioxietileno, estearil éter de polioxietileno y oleil éter de polioxietileno. Se prepara por medio de adición de óxido de etileno de alcohol graso, concretamente alcohol alifático C10-C22.

25 El contenido de éter de alcohol graso de polioxietileno en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,1 a un 3 % en peso, preferentemente de un 0,3 % a un 1,5 % en peso.

- 30 La composición fungicida comprende opcionalmente poli(alcohol vinílico). Cuando se usa poli(alcohol vinílico), el contenido de poli(alcohol vinílico) en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,5 % a un 3 % en peso, preferentemente de un 1 % a un 2 % en peso. Un ejemplo normal de PVA útil en la presente invención es Celvol 203, un producto de Celanese Corporation de Dallas, Texas. El material también se encuentra disponible como solución al 24 % en agua, denominada Celvol 24-203.

- 35 Además, la composición fungicida comprende opcionalmente sustancias auxiliares para la formulación, tales como un espesante, agente anti-congelación, agente anti-espumante, conservante, agente colorante y similares.

- 40 Los ejemplos de agente espesante incluyen goma xantán, goma de algarrobo, silicato de aluminio y magnesio, carboximetilcelulosa y bentonita. Cuando la composición fungicida comprende el espesante, el contenido del espesante en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,07 % a un 1 % en peso. La composición fungicida de la presente invención preferentemente comprende de un 0,07 % a un 0,24 % en peso de goma xantán y de un 0,12 % a un 0,4 % en peso de silicato de aluminio y magnesio.

- 45 Los ejemplos de agente anti-congelación incluyen etilen glicol, propilen glicol y glicerina. Cuando la composición fungicida comprende el agente anti-congelación, el contenido de agente anti-congelación en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 2 % a un 10 % en peso. La composición fungicida de la presente invención preferentemente comprende de un 3 % a un 8 % en peso de propilen glicol.

- 50 Los ejemplos normales de agente anti-espumante son emulsiones de silicona y dioles acetilénicos. Cuando la composición fungicida comprende el agente anti-espumante, el contenido de agente anti-espumante en la composición fungicida de la presente invención generalmente es de un 0,01 % a un 0,5 % en peso, basado en el producto anti-espumante comercial, tal y como viene suministrado por el fabricante.

- 55 Los ejemplos de conservantes incluyen conservantes de isotiazolona y conservantes de bencimidazol. Cuando la composición fungicida comprende el conservante, el contenido de conservante en la composición fungicida de la presente invención generalmente es de un 0,01 % a un 0,5 % en peso, basado en el producto de conservante comercial, tal y como viene suministrado por el fabricante.

Con frecuencia, se añaden los agentes colorantes - tal como colorantes de antraquinona, colorantes diazo y pigmentos, bien a la formulación o bien a la mezcla de aplicación final, durante el tratamiento de la semilla. Cuando la composición fungicida comprende el agente colorante, el contenido de agente colorante en la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 0,01 % a un 0,5 % en peso.

5 El contenido de agua de la composición fungicida de la presente invención es generalmente de un 25 % a un 65 % en peso, preferentemente de un 35 % a un 65 % en peso, más preferentemente de un 40 % a un 60 % en peso.

10 La composición fungicida de la presente invención se utiliza para el tratamiento de semillas. En el tratamiento de semillas, las semillas, los tubérculos, los tubérculos en forma semilla, los bulbos, los esquejes y similares se tratan con la composición fungicida. A continuación, el término "semilla" incluye un tubérculo, tubérculos en forma de semilla, bulbos, esquejes o similares así como semillas. Los ejemplos de semillas incluyen, maíz, trigo, cebada, centeno, arroz, sorgo y césped; y dicotiledóneas tales como algodón, remolacha azucarera, cacahuete, patata, girasol, soja, alfalfa, colza y otros vegetales. Además, se aplica tolclofos-metilo a las plantas transgénicas que incluyen avena; caña de azúcar; tabaco; especies vegetales solanáceas tales como berenjena, tomate, pimiento verde y pimiento; especies vegetales cucurbitáceas tales como pepino, calabaza, calabacín, sandía y melón; especies vegetales brasicáceas tales como rábano, nabo, rábano rusticano, colirábano, col de China, col, mostaza hindú, brécol y coliflor; especies vegetales compuestas tales como bardana, margarita, alcachofa y lechuga; especies vegetales liliáceas tales como ajo puerro, cebolla, ajo y espárrago; especies vegetales umbelíferas tales como zanahoria, perejil, apio y chirivía; especies vegetales quenopidiáceas tales como espinaca y acelga; especies vegetales lamináceas tales como perilla, menta y albahaca; fresa; patata dulce; ñame; taro; flores tales como petunia, manto de cielo, clavel, crisantemo y rosa; plantas de follaje; césped; árboles frutales tales como frutas con pepita (por ejemplo, manzana, pera, pera japonesa, membrillo chino y membrillo), frutas con hueso (por ejemplo, melocotón, ciruela, nectarina, albaricoque japonés, cereza y albaricoque), cítricos (por ejemplo, naranja de Satsuma, naranja, limón, lima y pomelo), frutas con cáscara (por ejemplo, castaña, nuez, avellana, almendra, pistacho, anacardo y nuez de Macadamia), bayas tales como arándano, arándano rojo, zarzamora y frambuesa; uvas; caqui; aceituna; níspero; plátano; café; palma; coco; otros árboles tales como té, mora, árboles con flor, y árboles ornamentales para vía pública (por ejemplo, fresno, abedul, cornejo, eucalipto, ginkgo, lilo, arce, roble, chopo, árbol de Judas chino, goma dulce de Formosa, plátano, zelkova japonesa, tuya japonesa, abeto, abeto hemlock, enebro de agujas, pino, abeto, tejo).

20 La aplicación se puede llevar a cabo por medio de pulverización de una composición fungicida de la presente invención sobre las semillas. Las semillas se pueden revestir con una composición fungicida sólida de la presente invención, La concentración de tolclofos-metilo en la dilución es generalmente de un 0,03 % a un 3 % de principio activo (ai) en peso. La dosificación de aplicación es generalmente de 2,0 g a 50 g (ai) por 1 kg de semillas.

Además, la composición fungicida de la presente invención se puede usar para aplicación al suelo o para aplicación foliar.

40 La dosificación de aplicación es generalmente de 0,03 g a 14 g por hectárea en la cantidad de tolclofos-metilo, aunque puede variar con los tipos de semilla objetivo, condiciones meteorológicas y similares. La dilución de la composición fungicida puede también usarse para aplicación aérea por medio de helicóptero, avión o helicóptero con radio-control. La composición fungicida puede diluirse con agua que contiene un agente de dispersión. Los ejemplos de agente de dispersión incluyen Agridex (nombre comercial de Helena Chemical Corporation), Dyanmic (nombre comercial de Helena Comercial Corporation), Induce (nombre comercial de Helena Chemical Corporation) y Silwet L-77 (fabricado por Nihon Unicar).

50 Los ejemplos de enfermedades de plantas controladas por la presente invención incluyen enfermedades provocadas por hongos fitopatógenos (en particular de las clases Ascomycetos, Deuteromicetos, Oomicetos y Basidiomicetos) tales como *Magnaporthe grisea*, *Cochliobolus miyabeanus*, *Rhizoctonia solani* y *Gibberella fujikuroi* en arroz; *Erysiphe graminis*, *Fusarium graminearum*, *F. avenacerum*, *F. culmorum*, *Microdochium nivale*, *Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*, *Typhula sp.*, *Micronectriella nivalis*, *Ustilago tritici*, *U. nuda*, *Tilletia caries*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Rhynchosporium secalis*, *Septoria tritici*, *Leptosphaeria nodorum* y *Pyrenophora teres* en trigo y cebada; *Diaporthe citri*, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium digitalum*, *P. italicum*, *Phytophthora parasitica* y *Phytophthora citrophthora* en cítricos; *Monilinia mali*, *Valsa ceratosperma*, *Podosphaera leucotricha*, *Alternaria alternata* patotipo de manzana, *Venturia inaequalis*, *Colletotrichum acutatum* y *Phytophthora cactorum* en manzana; *Venturia nashicola*, *V. pirina*, *Alternaria alternata* patotipo pera japonesa, *Gymnosporangium haraeaeum* y *Phytophthora cactorum* en pera; *Monilinia fructicola*, *Cladosporium carpophilum* y *Phomopsis sp.* en melocotón; *Elsinoe ampelina*, *Glomerella cingulata*, *Uncinula necator*, *Phakopsora ampelopsidis*, *Guignardia bidwellii* y *Plasmopara viticola* en uva; *Gloeosporium kaki*, *Cercospora kaki* y *Mycosphaerella nawae* en caqui; *Colletotrichum lagenarium*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Mycosphaerella melonis*, *Fusarium oxisporum*, *Pseudoperonospora cubensis* y *Phytophthora sp.* en especies vegetales cucurbitáceas; *Alternaria solani*, *Cladosporium fulvum* y *Phytophthora infestans* en tomate; *Phomopsis vexans* y *Erysiphe cichoracearum* en berenjena; *Alternaria japonica*, *Cercospora* *allii* y *Peronospora destructor* en ajo puerro; *Cercospora kikuchii*, *Elsinoe glycines*, *Diaporthe phaseolorum var. sojae*, *Phakopsora pachyrhizi* y *Phytophthora sojae* en soja; *Colletotrichum lindemthianum* de judía común; *Cercospora*

5 *personata*, *Cercospora arachidicola* y *Sclerotium rolfsii* en cachauete; *Erysiphe pisi* en guisante; *Alternaria solani*, *Phytophthora infestans*, *Phytophthora erythroseptica* y *Spongospora subterranean f. sp., subterranean* en patata; *Sphaerotheca humuli* y *Glomerella cingulata* en fresa; *Exobasidium reticulatum*, *Elsinoe leucospila*, *Pestalotiopsis sp.* y *Colletotrichum theae-sinensis* en té; *Alternaria longipes*, *Eryshiphe cichoracearum*, *Colletotrichum tabacum*,
 10 *Peronospora tabacina* y *Phytophthora nicotinae* en tabaco; *Cercospora beticola*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thanatephorus cucumeris* y *Aphanidermatum cochlioides* en remolacha azucarera; *Diplocarpon rosae*, *Sphaerotheca pannosa* y *Peronospora sparsa* en rosa; *Bremia lactucae*, *Septoria chrysanthemi-indici* y *Puccinia horiana* en crisantemo y especies vegetales compuestas; *Alternaria brassicicola* en rábano; *Sclerotinia homeocarpa* y *Rhizoctonia solani* en césped; *Mycosphaerella fijiensis* y *Mycosphaerella musicola* en plátano; *Plasmopara halstedii*
 15 en girasol; y diversas enfermedades en cultivos provocadas por *Pythium spp.* (por ejemplo, *Pythium aphanidermatum*, *Pythium debarianum*, *Pythium graminicola*, *Pythium irregulare*, *Pythium ultimum*), *Botrytis cinerea*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Aspergillus spp.*, *Penicillium spp.*, *Fusarium spp.*, *Gibberella, spp.*, *Tricoderma spp.*, *Thielaviopsis spp.*, *Rhizopus spp.*, *Mucor spp.*, *Corticium spp.*, *Phoma spp.*, *Rhizoctonia spp.*, *Diplodia spp.*, *Polymixa spp.* y *Oplidium spp.*

Ejemplos

A continuación, se explica la presente invención con más detalles en referencia a los ejemplos.

20 Ejemplos de Formulación 1-4 y Ejemplo de Referencia

Los ingredientes descritos en la Tabla 1 se mezclaron para obtener cada formulación.

Tabla 1

		Ej 1	Ej 2	Ej 3	Ej 4	Ej Ref.
Principio Activo	Tolclofos-metilo (96,08 %)	43,54				
Celvol 24-203 (24 %)	Poli(alcohol vinílico), en forma de solución al 24 % en agua	6,31	6,31			
Stepfac TSP PE-K (40 %)	Fosfato de polioxietilen triestirilfenol	1,31		1,31		
Stepfac TSP PE-N			1,31		1,31	
Tensioactivo mezclado	Mezcla de copolímero de bloques de EO/PO y alcohol graso de polioxietileno (3:1 en peso)	1,51	1,51	1,51	1,51	4
Espesante	Kelzan CC (en forma de solución al 2,4 % en agua)	5,00				
Espesante	Van Gel B (en forma de dispersión al 4 % en agua)	6,39				
Agente anti-congelación	Propilen glicol	5,00				
Agente anti-congelación	Surfynol 104PG (50 %)	0,07				
Conservante	Legendá MK	0,05				
Agua	Agua Desionizada	Equilibrio				
Total (peso/peso)		100				

Celvol 24-203 es un nombre comercial de poli(alcohol vinílico) producido por Celanase Corp y proporcionado en forma de solución al 24 % en agua.
 Stepfac TSP PE-K y Stepfac TSP PE-N son nombres comerciales de sales de ácido de éster de fosfato de polioxietilen triestirilfenol producidas por Stepan Corp.
 Kelzan CC y Van Gel B son nombres comerciales de un espesante producido por Kelco Corp. Los materiales normalmente se hidratan en agua antes de añadirse a la formulación. El Kelzan se disuelve en agua para preparar una solución al 2,4 %. El Van Gel B se mezcla en agua a elevada cizalla durante 30 minutos para hidratar la arcilla, formando una dispersión al 4 %.
 Surfynol 104PG es un nombre comercial de agente anti-espumante producido por Air Products Corp., y se suministra en forma de solución al 50 % de propilen glicol. Legend MK es un nombre comercial de un conservante producido por Rohm and Haas Company.

25 Ejemplo de Ensayo

30 Se almacenaron las formulaciones preparadas a 54 °C durante 2 semanas. Después de esto, se midieron las muestras por medio de un medidor de tamaño Master 2000, un analizador de partículas láser de Malvern Instruments Incorporated. Los resultados se proporcionan en la tabla siguiente.

Tabla 2

	Diámetro medio en volumen (µm)				
	Ej. 1	Ej. 2	Ej. 3	Ej. 4	Ej. Ref.
Inicial	2,1	2,0	2,2	2,1	2,2
Tras 2 semanas a 54 °C	10,7	9,6	9,8	8,3	20,2

Los resultados muestran que la aglomeración de partículas sólidas es baja en las formulaciones de la presente invención, y de este modo, la formulación de la presente invención tiene buena estabilidad de la formulación a temperatura elevada tal como 54 °C.

REIVINDICACIONES

- 5 1. Una composición fungicida que comprende tolclofos-metilo, fosfato de polioxietilen poliarilfenol, copolímero de bloque de polioxietileno y polioxipropileno, éter de alcohol graso de polioxietileno y agua.
- 10 2. La composición fungicida de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende de un 30 % a un 70 % en peso de tolclofos-metilo, de un 0,3 % a un 5 % en peso de fosfato de polioxietilen poliarilfenol, de un 0,5 % a un 5 % en peso de copolímero de bloque de polioxietileno y polioxipropileno, de un 0,1 % a un 3 % en peso de éter de alcohol graso de polioxietileno y de un 25 % a un 65 % en peso de agua.
- 15 3. La composición fungicida de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende de un 40 % a un 55 % en peso de tolclofos-metilo, de un 1 % a un 5 % en peso de fosfato de polioxietilen poliarilfenol, de un 1 % a un 3 % en peso de copolímero de bloque de polioxietileno y polioxipropileno, de un 0,3 % a un 1,5 % en peso de éter de alcohol graso de polioxietileno y de un 35 % a un 65 % en peso de agua.
- 20 4. La composición fungicida de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende tolclofos-metilo, fosfato de polioxietilen poliarilfenol, copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno, éter de alcohol graso de polioxietileno, poli(alcohol vinílico) y agua.
- 25 5. La composición fungicida de acuerdo con la reivindicación 4, que comprende de un 40 % a un 55 % en peso de tolclofos-metilo, de un 1 % a un 5 % en peso de fosfato de polioxietilen poliarilfenol, de un 1 % a un 3 % en peso de copolímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno, de un 0,3 % a un 1,5 % en peso de éter de alcohol graso de polioxietileno, de un 0,5 % a un 3 % en peso de poli(alcohol vinílico) y de un 35 % a un 65 % en peso de agua.
6. La composición fungicida de acuerdo con la reivindicación 1, 2 o 3, donde el fosfato de polioxietilen poliarilfenol es fosfato de polioxietilen triestiril fenol.