

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 608 467**

51 Int. Cl.:

A01N 43/713	(2006.01)	C07D 401/12	(2006.01)
A01N 43/22	(2006.01)		
A01N 43/50	(2006.01)		
A01N 43/80	(2006.01)		
A01N 43/90	(2006.01)		
A01N 47/38	(2006.01)		
A01N 47/40	(2006.01)		
A01N 51/00	(2006.01)		
A01N 63/02	(2006.01)		
A01P 3/00	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **14.03.2011 PCT/JP2011/055879**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **22.09.2011 WO11115029**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **14.03.2011 E 11756214 (0)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **12.10.2016 EP 2548439**

54 Título: **Agente de control de enfermedades de plantas**

30 Prioridad:

16.03.2010 JP 2010059638

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

11.04.2017

73 Titular/es:

**NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)
2-1 Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku
Tokyo 100-8165, JP**

72 Inventor/es:

URIHARA, ICHIROU

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 608 467 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

Agente de control de enfermedades de plantas

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un agente de control de enfermedades de plantas que incluye como ingrediente eficaz derivados de tetrazolil oxima e principios activos fungicidas para su uso agrícola y hortícola.

10 **Antecedentes de la técnica**

En el cultivo de especies agrícolas y hortícolas, aunque se usa un gran número de agentes de control de enfermedades contra las enfermedades de los cultivos, la mayoría de ellos no se consideran necesariamente satisfactorios, ya que los efectos de control de los mismos pueden ser inadecuados o el uso de los mismos puede estar restringido debido a la aparición de organismos patógenos resistentes a los agroquímicos o las plantas pueden dañarse o contaminarse por los agroquímicos o el agroquímico puede mostrar toxicidad para los seres humanos, el ganado o la vida marina. Por tanto, existe una necesidad de desarrollar un agente de control de enfermedades de plantas que pueda utilizarse de forma segura y tenga pocos de estos inconvenientes. El documento WO 2009/090181 A1 y el documento WO 2010/060982 A2 describen composiciones plaguicidas a base de un derivado de tetrazoliloxima y un fungicida o insecticida. El documento WO 2009/020191 A1 describe derivados de tetrazoliloxima con control de enfermedades de plantas.

Los presentes inventores realizaron una investigación exhaustiva en vista de las circunstancias descritas anteriormente y descubrieron que un derivado de tetrazolil oxima y/o una sal del mismo son útiles como principio activo de un agente de control de enfermedades de plantas y presentaron previamente una solicitud de patente (Documento de patente 1).

Bibliografía de la técnica anterior

30 Documentos de patente

Documento de patente 1: WO 03/016303

Divulgación de la invención

35 Problemas que se resuelven por la invención

La presente invención se realizó como parte de la investigación sobre un agente de control de enfermedades de plantas que incluye un derivado de tetrazolil oxima y/o una sal del mismo descrito en el Documento de Patente 1 como principio activo y un objetivo de la presente invención es proporcionar un agente de control de enfermedades de plantas que proporcione excelentes efectos de control frente a enfermedades de plantas a dosis bajas.

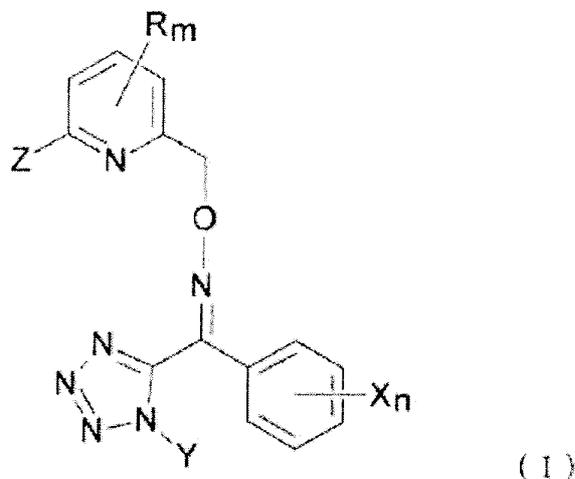
Medios para resolver los problemas

45 Con el fin de conseguir el objetivo anteriormente mencionado, los inventores de la presente invención realizaron investigaciones adicionales sobre un agente de control de enfermedades de plantas que incluye un derivado de tetrazolil oxima y/o una sal del mismo descrito en el Documento de patente 1 como principio activo. Como resultado, los inventores de la presente invención descubrieron que pueden obtenerse efectos de control superiores frente a enfermedades de plantas a dosis bajas mediante el uso de dicho derivado de tetrazolil oxima y/o una sal del mismo junto con un principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola, y completaron la presente invención.

Por tanto, la presente invención proporciona un agente de control de enfermedades de plantas de acuerdo con la reivindicación 1. En el presente documento se describe en general un derivado de tetrazoliloxima de fórmula (1).

55

[Fórmula química 1]



(en la fórmula (I), X representa un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo arilo C6-10 o un grupo alquil C1-6 sulfonilo; n representa un número entero de 0 a 5; Y representa un grupo alquilo C1-6; Z representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino o un grupo representado por NHC(=O)-Q; Q representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-8, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo alcoxi C1-8, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo aralquilo C7-20, un grupo alquil C1-4 tio-alquilo C1-8, un grupo alcoxi C1-4 alquilo C1-2, un grupo acil C1-4 amino-alquilo C1-6, un grupo acil C1-4 amino-alcoxi C1-6, un grupo alquilo C1-8 amino, un grupo alquenilo C2-6, un grupo aralquilo C7-20 o un grupo arilo C6-10; R representa un átomo de halógeno; m representa un número entero de 0 a 3) y al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en imidacloprida, triflumizol, espinosad, hidroxil isoxazol, tiofanato-metilo, triciclazol, clotianidina, benomilo, acetamiprida y sales de los mismos.

15 Efectos de la invención

El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención proporciona excelentes efectos de control frente a enfermedades de plantas a dosis bajas y elimina la preocupación acerca del daño químico a las plantas útiles.

20 Mejor modo de realización de la invención

El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención de acuerdo con la reivindicación 1. En el presente documento se describe de forma más general un agente de control de enfermedades de plantas incluyendo al menos uno seleccionado entre derivados de tetrazoliloxima de fórmula (I) y sales de los mismos y al menos uno seleccionado entre principios activos fungicidas específicos para su uso agrícola y hortícola.

(1) Derivado de tetrazolil oxima y sal del mismo

30 [X]

En la fórmula (I), X representa un grupo alquilo C1-6, un grupo alcoxi C1-6, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo arilo C6-10 o un grupo alquil C1-6 sulfonilo.

35 Los ejemplos del grupo alquilo C1-6 de X incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo 1-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo y similares.

40 Los ejemplos del grupo alcoxi C1-6 de X incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo s-butoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi y similares.

45 El grupo alquilo C1-6 o el grupo alcoxi C1-6 pueden estar sustituidos. Los sustituyentes no están particularmente limitados, siempre que sean químicamente permisibles. Los ejemplos de los sustituyentes incluyen un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o similares; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi o similares; un grupo fenilo sin sustituir o sustituido tal como un grupo fenilo, un grupo 4-metil fenilo, un grupo 2-clorofenilo o similares; un grupo nitro; un grupo ciano; un grupo amino sin sustituir o sustituido tal como un grupo amino, un grupo metil amino, un grupo dimetil amino, un

grupo acetil amino, un grupo benzoil amino o similares; y similares.

Los ejemplos del átomo de halógeno de X incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo y similares.

5

Los ejemplos del grupo arilo C6-10 de X incluyen un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2-naftilo y similares.

El grupo arilo puede estar sustituido. Los sustituyentes no están particularmente limitados, siempre que sean químicamente permisibles. Los ejemplos de los sustituyentes incluyen un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o similares; un grupo alquilo C1-6 tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo o similares; un grupo alqueno C2-6 tal como un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo o similares; un grupo alquínico C2-6 tal como un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo o similares; un grupo alcoxi C1-6 tal como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo t-butoxi o similares; un grupo nitro; un grupo ciano; y similares.

10

15

20

Los ejemplos del grupo alquil C1-6 sulfonilo de X incluyen un grupo metil sulfonilo, un grupo etil sulfonilo, un grupo n-propil sulfonilo, un grupo i-propil sulfonilo y similares.

El grupo alquil C1-6 sulfonilo puede estar sustituido. Los sustituyentes no están particularmente limitados, siempre que sean químicamente permisibles. Los ejemplos de los sustituyentes son los mismos que los enumerados como ejemplos de los sustituyentes del grupo alquilo C1-6 de X.

25

Entre estos ejemplos, X representa preferentemente un átomo de halógeno. n representa un número entero de 0 a 5 y preferentemente representa 0.

30

[Y]

En la fórmula (I), Y representa un grupo alquilo C1-6.

35

Los ejemplos del grupo alquilo C1-6 de Y son los mismos que los enumerados como ejemplos del grupo alquilo C1-6 de X.

Entre estos ejemplos, Y representa preferentemente un grupo metilo.

40

[Z]

En la fórmula (I), Z representa un átomo de hidrógeno, un grupo amino o un grupo representado por NHC(=O)-Q; Q representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-8, un grupo haloalquilo C1-6, un grupo cicloalquilo C3-6, un grupo alcoxi C1-8, un grupo cicloalcoxi C3-6, un grupo aralquilo C7-20, un grupo alquil C1-4 tio-alquilo C1-8, un grupo alcoxi C1-4 alquilo C1-2, un grupo acil C1-4 amino-alquilo C1-6, un grupo acil C1-4 amino-alcoxi C1-6, un grupo alquil C1-8 amino, un grupo alqueno C2-6, un grupo aralquilo C7-20 o un grupo arilo C6-10.

45

Los ejemplos del grupo alquilo C1-8 de Q incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo 1,1-dimetil propilo, un grupo n-butilo, un grupo i-butilo, un grupo s-butilo, un grupo t-butilo, un grupo 1-metil butilo, un grupo 2-metil butilo, un grupo neopentilo, un grupo 1-etil propilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, un grupo n-heptilo, un grupo n-octilo y similares.

50

Los ejemplos del grupo haloalquilo C1-6 de Q incluyen un grupo clorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-n-propilo, un grupo 1-clorohexilo y similares.

55

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C3-6 de Q incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo y similares.

60

Los ejemplos del grupo alcoxi C1-8 de Q incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo i-propoxi, un grupo 1,1-dimetil-n-propoxi, un grupo n-butoxi, un grupo i-butoxi, un grupo s-butoxi, un grupo t-butoxi, un grupo i-pentiloxi, un grupo 1-metil butoxi, un grupo 2-metil butoxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 1-etil propoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo n-heptiloxi, un grupo n-octiloxi y similares

65

Los ejemplos del grupo cicloalquilo C3-6 de Q incluyen un grupo ciclopropiloxi, un grupo ciclobutiloxi, un grupo ciclopentiloxi, un grupo ciclohexiloxi y similares.

Los ejemplos del grupo aralquiloxi C7-20 de Q incluyen un grupo benciloxi, un grupo fenetiloxi y similares.

Los ejemplos del grupo alquil C1-4 tio-alquilo C1-8 de Q incluyen un grupo metil tiometilo, un grupo 2-metil tioetilo, un grupo etil tiometilo, un grupo butil tiometilo y similares.

5 Los ejemplos del grupo alcoxi C1-4 alquilo C1-2 de Q incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo n-butoximetilo y similares.

10 Los ejemplos del grupo acril C1-4 amino-alquilo C1-6 de Q incluyen un grupo acetil aminometilo, un grupo 2-(propionilamino)etilo, un grupo 3-(acetil amino)propilo, un grupo 3-(propionil amino)propilo, un grupo 3-(pivaloíl amino)propilo, un grupo 4-(acetil amino)butilo, un grupo 5-(acetil amino)pentilo, un grupo 6-(acetil amino)hexilo y similares.

15 Los ejemplos del grupo acil C1-4 amino-alcoxi C1-6 de Q incluyen un grupo acetil aminometoxi, un grupo 2-(propionil amino)etoxi, un grupo 3-(acetil amino)propoxi, un grupo 3-(propionil amino)propoxi, un grupo 3-(pivaloíl amino)propoxi y similares.

20 Los ejemplos del grupo alquil C1-8 amino de Q incluyen un grupo metil amino, un grupo etil amino, un grupo n-propil amino, un grupo i-propil amino, un grupo n-butil amino, un grupo i-butil amino, un grupo s-butil amino, un grupo t-butil amino, un grupo neopentil amino, grupo 1-etil propil amino, un grupo n-pentil amino, un grupo n-hexil amino, un grupo n-heptil amino, un grupo n-octil amino y similares.

25 Los ejemplos del grupo alqueno C2-6 de Q incluyen un grupo alilo, un grupo i-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 5-hexenilo y similares.

Los ejemplos del grupo aralquilo C7-20 de Q incluyen un grupo bencilo, un grupo fenetilo, un grupo 3-fenil propilo, un grupo 1-naftil metilo, un grupo 2-naftil metilo y similares.

30 Los ejemplos del grupo arilo C6-10 de Q incluyen un grupo fenilo, un grupo 1-naftilo, un grupo 2-naftilo y similares.

Entre estos ejemplos, Z representa preferentemente un grupo representado por NHC(=O)-Q o un grupo representado por NHC(=O)-O-t-Bu. Además, t-Bu representa un grupo butilo terciario.

[R]

35 En la fórmula (I), R representa un átomo de halógeno tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o similares. m representa un número entero de 0 a 3 y preferentemente representa 0.

40 Las sales del derivado de tetrazolil oxima representado por la fórmula (I) no están particularmente limitados, siempre que sean agrícola y hortícola aceptables. Los ejemplos de las sales incluyen una sal de ácidos inorgánicos tales como clorhidratos, nitratos, sulfatos o fosfatos; una sal de ácidos orgánicos tales como acetatos, lactatos, propionatos o benzoatos; y similares.

45 Existen estereoisómeros de forma (E) y forma (Z) en el derivado de tetrazolil oxima representado por la fórmula (I) basados en dobles enlaces carbono-nitrógeno. Estos dos estereoisómeros junto con mezclas de los mismos también se incluyen en la presente invención. Normalmente se obtienen productos de síntesis en forma solo de la forma (Z) o como una mezcla de la forma (E) y la forma (Z). Los dos isómeros pueden aislarse respectivamente a partir de una mezcla de la forma (E) y la forma (Z) mediante la separación de acuerdo con técnicas conocidas, tales como cromatografía en columna de gel de sílice.

50 La forma (Z) del derivado de tetrazolil oxima representado por la fórmula (I) utilizado en la presente invención y las sales de del mismo, tienen efectos de control de enfermedades de plantas superiores en comparación con la forma (E). Sin embargo, puesto que la forma (Z) se convierte parcialmente en la forma (E) debido a la acción de la luz y similares, en el entorno natural y tiende a estabilizarse en una relación constante en forma de una mezcla de la forma (E) y la forma (Z), son útiles los dos compuestos así como las mezclas de los mismos. Además, puesto que la relación estable de la forma (E) a la forma (Z) varía en función de los compuestos individuales, no puede especificarse de forma universal.

60 El derivado de tetrazolil oxima representado por la fórmula (I) y la sal del mismo pueden producirse, por ejemplo, mediante un método descrito en el documento WO 03/016303.

Los ejemplos del derivado de tetrazolil oxima representado por la fórmula (I) incluyen los compuestos descritos en el documento WO03/016303.

65 (2) Principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola

Además del derivado de tetrazolil oxima descrito anteriormente y una sal del mismo (en lo sucesivo en el presente documento, puede denominarse "derivado de tetrazolil oxima o similar"), el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención incluye además al menos uno seleccionado entre el grupo que consiste en

5 Estos compuestos son principios activos fungicidas bien conocidos para su uso agrícola y hortícola. Por ejemplo, polvo humectable Trifmine (principio activo: 30 % de triflumizol, fabricado por Dow Chemical Japan Ltd.), formulación líquida Tachigaren (principio activo: 30 % de hidroxiiisoxazol, fabricado por Sankyo Agro Co., Ltd.), formulación líquida Mospiran SL (principio activo: 18 % de acetamiprida, fabricado por Nippon Soda Co., Ltd.) están disponibles en el mercado.

15 En el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención, la relación de composición entre (1) derivado de tetrazolil oxima o similar y (2) el principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola no está particularmente limitada. La relación de peso del (derivado de tetrazolil oxima o similar):(principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola) es preferentemente de 1:10.000.000 a 10.000.000:1, más preferentemente de 1:1.000.000 a 1.000.000:1, más preferentemente de 1:100.000 a 100 000:1, particularmente preferente de 1:10.000 a 10.000:1.

20 En el agente de control de enfermedades de plantas, la tasa de contenido de la cantidad total del (1) derivado de tetrazolil oxima o similar y (2) el principio activo para su uso agrícola y hortícola no está particularmente limitada y puede variarse de acuerdo con la formulación. Por ejemplo, en los polvos humectables, la tasa de contenido es normalmente del 5 al 90 % en peso, preferentemente del 10 al 85 % en peso; en las emulsiones, la tasa de contenido es normalmente del 3 al 70 % en peso, preferentemente del 5 al 60 % en peso; en los gránulos, el concentrado es normalmente del 0,01 al 50 % en peso, preferentemente del 0,05 al 40 % en peso.

25 (3) Otros componentes

30 En el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención, pueden añadirse agentes aditivos tales como aceite de colza, aceite de soja, aceite de semilla de girasol, aceite de ricino, aceite de pino, aceite de semilla de algodón o derivados de los mismos, o concentrados de aceite de los mismos.

35 Además, el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención puede incluir adicionalmente un principio activo plaguicidas, tal como insecticidas, acaricidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, fertilizantes o similares, según la necesidad.

La formulación del agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención no está particularmente limitada siempre que el agente de control de enfermedades de plantas incluya (1) el derivado de tetrazolil oxima o similar y (2) el principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola.

40 Los ejemplos del agente de control de enfermedades de plantas incluyen un agente de control de enfermedades de plantas obtenido mediante la mezcla de (1) una formulación que incluye el derivado de tetrazolil oxima o similar, (2) una formulación que incluye el principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola y, si es necesario, (3) una formulación que incluye un principio activo pesticida en una relación específica: un agente de control de enfermedades de plantas obtenido mediante la mezcla y, si es necesario, la formulación del (1) derivado de tetrazolil oxima o similares, (2) el principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola y (3) un principio activo pesticida en una relación específica; un agente de control de enfermedades de plantas obtenido mediante la adición de (1) una formulación que incluye el derivado de tetrazolil oxima o similar, (2) una formulación que incluye el principio activo fungicida para su uso agrícola y hortícola y, si es necesario, (3) una formulación que incluye un principio activo plaguicida al agua en una relación específica.

50 La formulación puede ser una forma que sea susceptible de adoptarse de acuerdo con los productos químicos agrícolas habituales, por ejemplo, un polvo humectable, gránulos, polvo, emulsión, solución, suspensión, agente fluido o similares.

55 La formulación no está particularmente limitada por el método o procedimiento de la misma y puede realizarse mediante métodos o procedimientos bien conocidos. Además, diversos materiales auxiliares útiles para la formulación, tales como vehículos, aditivos, disolventes o similares no están particularmente limitados.

60 Los ejemplos de aditivos y/o vehículos utilizados para la formulación sólida incluyen polvos vegetales tales como polvo de soja o polvo de trigo, polvos finos minerales tales como tierra de diatomeas, apatita, yeso, talco, bentonita, pirofilita o arcilla y compuestos orgánicos e inorgánicos tales como benzoato de sodio, urea o sulfato de sodio.

65 Para formulaciones líquidas, pueden utilizarse una fracción de aceite tal como queroseno, xileno, nafta disolvente o similares; disolventes, tales como ciclohexano, ciclohexanona, dimetilformamida, dimetilsulfóxido, alcohol, acetona, tricloroetileno, metil isobutil cetona, aceite mineral, aceite vegetal, agua o similares.

Además, puede añadirse un tensioactivo a estas formulaciones según sea necesario para obtener una forma uniforme y estable.

Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos no iónicos tales como polioxietilen-alquil fenil éteres, polioxietilen-alquil éteres, ésteres de ácidos grasos superiores polioxietilenados, ésteres de ácidos grasos de sorbitano polioxietilenados o polioxietilen-tristiril fenil éter y sales de éster de ácido sulfúrico de polioxietilen-alquil fenil éteres, alquilo benceno sulfonatos, sales de éster de ácido sulfúrico de alcoholes superiores, alquil naftaleno sulfonatos, policarboxilatos, sulfonatos de lignina, condensados de formaldehído de sulfonatos de alquil naftaleno y copolímeros de isobutileno-anhidrato maleico.

El polvo humectable, la emulsión y el agente fluido obtenidos de esta manera pueden usarse de una forma de manera que el polvo humectable, la emulsión y el agente fluido se diluyen con agua a una concentración predeterminada y la suspensión o emulsión resultante se pulveriza sobre el suelo o se mezcla con el suelo antes o después de la germinación de las malas hierbas. Los gránulos o el polvo pueden pulverizarse directamente sobre el suelo o mezclarse con el suelo antes o después de la generación de las malas hierbas. El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención se aplica generalmente de manera que la cantidad del principio activo es de más de 0,1 g por hectárea.

El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención proporciona una acción fungicida superior frente a una amplia gama de tipos de hongos, tales como los hongos pertenecientes a los Oomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes o Deuteromycetes.

El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención puede usarse para controlar diversas enfermedades de plantas que se producen durante el cultivo de cultivos agrícolas y hortícolas incluyendo plantas con flores, hierbas de césped y hierbas de pasto mediante el tratamiento de semillas, la pulverización foliar, la aplicación al suelo o la aplicación a la superficie del agua y similares.

Los ejemplos de enfermedades de plantas que pueden controlarse mediante el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención incluyen:

Remolacha azucarera:

Mancha foliar por *Cercospora* (*Cercospora beticola*)
 Podredumbre de la raíz por *Aphanomyces* (*Aphanomyces cochlioides*)
 Podredumbre de la raíz (*Thanatephorus cucumeris*)
 Roya foliar (*Thanatephorus cucumeris*)

Cacahuetes:

Mancha foliar parda (*Mycosphaerella arachidis*)
 Roya foliar negra (*Mycosphaerella berkeleyi*)

Pepinos:

Mildiú blanco (*Sphaerotheca fuliginea*)
 Mildió azul (*Pseudoperonospora cubensis*)
 Roya gomosa del tallo (*Mycosphaerella melonis*)
 Fusariosis (*Fusarium oxysporum*)
 Podredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*)
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Antracnosis (*Colletotrichum ohriculare*)
 Sarna (*Cladosporium cucumerinum*)
 Mancha foliar por *Corynespora* (*Corynespora cassicola*)
 Caída de almáciga (*Pythium debaryanum*, *Rhizoctonia solani* Kuhn)
 Mancha bacteriana (*Pseudomonas syringae* pv *Lecrymans.*)

Tomates:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Moho foliar (*Cladosporium fulvum*)
 Roya tardía (*Phytophthora infestans*)

Berenjenas:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Podredumbre negra (*Corynespora melongenae*)

Mildiú blanco (*Erysiphe cichoracearum*)
 Moho foliar (*Mycovellosiella natrassii*)

Fresas:

5 Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Mildiú blanco (*Sphaerotheca humuli*)
 Antracnosis (*Colletotrichum acutatum*, *Colletotrichum fragariae*)
 10 Podredumbre por Phytophthora (*Phytophthora cactorum*)

Cebollas:

Podredumbre del cuello (*Botrytis allii*)
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 15 Roya foliar (*Botrytis squamosa*)
 Mildiú blanco (*Peronospora destructor*)

Repollo:

20 Hernia (*Plasmodiophora brassicae*)
 Podredumbre blanda bacteriana (*Erwinia carotovora*)
 Mildiú azul (*Peronospora parasitica*)

Alubias:

25 Podredumbre del tallo (*Sclerotinia sclerotiorum*)
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)

Manzanas:

30 Mildiú blanco (*Podosphaera leucotricha*)
 Sarna (*Venturia inaequalis*)
 Roya de la flor (*Monilinia mali*)
 Mancha del fruto (*Mycosphaerella pomi*)
 35 Chancro por Valsa (*Valsa mali*)
 Mancha por Alternaria (*Alternaria mali*)
 Tizón (*Gymnosporangium yamadae*)
 Podredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*)
 Antracnosis (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*)
 40 Mancha (*Diplocarpon mali*)
 Mosqueado (*Zygophiala jamaicensis*)
 Fumagina (*Gloeodes pomigena*)

Caquis:

45 Mildiú blanco (*Phyllactinia kakicola*)
 Antracnosis (*Gloeosporium kaki*)
 Mancha foliar angular (*Cercospora kaki*)

50 Melocotones:

Podredumbre parda (*Monilinia fructicola*)
 Sarna (*Cladosporium carpophilum*)
 Podredumbre por Phomopsis (*Phomopsis sp*)

55

Cerezas:

Podredumbre parda (*Monilinia fructicola*)

60 Uvas:

Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Mildiú blanco (*Uncinula necator*)
 Podredumbre blanca de la vid (*Glomerella cingulata*, *Colletotrichum acutatum*)
 65 Mildiú azul (*Plasmopara viticola*)
 Antracnosis (*Elsinoe ampelina*)

Roya foliar (*Pseudocercospora vitis*)
 Podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*)

Peras:

- 5 Sarna (*Venturia nashicola*)
 Tizón (*Gymnosporangium asiaticum*)
 Mancha negra (*Alternaria kikuchiana*)
 Podredumbre anular (*Botryosphaeria berengeriana*)
 10 Mildiú blanco (*Phyllactinia mali*)

Té:

- 15 Roya gris (*Pestalotia theae*)
 Antracnosis (*Collectotrichum theae-sinensis*)

Cítricos:

- 20 Sarna (*Elsinoe fawcetti*)
 Moho azul (*Penicillium italicum*)
 Moho verde común (*Penicillium digitatum*)
 Moho gris (*Botrytis cinerea*)
 Melanosis (*Diaporthe citri*)
 25 Chancro (*Xanthomonas campestris* pv. *Citri*)

Trigo:

- Mildiú blanco (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*)
 30 Roya por Fusaria (*Gibberella zeae*)
 Tizón foliar (*Puccinia recondita*)
 Podredumbre de la raíz con pardeamiento (*Pythium iwayamae*)
 Moho de la nieve (*Monographella nivalis*)
 Cercosporodiosis (*Pseudocercospora herpotrichoides*)
 Mancha punteada foliar (*Septoria tritici*)
 35 Mancha de la pluma del trigo (*Leptosphaeria nodorum*)
 Roya de la nieve por Typhula (*Typhula incarnata*)
 Roya de la nieve por Sclerotinia (*Myriosclerotinia borealis*)
 Mal del pie del trigo (*Gaeumanomyces graminis*)

40 Cebada:

- Estriado (*Pyrenophora graminea*)
 Mancha foliar (*Rhynchosporium secalis*)
 45 Carbón desnudo (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)

Arroz:

- Quemado del arroz (*Pyricularia oryzae*)
 50 Roya de la vaina (*Rhizoctonia solani*)
 Enfermedad de Bakanae (*Gibberella fujikuroi*)
 Mancha parda (*Cochliobolus niyabeanus*)
 Roya de la plántula (*Pythium graminicolum*)
 Roya foliar bacteriana (*Xanthomonas oryzae*)
 55 Roya bacteriana de la plántula (*Burkholderia plantarii*)
 Estriado pardo bacteriano (*Acidovorax avenae*)
 Podredumbre bacteriana del grano (*Burkholderia glumae*)

Tabaco:

- 60 Podredumbre del tallo por Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*)
 Mildiú blanco (*Erysiphe cichoracearum*)

Tulipanes:

- 65 Moho gris (*Botrytis cinerea*)

Agrostis:

Roya de la nieve por Sclerotinia (*Sclerotinia borealis*)
 Roya bacteriana del brote (*Pythium aphanidennatum*)

5

Pasto ovillo:

Mildiú blanco (*Erysiphe graminis*)

10

Soja:

Mancha púrpura (*Cercospora kikuchii*)
 Mildiú azul (*Peronospora manshurica*)
 Podredumbre del tallo y de la raíz por Phytophthora (*Phytophthora sojae*)

15

Patatas, tomates:

Roya tardía (*Phytophthora infestans*)

20 Además, el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención tiene efectos fungicidas superiores frente a organismos resistentes.

25 Los ejemplos del organismo resistente incluyen el moho gris (*Botrytis cinerea*), la mancha foliar por Cercospora de la remolacha azucarera (*Cercospora beticola*), la sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) y la sarna del peral (*Venturia nashicola*), que presenta resistencia a fungicidas de bencimidazol tales como tiofanato-metilo, benomilo y carbendazima; el moho gris (*Botrytis cinerea*) que presenta resistencia a fungicidas de dicarboximida (por ejemplo, vinclozolina, procimidona, iprodiona) y similares.

30 Además, el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención provoca poco daño químico, presenta una baja toxicidad para los peces y los animales de sangre caliente y tiene un alto grado de seguridad.

Ejemplos

35 A continuación se proporciona una explicación más detallada de la presente invención a través de ejemplos. Sin embargo, la presente invención no se limita a los siguientes ejemplos.

(Producto químico I)

40 Se mezclaron 10 partes de éster t-butilico del ácido {6-([(Z)-(1-metil-1H-5-tetrazolil)fenil metilen]aminoximetil)-2-piridil}carbámico, 2 partes de polioxietilen aril fenil éter, 0,5 partes de sal de dialquil sulfosuccinato de sodio, 5 partes de glicerina, 0,3 partes de goma de xantano y 82,2 partes de agua y se molieron en húmedo hasta que el tamaño del grano se redujo a 3 µm o menos, obteniéndose de este modo como producto químico I un agente de suspensión (agente de SC) que contenía el 10 % de principio activo.

45 Además, el éster t-butilico del ácido {6-([(Z)-(1-metil-1H-5-tetrazolil)fenil metilen]aminoximetil)-2-piridil}carbámico es el compuesto n.º (3)-8 de la Tabla 3, que se produjo mediante el método descrito en el documento WO 03/016303.

(Producto químico II)

50 Las siguientes formulaciones (A) a (I) se prepararon como química II.

- (A) fluido Admire (principio activo: 20 % de imidacloprida, fabricado por Bayer Holding Ltd.)
- (B) polvo humectable Trifmine (principio activo: 30 % de triflumizol, fabricado por Dow Chemical Japan Ltd.)
- (C) gránulo humectable Spinoace (principio activo: 25 % de espinosad, fabricado por Dow Chemical Japan Ltd.)
- 55 (D) formulación líquida Tachigaren (principio activo: 30 % de hidroxisoxazol, fabricado por Sankyo Agro Co., Ltd.)
- (E) polvo humectable Topsin M (principio activo: 70 % de tiofanato-metilo, fabricado por Nippon Soda Co., Ltd)
- (F) Sol Beam (principio activo: 20 % de triciclazoilo, fabricado por Sumitomo Chemical Company, Limited)
- (G) polvo hidrosoluble Dantotsu (principio activo: 16 % de clotiazina, fabricado por Sumitomo Chemical
- 60 Company)
- (H) polvo humectable Benreto (principio activo: 50 % de benolilo, fabricado por Sumitomo Chemical Company)
- (I) formulación líquida Mospiran SL (principio activo: 18 % de acetamiprida, fabricado por Nippon Soda Co., Ltd.)

Ensayo de placa antifúngica de *Pythium graminicola*

65

Se añadieron compuesto químico I y compuesto químico II al agua para ajustar la concentración del principio activo

a las concentraciones mostradas en la Tabla 1 o la Tabla 2, obteniendo de este modo soluciones químicas. Las soluciones químicas se añadieron a un medio de cultivo PDA y la concentración de las soluciones químicas en el medio de cultivo PDA se ajustó al 1 %, obteniéndose de este modo placas de agar. Se sembraron discos de micelio (diámetro de 4 mm) de *Pythium graminicola* en las placas de agar. Las placas de agar se colocaron de forma estática durante 3 a 4 días a 20 °C y se midieron los diámetros de la colonia. Las tasas de inhibición de la elongación hifal con respecto al grupo de control se definen como valor preventivo y se muestran en la Tabla 1 y la Tabla 2. Además, los valores esperados calculados usando la ecuación de Colby se muestran en la Tabla 1 y la Tabla 2.

La tasa de inhibición de la elongación hifal (%) se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de inhibición de la elongación hifal (\%)} = \frac{(1 - (\text{diámetro de las colonias en el grupo de tratamiento}))}{(\text{diámetro de las colonias en el grupo control})} \times 100 \%$$

El valor esperado se calculó usando la ecuación de Colby: $E = M + N - MN/100$. En la ecuación, E representa un valor preventivo esperado (%), M representa un valor preventivo al usar el producto químico I solo (%), N representa un valor preventivo al usar el producto químico II solo (%).

Además, en la Tabla 1 y la Tabla 2, los Ejemplos Comparativos 1 y 12 muestran resultados cuando se usa una solución química que incluye producto químico I solo, los Ejemplos Comparativos 2 a 10 y 13 a 21 muestran resultados cuando se usa una solución química que incluye producto químico II solo y los Ejemplos Comparativos 11 y 22 muestran resultados cuando se usa solo agua en lugar de una solución química.

Tabla 1

		Producto químico I	Producto químico II		Valor preventivo (%)	Valor esperado (%)
		Concentración (ppm)	Formulación	Concentración (ppm)		
Ejemplo	6	0,0025	(D)	10	93	68
	7		(I)	100	93	68
	8			10	91	68
	9			1	90	68
Ejemplo de Referencia	1	0,0025	(A)	100	93	68
	2			10	94	68
	3			1	93	68
	4		(C)	10	93	68
	5			1	93	68
Ejemplo comparativo	1	0,0025	-	-	68	-
	2	-	(A)	100	0	-
	3			10	0	-
	4			1	0	-
	5	-	(C)	10	0	-
	6			1	0	-
	7		(D)	10	0	-
	8			100	0	-
	9	(I)	10	0	-	
	10		1	0	-	
	11	control			0	-

Tabla 2

		Producto químico I	Producto químico II		Valor preventivo (%)	Valor esperado (%)
		Concentración (ppm)	Formulación	Concentración (ppm)		
Ejemplo 10		0,0025	(B)	10	90	70
Ejemplo de Referencia	11	0,0025	(E)	10	90	70
	12			10	96	70
	13		(F)	1	92	70
	14			100	97	70
	15		(G)	10	94	70
	16			1	91	70
	17			100	99	76
	18		(H)	1	92	70

Ejemplo comparativo	12	0,0025	-	-	70	-
	13	-	(B)	10	0	-
	14		(E)	10	0	-
	15		(F)	10	0	-
	16			1	0	-
	17		(G)	100	0	-
	18			10	0	-
	19			1	0	-
	20		(H)	100	22	-
	21			1	0	-
	22		control			0

5 Como se muestra en la Tabla 1 y la Tabla 2, los valores preventivos cuando se usó una solución química que incluye tanto el producto químico I como el producto químico II fueron más altos que los valores preventivos esperados calculados sustituyendo los valores preventivos cuando se usa una solución química que incluye el producto químico I o el producto químico II solos en la ecuación de Colby. Por tanto, es evidente que pueden obtenerse efectos sinérgicos mediante el uso del producto químico I junto con el producto químico II.

Aplicabilidad industrial

10 El agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención demuestra excelentes efectos de control frente a enfermedades de plantas a dosis bajas y elimina la preocupación acerca del daño químico a las plantas útiles, haciendo de este modo que sea extremadamente útil en el campo industrial.

REIVINDICACIONES

1. Un agente de control de enfermedades de plantas que comprende:

- 5 éster t-butílico del ácido {6-([(Z)-(1-metil-1H-5-tetrazolil)fenilmetilen]aminooximetil)-2-piridil}carbámico y sales del mismo;
- 10 al menos un segundo principio activo seleccionado entre el grupo que consiste en triflumizol, hidroxil isoxazol, acetamiprida y sales de los mismos, en el que la relación en peso del derivado de tetrazolil oxima o la sal del mismo al segundo principio activo es de 1:10.000 a 10.000:1.