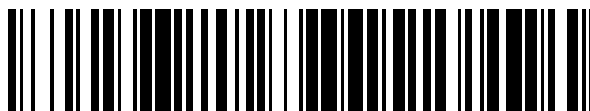


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 639 990**

51 Int. Cl.:

A01N 25/30 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **04.07.2007 PCT/JP2007/063397**

87 Fecha y número de publicación internacional: **10.01.2008 WO08004596**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.07.2007 E 07768149 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **30.08.2017 EP 2036436**

54 Título: **Composición fungicida y método para controlar las enfermedades de las plantas**

30 Prioridad:

05.07.2006 JP 2006185755

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

31.10.2017

73 Titular/es:

**ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD. (100.0%)
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU
OSAKA-SHI OSAKA 550-0002, JP**

72 Inventor/es:

**ISHIHARA, YOSHIAKI y
OGAWA, MUNEKAZU**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

Observaciones :

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

ES 2 639 990 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 y método para controlar las enfermedades de las plantas

5 **Campo técnico**

La presente invención se relaciona con un método para mejorar el efecto fungicida en el control de las enfermedades de las plantas y con un método para mejorar el efecto de vapor de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina.

10

Técnica anterior

El Documento de patente 1 desvela que un derivado de benzoilpiridina, que es un principio activo (a) de la composición fungicida de la presente invención, es útil como fungicida, y el Documento de patente 2 desvela una composición fungicida que contiene el derivado de benzoilpiridina y al menos un fungicida específico como principios activos. En estos documentos de patente, se describe que, según lo requiera el caso, se puede mezclar una composición fungicida con diversos aditivos y formularla en diversas formulaciones para su uso. Sin embargo, no se describe que, cuando se usa el derivado de benzoilpiridina en combinación con un ingrediente potenciador de la actividad específica, se puede obtener un efecto fungicida notablemente excelente. Además, no se sabe que el efecto de vapor (el efecto de control de microbios patógenos sobre las hojas con una cantidad traza tal de principios activos vaporizados que los humanos, los animales y el medio ambiente no resultan perjudicados) del derivado de benzoilpiridina mejora gracias al anterior ingrediente potenciador de la actividad específica. Además, no se sabe que, cuando se formula la composición de la presente invención en una formulación específica, se puede obtener una excelente estabilidad de la formulación.

25

Documento de patente 1: WO02/02527

Documento de patente 2: WO05/41663 (técnica anterior según el Art. 54(3)EPC)

EP1559320 A desvela derivados de piridina 3-benzoil-2,4,5-substituidos o sus sales, fungicidas que los contienen e intermediarios para su producción.

30

WO 96/17829 A desvela ciertas piridilfenilcetonas substituidas que demuestran actividad herbicida.

Divulgación de la invención

35

Problema que la invención ha de resolver

El derivado de benzoilpiridina 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina puede tener un efecto preventivo inadecuado contra una enfermedad específica de las plantas, su efecto residual puede durar solo un tiempo relativamente corto o su estabilidad frente a la lluvia puede ser débil, y sólo tiene un efecto de control inadecuado contra enfermedades de las plantas dependiendo prácticamente del sitio de aplicación.

40

Por lo tanto, es un objeto de la presente invención proporcionar un método para controlar enfermedades de las plantas usando 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina.

45

Medios para resolver los problemas

Los presentes inventores han realizado una investigación para resolver los anteriores problemas y, como resultado, han visto que, cuando se usan en combinación un derivado de benzoilpiridina, la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina, y un ingrediente potenciador de la actividad específica, se puede obtener un inesperadamente excelente efecto fungicida en comparación con el uso de cada compuesto por sí solo. Por lo tanto, se ha conseguido la presente invención.

50

A saber, la presente invención se relaciona con la materia objeto de las reivindicaciones 1 a 6.

55

El compuesto 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina puede formar una sal con una sustancia ácida, y puede formar, por ejemplo, una sal de ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, un bromhidrato, un fosfato, un sulfato o un nitrato, o una sal de ácido orgánico, tal como un acetato, un benzoato, un p-toluensulfonato, un metanosulfonato o un propanosulfonato.

60

El compuesto 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina puede ser preparado mediante

procedimientos de producción como se desvela en los Documentos de patente 1 y 2. Además, puede ser también producido por un método según Journal of Organic Chemistry, 58, 7832 (1993), European Journal of Organic Chemistry, 7, 1371-1376 (2001), o los Ejemplos de preparación que se darán aquí más adelante.

5 A continuación, se mencionarán ejemplos específicos de los ingredientes potenciadores de la actividad. Los ejemplos específicos están representados por una denominación de marca. La amina alifática etoxilada puede ser, por ejemplo, una amina de sebo etoxilada, tal como Frigate (fabricada por ISK Biocscience Europe S.A.), Genamin T-150 o Genamin T-200 (fabricadas por Clariant), Sopol 7553 o Sopol 7409 (fabricadas por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.), New kalgen D-3615T (fabricada por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) y Ethomeen T/25 (fabricada por LION AKZO CO., LTD.). La amina de soja etoxilada puede ser, por ejemplo, Sopol 7721 (fabricada por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) o New kalgen D-3605 (fabricada por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.). La amina de coco etoxilada puede ser, por ejemplo, Sopol 7376 6 (fabricada por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.), New kalgen D-3110 (fabricada por TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) o Ethomeen C/12 (fabricada por LION AKZO CO., LTD.).

15 El agente tensoactivo de silicona puede ser, por ejemplo, un polioxietileno metilpolisiloxano, tal como Makupika (fabricado por Ishihara Sangyo Kaisha, Ltd.), KF-644 (fabricado por Shin-Etsu Chemical Co., Ltd.), SILWET L-77 (fabricado por Toshiba GE Silicone) y SLIPPA (fabricado por INTERAGRO).

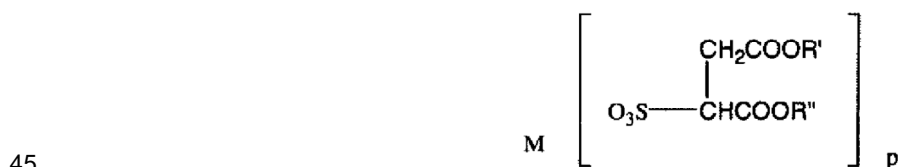
20 El agente tensoactivo de éster de citrato puede ser, por ejemplo, un polioxietileno alquil éter citrato, tal como Adsee CE 24/19 (fabricado por LION AKZO CO., LTD.) o la denominación comercial Adsee CE 8L/22 (fabricada por LION AKZO CO., LTD.).

25 El agente tensoactivo de éster de sulfato (incluyendo sales de ésteres de sulfato) puede ser, por ejemplo, un éster de polioxietileno alquil éter sulfato, tal como HITENOL LA-12 (fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd.), New Kalgen P-1203S (fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.) o AGNIQUE SLES-270 TL (fabricado por Cognis); un éster de polioxietileno alquilfenil éter sulfato, tal como AGNIQUE SNT-45 (fabricado por Cognis) o Sopol 5039 (fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.); un éster de polioxietileno estirilfenil éter sulfato, tal como Sorprophor 4D384 (fabricado por Rhodia NICCA), Sopol 7948 (fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.) o HITENOL NF-08 (fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd.); o un éster de sulfato de polímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno, tal como Sopol 7933 (fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.).

35 El agente tensoactivo de éster de fosfato (incluyendo sales de ésteres de fosfato) puede ser, por ejemplo, un éster de polioxietileno alquil éter fosfato, tal como Phosphanol M-220 (fabricado por TOHO Chemical Industry Co., Ltd.), NIKKOL DDP-10 (fabricado por Nikko Chemicals) o AGNIQUE PE 25 (fabricado por Cognis); un éster de polioxietileno alquilfenil éter fosfato, tal como Rhodafa PS/17 (fabricado por Rhodia NICCA); un éster de polioxietileno estirilfenil éter fosfato, tal como Sorprophor FLK-70 (fabricado por Rhodia NICCA), AGNIQUE PE TSP-16T (fabricado por Cognis) o PLYSURF AL (fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd.); o un fosfato de polímero de bloques de polioxietileno y polioxipropileno.

40 El polioxietileno alquil éter puede ser, por ejemplo, ATLOX MBA 11/8, Synperonic 91/6 (cada uno de ellos fabricado por Uniqema) o NOIGEN TDS-70 (fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd.).

El sulfosuccinato de alquilo puede ser, por ejemplo, un compuesto representado por la fórmula (II):



(donde R' y R'', que son independientes entre sí, son un grupo alquilo C₁₋₁₂ lineal o ramificado; M es Na, Ca o K, siempre que, cuando M sea Na o K, p sea 1, y que, cuando M sea Ca, p sea 2). Concretamente, se pueden mencionar, por ejemplo New Kalgen EP-70G (fabricado por TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd.), AGNIQUE EHS70WE (fabricado por Cognis) o LANKROPOL 4500 (fabricado por LION AKZO CO., LTD.) (sulfosuccinato de dioctilo).

50 El alquilpoliglicósido puede ser, por ejemplo, AGNIQUE PG 8105-G, AGNIQUE PG 264-G (cada uno de ellos fabricado por Cognis) o AG 6202 (fabricado por LION AKZO CO., LTD.).

Efectos de la invención

La composición fungicida aquí descrita tiene una actividad fungicida estable y elevada sobre cultivos infectados con una enfermedad de plantas, y mediante el uso de dicha composición, se puede prevenir la enfermedad de las plantas. Además, se puede mejorar el efecto de vapor del principio activo (a), que es la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina, en la composición fungicida, y es así posible prevenir de manera efectiva las enfermedades de las plantas en los cultivos, incluso aunque se pulverice la composición fungicida con una pequeña cantidad de agua.

Breve descripción de los dibujos

La Fig. 1 es una vista en plano que muestra la disposición de plantas tratadas después de un tratamiento por pulverización y de plantas no tratadas en una cámara de temperatura constante.

Explicación de los símbolos

1: Contenedor, 2: maceta de plástico, A: plantas tratadas y B: plantas no tratadas.

Mejor modo de realización de la invención

El derivado de benzoilpiridina utilizado es la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (Compuesto N° 35).

La composición fungicida aquí desvelada es particularmente útil como fungicida agrícola y hortícola. Como fungicida agrícola y hortícola, es efectiva para controlar enfermedades tales como el tizón, el tizón de la hoja o el mildiú de la vaina del arroz (*Oryza sativa*, etc.); el oídio, la sarna, la roya, el moho de la nieve, el mildiú de la nieve, el carbón volador, la mancha ocular, la mancha de la hoja o la mancha de la gluma de los cereales (*Hordeum vulgare*, *Tricum aestivum*, etc.); la melanosis o la sarna de los cítricos (*Citrus spp.*, etc.); el mildiú de las flores, el oídio, la mancha de las hojas por *Alternaria* o la sarna de la manzana (*Malus pumila*); la sarna o la mancha negra de la pera (*Pyrus serotina*, *Pyrus ussuriensis*, *Pyrus communis*); la podredumbre marrón, la sarna o la podredumbre por *Phomopsis* del melocotón (*Prunus persica*, etc.); la antracnosis, la podredumbre amarga, el oídio o el mildiú de la vid (*Vitis vinifera* spp., etc.); la antracnosis o la podredumbre marrón del tallo del kaki (*Diospyros kaki*, etc.); la antracnosis, el oídio, el tizón gomoso del tallo o el mildiú de las cucurbitáceas (*Cucumis melo*, etc.); el tizón temprano, el moho foliar o el tizón tardío del tomate (*Lycopersicon esculentum*); diversos patógenos de enfermedad por *Alternaria* de las hortalizas crucíferas (*Brassica sp.*, *Raphanus sp.*, etc.); tizón tardío o tizón temprano de la patata (*Solanum tuberosum*); oídio de la fresa (*Fragaria*, etc.); y moho gris o enfermedad causada por *Sclerotinia* de diversos cultivos. Es particularmente efectiva frente al oídio de los cereales y de las hortalizas y frente al tizón del arroz. Además, es efectiva también para controlar enfermedades del suelo causadas por patógenos de las plantas tales como *Fusarium*, *Pythium*, *Rhizoctonia*, *Verticillium* y *Plasmodiophora*.

La composición fungicida puede ser mezclada, del mismo modo que los productos químicos agrícolas convencionales, con diversos aditivos y formulada en diversas formulaciones, tales como un polvo, gránulos, gránulos dispersables en agua, un polvo hidratable, un concentrado en suspensión basada en agua, un concentrado en suspensión basada en aceite, gránulos hidrosolubles, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, una pasta, un aerosol y una formulación de volumen ultrabajo. Dichos aditivos incluyen soportes sólidos, tales como tierra de diatomeas, cal apagada, carbonato de calcio, talco, carbón blanco, caolín, bentonita, una mezcla de caolinita y sericita, arcilla, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio, mirabilita, zeolita y almidón; solventes, tales como agua, alquilbenceno, alquilnaftaleno, parafina, dimetilalquilamida, ciclohexano, sulfóxido de dimetilo, éster de N-alquilpirrolidona, cetona, glicol y alcohol; surfactantes y dispersores aniónicos, tales como una sal de ácido graso, un benzoato, un policarboxilato, un alquilsulfato, un alquilarilsulfato, un alquil diglicol éter sulfato, una sal de éster de alcohol y ácido sulfúrico, un alquilsulfonato, un alquilarilsulfonato, un arilsulfonato, un ligninsulfonato, un alquildifenil éter disulfonato, un poliestireno sulfonato, un alquilarilfosfato, un estirilarilfosfato, una sal de polioxietilén alquil éter ácido sulfúrico y una sal de un condensado de naftalensulfonato con formalina; surfactantes y dispersores no iónicos, tales como un éster de sorbitán y ácido graso, un éster de glicerina y ácido graso, un poliglicérido de ácido graso, un alcohol de ácido graso poliglicol éter, acetilenglicol, alcohol acetilénico, un polímero de bloques de oxialquileno, un polioxietilén alquilaril éter, un polioxietilén estirilaril éter, un polioxietilenglicol alquil éter, un éster de polioxietileno y ácido graso, un éster de polioxietilensorbitán y ácido graso, un éster de polioxietilenglicerina y ácido graso, un polioxietileno aceite de ricino hidrogenado y un éster de polioxipropileno y ácido graso; y aceites vegetales y minerales, tales como aceite de oliva, aceite de kapok, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semillas de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite de tung y parafinas líquidas. Además, también se

pueden emplear diversos aditivos comúnmente utilizados, tales como una carga, un espesante, un agente antisedimentante, un agente anticongelante, un estabilizador de la dispersión, un agente reductor de la fitotoxicidad y un agente antimohos. La proporción de mezcla de los componentes de principio activo con respecto a los diversos aditivos es normalmente de 0,005:99,995 a 95:5, preferiblemente de 0,2:99,8 a 90:10. En la aplicación real de dicha formulación, se puede usar ésta tal cual o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente, tal como agua, y se le pueden añadir diversos dispersores, según lo requiera el caso.

Entre las diversas formulaciones anteriores de la composición que ha de ser usada, cuando se formula la composición en una formulación sólida, tal como un polvo, gránulos, gránulos dispersables en agua, un polvo hidratable o gránulos hidrosolubles, o en un concentrado en suspensión, tal como un concentrado en suspensión basada en agua o un concentrado en suspensión basada en aceite, la formulación que se ha de usar tiene una excelente estabilidad.

En la composición fungicida, la razón apropiada de pesos del principio activo 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a):el ingrediente potenciador de la actividad (b) es normalmente de 1:5.000 a 2.000:1, preferiblemente de 0,05:99,95 a 90:10, más preferiblemente de 0,2:99,8 a 80:20. Por otro lado, desde el punto de vista de la estabilidad de la formulación, la razón de pesos del principio activo (a):el ingrediente potenciador de la actividad (b) que se ha de añadir es preferiblemente de 5:95 a 90:10. Considerando la estabilidad de la formulación, como el ingrediente potenciador de la actividad antes mencionado (b), se prefiere usar al menos uno seleccionado entre el grupo consistente en una amina alifática etoxilada, un agente tensoactivo de silicona, un agente tensoactivo de éster de sulfato, un polioxietilén alquil éter, un sulfosuccinato de alquilo y un alquilpoliglicósido.

En caso de usar la composición fungicida en forma de suspensión, dependiendo de su razón de pesos de formulación, la viscosidad de la suspensión aumenta y la composición no puede, por lo tanto, ser formulada cuando se añade el ingrediente potenciador de la actividad (b). Con objeto de resolver dicho problema, como reductor de la viscosidad se puede usar un alcohol bivalente, de tal modo que la formulación pueda tener una viscosidad apropiada y ser estable. El alcohol bivalente puede ser, por ejemplo, etilenglicol o propilenglicol, y se usa preferiblemente el propilenglicol. Además, el alcohol bivalente tiene también un efecto como agente anticongelante. La cantidad del alcohol bivalente que se ha de utilizar es preferiblemente de 2 a 50, más preferiblemente de 5 a 30, en razón de pesos con respecto a la formulación.

También se desvela aquí un método para controlar las enfermedades de las plantas, que consiste en aplicar la composición fungicida a las plantas agrícolas y hortícolas. La concentración de la composición fungicida no puede ser definida de una manera general, ya que varía dependiendo de las plantas del cultivo que se han de tratar, del método de aplicación, del tipo de formulación, de la dosis, etc. Sin embargo, se aplica en una concentración del principio activo 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a) normalmente de 0,1 a 10.000 ppm, preferiblemente de 1 a 2.000 ppm, en el caso del tratamiento del follaje, y normalmente de 10 a 100.000 g/ha, preferiblemente de 200 a 20.000 g/ha, en el caso del tratamiento del suelo.

Se puede aplicar la formulación que contiene la composición fungicida o un producto diluido de la misma mediante un método de aplicación comúnmente empleado, tal como dispersión (dispersión, pulverización, nebulización, atomización, difusión de granos o aplicación sobre la superficie del agua), aplicación al suelo (tal como mezcla o irrigación) o aplicación a la superficie (tal como revestimiento, revestimiento con polvo o recubrimiento). Además, también se puede aplicar mediante el así llamado volumen ultrabajo.

Por otro lado, además de 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina, la composición puede ser mezclada o usada en combinación con otros productos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes reductores de la fitotoxicidad, gracias a lo cual a veces se pueden obtener efectos o actividades más excelentes. Dichos otros productos químicos agrícolas pueden ser, por ejemplo, un herbicida, un insecticida, un acaricida, un nematocida, un pesticida de suelo, un fungicida, un agente antivírico, un atrayente, un antibiótico, una hormona de plantas y un agente regulador del crecimiento de las plantas. Especialmente, con una composición fungicida mixta que tiene 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina mezclada o usada en combinación con uno o más de otros principios activos desde el punto de vista fungicida, se pueden mejorar el rango de aplicación, el tiempo de aplicación, las actividades fungicidas, etc. en direcciones preferidas. El principio activo 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a) usado en la presente invención y el principio activo de otro fungicida pueden ser aquí formulados por separado de tal modo que se puedan mezclar para su uso en el momento de la aplicación, o pueden ser formulados juntos para su uso. La presente divulgación se relaciona también con dicha composición fungicida mixta.

La razón de mezcla entre la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoi)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina y el otro principio activo fungicida no puede ser definida de manera general, ya que varía dependiendo de las condiciones atmosféricas, de

los tipos de formulación, de los cultivos que haya que tratar, del tiempo de aplicación, del sitio de aplicación, de los tipos o del estado de germinación de los hongos nocivos, de los tipos o del estado de las enfermedades, etc., pero se encuentra normalmente en un rango de 1:300 a 300:1, preferiblemente de 1:100 a 100:1, en peso. Además, la dosis para la aplicación puede ser tal que la cantidad total de los principios activos sea de 0,1 a 50.000 g, preferiblemente de 1 a 30.000 g, por hectárea. La presente invención desvela un método para controlar hongos nocivos mediante la aplicación de dicha composición fungicida mixta.

Los principios activos de los agentes para el control de plagas de insectos, tales como insecticidas, acaricidas, nematocidas o pesticidas de suelo, en los otros productos químicos agrícolas antes mencionados incluyen, por ejemplo, (por los nombres comunes, algunos de los cuales están aún en fase de solicitud, o los códigos de ensayo) compuestos de fosfato orgánico, tales como profenofós, diclorvós, fenamifós, fenitrotión, EPN, diazinón, clorpirifós-metilo, acefato, protiofós, fostiazato, fosfocarb, cadusafós, dislufotón, clorpirifós, demetón-S-metilo, dimetoato, metamidofós, imiciafós, isoxatión, isofenfós, etión, etrimfós, quinalfós, dimetilvinfós, sulprofós, tiometón, vamidotión, piraclofós, piridafentión, pirimifós-metilo, propafós, fosadona, formotión, malatión, tetraclovinfós, clorfenvinfós, cianofós, triclorfón, metidatión, fentoato, ESP, azinfós-metilo, fentión, heptenofós, metoxiclor, paratión, monocrotofós, paratión-metilo, terbufós, fosпамидón, fosmet y forato; compuestos de carbamato, tales como carbarilo, propoxur, aldicarb, carbofurano, tiodicarb, metomilo, oxamilo, etiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfán, benfuracarb, bendiocarb, furatiocarb, isoprocarb, metolcarb, xililcarb, XMC y fenotiocarb; derivados de nereistoxina, tales como cartap, tiociclam, bensultap y tiosultap-sodio; compuestos de cloro orgánicos, tales como dicofol, tetradifón, endosulfán, dienoclor y dieldrina; compuestos metálicos orgánicos, tales como óxido de fenbutatina y cihexatina; compuestos piretroides, tales como fenvalerato, permetrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, teflutrina, etofenprox, fenpropatrina, bifentrina, ciflutrina, flucitrinato, fluvalinato, cicloprotrina, lambda-cihalotrina, piretrinas, esfenvalerato, tetrametrina, resmetrina, protrifenbuto, bifentrina, zeta-cipermetrina, acrinatrina, alfa-cipermetrina, aletrina, gamma-cihalotrina, theta-cipermetrina, tau-fluvalinato, tralometrina, proflutrina, beta-cipermetrina, beta-ciflutrina y metoflutrina; compuestos de benzoilurea, tales como diflubenzurón, clorfluazurón, teflubenzurón, flufenoxurón, lufenurón, novalurón, triflumurón, hexaflumurón, bistriflurón, noviflumuron y fluazurón; compuestos de tipo hormona juvenil, tales como metopreno, piriproxifén, fenoxicarb y diofenolán; compuestos de piridazinona, tales como piridabén; compuestos de pirazol, tales como fenpiroximato, fipronilo, tebufenpirad, etiprol, tolfenpirad, acetoprol, pirafloprol y piriprol; neonicotinoides, tales como imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, tiametoxam, clotianidina, dinotefurano y nitiazina; compuestos de hidrazina, tales como tebufenozida, metoxifenozida, cromafenozida y halofenozida; otros compuestos, tales como flonicamid, buprofezina, hexitiazox, amitraz, clordimeform, silafluofén, triazamato, pimetozina, pirimidifén, clorfenapir, indoxacarb, acequinocilo, etoxazol, ciromazina, 1,3-dicloropropeno, diafenthiurón, bencloflaz, flufenimer, piridialilo, espirodiclofen, bifenazato, espiromesifén, espirotetramat, propargita, clofentezina, fluacripirim, metaflumizona, flubendiamida, ciflumetofén, cienopirafén, clorantraniliprol, pirifluquinazón, fenazaquina, piridabén, amidoflomet, clorobenzoato, sulfluramid, hidrametilnón, metaldehído y rianodina. Además, se pueden mencionar, por ejemplo, productos químicos agrícolas microbianos, tales como *Bacillus thuringiensis* aizawai, *Bacillus thuringiensis* kurstaki, *Bacillus thuringiensis* israelensis, *Bacillus thuringiensis* japonensis, *Bacillus thuringiensis* tenebrionis, proteína cristalina insecticida producida por *Bacillus thuringiensis*, virus de insectos, hongos entomopatógenicos y hongos nematófagos; antibióticos o antibióticos semisintéticos, tales como avermectina, emamectina-benzoato, milbemectina, espinosad, ivermectina, lepimectina, espinetoram, abamectina y emamectina; productos naturales, tales como azadiractina y rotenona; y repelentes, tales como DEET. Por cierto, la frase "aún en fase de solicitud" en este párrafo o aquí a continuación significa "antes de su aprobación por la ISO (International Organization for Standardization)".

Los principios activos fungicidas en los otros productos químicos agrícolas antes mencionados incluyen, por ejemplo (por los nombres comunes, algunos de los cuales están aún en fase de solicitud, o los códigos de ensayo de la Japan Plant Protection Association), compuestos de anilinopirimidina, tales como mepanipirim, pirimetanil y ciprodinil; compuestos de piridinamina, tales como fluazinam; compuestos de azol, tales como triadimefón, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanilo, ciproconazol, tebuconazol, hexaconazol, furconazol-cis, procloraz, metconazol, epoxiconazol, tetraconazol, fumarato de oxpoconazol, sipconazol, protioconazol, triadimenol, flutriafol, difenoconazol, fluquinconazol, fenbuconazol, bromuconazol, diniconazol, tricloclazol, probenazol, simeconazol, pefurazoato, ipconazol e imibenconazol; compuestos de quinoxalina, tales como quinometionato; compuestos de ditiocarbamato, tales como maneb, zineb, mancozeb, policarbamato, metiram, propineb y tiram; compuestos de cloro orgánicos, tales como ftalida, clorotalonil y quintozeno; compuestos de imidazol, tales como benomilo, tiofanato-metilo, carbendazim, tiabendazol, fuberiazol y ciazofamid; compuestos de cianoacetamida, tales como cimoxanil; compuestos de fenilamida, tales como metalaxilo, metalaxilo-M, mefenoxam, oxadixilo, ofurace, benalaxilo, benalaxilo-M (otro nombre: kiralaxilo, quiralaxilo), furalaxilo y ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico, tales como diclofluanid; compuestos de cobre, tales como hidróxido cúprico y oxina cobre; compuestos de isoxazol, tales como himexazol; compuestos organofosforados, tales como fosetilo-Al, tolclofós-metilo, S-bencilo, O,O-diisopropilfosforotioato, O-etilo, S,S-difenilfosforoditioato y etilhidrógeno fosfonato de aluminio; edifenfós, iprobenfós, compuestos de N-halogenotioalquilo, tales como captán, captafol y folpet; compuestos de

dicarboximida, tales como procimidona, iprodiona y vinclozolina; compuestos de benzanilida, tales como flutolanilo, mepronilo, zoxamid y tiadinil; compuestos de anilida, tales como carboxina, oxicarboxina, tfluzamida, pentiopirad y boscalid; compuestos de piperazina, tales como triforina; compuestos de piridina, tales como pirifenox; compuestos de carbinol, tales como fenarimol y flutriafol; compuestos de piperidina, tales como fenpropidina; compuestos de morfolina, tales como fenpropimorf, espiroxamina y tridemorf; compuestos de organoestaño, tales como hidróxido de fentina y acetato de fentina; compuestos de urea, tales como pencicurón; compuestos de ácido cinámico, tales como dimetomorf y flumorf; compuestos de fenilcarbamato, tales como dietofencarb; compuestos de cianopirrol, tales como fludioxonil y fenpiclonil; compuestos de estrobilurina, tales como azoxistrobina, kresoxim-metilo, metominofén, trifloxistrobina, picoxistrobina, orizastrobina, dimoxistrobina, piraclostrobina, fluoxastrobina y fluacipirina; compuestos de oxazolidinona, tales como famoxadona; compuestos de tiazolcarboxamida, tales como etaboxam; compuestos de sililamida, tales como siltiofam; compuestos de amidocarbamato de aminoácido, tales como iprovalicarb y bentiavalicarb-isopropilo; compuestos de imidazolidina, tales como fenamidona; compuestos de hidroxanilida, tales como fenhexamid; compuestos de bencenosulfonamida, tales como flusulfamida; compuestos de éter de oxima, tales como diflufenamid; compuestos de fenoxiamida, tales como fenoxanil; antibióticos, tales como validamicina, kasugamicina y polioxinas; compuestos de guanidina, tales como iminocadina; y otros compuestos, tales como isoprotiolano, piroquilón, diclomezina, quinoxifén, clorhidrato de propamocarb, espiroxamina, cloropirina, dazomet, metam-sodio, nicobifén, metrafenona, UBF-307, diclocimet, proquinazid, amisulbrom (otro nombre: amibromdol), KIF-7767 (KUF-1204, piribencarb metilo, mepiricarb), Syngenta 446510 (mandipropamid, dipromandamid), fluopicolida, carpropamid, BCF051, BCM061 y BCM062.

Además, los productos químicos agrícolas que pueden ser usados en mezcla o en combinación con 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina pueden ser, por ejemplo, los principios activos en los herbicidas desvelados en Farm Chemicals Handbook (edición de 2002), en particular los del tipo de tratamiento del suelo.

Ejemplos

Se explicará ahora la presente invención con más detalle haciendo referencia a los Ejemplos.

Ejemplo de ensayo 1

Se añadieron 500 ppm del ingrediente potenciador de la actividad (b) a una solución química que contenía el principio activo (a) preparado para que hubiera de 125 a 150 ppm, y se aplicó la solución resultante a plantas de trigo en el estadio de 1 hoja cultivadas en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 9 cm. Un día antes del tratamiento anterior, se espolvorearon e inocularon las plantas de trigo y se inocularon con conidios de *Erysiphe graminis*. Después del tratamiento, se mantuvieron las plantas de trigo en una cámara de temperatura constante durante 3 a 5 días. Se volvieron a espolvorear e inocular entonces de nuevo conidios de *Erysiphe graminis*. A partir de los 7 días de la inoculación, se midió el índice de enfermedad de cada mancha por observación visual, se comparó el índice de enfermedad con plantas no tratadas y se calculó el valor del efecto preventivo. Se obtuvo el valor del efecto preventivo mediante la siguiente fórmula.

$$\text{Valor del efecto preventivo} = (\text{índice de enfermedad de cada planta} / \text{índice de enfermedad en el área no tratada}) \times 100$$

Realizando el ensayo como se ha indicado anteriormente, se obtuvo el siguiente resultado. Cuando se usaron al menos uno seleccionado entre el grupo consistente en el compuesto N° 35 y los compuestos comparativos N° 39 (4-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-2,5-dicloro-3-trifluorometilpiridina) y N° 40 (4-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-2-cloro-3-trifluorometil-5-metoxipiridina) como componente (a) y al menos uno seleccionado entre el grupo consistente en Frigate, KF-644, Adsee CE 24/19, hightenol LA-12, ATROX MBA11/8, Synperonic 91/6, LANKROPOL 4500 y AGNIQUE PG 8105-G, se obtuvo al menos un 99 del valor del efecto preventivo. Además, en caso de no usar el ingrediente potenciador de la actividad (b), el valor del efecto preventivo era de aproximadamente 80.

Ejemplo de ensayo 2

Se espolvorearon e inocularon plantas de trigo en el estadio de 1 hoja cultivadas en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 9 cm con conidios de *Erysiphe graminis*. Al día siguiente, se aplicó una solución química que contenía una concentración predeterminada del principio activo (a) y una concentración predeterminada del ingrediente potenciador de la actividad (b) en una cantidad de 200 l/ha a las "plantas tratadas". Por otro lado, las plantas que no recibieron tratamiento eran "plantas no tratadas". Se secaron al aire las plantas tratadas y, como se muestra en la Fig. 1, se pusieron las macetas de plástico 2 en el contenedor 1, se puso una planta de trigo no tratada en el centro para examinar el efecto de vapor y se dejó el contenedor en una cámara de temperatura

constante. A los 3 días, se espolvorearon e inocularon conidios de *Erysiphe graminis* sobre el contenedor. Tras la inoculación, se dejó el contenedor en una cámara de temperatura constante. A partir de los 6 días de la inoculación, se midió el índice de enfermedad de cada maceta por observación visual, se comparó el índice de enfermedad con las plantas no tratadas y se calculó el valor del efecto preventivo. Se obtuvo el valor del efecto preventivo mediante la siguiente fórmula.

$$\text{Valor del efecto preventivo} = (\text{índice de enfermedad de cada planta} / \text{índice de enfermedad en el área no tratada}) \times 100$$

El efecto directo del tratamiento es mostrado por el valor medio del efecto preventivo de las plantas (8 plantas) tratadas con la solución química. Además, el efecto de vapor es mostrado por el valor del efecto preventivo de la planta colocada en el centro.

En la Tabla 1 se muestran los ingredientes potenciadores de la actividad utilizados, y en las Tablas 2 a 4 se muestran los resultados de los ensayos.

Tabla 1

Denominación comercial	Composición	Tipo
Frigate	Etoxilato de amina de sebo (15 mol)	Amina alifática etoxilada
KF-644	Silicona modificada con poliéter	Agente tensoactivo de silicona (polioxietilenometilpolisiloxano)
Adsee CE24/19	Citrato de polioxietilén C ₁₂₋₁₄ alquil éter citrato	Agente tensoactivo de éster de citrato (citrato de polioxietilén alquil éter)
HITENOL LA-12	Polioxietileno (6 mol) lauril éter sulfato de sodio	Agente tensoactivo de éster de sulfato (sulfato de polioxietilén alquil éter)
Phosphanol ML-220	Monoéster de polioxietilén (3 mol) alquil (C ₁₃) éter y ácido fosfórico	Agente tensoactivo de éster de fosfato (fosfato de polioxietilén alquil éter)
ATLOX MBA 11/8	Etoxilato de alcohol C ₁₁ ramificado	Polioxietilén alquil éter
Synperonic 91/6	Etoxilato de alcohol	Polioxietilén alquil éter
LANKROPOL 4500	Sulfosuccinato de dioctilo	Sulfosuccinato de alquilo
AGNIQUE PG8105-G	Alquilpoliglicósido C ₈ -C ₁₀ , grado de polimerización: 1,5	Alquilpoliglicósido

Tabla 2

Se usaron 150 ppm de compuesto N° 35 como principio activo (a) y se usaron 500 ppm del ingrediente potenciador de la actividad (b)		
Tipo del ingrediente potenciador de la actividad (b) (denominación comercial)	Valor preventivo	
	Efecto directo del tratamiento	Efecto de vapor
Frigate	99,4	70
KF-644	99,4	90
Adsee CE24/19	99,4	95
HITENOL LA-12	100	95
Phosphanol ML-220	97,5	80
ATLOX MBA 11/8	100	95
Synperonic 91/6	100	95
LANKROPOL 4500	99,4	100
AGNIQUE PG8105-G	100	90
Ninguno	83,8	30

Tabla 3 (comparativa)

Se usaron 150 ppm de compuesto N° 39 como principio activo (a) y se usaron 500 ppm del ingrediente potenciador de la actividad (b)		
Tipo del ingrediente potenciador de la actividad (b) (denominación comercial)	Valor preventivo	
	Efecto directo del tratamiento	Efecto de vapor
Frigate	100	90
KF-644	86,9	80
Adsee CE24/19	99,4	100
HITENOL LA-12	96,3	90
Phosphanol ML-220	98,1	100
ATLOX MBA 11/8	98,8	100
Synperonic 91/6	96,9	80
LANKROPOL 4500	99,4	95
AGNIQUE PG8105-G	97,5	100
Ninguno	83,1	40

Tabla 4 (comparativa)

5

Se usaron 150 ppm de compuesto N° 40 como principio activo (a) y se usaron 500 ppm del ingrediente potenciador de la actividad (b)		
Tipo del ingrediente potenciador de la actividad (b) (denominación comercial)	Valor preventivo	
	Efecto directo del tratamiento	Efecto de vapor
Frigate	93,1	0
KF-644	100	50
Adsee CE24/19	95,6	30
HITENOL LA-12	98,8	20
Phosphanol ML-220	100	60
ATLOX MBA 11/8	98,1	40
Synperonic 91/6	98,8	20
LANKROPOL 4500	100	80
AGNIQUE PG8105-G	96,9	10
Ninguno	70,6	10

Ejemplo de formulación 1

- 10 (1) Principio activo (a) 28,1 partes en peso
 (2) Dispersante, Morwet D-425 (denominación comercial, fabricado por LION AKZO CO., LTD.) 1,8 partes en peso
 (3) Dispersante, SANX C (denominación comercial, fabricado por Nippon Paper Chemicals Co., Ltd.) 1,8 partes en peso
 15 (4) Dispersante Tersperse 2500 (denominación comercial, fabricado por HUNTSMAN) 4,4 partes en peso
 (5) Agente antiespumante, Rhodorsill 432 (denominación comercial, fabricado por Rhodia NICCA) 0,4 partes en peso
 (6) Agente anticongelante, propilenglicol 4,4 partes en peso
 (7) Dispersante/suspensión, Veegum R (denominación comercial, fabricado por Sanyo Chemical Industries, Ltd.) 0,3 partes en peso
 20 (8) Espesante, Rhodopol 23 (denominación comercial, fabricado por Rhodia NICCA) 0,1 parte en peso
 (9) Agente antimohos, Proxel GXL (denominación comercial, Avesia) 0,1 parte en peso
 (10) Agua 58,6 partes en peso

25 Se mezclaron los anteriores (1) a (7) y (10) y se pulverizó la mezcla en húmedo, de tal modo que el tamaño medio de partícula del principio activo (a) fuera de 2 µm. Se añadieron entonces (8) y (9) y se agitó la mezcla, para obtener una suspensión. Se añadieron 10 partes en peso del ingrediente potenciador de la actividad (b) a 90 partes en peso de la suspensión y se mezclaron, para obtener un producto en suspensión acuosa.

Ejemplo de formulación 2

- (1) Principio activo (a) 25,3 partes en peso
- (2) Dispersante, Morwet D-425 1,6 partes en peso
- (3) Dispersante, SANX C 1,6 partes en peso
- (4) Dispersante, Tersperse 2500 4 partes en peso
- (5) Agente antiespumante, Rhodorsil 432 0,4 partes en peso
- (6) Agente anticongelante, propilenglicol 4 partes en peso
- (7) Dispersante/suspensión, Veegum R 0,3 partes en peso
- (8) Espesante, Rhodopol 23 0,1 parte en peso
- (9) Agente antimohos, Proxel GXL 0,1 parte en peso
- (10) Agua 52,6 partes en peso
- (11) Ingrediente potenciador de la actividad (b) 10 partes en peso

Se mezclaron los anteriores (1) a (7) y (10) y se pulverizó la mezcla en húmedo, de tal modo que el tamaño medio de partícula del principio activo (a) fuera de 2 μm . Se añadieron entonces (8), (9) y (11) y se agitó la mezcla, para obtener un producto en suspensión acuosa.

Ejemplos de formulación 3 a 7

Se mezclaron y se pulverizaron en húmedo los componentes respectivos mostrados en la Tabla 5 de tal manera que el tamaño medio de partícula del principio activo (a) fuera de 1 μm , para obtener un producto en suspensión acuosa.

Tabla 5

Ejemplo de formulación Componentes de la formulación	Cantidades de mezcla de los componentes respectivos en cada Ejemplo de Formulación (partes en peso)				
	3	4	5	6	7
Principio activo (a)	18,1	18,1	17,7	17,7	5,2
Soprophor FLK/70	2,8	2,8	2,8	2,8	3,0
Morwet D-425	2,8	2,8	2,8	2,8	3,0
Agente antiespumante, Rhodorsil 432	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Ingrediente potenciador de la actividad (b)	8,3	8,3	8,3	8,3	74,6
Rhodopol 23	0,1	0,1	0,1	0,1	0
Proxel GXL	0,1	0,1	0,1	0,1	0
Propilenglicol	9,3	18,6	18,6	23,3	10
Agua	58,0	48,7	49,1	44,4	3,7

Ejemplo comparativo

Se trató de preparar una suspensión acuosa del mismo modo que en los Ejemplos de formulación 3 a 7 usando 5,2 partes en peso del principio activo (a), 3,0 partes en peso de Soprophor FLK/70, 3,0 partes en peso de Morwet D-425, 0,5 partes en peso de agente antiespumante, Rhodorsil 432, 74,6 partes en peso del ingrediente potenciador de la actividad (b) y 13,7 partes en peso de agua. Sin embargo, la mezcla se solidificó y no pudo ser formulada.

Ejemplo de ensayo de formulación 1

En el caso en el que, en el Ejemplo de ensayo de formulación 3, se usaron el compuesto N° 35 y los compuestos comparativos Nos. 39 y 40 como principio activo (a) y se usaron nueve tipos de los ingredientes potenciadores de la actividad mostrados en la Tabla 1 en el Ejemplo de ensayo 2 como ingrediente potenciador de la actividad (b), la viscosidad era de aproximadamente 800 mPa·S.

Ejemplo de ensayo de formulación 2

En el caso en el que, en los Ejemplos de ensayo de formulación 4 ó 5, se usaron el compuesto N° 35 y los compuestos comparativos N° 39 y N° 40 como principio activo (a) y se usaron nueve tipos de los ingredientes potenciadores de la actividad mostrados en la Tabla 1 en el Ejemplo de ensayo 2 como ingrediente potenciador de la actividad (b), la viscosidad era de aproximadamente 350 mPa·S.

Ejemplo de ensayo de formulación 3

- 5 En el caso en el que, en el Ejemplo de ensayo de formulación 6, se usaron el compuesto N° 35 y los compuestos comparativos N° 39 y N° 40 como principio activo (a) y se usaron nueve tipos de los ingredientes potenciadores de la actividad mostrados en la Tabla 1 en el Ejemplo de ensayo 2 como ingrediente potenciador de la actividad (b), la viscosidad era de aproximadamente 150 mPa·S.

Ejemplo de ensayo de formulación 4

- 10 En el caso en el que, en el Ejemplo de ensayo de formulación 7, se usaron el compuesto N° 35 y los compuestos comparativos N° 39 y N° 40 como principio activo (a) y se usaron nueve tipos de los ingredientes potenciadores de la actividad mostrados en la Tabla 1 en el Ejemplo de ensayo 2 como ingrediente potenciador de la actividad (b), la viscosidad era de aproximadamente 100 mPa·S.

15 **Aplicabilidad industrial**

La composición fungicida de la presente invención tiene un efecto estable y altamente preventivo sobre cultivos infectados con una enfermedad de las plantas, y es posible prevenir las enfermedades de las plantas.

REIVINDICACIONES

1. Un método para mejorar el efecto fungicida con objeto de controlar las enfermedades de las plantas de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina añadiendo al menos un ingrediente potenciador de la actividad seleccionado entre el grupo consistente en una amina alifática etoxilada, un agente tensoactivo de silicona, un agente tensoactivo de éster de citrato, un agente tensoactivo de éster de sulfato, un agente tensoactivo de éster de fosfato, un polioxietilén alquil éter, un sulfosuccinato de alquilo y un alquilpoliglicósido.
2. Un método para mejorar el efecto de vapor de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina añadiendo al menos un ingrediente potenciador de la actividad seleccionado entre el grupo consistente en una amina alifática etoxilada, un agente tensoactivo de silicona, un agente tensoactivo de éster de citrato, un agente tensoactivo de éster de sulfato, un agente tensoactivo de éster de fosfato, un polioxietilén alquil éter, un sulfosuccinato de alquilo y un alquilpoliglicósido.
3. El método según la Reivindicación 1 ó 2, donde la razón de pesos de mezcla de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a) con respecto al ingrediente potenciador de la actividad (b) es de 1:5.000 a 2.000:1.
4. El método según cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, donde la mezcla de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a) y el ingrediente potenciador de la actividad (b) está en forma de una formulación sólida.
5. El método según cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 3, donde la mezcla de la 3-(2,3,4-trimetoxi-6-metilbenzoil)-5-cloro-2-metoxi-4-metilpiridina (a) y el ingrediente potenciador de la actividad (b) está en forma de una formulación en suspensión.
6. El método según la Reivindicación 5, donde se usa un alcohol bivalente como reductor de la viscosidad.

Fig. 1

