

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 712 668**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/40** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **31.12.2013 PCT/US2013/078511**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.07.2014 WO14106254**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **31.12.2013 E 13867933 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.11.2018 EP 2938193**

54 Título: **Composiciones fungicidas sinérgicas**

30 Prioridad:

**31.12.2012 US 201261747475 P**

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

**14.05.2019**

73 Titular/es:

**DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)  
9330 Zionsville Road  
Indianapolis, US**

72 Inventor/es:

**OUIMETTE, DAVID G.;  
MANN, RICHARD K.;  
MATHIESON, JOHN T. y  
DASILVA, OLAVO CORREA**

74 Agente/Representante:

**SÁEZ MAESO, Ana**

**ES 2 712 668 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).

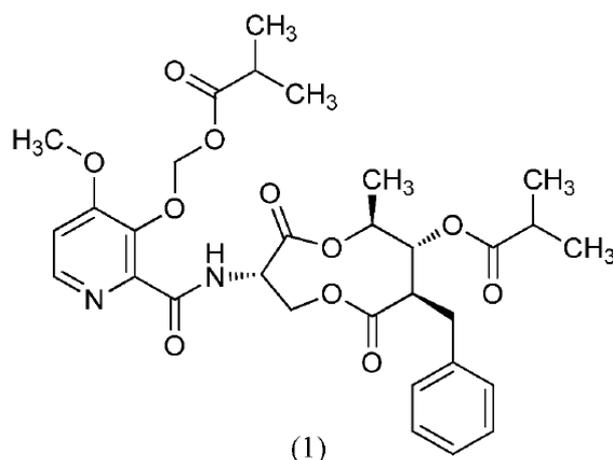
## DESCRIPCIÓN

Composiciones fungicidas sinérgicas

## 5 Campo de la invención

Esta invención se refiere a una composición fungicida sinérgica que contiene una cantidad fungicida eficaz de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol, kasugamicina y boscalid.

10



Antecedentes y resumen de la invención

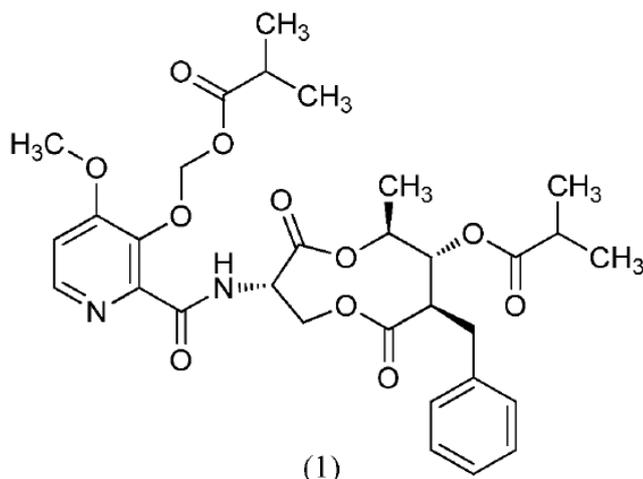
15 El arroz es el cultivo alimentario básico para una gran parte de la población humana en el mundo de hoy. Una falla en los cultivos, por cualquier razón, representa una amenaza real de inanición. El añublo del arroz, provocada por un hongo (*Magnaporthe oryzae*; anamorph: *Pyricularia oryzae*) es, con mucho, la enfermedad más importante de las muchas enfermedades que atacan el arroz. El hongo provoca la formación de lesiones en hojas, tallos, pedúnculos, panículas, semillas e incluso raíces. Tan grande es la amenaza potencial para el fracaso de los cultivos de esta enfermedad que se ha clasificado entre las enfermedades de las plantas más importantes de todas. El hongo del añublo del arroz se encuentra dondequiera que se cultiva el arroz y es una gran amenaza. Se estima que cada año se destruye suficiente arroz para alimentar a más de 60 millones de personas. Los fracasos de cultivos de arroz completos han resultado directamente de las epidemias del añublo del arroz. Existe la necesidad de agentes más efectivos para proteger las plantas, incluido el arroz, del daño provocado por este patógeno.

25 Los fungicidas son compuestos, de origen natural o sintético, que actúan para proteger a las plantas contra el daño provocado por los hongos. Los métodos actuales de la agricultura dependen en gran medida del uso de fungicidas. De hecho, algunos cultivos no pueden cultivarse de manera útil sin el uso de fungicidas. El uso de fungicidas permite a un productor aumentar el rendimiento y la calidad del cultivo y, en consecuencia, aumentar el valor del cultivo. En la mayoría de las situaciones, el aumento en el valor del cultivo vale por lo menos tres veces el costo del uso del fungicida.

35 Desafortunadamente, ningún fungicida es útil en todas las situaciones y el uso repetido de un solo fungicida frecuentemente conduce al desarrollo de resistencia a eso y fungicidas relacionados. En consecuencia, se están realizando investigaciones para producir fungicidas y combinaciones de fungicidas que sean más seguros, que tengan un mejor rendimiento, que requieran dosis más bajas, que sean más fáciles de usar y que cuesten menos. También se están estudiando combinaciones que producen sinergismo, es decir, la actividad de dos o más compuestos excede las actividades de los compuestos cuando se usan solos.

40 Es un objeto de esta invención proporcionar composiciones sinérgicas que comprenden compuestos fungicidas. Un objeto adicional de esta invención es proporcionar procesos que utilicen estas composiciones sinérgicas.

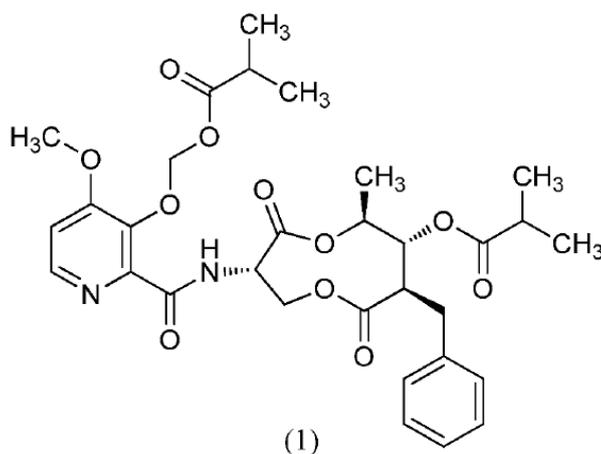
45 En una realización, la invención se refiere a una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol, kasugamicina y boscalid.



Ventajosamente, las composiciones sinérgicas que comprenden triciclazol, probenazol, carpropamida y/o kasugamicina con Fórmula I son capaces de prevenir o curar, o ambas, la enfermedad del arroz provocada por, por ejemplo, *Magnaporthe oryzae*. De manera similar, las composiciones sinérgicas que comprenden boscalid con la Fórmula I son capaces de prevenir o curar, o ambas, la enfermedad del arroz provocada por una amplia gama de hongos que incluyen, por ejemplo, Basidiomycetes y/o Ascomycetes. De acuerdo con esta invención, se proporcionan composiciones sinérgicas junto con métodos para su uso.

#### 10 Descripción detallada de la invención

La presente invención se refiere a una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol, kasugamicina de acuerdo con la reivindicación 1, y una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de la Fórmula I y boscalid de acuerdo con la reivindicación 6.



20 Como se usa en este documento, el término "cantidad eficaz como fungicida" es sinónimo de la frase "cantidad eficaz para controlar o reducir los hongos" y se usa en relación con una composición fungicida en una cantidad que matará o inhibirá materialmente el crecimiento, la proliferación, la división, reproducción, o propagación de hongos.

25 Triciclazol es el nombre común para 5-metil-1,2,4-triazolo[3,4-b]benzotiazol. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. El triciclazol es un fungicida comercial utilizado para controlar el añublo del arroz.

30 La azoxistrobina es el nombre común para el metil (αE)-2-[[6-(2-cianofenoxi)-4-pirimidinil]oxi]-α-(metoximetileno) bencenoacetato. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. La azoxistrobina controla una variedad de patógenos a tasas de aplicación entre 100 y 375 gramos/hectárea (g/ha).

Carpropamida es el nombre común de 2,2-dicloro-N-[1-(4-clorofenil)etil]-1-etil-3-metilciclopropanocarboxamida. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. Carpropamida es un fungicida comercial utilizado para controlar el añublo del arroz.

Probenazol es el nombre común de 3-(2-propenilo)-1,2-bencisotiazol 1,1-dióxido. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. El probenazol es el ingrediente activo de Orzymate, un agroquímico que se usa para controlar el añublo del arroz. El probenazol es un “activador de plantas” que protege las plantas al activar sus mecanismos de defensa.

Kasugamicina es el nombre común para 3-O-[2-amino-4-[(carboxilminometil)amino]-2,3,4,6-tetraoxi- $\alpha$ -D-arabino-hexopiranosil]-D-quiró-inositol. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. La kasugamicina es un antibiótico aminoglucósido producido por una bacteria del género *Streptomyces*, que se usa como fungicida para controlar el añublo del arroz, así como las infecciones bacterianas.

Boscalid es el nombre común para 2-cloro-N-(4'-cloro[1,1'-bifenil]-2-il)-3-piridinacarboxamida. Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, Decimocuarta edición, 2006. Boscalid proporciona control de mildiu pulverulento, *Alternaria* spp., *Botrytis* spp., *Sclerotinia* spp. y *Monilia* spp. en una gama de frutas y verduras.

En la composición de esta invención, la relación en peso del compuesto de Fórmula I a triciclazol en la que el efecto fungicida es sinérgico se encuentra dentro del intervalo de entre 1:20 y 4:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a carpropamida a la cual el efecto fungicida es sinérgico se encuentra dentro del rango de entre 1:20 y 4:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a probenazol en el que el efecto fungicida es sinérgico se encuentra dentro del rango de entre 1:125 y 1:2. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a kasugamicina en la que el efecto fungicida es sinérgico se encuentra dentro del intervalo de entre 1:250 y 1:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a boscalid en el que el efecto fungicida es sinérgico se encuentra dentro del rango de entre 1:1000 y 1:60.

La tasa a la que se aplica la composición sinérgica dependerá de la composición específica, el tipo particular de hongo que se va a controlar, el grado de control requerido y el momento y/o el método de aplicación. En general, la composición de la invención se puede aplicar a una tasa de aplicación de entre aproximadamente 50 gramos por hectárea (g/ha) y aproximadamente 2300 g/ha en base a la cantidad total de ingredientes activos en la composición. En general, el triciclazol se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. La azoxistrobina se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. carpropamida puede aplicarse a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha y el compuesto de Fórmula I puede aplicarse a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. El probenazol se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 200 g/ha y aproximadamente 400 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. La Kasugamicina se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 200 g/ha y aproximadamente 400 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una tasa entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 300 g/ha.

Los componentes de la mezcla sinérgica de la presente invención se pueden aplicar por separado o como parte de un sistema fungicida multiparte.

La mezcla sinérgica de la presente invención se puede aplicar junto con uno o más fungicidas para controlar una variedad más amplia de enfermedades indeseables. Cuando se usan junto con otro(s) fungicida(s), los compuestos actualmente reivindicados pueden formularse con el otro(s) fungicida(s), mezclarse en el tanque con el(los) otro(s) fungicida(s) o aplicarse secuencialmente con el otro(s) fungicida(s). Dichos otros fungicidas pueden incluir 2-(tiocianatometil)-benzotiazol, 2-fenilfenol, 8-hidroxiquinolina sulfato, ametocradina, amisulbrom, antimicina, *Ampelomyces quisqualis*, azaconazol, azoxistrobina, *Bacillus subtilis*, *Bacillus subtilis* cepa QST713, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb-isopropilo, bencilaminobenzenosulfonato (BABS) sal, bicarbonatos, bifenilo, bismerotiazol, bitertanol, bixafeno, blastidina-S, bórax, mezcla de Burdeos, boscalid, bromuconazol, bupirimate, polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbendazim, carboxin, carpropamida, carvona, clazafenona, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, *Coniothyrium minitans*, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido cuproso, cazofamida, ceflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, etilenobis (ditiocarbamato) de diamonio, diclofluanida, diclorofeno, diclocimet, diclomezini, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, ion difenzoquat, diflufometorim, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinobuton, dinocap, difenilamina, dithianon, dodemorf, acetato de dodemorf, dodina, base libre de dodina, edifenfos, enestrobina, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquina, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, fenpirazamina, fentina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, formaldehído, fosetilo, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, guazatina acetatos, GY-81, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, tris (albesilato) de iminoctadina, yodocarb, ipconazol, ipfenpirazolona, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotilolano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, hidrato de hidrocloreuro de kasugamicina, kresoximmetilo, laminarin, mancopper, mancozeb, mandipropamid, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, meptil-dinocap, cloruro de mercurio, óxido de mercurio, cloruro de mercurio, metalaxilo, metalaxil-M, metam, metam-amonio, metampotásico,

5 metam-sodio, metconazol, metasulfocarb, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metominostrobina, metrafenona, mildiomicina, miclobutanilo, nabam, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octilinona, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobina, oxadixilo, oxina-cobre, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, penciacurón, penflufen, pentaclorofenol, pentaclorofenil laurato, pentiopiradio, acetato de fenilmercurio, fosfónico  
 10 ácido, ftalida, picoxistrobina, polioxina B, polioxinas, polioxorim, bicarbonato de potasio, hidroxiquinolina de potasio sulfato, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piracllostrobina, piramostostrobina, piroxiestrobina, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, pirriofenona, piroquilon, quinoclamina, quinoxifen, quitozeno, extracto de Reynoutria sachalinensis, sedaxano, siltiofam, simeconazol, 2-fenilfenóxido de sodio, bicarbonato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, espiroxamina, azufre, SYP-Z048, aceites de alquitrán, tebuconazol, tebufloquina, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo, tolilfluanida, triadimefón, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxystrobin, triflumizole, triforina, triticonazol, validamicina, valifenalato, valifenal, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, Candida oleophila, Fusarium oxysporum, Gliocladium spp., Phlebiopsis gigantea, Streptomyces griseoviridis, Trichoderma spp., (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano, 1,3- Hidrato de dicloro-1,1,3,3-tetrafluoroacetona, 1-cloro-2,4-dinitronaftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 2- (2-heptadecil-2-imidazolin-1-il)etanol, 2,3-dihidro-5-fenil-1,4-diti-ina 1,1,4,4-tetraóxido, acetato de 2-metoxietilmercurio, 2- cloruro de metoxietilmercurio, silicato de 2-metoxietilmercurio, 3-(4-clorofenil) -5-metilrodanina, 4-(2-nitropropilo)1-enil) fenil tiocianateme, ampropilfos, anilazina, azitiram, polisulfuro de bario, Bayer 32394, benodanilo, benquinox, bentalurón, benzamacril; benzamacril-isobutil, benzamorf, binapacril, bis(metilmercurio) sulfato, óxido de bis(tributilestaño), buthiobato, cadmio, calcio, cobre, zinc, sulfato, carbamorf, CECA, clobentiazona, cloraniformetano, clorfenazol, clorquinox, climbazol, bis(3-fenilsalicilato) de cobre, cromato de zinc y cobre, cufraneb, hidrazinio cúprico sulfato, cuprobam, ciclafuramid, cipendazol, ciprofuram, decafentina, diclon, diclozolina, diclobutrazol, dimetirimol, dinocron, dinosulfon, dinoterbon, dipritiona, ditalimfos, dodicina, drazoxolon, EBP, ESBP, etaconazol, etem, etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropan, fluotrimazol, furcarbanilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, furofanata, gliodina, griseofulvin, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858, isopamfos, isovalediona, mebenilo, mecarbinzid, metazoxolon, methuroxam, metilmercurio y diciandiamida, metsulfovax, milneb, anhídrido mucoclórico, miclozolina, N-3,5-diclorofenil-succinimida, N-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, N-etilmercurio-4-toluensulfonaniilida, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, OCH, dimetilditiocarbamato de fenilmercurio, nitrato de fenilmercurio, fosdifeno, protiocarb; clorhidrato de protiocarb, piracarbólida, piridinitrilo, piroxicloro, piroxifur, quinacetol; quinacetol sulfato, quinazamida, quinconazol, rabenzazol, salicilanilida, SSF-109, sultropeno, tecoram, tiadifluor, ticocefeno, tiochlorfenphim, tiophanate, tioquinox, tioximid, triamifos, triarimol, triazbutil, triclamida, urbacida, zarilamida, y cualquier combinación de los mismos.

35 Las composiciones de la presente invención se aplican preferiblemente en forma de una formulación que comprende una composición de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol, kasugamicina y boscalid, junto con un portador fitológicamente aceptable si se desea.

40 Las formulaciones concentradas se pueden dispersar en agua, u otro líquido, para la aplicación, o las formulaciones pueden ser similares al polvo o granulares, que luego se pueden aplicar sin tratamiento adicional. Las formulaciones se preparan de acuerdo con procedimientos que son convencionales en la técnica química agrícola, pero que son novedosas e importantes debido a la presencia en el mismo de una composición sinérgica.

45 Las formulaciones que se aplican con mayor frecuencia son suspensiones o emulsiones acuosas. Estas formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua o emulsionables son sólidos, generalmente conocidos como polvos humectables, o líquidos, conocidos generalmente como concentrados emulsionables, suspensiones acuosas o concentrados en suspensión. La presente invención contempla todos los vehículos mediante los cuales las composiciones sinérgicas pueden formularse para suministro y uso como un fungicida.

50 Como se apreciará fácilmente, se puede usar cualquier material al que se puedan agregar estas composiciones sinérgicas, siempre que proporcionen la utilidad deseada sin interferencia significativa con la actividad de estas composiciones sinérgicas como agentes antifúngicos.

55 Los polvos humectables, que pueden compactarse para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima de la composición sinérgica, un portador y tensioactivos aceptables desde el punto de vista agrícola. La concentración de la composición sinérgica en el polvo humectable es generalmente de aproximadamente 10% a aproximadamente 90% en peso, más preferiblemente de aproximadamente 25% a aproximadamente 75% en peso, basado en el peso total de la formulación. En la preparación de formulaciones de polvos humectables, la composición sinérgica se puede combinar con cualquiera de los sólidos finamente divididos, tales como profilita, talco, tiza, yeso, tierra de Fuller, bentonita, attapulgita, almidón, caseína, gluten, arcillas de montmorillonita, tierras de diatomeas, silicatos purificados o similares. En tales operaciones, el vehículo finamente dividido se muele o se mezcla con la composición sinérgica en un disolvente orgánico volátil. Los tensioactivos eficaces, que comprenden de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% en peso del polvo humectable, incluyen ligninas sulfonadas, naftalenosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquilsulfatos y tensioactivos no iónicos, tales como aductos de óxido de etileno de alquifenoles.

65

Los concentrados emulsionables de la composición sinérgica comprenden una concentración conveniente, tal como de aproximadamente 10% a aproximadamente 50% en peso, en un líquido adecuado, basado en el peso total de la formulación de concentrado emulsionable. Los componentes de las composiciones sinérgicas, conjunta o separadamente, se disuelven en un portador, que es un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolventes orgánicos inmiscibles en agua y emulsionantes. Los concentrados pueden diluirse con agua y aceite para formar mezclas de pulverización en forma de emulsiones de aceite en agua. Los disolventes orgánicos útiles incluyen compuestos aromáticos, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alto punto de ebullición del petróleo, como la nafta aromática pesada. También se pueden usar otros disolventes orgánicos, tales como, por ejemplo, disolventes terpénicos, que incluyen derivados de colofonia, cetonas alifáticas, como ciclohexanona, y alcoholes complejos, como el 2-etoxietanol.

Los emulsionantes que se pueden emplear ventajosamente en el presente documento pueden determinarse fácilmente por los expertos en la técnica e incluyen diversos emulsionantes no iónicos, aniónicos, catiónicos y anfóteros, o una mezcla de dos o más emulsionantes. Los ejemplos de emulsionantes no iónicos útiles en la preparación de concentrados emulsionables incluyen los éteres de polialquilenglicol y productos de condensación de alquil y arilfenoles, alcoholes alifáticos, aminas alifáticas o ácidos grasos con óxido de etileno, óxidos de propileno tales como los alquil fenoles etoxilados y ésteres carboxílicos solubilizados con el poliol o polioxilalquileo. Los emulsionantes catiónicos incluyen compuestos de amonio cuaternario y sales de aminas grasas. Los emulsionantes aniónicos incluyen las sales solubles en aceite (por ejemplo, calcio) de ácidos alquilarilsulfónicos, sales solubles en aceite o éteres de poliglicol sulfatados y sales apropiadas de éter de poliglicol fosfatado.

Líquidos orgánicos representativos que pueden emplearse para preparar los concentrados emulsionables de la presente invención son los líquidos aromáticos tales como fracciones de xileno, propilbenceno; o fracciones mixtas de naftaleno, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos, tales como ftalato de dioctilo; queroseno; amidas de dialquilo de diversos ácidos grasos, particularmente las dimetil amidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como el n-butil éter, etil éter o metil éter de dietilenglicol y el metil éter de trietilenglicol. Las mezclas de dos o más líquidos orgánicos a menudo también se emplean adecuadamente en la preparación del concentrado emulsionable. Los líquidos orgánicos preferidos son xileno y fracciones de propilbenceno, siendo el más preferido el xileno. Los agentes dispersantes tensioactivos se emplean habitualmente en formulaciones líquidas y en una cantidad de 0,1 a 20 por ciento en peso del peso combinado del agente dispersante con las composiciones sinérgicas. Las formulaciones también pueden contener otros aditivos compatibles, por ejemplo, reguladores del crecimiento de las plantas y otros compuestos biológicamente activos utilizados en la agricultura.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de uno o más compuestos insolubles en agua, dispersados en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 70% en peso, basado en el peso total de la formulación de suspensión acuosa. Las suspensiones se preparan moliendo finamente los componentes de la combinación sinérgica, ya sea juntos o por separado, y mezclando vigorosamente el material molido en un vehículo compuesto de agua y surfactantes elegidos de los mismos tipos mencionados anteriormente. También se pueden agregar otros ingredientes, como las sales inorgánicas y las gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y la viscosidad del vehículo acuoso. A menudo es más efectivo moler y mezclar al mismo tiempo al preparar la mezcla acuosa y homogeneizarla en un implemento como un molino de arena, un molino de bolas o un homogeneizador de tipo pistón.

La composición sinérgica también se puede aplicar como formulación granular, que es particularmente útil para aplicaciones en el suelo. Las formulaciones granulares contienen generalmente de aproximadamente el 0,5% a aproximadamente el 10% en peso de los compuestos, basado en el peso total de la formulación granular, dispersada en un vehículo que consiste total o en gran parte de attapulgita, bentonita, diatomita, arcilla o una sustancia barata similar. Dichas formulaciones se preparan generalmente disolviendo la composición sinérgica en un disolvente adecuado y aplicándola a un vehículo granular que se ha preformado al tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Dichas formulaciones también pueden prepararse haciendo una masa o pasta del vehículo y la composición sinérgica, y triturando y secando para obtener la partícula granular deseada.

Los polvos que contienen la composición sinérgica se preparan simplemente mezclando íntimamente la composición sinérgica en forma de polvo con un vehículo agrícola polvoriento adecuado, tal como, por ejemplo, arcilla de caolín, roca volcánica molida y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente el 1% a aproximadamente el 10% en peso de la combinación sinérgica de composición/vehículo.

Las formulaciones pueden contener surfactantes adyuvantes aceptables en la agricultura para mejorar la deposición, la humectación y la penetración de la composición sinérgica en el cultivo y el organismo objetivo. Estos tensioactivos adyuvantes pueden emplearse opcionalmente como un componente de la formulación o como una mezcla de tanque. La cantidad de surfactante adyuvante variará de 0.01 por ciento a 1.0 por ciento v/v basado en un volumen de rociado de agua, preferiblemente de 0.05 a 0.5 por ciento. Los tensioactivos adyuvantes adecuados incluyen nonilfenoles etoxilados, alcoholes sintéticos o naturales etoxilados, sales de los ésteres o ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales.

Las formulaciones pueden incluir opcionalmente combinaciones que pueden comprender al menos 1% en peso de una o más de las composiciones sinérgicas con otro compuesto pesticida. Dichos compuestos pesticidas adicionales pueden ser fungicidas, insecticidas, nematocidas, miticidas, artropodocidas, bactericidas o combinaciones de los mismos que sean compatibles con las composiciones sinérgicas de la presente invención en el medio seleccionado para la aplicación, y no antagónicos a la actividad de los presentes compuestos. Por consiguiente, en tales realizaciones, el otro compuesto pesticida se emplea como un tóxico suplementario para el mismo o para un uso pesticida diferente. El compuesto pesticida y la composición sinérgica pueden mezclarse generalmente en una relación en peso de 1:100 a 100:1.

La presente invención incluye dentro de su alcance métodos para el control o prevención del ataque de hongos. Estos métodos comprenden la aplicación al lugar del hongo, o al lugar en el que se debe prevenir la infestación (por ejemplo, la aplicación a las plantas de arroz), una cantidad fungicida de la composición sinérgica. La composición sinérgica es adecuada para el tratamiento de varias plantas a niveles fungicidas, mientras que exhibe baja fitotoxicidad. La composición sinérgica es útil de una manera protectora o errática. La composición sinérgica se puede aplicar por cualquiera de una variedad de técnicas conocidas, ya sea como la composición sinérgica o como una formulación que comprende la composición sinérgica. Por ejemplo, las composiciones sinérgicas pueden aplicarse a las raíces, semillas o follaje de las plantas para el control de diversos hongos, sin dañar el valor comercial de las plantas. La composición sinérgica se puede aplicar en forma de cualquiera de los tipos de formulación generalmente utilizados, por ejemplo, como soluciones, polvos, polvos humectables, concentrados fluidos o concentrados emulsionables. Estos materiales se aplican convenientemente de diversas maneras conocidas.

Se ha encontrado que la composición sinérgica tiene un efecto fungicida significativo, particularmente para uso agrícola. La composición sinérgica es particularmente efectiva para el uso con cultivos agrícolas y plantas hortícolas. En particular, las composiciones sinérgicas que comprenden triciclazol, probenazol, carpropamida y/o kasugamicina con Fórmula I son capaces de prevenir o curar, o ambas, la enfermedad del arroz provocada por, por ejemplo, *Magnaporthe oryzae*. De manera similar, las composiciones sinérgicas que comprenden boscalid con la Fórmula I son capaces de prevenir o curar, o ambas, la enfermedad del arroz provocada por una amplia gama de hongos que incluyen, por ejemplo, Basidiomycetes y/o Ascomycetes.

Las composiciones sinérgicas tienen un amplio rango de eficacia como fungicida. La cantidad exacta de la composición sinérgica a aplicar depende no solo de las cantidades relativas de los componentes, sino también de la acción particular deseada, las especies de hongos a controlar y la etapa de crecimiento de los mismos, así como la parte de la planta u otro producto a contactar con la composición sinérgica. Por lo tanto, las formulaciones que contienen la composición sinérgica pueden no ser igualmente efectivas en concentraciones similares o contra la misma especie fúngica.

Las composiciones sinérgicas son eficaces en el uso con plantas en una cantidad inhibidora de la enfermedad y fitológicamente aceptable. El término "inhibidor de la enfermedad y cantidad fitológicamente aceptable" se refiere a una cantidad de la composición sinérgica que mata o inhibe la enfermedad de la planta para la cual se desea el control, pero no es significativamente tóxica para la planta. Esta cantidad generalmente será de aproximadamente 1 a aproximadamente 1000 ppm, prefiriéndose de aproximadamente 2 a aproximadamente 500 ppm. La concentración exacta de la composición sinérgica requerida varía con la enfermedad fúngica que se va a controlar, el tipo de formulación empleado, el método de aplicación, la especie de planta particular, las condiciones climáticas y similares. Una tasa de aplicación adecuada para la composición sinérgica suele corresponder a aproximadamente 0,10 a aproximadamente 4 libras/acre (aproximadamente 0,1 a 0,45 gramos por metro cuadrado g/m<sup>2</sup>).

Las presentes composiciones se pueden aplicar a hongos o a su lugar mediante el uso de pulverizadores de tierra convencionales, aplicadores de gránulos y por otros medios convencionales conocidos por los expertos en la técnica.

Los siguientes ejemplos se proporcionan para ilustrar adicionalmente la invención. No deben interpretarse como limitantes de la invención.

#### Ejemplos

Prueba 1. Evaluación de la actividad protectora de las mezclas de fungicidas vs. Añublo del arroz provocada por *Magnaporthe oryzae*; Anamorfo: *Pyricularia oryzae*.

Para los estudios de mezcla con compuesto de Fórmula I: los tratamientos consistieron en fungicidas, incluido un compuesto de Fórmula I, triciclazol, azoxistrobina, carpropamida, probenazol, kasugamicina y boscalid, aplicados individualmente o como mezclas de dos vías con un compuesto de Fórmula I. Los grados técnicos de los materiales se disolvieron en acetona para obtener soluciones madre, que luego se utilizaron para realizar diluciones triples en acetona para cada componente fungicida individual o para las mezclas de dos vías. Las tasas de fungicidas deseadas se obtuvieron después de mezclar las diluciones con nueve volúmenes de agua que contenían 110 partes por millón (ppm) de Triton X-100. Se aplicaron soluciones de fungicida de diez ml a seis macetas de plantas utilizando un pulverizador automático de cabina, que utilizaba dos boquillas de aspersion JAUPM 6218-1/4 que operaban a 20 libras por pulgada cuadrada (psi) colocadas en ángulos opuestos para cubrir ambas superficies foliares. Todas las plantas

5 pulverizadas se dejaron secar al aire antes de su posterior manipulación. Las plantas de control se pulverizaron de la misma manera con el blanco de disolvente. Un día después de la aplicación del compuesto, las plantas se inocularon con una suspensión de esporas de *M. oryzae* ( $1 \times 10^6$  esporas/ml) y luego se colocaron en una habitación de rocío de 22°C durante 2 días para permitir que se produjera la infección. Las plantas se trasladaron luego a un invernadero mantenido a 24°C durante 8 días para permitir que se desarrollaran los síntomas de la enfermedad.

10 Cuando la enfermedad alcanzó un 40 a 100% en las plantas de control, los niveles de infección se evaluaron visualmente en las plantas tratadas y se calificaron en una escala de 0 a 100 por ciento. El porcentaje de control de la enfermedad se calculó luego utilizando la proporción de la enfermedad en las plantas tratadas en relación con las plantas de control.

La ecuación de Colby se utilizó para determinar los efectos fungicidas esperados de las mezclas. (See Colby, S. R., Calculation of the synergistic and antagonistic response of herbicide combinations. Weeds 1967, 15, 20-22).

15 Se utilizó la siguiente ecuación para calcular la actividad esperada de mezclas que contienen dos ingredientes activos, A y B:

$$\text{Esperado} = A+B-(A \times B/100)$$

20 A = eficacia observada del componente activo A en la misma concentración que la utilizada en la mezcla;  
B = eficacia observada del componente activo B en la misma concentración que la utilizada en la mezcla.

Las interacciones sinérgicas representativas, incluidas las tasas de aplicación empleadas y el control de la enfermedad resultante del añublo del arroz se presentan en las siguientes Tablas 1 y 2.

25 % DC = Porcentaje de control de la enfermedad

% DC Obs = Porcentaje de control de la enfermedad observado

30 % DC Exp = Porcentaje de control de la enfermedad esperado

Factor de sinergia = % DC Obs/% DC Exp.

35 Tabla 1 Interacciones sinérgicas del compuesto I (XDE-777) y otros fungicidas en las pruebas protectoras de *M. oryzae* de 1 día.

Las entradas marcadas con un asterisco (\*) se incluyen para referencia.

Compuesto A+B	Tasa A (ai ppm)	Tasa B (ai ppm)	% promedio de enfermedad	A% DC	B % DC	% A+B DC obs	% A+B DC exp	Factor de sinergismo	sinergia >1
777+Azoxistrobina*	0.1	1.56	50	21	0	40	21	1.87	Sí
777+Azoxistrobina*	0.025	0.4	40	0	30	46	30	1.54	Sí
777+Azoxistrobina*	0.1	0.1	65	21	19	59	36	1.62	Sí
777+Azoxistrobina*	0.025	0.1	65	0	19	43	19	2.24	Sí
777+Azoxistrobina*	0.1	0.025	50	21	9	56	28	1.98	Sí
777+Azoxistrobina*	0.025	0.025	50	0	9	55	9	6.11	Sí
777+Azoxistrobina*	0.1	1.56	50	21	0	51	21	2.4	Sí
777+Carpropamida	0.4	0.1	65	61	2	65	62	1.05	Sí
777+Carpropanid	0.1	0.1	65	21	2	65	23	2.84	Sí
777+carpropamida	0.25	0.1	65	0	2	65	2	32.5	Sí
777+carpropamida	0.1	0.4	50	21	23	54	39	1.36	Sí
777+Triciclazol	0.025	0.4	35	0	23	44	23	1.9	Sí

ES 2 712 668 T3

777+Triciclazol	0.1	0.1	45	21	0	46	21	2.17	Sí
777+Triciclazol	0.1	0.025	25	21	0	39	21	1.82	Sí

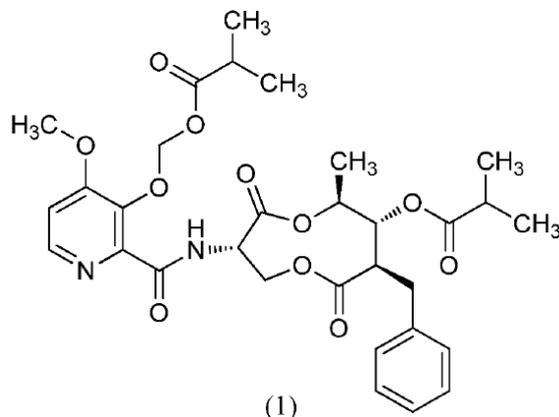
Tabla 2: Interacciones sinérgicas del compuesto I (XDE-777) y otros fungicidas en pruebas de *M. oryzae* curativas/protectoras de 1 día. Las entradas marcadas con un asterisco (\*) están incluidas para referencia.

Compuesto A+B	Tasa A (ai/ppm)	Tasa B (ai/ppm)	% promedio de enfermedad	A% DC	B % DC	% A+B DC obs	% A+B DC exp	Factor de sinergismo	sinergia >1
777+Triciclazol	0.4	0.1	2	50	71	95	86	1.11	Sí
777+Triciclazol	0.1	0.1	3	28	71	94	79	1.19	Sí
777+Probenazol	0.1	12.5	4	28	78	91	84	1.08	Sí
777+Probenazol	1.56	3.12	2	67	69	95	90	1.06	Sí
777+Probenazol	0.4	3.12	5	50	69	89	85	1.05	Sí
777+Probenazol	0.1	3.12	7	28	69	84	78	1.08	Sí
777+Kasugamicina	1.56	25	1	67	74	98	91	1.07	Sí
777+Kasugamicina	0.4	25	2	50	74	96	87	1.10	Sí
777+Kasugamicina	0.1	25	6	28	74	87	81	1.07	Sí
777+Kasugamicina	1.56	6.25	2	67	68	95	89	1.06	Sí
777+Kasugamicina	0.4	6.25	4	50	68	91	84	1.08	Sí
777+Kasugamicina	0.1	6.25	3	28	68	94	77	1.22	Sí
777+Kasugamicina	1.56	1.56	1	67	69	98	90	1.09	Sí
777+Boscalid	6.25	400	1	81	69	99	94	1.05	Sí
777+Boscalid	1.56	400	1	67	69	97	90	1.08	Sí
777+Boscalid	0.4	400	2	50	69	96	85	1.14	Sí
777+Boscalid*	0.1	400	3	28	69	93	78	1.2	Sí

## REIVINDICACIONES

1. Una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad fungicida eficaz de un compuesto de Fórmula I que se muestra a continuación

5



y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol y kasugamicina, en el que la mezcla se caracteriza además por:

10

(a) relación en peso de Fórmula (1) a triciclazol de entre 1:20 y 4:1 cuando el fungicida es triciclazol;

(b) una relación en peso de Fórmula (1) a carpropamida de entre 1:20 y 4:1 cuando el fungicida es carpropamida;

15

(c) una relación en peso de Fórmula (1) a probenazol de entre 1:125 y 1:2 cuando el fungicida es probenazol; o

(d) una relación en peso de Fórmula (1) a kasugamicina de entre 1:250 y 1:1 cuando el fungicida es kasugamicina.

20

2. La mezcla de la reivindicación 1, en la que el fungicida es triciclazol y en la que la relación en peso del Compuesto I a triciclazol está entre 1:20 y 4:1.

3. La mezcla de la reivindicación 1, en el que el fungicida es carpropamida y en el que la relación en peso de Compuesto I a carpropamida está entre 1:20 y 4:1.

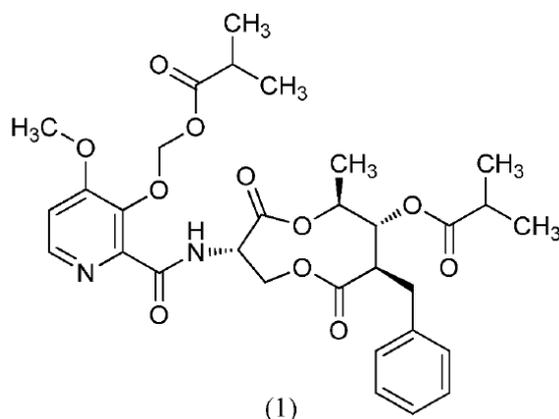
25

4. La mezcla de la reivindicación 1, en el que el fungicida es probenazol y en el que la relación en peso de Compuesto I a probenazol está entre 1:125 y 1:2.

5. La mezcla de la reivindicación 1, en el que el fungicida es kasugamicina y en el que la relación en peso del Compuesto I a kasugamicina está entre 1:250 y 1:1.

30

6. Una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad fungicida eficaz de un compuesto de Fórmula (1) que se muestra a continuación



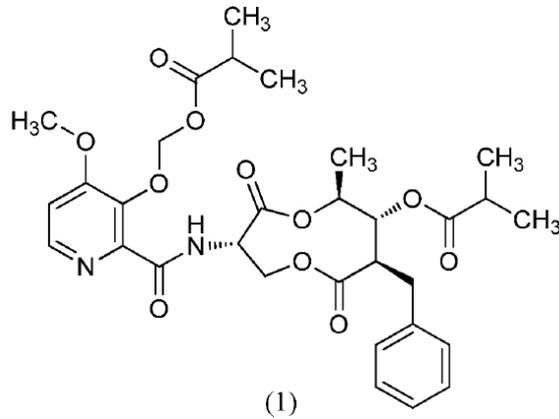
35

y boscalid en el que la relación en peso de Compuesto (1) a boscalid está entre 1:1000 y 1:60.

7. La mezcla de la reivindicación 1, que comprende además un adyuvante o portador agrícolamente aceptable.

8. Un método para el control y la prevención del ataque de hongos en una planta, el método comprende: aplicar una cantidad fungicida eficaz de un compuesto de Fórmula I que se muestra a continuación

5



y al menos un fungicida seleccionado del grupo que consiste en triciclazol, carpropamida, probenazol, kasugamicina y boscalid en el que dicha cantidad efectiva se aplica a al menos una de la planta, un área adyacente a la planta, suelo adaptado para soportar el crecimiento de la planta, una raíz de la planta, follaje de la planta y una semilla adaptada para producir la planta, en el que la mezcla se caracteriza además por:

10

(a) una relación en peso de Fórmula (1) a triciclazol de entre 1:20 y 4:1 cuando el fungicida es triciclazol;

15

(b) una relación en peso de Fórmula (1) a carpropamida de entre 1:20 y 4:1 cuando el fungicida es carpropamida;

(c) una relación en peso de Fórmula (1) a probenazol de entre 1:125 y 1:2 cuando el fungicida es probenazol;

20

(d) una relación en peso de Fórmula (1) a kasugamicina de entre 1:250 y 1:1 cuando el fungicida es kasugamicina; o

(e) una relación en peso de Fórmula (1) a boscalid de entre 1:1000 y 1:60 cuando el fungicida es boscalid.