

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 727 663**

51 Int. Cl.:

A01N 43/54 (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: **31.12.2013 PCT/US2013/078524**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.07.2014 WO14106259**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **31.12.2013 E 13867164 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **13.03.2019 EP 2941126**

54 Título: **Composiciones fungicidas sinérgicas**

30 Prioridad:

31.12.2012 US 201261747464 P

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

17.10.2019

73 Titular/es:

**DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis, IN 46268, US**

72 Inventor/es:

**OUIMETTE, DAVID G.;
MATHIESON, JOHN T.;
YAO, CHENGLIN;
DASILVA, OLAVO CORREA y
KEMMITT, GREG**

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 727 663 T3

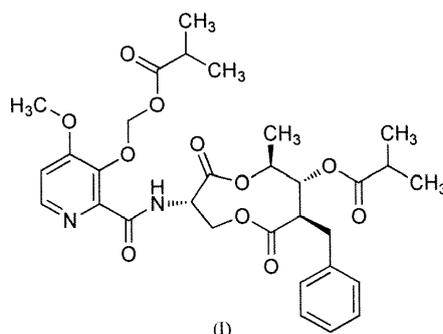
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar 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

Campo de la invención

5 Esta descripción se refiere a una composición fungicida sinérgica que contiene una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de Fórmula I y al menos un triazol seleccionado del grupo que consiste en tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol.

**Antecedentes y Compendio**

10 Los fungicidas son compuestos, de origen natural o sintético, que actúan para proteger las plantas contra el daño causado por los hongos. Los métodos actuales de la agricultura dependen en gran medida del uso de fungicidas. De hecho, algunos cultivos no se pueden cultivar de manera útil sin el uso de fungicidas. El uso de fungicidas permite a un agricultor aumentar el rendimiento y la calidad del cultivo y, por consiguiente, 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 coste del uso del fungicida.

15 Sin embargo, ningún fungicida es útil en todas las situaciones y el uso repetido de un solo fungicida conduce frecuentemente al desarrollo de resistencia frente a ese fungicida y a otros relacionados. Por consiguiente, se están llevando a cabo investigaciones para producir fungicidas y combinaciones de fungicidas que sean más seguros, que tengan 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. El documento US2011082160 describe mezclas sinérgicas que comprenden el compuesto de fórmula (I) y otros fungicidas de triazol, a saber, epoxiconazol o protioconazol.

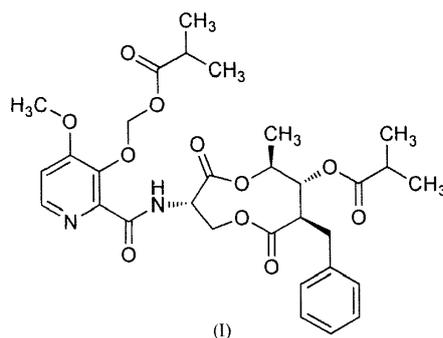
25 Es un objetivo de esta descripción proporcionar composiciones sinérgicas que comprenden compuestos fungicidas. Un objetivo adicional de esta descripción es proporcionar procedimientos que utilicen estas composiciones sinérgicas. Las composiciones sinérgicas son capaces de prevenir o curar, o ambos, enfermedades causadas por hongos dentro de las clases ascomicetos y basidiomicetos. Además, las composiciones sinérgicas han mejorado la eficacia contra los patógenos ascomicetos y basidiomicetos, que incluye la mancha de la hoja del trigo (causada por *Mycosphaerella graminicola*; anamorfo: *Septoria tritici*; Código Bayer SEPTTR); y la roya parda del trigo, causada por *Puccinia recondita* f. sp. *tritici*, sinónimo *Puccinia triticina*; Código Bayer PUC CRT). De acuerdo con esta descripción, se proporcionan las composiciones sinérgicas junto con métodos para su uso.

30 Descripción detallada

La presente descripción se refiere a una mezcla fungicida sinérgica que comprende una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida de triazol.

35 Como se emplea en esta memoria, el término "cantidad fungicidamente eficaz" es sinónimo de la frase "cantidad eficaz para controlar o reducir hongos" y se utiliza en relación con una composición fungicida en una cantidad que matará o inhibirá materialmente el crecimiento, proliferación, división, reproducción, o propagación de un número significativo de hongos.

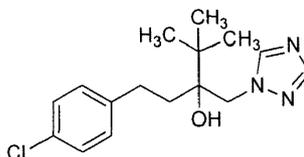
El compuesto de Fórmula I, isobutirato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-(3-((isobutiriloxi)metoxi)-4-metoxipicolinamido)-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, es una picolamida macrocíclica que actúa en el sitio MET III Q_i y posee la siguiente estructura:



Es eficaz en el control de patógenos de cereales económicamente importantes, que incluyen, pero no se limitan a, la mancha de la hoja del trigo (causada por *Mycosphaerella graminicola*; anamorfo: *Septoria tritici*; Código Bayer SEPTTR).

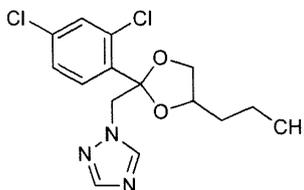
- 5 El triazol se selecciona del grupo que consiste en tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol.

Tebuconazol es el nombre común para α -[2-(4-clorofenil)etil]- α -(1,1-dimetiletil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol y posee la siguiente estructura:



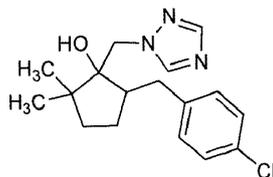
- 10 Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, decimocuarta edición, 2006. El tebuconazol es un fungicida comercial que se utiliza para controlar las enfermedades fúngicas en una variedad de cultivos agrícolas, en particular cereales, que incluyen trigo, cebada y canola, así como cacahuetes, colza oleaginosa, uvas, frutas de pepita, frutas de hueso y bananas.

Propiconazol es el nombre común para 1-[[2-(2,4-diclorofenil)-4-propil-1,3-dioxolan-2-il] metil]-1H-1,2,4-triazol y posee los siguientes estructura:



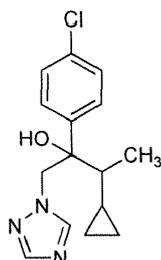
- 15 Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, decimocuarta edición, 2006. El propiconazol controla las enfermedades causadas por *Cochliobolus sativus*, *Erysiphe graminis*, *Leptosphaeria nodorum*, *Puccinia spp.*, *Septoria spp.*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis* y *Rhynchosporium secalis* en los cereales.

- 20 Metconazol es el nombre común para 5-[(4-clorofenil)metil]-2,2-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol y posee la siguiente estructura:



Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, decimocuarta edición, 2006. El metconazol controla una amplia gama de enfermedades foliares en los cultivos de cereales.

- 25 Ciproconazol es el nombre común para α -(4-clorofenil)- α -(1-ciclopropiletil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol y posee la siguiente estructura:



Su actividad fungicida se describe en The Pesticide Manual, decimocuarta edición, 2006. El ciproconazol controla la *Septoria*, roya, mildiu pulverulento, *Rhynchosporium*, *Cercospora* y la *Ramularia* en cereales y remolacha azucarera.

5 En las composiciones descritas en la presente memoria, la relación en peso del compuesto de Fórmula I a los triazoles reivindicados en los que el efecto fungicida es generalmente sinérgico cae dentro del intervalo de entre aproximadamente 1:16 y aproximadamente 64:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a tebuconazol en el que el efecto fungicida es sinérgico cae dentro del intervalo de entre aproximadamente 1:16 y aproximadamente 60:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a propiconazol en el que el efecto fungicida es sinérgico cae dentro del intervalo de entre aproximadamente 1:64 y aproximadamente 64:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a metconazol en el que el efecto fungicida es sinérgico cae dentro del intervalo de entre aproximadamente 1: 4 y aproximadamente 16:1. La relación en peso del compuesto de Fórmula I a ciproconazol en el que el efecto fungicida es sinérgico cae dentro del intervalo de entre aproximadamente 1:16 y aproximadamente 64:1.

15 La proporción a la que se aplica la composición sinérgica dependerá de la composición específica, el tipo particular de hongo a controlar, el grado de control requerido y/o el momento y método de aplicación. En general, la composición descrita en la presente memoria se puede aplicar a una dosis de aplicación entre aproximadamente 50 gramos por hectárea (g/ha) y aproximadamente 2300 g/ha basado en la cantidad total de ingredientes activos en la composición. En algunas realizaciones, la composición descrita en la presente memoria se puede aplicar a una dosis de aplicación entre aproximadamente 100 g/ha y aproximadamente 550 g/ha. En general, el triazol se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha. El tebuconazol se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. El propiconazol se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. El metconazol se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 300 g/ha. El ciproconazol se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 250 g/ha y el compuesto de Fórmula I se puede aplicar a una dosis entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 300 g/ha.

Los componentes de la mezcla sinérgica descrita en la presente memoria se pueden aplicar o por separado o como parte de un sistema fungicida en varias partes.

30 La mezcla sinérgica de la presente descripción se puede aplicar junto con uno o más otros fungicidas para controlar una amplia variedad de enfermedades no deseadas. Cuando se utiliza junto con otro(s) fungicida(s), los compuestos actualmente reivindicados se pueden formular con el (los) otro(s) fungicida(s), mezclarse en el tanque con el (los) otro(s) fungicida(s) o aplicarse secuencialmente con el (los) otro(s) fungicida(s). Tales otros fungicidas pueden incluir 2-(tiocianatometil)tiol-benzotiazol, 2-fenilfenol, sulfato de 8-hidroxiquinolona, ametoctradiina, amisulbrom, antimicina, Ampelomyces quisqualis, azaconazol, azoxistrobina, Bacillus subtilis, Bacillus subtilis cepa QST713, benalaxil, benomilo, bentiavalicarb-isopropil, sal de bencilaminobenceno-sulfonato (BABS), bicarbonatos, bifenilo, bismertiazol, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, bórax, mezcla de Burdeos, boscalid, bromuconazol, bupirimato, polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbendazim, carboxina, carpropamid, carvona, clazafenona, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, Coniothyrium minitans, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido cuproso, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxalil, ciproconazol, ciprodinil, dazomet, debacarb, diamonio etileno bis-(ditiocarbamato), diclofluanid, diclorofeno, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, ion difenzoquato, diflumetorim, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinotubon, dinocap, difenilamina, ditianon, dodemorf, dodemorf acetato, dodina, base libre de dodina, edifenfos, enestrobina, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquina, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenciclonilo, fenpropidin, fenpropimorf, fenpirazamina, fentin, fentin acetato, fentin hidróxido, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, formaldehido, fosetil, fosetilaluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, acetatos de guazatina, GY-81, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalil, sulfato de imazalil, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, tris(albésilato) de iminoctadina, iodocarb, ipconazol, ipfenpirazolona, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, kasugamicina hidrocloreto hidrato, kresoxim-metil, laminarina, 45 mancozeb, mancozeb, mandipropamid, maneb, mfenoxam, mepanipirim, mepronilo, meptil-dinocap, cloruro de mercurio, óxido de mercurio, cloruro mercurioso, metalaxil, metalaxil-M, metam, metam-amonio, metam-potasio, metam-sodio, metconazol,

metasulfocarb, ioduro de metilo, metil-isotiocianato, metiram, metominostrobrina, metrafenona, mildiomicina, miclobutanil, nabam, nitrotal-isopropil, nuarimol, octilinona, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobrina, oxadixilo, oxina-cobre, oxpoconazol fumarato, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, 50 pencicuron, penflufeno, pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentiopirad, acetato de fenilmercurio, ácido fosfónico, ftalida, 5 picoxistrobrina, polioxina B, polioxinas, polioxorim, bicarbonato de potasio, hidroxiquinolono-sulfato de potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb hidrocloreuro, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobrina, piraioxistrobrina, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, piriofenona, piroquilona, quinoclamina, quinoxifen, quintozeno, extracto de Reynoutria 55 sachalinensis, sedaxano, siltiofam, simeconazol, 2-fenilfenóxido de sodio, bicarbonato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, 10 spiroxamina, azufre, SYP-Z048, aceites de alquitrán, tebuconazol, tebufloquina, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metil, tiram, tiadinil, tolclofos-metil, tolilfluamid, triadimefon, triadimenol, triazoxide, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobrina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina, valifenalato, valifenal, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, Candida oleophila, Fusarium oxysporum, Gliocladium spp., Phlebiopsis gigantea, 60 Sreptomyces griseoviridis, Trichoderma spp., (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano, hidrato de 1,3-dicloro-1,1,3,3-tetrafluroacetona, 1-cloro-2,4-dinitronaftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 2-(2-heptadecil-2-imidazolil-1-il)etanol, 2,3-dihidro-5-fenil-1,4-ditiino, 1,1,4,4-tetraóxido, acetato de 2-metoxietilmercurio, cloruro de 2-metoxietilmercurio, silicato de metoxietilmercurio, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina, 4-(2-nitroprop-1-enil)fenil-tiocianatemo, ampropilfos, anilazina, azitiram, polisulfuro de bario, Bayer 32394, benodanilo, benquinox, bentalurón, benzamacrilo, benzamacrilo-isobutil, benzamorf, binapacrilo, sulfato de bis(metilmercurio), óxido de bis(tributilestaño), 20 butiobate, sulfato de cadmio calcio cobre cinc y cromato, carbamorf, CECA, clobentiazona, cloraniformetan, clorfenazol, clorquinox, climbazol, bis(3-fenilsalicilato) de cobre, cromato de cobre y cinc, cufraneb, sulfato cúprico de hidrazinio, cuprobam, ciclafuramid, cipendazol, ciprofuram, decafentina, diclona, diclozolina, diclobutrazol, dimetirimol, dinocton, dinosulfona, dinoterbon, dipiritiona, ditalimfos, dodicina, drazoxolona, EBP, ESBP, etaconazol, etem, etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropano, fluotrimazol, furcarbanilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, furofanato, gliodina, griseofulvina, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858, isopamfos, isovalediona, mebenilo, mecarbinzid, metazoxolona, metfuroxam, diciandiamida de metilmercurio, metsulfovax, milneb, anhídrido mucoclorico, miclozolina, N-3,5-diclorofenil-succinimida, N-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, N-etilmercurio-4-toluensulfonanilida, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, OCH, dimetilditiocarbamato de fenilmercurio, nitrato de fenilmercurio, fosdifeno, 25 protiocarb; protiocarb hidrocloreuro, piracarbolid, piridinitrilo, piroxiclor, piroxifur, quinacetol, sulfato de quinacetol, quinazamida, quinconazol, rabenzazol, salicilanilida, SSF-109, sultropeno, tecoram, tiadifluor, ticiofeno, tioclorfenfim, tiofanato, tioquinox, tioximid, triamifos, triarimol, triazbutilo, triclamida, urbacid, zarilamid, y una cualquiera de sus combinaciones.

Las composiciones descritas en la presente memoria se aplican preferiblemente en la forma de una formulación que comprende una composición de un compuesto de fórmula I y al menos un triazol seleccionado del grupo que consiste en tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol, junto con un vehículo fitológicamente aceptable si se desea. 35

Las formulaciones concentradas pueden estar dispersas en agua, u otro líquido, para su aplicación, o las formulaciones pueden ser granulares o semejantes a polvo, que se pueden aplicar luego sin ningún otro tratamiento. Las formulaciones se preparan según los procedimientos que son convencionales en la técnica de la química agrícola, pero que son nuevos e importantes debido a la presencia de una composición sinérgica.

Las formulaciones que se aplican más a menudo son suspensiones acuosas o emulsiones. Tales formulaciones solubles en agua, o que se suspenden en agua, o emulsionables son sólidas, habitualmente conocidas como polvos humectables, o líquidos, habitualmente conocidas como concentrados emulsionables, suspensiones acuosas, o concentrados en suspensión. La presente descripción contempla todos los vehículos en los que las composiciones sinérgicas se pueden formular para su administración y uso como un fungicida. 40

Como se apreciará rápidamente, se puede utilizar cualquier material que se pueda añadir a estas composiciones sinérgicas, siempre que proporcionen la utilidad deseada sin interferencia significativa con la actividad de estas composiciones sinérgicas como agentes antifúngicos. 45

Los polvos humectables, que pueden ser compactados para formar gránulos que se dispersan en agua, comprenden una mezcla íntima de la composición sinérgica, un vehículo y tensioactivos aceptables agrícolamente. La concentración de la composición sinérgica en el polvo humectable es habitualmente de aproximadamente 10% a aproximadamente 90% en peso, más preferiblemente aproximadamente 25% a aproximadamente 75% en peso, basado en el peso total de la formulación. En la preparación de las formulaciones de polvos humectables, la composición sinérgica puede estar compuesta con uno cualquiera de los sólidos finamente divididos, tal como pirofilita, talco, tiza, yeso, tierra de Fuller, bentonita, atapulgita, almidón, caseína, gluten, arcillas montmorillonita, tierras diatomeas, silicatos purificados y similares. En tales operaciones, el vehículo finamente dividido se tritura y 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, tal como aductos de óxido de etileno de alquilfenoles. 50 55

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 60

formulación del concentrado emulsionable. Los componentes de las composiciones sinérgicas, de manera conjunta o por separado, se disuelven en un vehículo, que o bien es un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolventes orgánicos inmiscibles en agua, y emulsionantes. Los concentrados se pueden diluir con agua y aceite para formar mezclas pulverizables en forma de emulsiones de aceite en agua. Los disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alto punto de ebullición del petróleo, tal como el nafta aromático pesado. También se pueden utilizar otros disolventes orgánicos, tal como, por ejemplo, disolventes terpénicos, incluido derivados de colofonia, cetonas alifáticas, tal como ciclohexanona, y alcoholes complejos, tal como 2-etoxietanol.

Los emulsionantes que se pueden emplear ventajosamente en la presente memoria se pueden determinar rápidamente 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 para preparar los concentrados emulsionables incluyen 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 alquilfenoles etoxilados y ésteres carboxílicos disueltos con el poliol o polioxialquileno. Los emulsionantes catiónicos incluyen compuestos de amonio cuaternario y sales de aminas grasas. Los emulsionantes aniónicos incluyen sales solubles en aceite (p.ej. calcio) de ácidos alquilaril sulfónicos, sales solubles en aceite o éteres de poliglicol sulfatados y sales apropiadas de éter de poliglicol fosfatado.

Los líquidos orgánicos representativos que se pueden emplear para preparar los concentrados emulsionables de la presente descripción son los líquidos aromáticos tal como xileno, fracciones de propilbenceno, o fracciones de mezclas de naftaleno, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos tales como dioctil ftalato, queroseno, dialquilamidas de diversos ácidos grasos, particularmente las dimetilamidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como n-butiléter, etiléter o metiléter de dietilenglicol, y el metiléter de trietilenglicol. A menudo las mezclas de dos o más líquidos orgánicos se emplean también adecuadamente en la preparación del concentrado emulsionable. Los líquidos orgánicos preferidos son xileno, y fracciones de propilbenceno, siendo el xileno el más preferido. Los agentes de dispersión activos de superficie que se emplean habitualmente en formulaciones líquidas y en una cantidad de aproximadamente 0,1 a 20 por ciento en peso del peso combinado del agente de dispersión con las composiciones sinérgicas. Las formulaciones pueden contener también otros aditivos compatibles, por ejemplo reguladores del crecimiento de plantas y otros compuestos activos biológicamente utilizados en agricultura.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de uno o más compuestos solubles en agua, dispersos en un vehículo acuoso a una concentración dentro del intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 70% en peso, basado en el peso total de la formulación de la suspensión acuosa. Las suspensiones se preparan triturando finamente los componentes de la combinación sinérgica o bien juntos o por separado, y mezclando vigorosamente el material triturado en un vehículo que consta de agua y tensioactivos elegidos de entre los mismos tipos abordados anteriormente. También se pueden añadir otros ingredientes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales para aumentar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso. A menudo es más eficaz triturar y mezclar al mismo tiempo al preparar la mezcla acuosa y homogeneizarla en un instrumento tal como un molino de arena, molino de bolas, o un homegeneizador de tipo pistón.

La composición sinérgica se puede aplicar también como una formulación granular, que es particularmente útil para aplicaciones en suelos. Habitualmente las formulaciones granulares contienen desde aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% en peso de los compuestos, basado en el peso total de la formulación granular, dispersos en un vehículo que consiste enteramente o en gran parte en atapulgita, bentonita, diatomita, arcilla divididas gruesamente o una sustancia económica similar. Habitualmente tales formulaciones se preparan disolviendo la composición sinérgica en un disolvente adecuado y aplicándolas sobre un vehículo granular que se ha preparado con el tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Tales formulaciones se pueden preparar también preparando una masa o pasta del vehículo y la composición sinérgica, y triturándola y secándola para obtener la partícula granular deseada.

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

Las formulaciones pueden contener tensioactivos adyuvantes aceptables agrícolamente para mejorar la deposición, humectación y penetración de la composición sinérgica sobre la cosecha y organismo diana. Estos tensioactivos adyuvantes se pueden emplear opcionalmente como un componente de la formulación o como una mezcla de tanque. La cantidad del tensioactivo adyuvante variará desde 0,01 por ciento a 1,0 por ciento v/v basado en un volumen pulverizado de agua, preferiblemente 0,05 a 0,5 por ciento. Los tensioactivos adyuvantes adecuados incluyen nonilfenoles etoxilados, alcoholes etoxilados sintéticos o naturales, 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. Tales compuestos pesticidas adicionales pueden ser fungicidas, insecticidas, nematocidas, mitocidas, artropodocidas, bactericidas o combinaciones de los

mismos que sean compatibles con las composiciones sinérgicas de la presente descripción en el medio seleccionado para su aplicación, y no antagonista con la actividad de los compuestos presentes. 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 se pueden mezclar juntos generalmente en una relación en peso de aproximadamente 1:100 a 100:1.

La presente descripción incluye dentro de su alcance métodos para el control o prevención de un ataque fúngico. Estos métodos comprenden la aplicación al locus del hongo, o a un locus en donde se quiere prevenir la infección (por ejemplo la aplicación a plantas de trigo), una cantidad fungicidamente eficaz de la composición sinérgica. La composición sinérgica es adecuada para el tratamiento de diversas plantas a niveles fungicidas, mientras exhibe una baja fitotoxicidad. La composición sinérgica es útil de una manera protectora o erradicadora. La composición sinérgica se puede aplicar mediante una cualquiera o varias técnicas conocidas, o como la composición sinérgica o como una formulación que comprende la composición sinérgica. Por ejemplo, las composiciones sinérgicas se pueden aplicar a las raíces, semillas o follaje de plantas para el control de diversos hongos, sin dañar el valor comercial de las plantas. La composición sinérgica se puede aplicar en forma de uno cualquiera de los tipos de formulación utilizados generalmente por ejemplo, como disoluciones, 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 su uso en la agricultura. La composición sinérgica es particularmente eficaz para su uso en cultivos agrícolas y plantas de horticultura.

En particular, la composición sinérgica es eficaz para controlar una variedad de hongos no deseables que infectan cultivos de plantas útiles.

La composición sinérgica se puede utilizar contra una variedad de hongos ascomicetos, que incluyen por ejemplo las especies representativas de hongos siguientes: la mancha de la hoja del trigo (*Mycosphaerella graminicola*; anamorfo: *Septoria tritici*; código Bayer SEPTTR); mancha de la gluma del trigo (*Leptosphaeria nodorum*; código de Bayer LEPTNO; anamorfo: *Stagonospora nodorum*); mancha borrosa de la cebada (*Cochliobolus sativum*; código Bayer COCHSA; anamorfo: *Helminthosporium sativum*); mancha de la hoja de la remolacha azucarera (*Cercospora beticola*; código Bayer CERCBE); mancha de la hoja del cacahuete (*Mycosphaerella arachidis*; código Bayer MYCOAR; anamorfo: *Cercospora arachidicola*); antracnosis del pepino (*Glomerella lagenarium*; anamorfo: *Colletotrichum lagenarium*; código Bayer COLLLA); sarna del manzano (*Venturia inaequalis*; código Bayer VENTIN) y enfermedad de la sigatoka negra del plátano (*Mycosphaerella fijiensis*; código Bayer MYCOFI).

La composición sinérgica se puede utilizar contra una variedad de patógenos ascomicetos y basidiomicetos, que incluyen la mancha de la hoja de trigo causada por *Septoria tritici* (SEPTTR), y la roya parda del trigo, causada por *Puccinia recondita tritici* (PUCCRT). La siguiente lista incluye especies adicionales de hongos representativos: la roya estriada del trigo causada por *Puccinia striiformis* (PUC CST) y la roya del tallo del trigo, causada por *Puccinia graminis f.sp. tritici* (PUCCTR). Los expertos en la técnica entenderán que la eficacia de las composiciones sinérgicas para uno o más de los hongos anteriores establece la utilidad general de las composiciones sinérgicas como fungicidas.

Las composiciones sinérgicas tienen un amplio intervalo de eficacia como fungicida. La cantidad exacta de la composición sinérgica a aplicar depende no solamente de las cantidades relativas de los componentes, sino también de la acción particular deseada, las especies fúngicas que hay que controlar, y del estadio del crecimiento de las mismas, así como la parte de la planta u otro producto en contacto con la composición sinérgica. Por lo tanto, las formulaciones que contienen la composición sinérgica no pueden ser igualmente eficaces a concentraciones similares o contra las mismas especies de hongo.

Las composiciones sinérgicas son eficaces en su uso con plantas en una cantidad aceptable fitológicamente y para inhibir una enfermedad. La expresión "cantidad aceptable fitológicamente y para inhibir una enfermedad" se refiere a una cantidad de la composición sinérgica que mata o inhibe la enfermedad de la planta que se desea controlar, pero no es significativamente tóxica para la planta. Esta cantidad generalmente será de aproximadamente 1 a aproximadamente 1000 ppm, prefiriéndose con aproximadamente 2 a aproximadamente 500 ppm. La concentración exacta de la composición sinérgica requerida varía con la enfermedad fúngica que hay que controlar, el tipo de formulación empleada, el método de aplicación, las especies de plantas particulares, las condiciones climáticas, y similar. Una dosis de aplicación adecuada para la composición sinérgica normalmente corresponde de aproximadamente 0,1 a 0,45 gramos por metro cuadrado g/m² (aproximadamente 0,10 a aproximadamente 4 libras/acre).

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

Los ejemplos siguientes se proporcionan para mayor ilustración de la descripción.

Ejemplos

Las interacciones sinérgicas representativas, que incluyen las dosis de aplicación empleadas y el control de la

enfermedad resultante de la roya parda del trigo y la mancha de la hoja del trigo se presentan en las siguientes, Tablas 1-5.

5 Para los estudios de mezcla con el compuesto de Fórmula I: los tratamientos consistieron en fungicidas, que incluía un compuesto de Fórmula I, tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol, aplicados o individualmente o como mezclas de dos vías con un compuesto de Fórmula I. Los grados técnicos de los materiales se disolvieron en acetona para preparar disoluciones madre que se utilizaron para realizar diluciones tres veces en acetona para cada componente fungicida individual o para las mezclas de dos vías. Las dosis de fungicidas deseadas se obtuvieron después de mezclar las disoluciones con nueve volúmenes de agua que contenían 110 partes por millón (ppm) de Triton X-100. Se aplicaron las disoluciones de fungicida (10 mililitros (mL)) sobre seis macetas de plantas utilizando una cámara de pulverización automática, que utilizaba dos toberas pulverizadoras modelo 6218-1/4 JAUPM operando a 137,9 kpa (20 libras por pulgada cuadrada (psi)) en ángulos opuestos para recubrir ambas superficies de las hojas. Se dejaron secar al aire todas las plantas pulverizadas antes de su posterior manejo. Las plantas control se pulverizaron de la misma manera con un blanco de disolvente.

15 Para los experimentos protectores a un día, se inocularon las plantas con una suspensión acuosa de esporas del patógeno de interés (o PuccRT o SEPTTR) y luego se colocaron en una habitación de rocío de 1-3 días para permitir que se produjera la infección. Las plantas se colocaron luego en el invernadero para que se produjera el desarrollo de síntomas. En el caso de PuccRT, los síntomas aparecieron normalmente en 7-10 días, mientras que para los síntomas de SEPTTR aparecieron normalmente en 25-30 días.

20 Para los experimentos curativos a tres días, se inocularon las plantas con una suspensión acuosa de esporas del patógeno de interés (o PuccRT o SEPTTR) y se colocaron luego en una habitación de rocío de 1-3 días para permitir que se produjera la infección. Las plantas se retiraron de la sala de rocío, se dejaron secar durante aproximadamente una hora (h), se rociaron con los materiales de ensayo formulados como se describió anteriormente y se colocaron luego en el invernadero para que se produjera el desarrollo de los síntomas como se describió anteriormente.

25 Cuando la gravedad de la enfermedad alcanzó el 50-100% en las plantas control, se evaluaron visualmente los niveles de infección en las plantas tratadas y se puntuaron en una escala de 0 a 100 por ciento. Luego se calculó el porcentaje de control de la enfermedad utilizando la relación de la enfermedad en las plantas tratadas frente a las plantas control.

30 Se utilizó la ecuación de Colby para determinar los efectos fungicidas esperados de las mezclas. (Véase Colby, S. R. Calculation of the synergistic and antagonistic response of herbicide combinations, Weeds 1967, 15, 20-22). Más específicamente, en las Tablas 1-5, la ecuación de Colby se utilizó para calcular la actividad esperada de las mezclas que contenían dos ingredientes activos, A y B:

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

en donde

A=eficacia observada de componente activo A a la misma concentración empleada en la mezcla;

B=eficacia observada de componente activo B a la misma concentración empleada en la mezcla.

35 Además, las siguientes abreviaturas se aplican a las Tablas 1-5:

% DC = porcentaje de control de la enfermedad (DC, en inglés disease control)

% DC Obs = porcentaje de control de la enfermedad observado

% DC Exp = porcentaje de control de la enfermedad esperado

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

40 Tabla 1. Evaluación de la eficacia de las mezclas fungicidas para el control de la roya parda del trigo causada por *Puccinia recondita tritici* (PuccRT) en una aplicación protectora a un día (1DP).

Compuesto A+B	Tasa A (ppm)	Tasa B (ppm)	% medio de enfermedad	A %DC	B %DC	A+B %DC (obs)	A+B %DC (exp)	Factor de sinergia	>1 sinergia
Comp.I+Ciproconazol	6,3	6,3	1	85,5	57	98,8	93,8	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	1,6	6,3	15	19,6	57	82,4	65,4	1,3	sí
Comp.I+Ciproconazol	0,4	6,3	33,3	0	57	60,8	57,0	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	1,6	1,6	31,7	19,6	27	62,7	41,3	1,5	sí

ES 2 727 663 T3

Comp.I+Ciproconazol	6,3	0,4	5,3	85,5	0	93,7	85,5	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	1,6	0,4	65	19,6	0	23,5	19,6	1,2	sí
Comp.I+Ciproconazol	6,3	0,1	7,7	85,5	0	91	85,5	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	1,6	0,1	66,7	19,6	0	21,6	19,6	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	1,6	6,3	3,7	19,6	82	95,7	85,5	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	6,3	1,6	5	85,5	18	94,1	88,1	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	6,3	0,4	5,7	85,5	0	93,3	85,5	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	6,3	0,1	6	85,5	0	92,9	85,5	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	1,6	0,1	60	19,6	0	29,4	19,6	1,5	sí
Comp.I+Propiconazol	6,3	6,3	6,7	85,5	0	92,2	85,5	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	6,3	1,6	4,7	85,5	0	94,5	85,5	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	6,3	0,1	5	85,5	0	94,1	85,5	1,1	sí
Comp.I+Metconazol	1,6	6,3	4	19,6	87	95,3	89,5	1,1	sí
Comp.I+Metconazol	6,3	1,6	2,7	85,5	8	96,9	86,7	1,1	sí
Comp.I+Metconazol	1,6	0,4	65	19,6	0	23,5	19,6	1,2	sí
sin tratar	0	0	85	0	0	0	0	n/A	n/A

Tabla 2. Evaluación de la eficacia de las mezclas fungicidas para el control de la roya parda del trigo causada por *Puccinia recondita tritici* (PUCCRT) en una aplicación curativa a tres días (3DC).

Compuesto A+B	Tasa A (ppm)	Tasa B (ppm)	%medio de enfermedad	A %DC	B %DC	A+B %DC (obs)	A+B %DC (exp)	Factor de sinergia	>1 sinergia
Comp.I+Ciproconazol	6,3	0,4	3,7	0	82	95,7	82	1,2	sí
Comp.I+Ciproconazol	1,6	0,4	3,3	0	82	96,1	82	1,2	sí
Comp.I+Tebuconazol	6,3	1,6	5	0	87	94,1	87	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	1,6	1,6	3,7	0	87	95,7	87	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	6,3	0,4	76,7	0	2	9,8	2	4,9	sí
Comp.I+Propiconazol	6,3	6,3	0,3	0	93	99,6	93	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	1,6	6,3	0,3	0	93	99,6	93	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	6,3	1,6	38,3	0	2	54,9	2	27,5	sí
Comp.I+Propiconazol	1,6	1,6	51,7	0	2	39,2	2	19,6	sí
Comp.I+Propiconazol	0,4	1,6	60	0	2	29,4	2	14,7	sí
Comp.I+Propiconazol	0,1	1,6	70	0	2	17,6	2	8,8	sí
Comp.I+Metconazol	6,3	0,4	73,3	0	4	13,7	4	3,4	sí
sin tratar	0	0	85	0	0	0	0	n/A	n/A

ES 2 727 663 T3

Tabla 3. Evaluación de la eficacia de las mezclas fungicidas para el control de la mancha de la hoja de trigo causada por *Septoria tritici* (SEPTTR) en una aplicación protectora a un día (1DP).

Compuesto A+B	Tasa A (ppm)	Tasa B (ppm)	% medio de enfermedad	A %DC	B %DC	A+B %DC (obs)	A+B %DC (exp)	Factor de sinergia	>1 sinergia
Comp.I+Ciproconazol	1,6	1,6	6	53	19	91,2	61,9	1,5	sí
Comp.I+Ciproconazol	0,4	1,6	28,3	19	19	58,3	34,4	1,7	sí
Comp.I+Ciproconazol	0,1	0,4	40,7	7	9	40,2	15,4	2,6	sí
Comp.I+Tebuconazol	1,6	1,6	13,3	53	34	80,4	69,0	1,2	sí
Comp.I+Tebuconazol	0,4	1,6	26,7	19	34	60,8	46,5	1,3	sí
Comp.I+Tebuconazol	0,1	1,6	33,3	7	34	51,0	38,6	1,3	sí
Comp.I+Tebuconazol	0,4	0,4	50	19	0	26,5	19,0	1,4	sí
Comp.I+Propiconazol	1,6	6,3	6,7	53	68	90,2	85,0	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	0,4	6,3	6,7	19	68	90,2	74,1	1,2	sí
Comp.I+Propiconazol	0,1	6,3	12,7	7	68	81,4	70,2	1,2	sí
Comp.I+Propiconazol	1,6	1,6	18,3	53	29	73,0	66,6	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	0,1	1,6	43,3	7	29	36,3	34,0	1,1	sí
Comp.I+Propiconazol	0,4	0,1	46,7	19	0	31,4	19,0	1,7	sí
Comp.I+Propiconazol	0,1	0,1	61,7	7	0	9,3	7,0	1,3	sí
Comp.I+Metconazol	1,6	0,1	25	53	9	63,2	57,2	1,1	sí

5 Tabla 4. Evaluación de la eficacia de las mezclas fungicidas para el control de la mancha de la hoja de trigo causada por *Septoria tritici* (SEPTTR) en una aplicación curativa a tres días (3DC).

Compuesto A+B	Tasa A (ppm)	Tasa B (ppm)	% medio de enfermedad	A %DC	B %DC	A+B %DC (obs)	A+B %DC (exp)	Factor de sinergia	>1 sinergia
Comp.I+Ciproconazol	6,3	0,1	3,7	70,1	44,0	94,5	83,3	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	0,1	0,1	6,7	45,3	44,0	90,0	69,4	1,3	sí
Comp.I+Tebuconazol	1,6	0,1	16,7	55,2	23,0	75,1	65,5	1,1	sí
Comp.I+Tebuconazol	0,1	0,1	11,0	45,3	23,0	83,6	57,9	1,4	sí

Tabla 5. Evaluación de la eficacia de las mezclas fungicidas para el control de la roya parda del trigo causada por *Puccinia recondita tritici* (PUCCRT) en un experimento de investigación de campo.

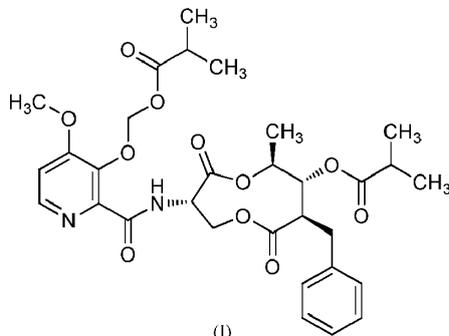
Compuesto A+B	Tasa A (g ai/ha)	Tasa B (g ai/ha)	A %DC	B %DC	A+B %DC (obs)	A+B %DC (exp)	Factor de sinergia	>1 sinergia
Comp.I+Piraclostrobina	150	60	34,1	85,8	91,7	90,6	1,1	sí
Comp.I+Ciproconazol	150	40	34,1	38	89,7	59,1	30,6	sí
Comp.I+Tebuconazol	150	140	34,1	74,3	91,8	83,1	8,7	sí

5 El experimento de campo se llevó a cabo en la estación de campo de Dow AgroSciences ubicada en Mogi Mirim, Brasil. Había cuatro parcelas repetidas por tratamiento, con cada parcela de 2x3,5 metros de largo y ancho. Las parcelas se rociaron dos veces con los tratamientos, una vez en la etapa de crecimiento BBCH 33 y otra vez en la etapa de crecimiento BBCH 61-65. Se aplicaron los tratamientos con volúmenes de pulverización de 150 litros/hectárea (L/ha) con una boquilla de abanico plano XR. El desarrollo de la enfermedad se basó en el inóculo natural (sin infección artificial). Se utilizaron diez plantas por parcela para cada evaluación de la gravedad de la enfermedad, con todas las hojas por planta utilizadas para la evaluación.

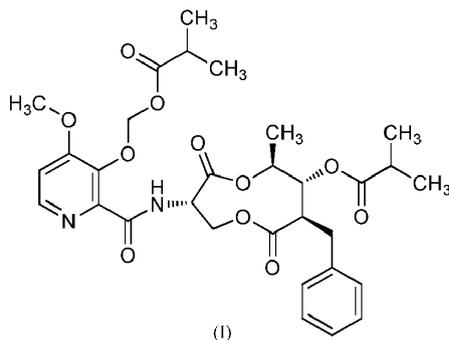
10

REIVINDICACIONES

1. Una mezcla fungicida sinérgica que consiste esencialmente en una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de Fórmula I, isobutirato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-(3-((isobutiriloxi)metoxi)-4-metoxipicolinamido)-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, y al menos un fungicida de triazol



- 5 en donde el al menos un fungicida de triazol se selecciona del grupo que consiste en tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol.
2. La mezcla de la reivindicación 1, en donde el al menos un fungicida de triazol es tebuconazol y en donde la relación en peso de Compuesto I a tebuconazol está entre 1:16 y 64:1.
- 10 3. La mezcla de la reivindicación 1, en donde el al menos un fungicida de triazol es propiconazol y en donde la relación en peso de Compuesto I a propiconazol está entre 1:64 y 64:1.
4. La mezcla de la reivindicación 1, en donde el al menos un fungicida de triazol es metconazol y en donde la relación en peso de Compuesto I a metconazol está entre 1:4 y 16:1.
- 15 5. La mezcla de la reivindicación 1, en donde el al menos un fungicida de triazol es ciproconazol y en donde la relación en peso de Compuesto I a ciproconazol está entre 1:16 y 64:1.
6. La mezcla de la reivindicación 1, que comprende además un adyuvante o vehículo agrícolamente aceptable.
7. Un método para el control y la prevención del ataque fúngico en una planta, cuyo método incluye las etapas de: aplicar una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida de triazol a al menos uno de, la planta, un área adyacente a la planta, el suelo adaptado para soportar el crecimiento de la planta, una raíz de la planta, el follaje de la planta y una semilla adaptada para producir la planta
- 20



en donde el al menos un fungicida de triazol se selecciona del grupo que consiste en tebuconazol, propiconazol, metconazol y ciproconazol.

- 25 8. El método de la reivindicación 7, que comprende además mezclar un adyuvante o vehículo agrícolamente aceptable con el compuesto de Fórmula I y al menos un fungicida de triazol antes de la aplicación.