



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 274 242**

51 Int. Cl.:  
**A01N 37/06** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **03734571 .7**

86 Fecha de presentación : **10.06.2003**

87 Número de publicación de la solicitud: **1511380**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **09.03.2005**

54 Título: **Mezclas de pirimidinonas combinadas y compuestos dinitrofenólicos útiles para controlar el moho.**

30 Prioridad: **11.06.2002 US 387636 P**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**16.05.2007**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**16.05.2007**

73 Titular/es:  
**E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY**  
**1007 Market Street**  
**Wilmington, Delaware 19898, US**

72 Inventor/es: **Geddens, Ray, Michael y**  
**Klapproth, Michael, Caldwell**

74 Agente: **Torner Lasalle, Elisabet**

**ES 2 274 242 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**

Mezclas de pirimidinonas combinadas y compuestos dinitrofenólicos útiles para controlar el moho.

**5 Campo de la invención**

Esta invención se refiere a ciertas mezclas combinadas de pirimidinonas y compuestos dinitrofenólicos, sus sales adecuadas para la agricultura, y los métodos para su uso como fungicidas.

**10 Antecedentes de la invención**

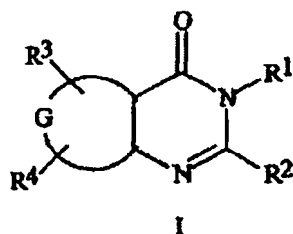
El control de las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideas es extremadamente importante para conseguir una gran eficiencia en el cultivo. Las enfermedades de las plantas perjudican el cultivo ornamental, de vegetales, en el campo, del cereal, y la fruta y pueden producir una reducción significativa en la productividad y en consecuencia resultar en costes elevados para el consumidor. En consecuencia, los fungicidas que controlan de forma efectiva las enfermedades de las plantas se encuentran en una demanda constante por los cultivadores. Muchos productos se encuentran comercialmente disponibles para estos propósitos, la necesidad continua para nuevos productos que sean más efectivos, menos costosos, menos tóxicos, medioambientalmente más seguros y/o que presenten distintos modos de acción. Las enfermedades de las plantas son altamente destructivas, difíciles de controlar y rápidamente desarrollan resistencia a los fungicidas comerciales. Las combinaciones de pesticidas normalmente se utilizan para facilitar el control de la enfermedad, para ampliar el espectro del control y para retardar el desarrollo de la resistencia (véase por ejemplo, WO98/33381). Se sabe por aquellos especialistas en el campo que las ventajas de las combinaciones de pesticidas pueden variar a menudo, dependiendo de factores como la planta en particular y la enfermedad de la planta que se trata, y las condiciones del tratamiento. En consecuencia, hay una búsqueda continua de las combinaciones ventajosas de los pesticidas.

**Resumen de la invención**

Esta invención se refiere a combinaciones de fungicidas (por ejemplo, mezclas) que comprenden

(1) al menos un compuesto seleccionada entre las pirimidinonas combinadas de Fórmula I (incluyendo todas las geometrías y estereoisómeros), sus N-óxidos, y sus sales adecuadas,

donde



G es un tiofeno de fenilo o anillo de piridina combinado;

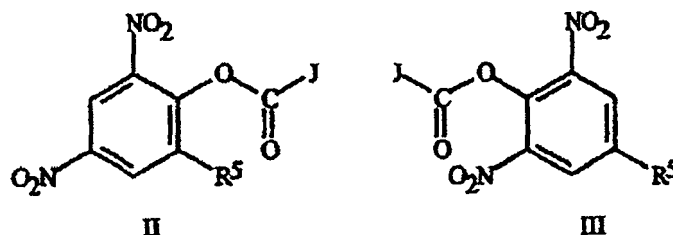
R<sup>1</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilalquilo de C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>;

R<sup>2</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxido de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o alquiltio de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sub>3</sub> es halógeno; y

R<sub>4</sub> es hidrógeno o halógeno; y

(2) al menos un compuesto dinitrofenólico que se selecciona del grupo que consiste en compuestos de Fórmula II y compuestos de Fórmula III (incluyendo todas las geometrías y estereoisómeros)



donde

J es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxido de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o alqueno de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; y

5 R<sup>5</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>.

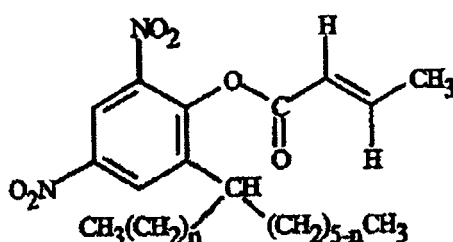
Esta invención proporciona composiciones agrícolas que contienen estas combinaciones. Esta invención también proporciona un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoi-  
deos (en especial moho) que comprenden aplicar a la planta o a una de sus porciones, o a la semilla de la planta o al  
10 semillero, una cantidad efectiva fungicidamente de estas combinaciones (por ejemplo, en forma de una composición tal y como se describe aquí).

### Detalles de la invención

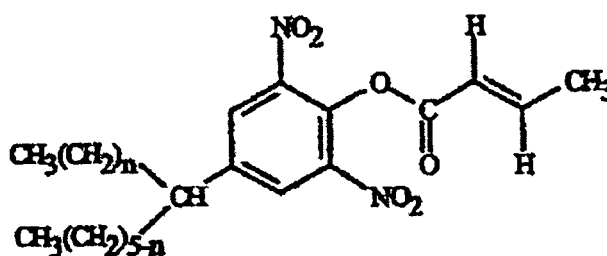
15 Los fungicidas de pirimidinona de Fórmula I se describen en la Solicitud de Patente Internacional WO94/26722, U.S. Pat. No. 6,066,638, U.S. Pat. No. 6,245,770, U.S. Pat. No. 6,262,058 y U.S. Pat. No. 6,277,858. Véase estas referencias para los métodos de preparación de compuestos de componente (1). Los compuestos de Fórmula I también se pueden denominar 2-(R<sup>2</sup>)-3-(R<sup>1</sup>)-pirimidin-4(3H)-onas combinadas a las posiciones 5- y 6- a G(R<sup>3</sup>)(R<sup>4</sup>).

20 Los compuestos dinitrofenólicos de Fórmula II también se pueden denominar como 1,3-dinitro-5-R<sup>5</sup>-benzenos substituidos además a la posición 4 por -OC(=O)J. Los compuestos dinitrofenólicos de Fórmula III también se pueden denominar como 1,3-dinitro-5-R<sup>5</sup>-benzenos substituidos además a la posición 2 por -OC(=O)J.

Los compuestos dinitrofenólicos de Fórmula II incluyen una mezcla que comprende compuestos de Fórmula II donde J es 1-propenilo y R<sup>5</sup> es octilo donde "octilo" es una mezcla de 1-metilheptilo, 1-etilhexilo y 1-propilpentilo (Fórmula IIa). Un compuesto de Fórmula IIa en forma de un compuesto único se conoce con el nombre de Chemical  
25 Abstracts como 2-butenato de (E)-2-(1-metilheptil)-4-,6-dinitrofenilo (Número de Registro de CAS [131-72-6] y la mezcla de los isómeros de octilo con estereoquímica no mencionada como el número de Registro de CAS [39300-45-3]).



Los compuestos de Fórmula IIa se encuentran comercialmente disponibles en una mezcla que comprende de 2.0 a  
45 2.5 partes de Fórmula IIa a 1.0 partes de Fórmula IIIa que presenta el nombre común dinocap y el nombre de la IUPAC crotonatos de 2,6-dinitro-4-octilfenilo y crotonatos de 2,4-dinitro-6-octilfenilo en los que "octilo" es una mezcla de grupos 1-metilheptilo, 1-etilhexilo y 1-propilpentilo.

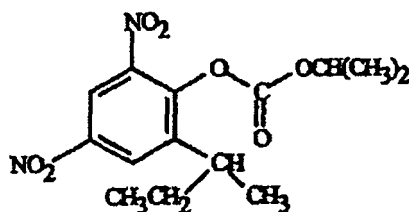


IIIa, wherein n is 0, 1 or 2.

Como consecuencia, el componente (2) también se puede proporcionar mediante dinocap. Son de importancia las  
65 composiciones (por ejemplo, mezclas que comprenden dinocap) que comprendan un compuesto de Fórmula II y un compuesto de Fórmula III. El Dinocap se divulga en la patente de E.E.U.U. No.2,526,660 y la patente de E.E.U.U. número 2,810,767 como un fungicida y un acaricida.

## ES 2 274 242 T3

Los compuestos dinitrofenólicos de Fórmula II también pueden incluir un compuesto de Fórmula II donde J es  $\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$  y  $\text{R}^5$  es  $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$  (Fórmula IIb). La Fórmula IIb también se conoce con el nombre de Chemical Abstracts carbonato de 1-metiletil-2-(1-metilpropil)-4,6-dinitro-fenilo (Número de Registro de CAS [973-21-7], con el nombre de la IUPAC carbonato de 2-sec-butil-4,6-dinitrofenil-isopropilo y con el nombre común dinobuton.



IIb

Dinobuton se divulga en la patente de la Gran Bretaña número 1,019,451 como un fungicida y un acaricida.

En el relato anterior, el término “alquilo”, utilizado sólo o en las palabras de un compuesto como “alquiltio” incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, como n-propilo de metiletilo, i-propilo, o los distintos isómeros de butilo, pentilo o hexilo. “Alquenilo” incluye alcanos de cadena lineal o ramificada como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y los distintos isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. “Alquenilo” también incluye polienos como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. “Alcóxido” incluye, por ejemplo, metóxido, etóxido, n-propilóxido, isopropilóxido y los distintos isómeros de butóxido, pentóxido y hexilóxido. “Alquiltio” incluye motivos alquiltio de cadena lineal o ramificada como metiltio, etiltio, y los distintos isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. “Cicloalquilo” incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. “Cicloalquilalquilo” incluye grupos alquilo sustituidos por grupos cicloalquilo, por ejemplo, ciclopropilmetiol, ciclopropiletio y ciclohexilmetilo.

El término “halógeno” incluye flúor, cloro, bromo o yodo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica mediante el prefijo “Ci-Cj”, donde i y j son números del 1 al 8. Cuando un compuesto se sustituye por un sustituyente que lleva un subíndice que indica el número de dichos sustituyentes que puede exceder de 1, dichos sustituyentes (cuando exceden de 1) se seleccionan de forma independiente del grupo de los sustituyentes definidos. Además, cuando el subíndice indica un rango, por ejemplo (R)*i-j*, entonces el número de sustituyentes se pueden seleccionar de los enteros entre i y j inclusive.

Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser un hidrógeno, por ejemplo  $\text{R}^4$ , entonces, cuando este sustituyente se toma como un hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a dicho grupo que no está sustituido.

Los compuestos adecuados para su uso de acuerdo con esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los varios estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un especialista en el campo apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede exhibir efectos beneficiosos cuando se enriquece respecto a los otros estereoisómero(s) o cuando se separa de los otros estereoisómero(s). Además, los especialistas en el campo saben como separar, enriquecer, y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Como consecuencia, la presente invención comprende compuestos de Fórmula I y de Fórmula II, sus N-óxidos y sus sales adecuadas. Los compuestos pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales, o como formas activamente ópticas.

Un especialista en el campo apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar N-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par libre disponible para la oxidación al óxido; un especialista en el campo reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar N-óxidos. Un especialista en el campo también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar N-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de N-óxidos de heterociclos y aminas terciarias se conocen bien por un especialista en el campo, incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con ácidos de peróxido como ácido peracético y m-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo como hidroperóxido de t-butilo, perborato de sodio, y dioxiranos como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de N-óxidos se han descrito de forma extensa y se han revisado en la literatura, véase por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

## ES 2 274 242 T3

Las sales de los compuestos que comprenden esta invención incluyen sales de adición ácida con ácidos inorgánicos o orgánicos como ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluensulfónico o valérico. Las sales de los compuestos que comprenden esta invención también incluyen aquellos formados con bases orgánicas (por ejemplo, piridina, amoníaco, o trietilamina) o bases inorgánicas (por ejemplo, hidruros, hidróxidos, o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario) cuando el compuesto contiene un grupo ácido como un ácido carboxílico o fenol.

Las composiciones preferidas por razones de coste, facilidad de síntesis y/o eficacia biológica son:

Preferido 1. Composiciones que comprenden la Fórmula I anterior como el componente (1), y sus sales adecuadas, donde R<sup>1</sup> es propilo o ciclopropilmetilo; y R<sup>2</sup> es propilóxido o propiltio.

Son de importancia los fungicidas de pirimidinona de Fórmula I que se seleccionan del grupo que consiste en

6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6,8-diiodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona,

6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, y

3-(ciclopropilmetil)-6-iodo-2-(propiltio)pirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Preferido 2. Composiciones de Preferido 1 donde el componente (2) se proporciona mediante dinocap.

Preferido 3. Composiciones de Preferido 2 donde G es un anillo de fenilo o tiofeno combinado; R<sup>1</sup> es propilo; R<sup>2</sup> es propilóxido; R<sup>3</sup> es Cl, Br o I en la posición 6; y R<sup>4</sup> es hidrógeno. Preferido 4. Composiciones de Preferido 2 donde el componente (1) comprende

6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona o

6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Preferido 5. Composiciones de Preferido 4 donde el componente (1) comprende

6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona o

Composiciones que incluyen aquellas en las que el componente (1) y el componente (2) se encuentran presentes en una cantidad efectiva fungicidamente y una proporción en peso del componente (1) respecto al componente (2) desde alrededor de 1:100 a 1:5000. Estas composiciones se consideran que son en particular efectivas para controlar las enfermedades de moho. Son de importancia las composiciones donde la proporción en peso del componente (1) respecto al componente (2) es de alrededor de 1:125 a 1:4000.

Esta invención también se refiere a métodos para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos que comprenden aplicar a la planta o a una de sus porciones, o a la semilla de la planta o al semillero, cantidades efectivas fungicidamente de las composiciones de la invención (por ejemplo, en forma de una composición que se describe aquí). Los métodos preferidos de utilizar incluyen aquellos que implican las composiciones preferidas anteriores; y las enfermedades controladas con efectividad particular incluyen las enfermedades de moho. Las combinaciones de fungicidas utilizados de acuerdo con esta invención se pueden utilizar para facilitar el control de la enfermedad y para retardar el desarrollo de la resistencia.

### *Efectos Sinérgicos*

Los fungicidas que controlan de forma efectiva la fungicidad de las plantas, en particular moho del trigo (*Erysife graminis*) se encuentran en constante demanda por los cultivadores. Las combinaciones de fungicidas a menudo se utilizan para facilitar el control de la enfermedad y para retardar el desarrollo de la resistencia. Las mezclas de fungicidas pueden proporcionar un mejor control significativo de la enfermedad que el que se podría predecir basándose en la actividad de los componentes individuales. Esta sinergia se ha descrito como “la acción cooperativa de dos com-

## ES 2 274 242 T3

ponentes de una mezcla, de forma que el efecto total es mayor o más prolongado que la suma de los efectos de los dos (o más) tomados de forma separada” (véase Tames, P. M. L., Neth. J. Plant Pathology, (1964), 70, 73-80). Se ha demostrado que las composiciones que contienen compuestos exhiben efectos sinérgicos.

5 La presencia de efectos sinérgicos entre dos ingredientes activos se establece con la ayuda de la ecuación de Colby (véase Colby, S. R. en Calculating synergic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations, Weeds, (1967), 15, 20-22):

$$10 \quad p = A + B - [(A \times B)/100]$$

15 Utilizando los métodos de Colby, la presencia de la interacción sinérgica entre dos ingredientes activos se establece mediante primero el cálculo de la actividad pronosticada, p, de la mezcla basándose en las actividades de los dos componentes aplicados solos. Si p es menor que el efecto establecido experimentalmente, la sinergia ha ocurrido. En la ecuación anterior, A es la actividad de fungicida en el control del porcentaje control de un componente aplicando sólo un índice x. El término B es la actividad de fungicida en control de porcentaje del segundo componente aplicado a un índice y. La ecuación estima p, la actividad de fungicida de la mezcla de A a un índice x con B a un índice y si sus efectos son estrictamente aditivos y no ocurre interacción.

La ecuación de Colby para una mezcla tres-veces mezcla es

$$25 \quad p = A + B + C + (A \times B \times C)/10000 - [(A \times B) + (A \times C) + (B \times C)]/100]$$

30 donde A, B y C son las actividades de fungicida de los tres componentes respectivamente.

Las composiciones se proporcionan de acuerdo con esta invención que comprenden proporciones de componente (1) y de componente (2) que son en especial útiles para controlar las enfermedades fungoideas particulares. Estas composiciones se consideran especialmente útiles para controlar el moho del trigo (*Erysife graminis*).

35 En esta aplicación, la actividad fungicida se proporciona mediante composiciones del componente (1) (compuestos de Fórmula I) y el componente (2) (compuestos de Fórmula II) solos se compara con aquella de composiciones del componente (1) y el componente (2) juntos. Basándose en la descripción de la sinergia desarrollada por Colby, las composiciones de la presente invención se considera que son sinérgicamente útiles. En consecuencia, esta invención proporciona un mejor método de combatir las enfermedades de moho, como el moho del trigo (*Erysife graminis*) en el cultivo, en especial de cereales.

### Formulación/Utilidad

45 Esta invención proporciona composiciones fungicidas que comprenden cantidades efectivas fungicidamente de las combinaciones de la invención y al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluentes sólidos o diluentes líquidos y/o al menos otro fungicida que presente un modo distinto de acción.

50 Las composiciones fungicidas de la presente invención comprenden una cantidad efectiva de una mezcla de los compuestos(s) del componente (1) (por ejemplo, 6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona-Compuesto 1 de la Tabla Índice A de más abajo) y el compuesto(s) del componente (2) (por ejemplo, dinocap). Las mezclas de esta invención se utilizarán en general como una formulación o composición con un transportador adecuado agrícola-mente y transportadores adecuados que comprendan al menos uno de un diluyente líquido, un diluyente sólido o un surfactante. En consecuencia, las composiciones que se proporcionan comprenden, además del una cantidad efectiva fungicidamente de compuesto(s) activo, al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Los ingredientes de la formulación o la composición se seleccionan para que sean consistentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, el modo de aplicación y los factores ambientales como el tipo de suelo, la humedad y la temperatura. Las formulaciones útiles incluyen líquidos como soluciones (incluyendo concentrados emulsificables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares que opcionalmente se pueden espesar en geles. Las formulaciones útiles además incluyen sólidos como polvos, polvillos, gránulos, comprimidos, pastillas, films, y similares que se pueden dispersar en agua (“humectante”) o solubles en agua. Los ingredientes activos pueden estar (micro)encapsulados y además formados a una suspensión o formulación sólida; de forma alternativa la formulación entera de los ingredientes activos se pueden poner en cápsulas(o “recubrir”). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación de los ingredientes activos. Las formulaciones esprayables se pueden extender de forma adecuada y se pueden utilizar a volúmenes de espray de alrededor de uno a varios centenares de litros por hectárea. Las composiciones de alta fuerza se utilizan en primera instancia como intermediarios para formulaciones adicionales.

## ES 2 274 242 T3

Normalmente, las Formulaciones contendrán cantidades efectivas de ingredientes activos, diluyentes y surfactantes, dentro de los siguientes rangos aproximados hasta llegar al 100% del peso.

		Porcentaje en Peso		
	<u>Ingredientes Activos</u>	<u>Diluyentes</u>	<u>Surfactantes</u>	
5				
10	Gránulos, Cápsulas y Polvos, dispersables y solubles en agua	5-90	0-94	1-15
	Suspensiones, Emulsiones, Soluciones (incluyendo Concentrados Emulsionantes)	5-50	40-94	0-15
15	Polvillos	1-25	70-99	0-5
	Gránulos y Aglomerados	0.01-99	5-99.99	0-15
	Composiciones de alta resistencia	90-99	0-10	0-2

20 Los sólidos diluyentes típicos son descritos en Watkins, *et al.*, *Handbook of Insecticide Dust Diluents y Carriers*, 2<sup>nd</sup> Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Los diluyentes líquidos descritos en Marseden, *Solvents Guide*, 2<sup>nd</sup> Ed., Interscience, New York, 1950. *McCutcheon's Detergents y Emulsifiers Annual*, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, y en Sisley y Wood, *Enciclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc, New York, 1964, proporcionan listados de surfactantes y usos recomendados. Todas las Formulaciones pueden contener pequeñas cantidades de aditivos para reducir la espuma, la sedimentación compacta, la corrosión, el crecimiento microbiológico y otros similares, o agentes espesores para incrementar la viscosidad.

30 Los surfactantes incluyen, por ejemplo, alcoholes polietoxilados, alquilfenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, dialquilo sulfosuccinados, alquilsulfatos, alquilbenzenos sulfonados, organosiliconas, *N,N*-dialquiltauratos, sulfonatos de lignina, condensados de sulfonato naftaleno formaldehído, policarboxilados, y poletoxilenos/polietoxipropilenos de bloques de copolímeros. Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas como bentonita, montmorillonita, attapulgita o caolín, almidón, azúcar, sílice, talco, tierra de diatomeas, urea, carbonato cálcico, carbonato y bicarbonato sódico y sulfato sódico. Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, 35 *N,N*-dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, *N*-alquilpirrolidón, etilenglicol, polipropilenglicol, parafina, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, aceites de oliva, ricino, semillas de lino, tung, sésamo, cacahuete, ésteres de ácidos grasos, cetonas como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxil-4-metil-2-pentanona, y alcoholes como metanol, ciclohexanol, alcohol de decanol, y tetrahidrofurfurilo.

40 Las soluciones que incluyen concentrados emulsionantes, se pueden preparar simplemente mezclando los ingredientes. Los polvillos y los polvos se pueden preparar mezclando y normalmente machacando en un molino de martillos, o en un molino de chorro. Las suspensiones se preparan normalmente por molienda húmeda; ver, por ejemplo, U.S. 3,060,084. Los gránulos y los aglomerados se pueden preparar pulverizando el material activo sobre portadores granulados preformados o por técnicas de aglomeración. Ver Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4<sup>th</sup> Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y International Patente Publication WO 91/13546. Los aglomerados se pueden preparar como están descritos en la U.S Patente NO. 4,172,714. Los gránulos que son dispersables y solubles en agua se pueden preparar como se muestra en la U.S patente No. 4.144.150, U.S patente No. 3.920.442 y la patente alemana DE 3.246.493. Las pastillas se pueden preparar como se muestra en la U.S patente No. 5, 180,587, U.S patente No. 5,232,701 y U.S patente No. 5,208,030. Las películas se pueden preparar como se muestra en la Aplicación de la Patente de la Gran Bretaña Patente GB 2,095,558 y la Patente de E.E.U.U. No 3,299,566.

55 Para más información acerca de la Formulación, véase la patente de E.E.U.U. No. 3,235,361, Col. 6, línea 16 hasta Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; la patente de E.E.U.U. No. 3,309,192, Col. 5, línea 43 hasta Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182;

60 La Patente de E.E.U.U. No. 2,891,855, Col. 3, línea 66 hasta Col. 5, línea 17 y los Ejemplos 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley y Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; y Hance *et al.*, *Weed Control Handbook*, 8<sup>th</sup> Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes son en peso y todas las Formulaciones se han preparado de forma convencional.

65

## ES 2 274 242 T3

### Ejemplo A

#### *Polvo Humectante*

5	Ingrediente(s) activos	65.0%
	Éter de polietilenglicol de dodecilfenol	2.0%
	Sulfonato de lignina sódico	4.0%
	Silicoaluminato sódico	6.0%
10	Montmorillonita (calcinada)	23.0%

### Ejemplo B

15	<i>Gránulo</i>	
	Ingrediente(s) activos	10.0%
20	Gránulos de attapulgita (materias de baja volatilidad, 0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 cedazos)	90.0%

### 25 Ejemplo C

#### *Aglomerados extrusionados*

30	Ingrediente(s) Activos	25.0%
	Sulfato anhídrico sódico	10.0%
	Sulfonato cálcico de lignina	5.0%
	Alquilo naftalenos de sulfonatos sódicos	1.0%
35	Bentonita de calcio/magnesio	59.0%

### Ejemplo D

40	<i>Concentrados emulsionantes</i>	
	Ingrediente(s) Activos	20.0%
	Mezcla de sulfonados de aceites solubles y éteres polioxielileno	10.0%
45	Isoforona	70.0%

50 Las composiciones de esta invención también pueden incluir uno o más insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento, quemoesterilantes, semiquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de alimentación adicionales u otros compuestos activos biológicamente para formar un pesticida multi-componente que dé un espectro más amplio de protección agrícola. Los Ejemplos de estos protectores agrícolas con las que las composiciones de esta invención se pueden formular son: insecticidas como abamectin, acefato, azinfos-metiol bifentrin, buprofezin, carbofurano, clorfenapir, clorpirifos, clorpirifos-metiol, ciflutrin, beta-ciflutin, cihalotin, lambda-cihalotrin, deltametrin, diafentiuon, diazinon, diflubenzuron, dimetoato, esfenvalerato, etiprole, fenoxicarb, fenpropatrin, fenvalerato, fipronil, flucidirinato, tau-fluvalinato, fonofos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, malation, metaldehído, metamidofos, metidation, metomil, methopreno, metoxicloro, monocrotofos, oxamilo, paration, paration-metilo permetrin, forato, pfsalon, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, rotenona, sulprofos, tebufenozida, tefluthin, terbufos, tetraclorvinfos, tiodicarb, tralometrin, tricloforon y triflumuron; fungicidas como acibenzolar, azoxistrobin, benomil, blastidicin-S, mezcla Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), bromuconazol, butiobato, carpropamid (KTU 3616), captafol, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, clotrimazol, oxiclورو de cobre, sales de cobre, cimoxanilo, ciflufenamid, ciproconazol, ciprodinilo (CGA 219417), (S)-3,5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH 7281), diclocimet (S-2900), diclomezina, dicloran, difenoconazol, (S)-3,5-dihidro-5-metil-2-(methiltio)-5-fenil-3-(fenil-amino)-4H-imidazol-4-ona (RP 407213), dimetomorf, dimoxistrobin (SSF-129), diniconazol, diniconazol-M, dodine, econazol, edifenfos, epoxiconazol (BAS 480F), famoxadone, fenarimol, fenbuconazole, fencaramid (SZX0722), fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorph, acetato de fentin, hidróxido de fentin, fluazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol folpet, fosetil-aluminio, furalaxil, furametapir (S-82658), hexa-



conazol, imazalilo, 6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, ipconazol, iprobenfos, iprodione, isoconazol, isoprotholane, kasugarmicin, kresoxim-metil, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepronil, metalaxil, metconazol, metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), metrafenona, miconazole, miclobutanil, neo-asozin (methnarsonato férrico), nicobifen, nuarinol, orisastrobin, oxadixil, penconazol, pencicuron, picoxistrobin, probenazol, procloraz, propamocarb, propiconazole, piraclostrobin, pirifenox, pirimetanil, procloraz, protioconazol, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, spiroxaminea, sulfuir, tebuconazol, tetraconazol, thiabendazole, thifluzamide, tiophanate-methyl, thiram, triadimefon, triadimenol, triarimol, triciclazole, triforine, triticonazole, uniconazole y validamicin; nematocidas como aldoxicarb y fenamifos; bactericidas como estreptomycin; acaricidas como amitraz, chinometionat, clorobenzilato, cihexatin, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, óxido de fenbutatin, fenpropatrin, fenpiroximato, hexittiazox, propargite, piridaben y tebufenpirad; y agentes biológicos como *Bacillus thuringiensis* incluyendo ssp. *aizawai* y *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, y bacteria, virus y hongo entomopatogénicos. Las descripciones de varios compuestos disponibles comercialmente que se han citado anteriormente se pueden encontrar en *The Pesticide Manual, Twelfth Edition*, C. D. S. Tomlin, ed., British Crop Protection Council, 2000. Para las incorporaciones donde uno o más de estos compuestos de mezclado se utilizan, la unidad de peso de estos varios compuestos de mezclado (en total) respecto a la cantidad total del componente (1) y el componente (2) normalmente es entre 100:1 y 1:3000. Son de importancia las unidades de peso entre 30:1 y 1:300 (por ejemplo índices entre 1:1 y 1:30). Es evidente que incluyendo estos compuestos adicionales se puede aumentar el espectro de enfermedades controladas más allá del espectro controlado por la combinación del componente (1) y el componente (2) solos.

Los compuestos del componente (1) (por ejemplo el Compuesto 1) de esta invención se considera que controlan los patógenos de las plantas mediante inhibición potente y diferenciación-específica, del proceso de infección. Los compuestos del componente (2) (por ejemplo dinocap) de esta invención se considera que desacoplan la fosforilación oxidativa mitocondrial. En ciertos casos, las combinaciones con otros fungicidas que presentan un modo distinto de acción serán en particular ventajosas para el manejo de la resistencia (en especial si los otros fungicidas también tienen un espectro similar de control). Son de importancia las composiciones que además del componente (1) y del componente (2) incluyen (3) al menos otro fungicida útil en el control de la enfermedad de moho pero que presente un modo distinto de acción distinto al del componente (1) y el componente (2). Los Ejemplos de otros fungicidas que presentan un modo distinto de acción incluyen compuestos que actúan en el complejo bc1 del sitio de transferencia electrónico de la cadena respiratoria mitocondrial de fungoideos, los compuestos que actúan en el enzima demetilasa de la ruta de la biosíntesis del esterol y los compuestos de morfolina y piperidina que actúan en la ruta de la biosíntesis del esterol.

#### 35 *Los Fungicidas del complejo bc<sub>1</sub>*

Son de importancia las combinaciones que incluyen el componente (1), el componente (2) y al menos un fungicida de estrobilurin. Los fungicidas de estrobilurin como azoxistrobin, dimoxistrobin (SSF-129), fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), orisastrobin, picoxistrobin, piraclostrobin y trifloxistrobin se sabe que presentan un modo de acción fungicida que inhibe el complejo de citocromo bc<sub>1</sub> en la cadena respiratoria mitocondrial (Angew. Chem. Int. Ed., 1999, 38, 1328-1349). Se describe metil(E)-2-[[6-(2-cianofenoxi)-4-pirimidinil]oxi]-alfa-(metoxiimino)benzeneacetato (también conocido como azoxistrobin) como el inhibidor del complejo bc<sub>1</sub> en Biochemical Society Transactions 1993, 22, 68S. Se describe metil(E)-alfa-(metoxiimino)-2-[(2-metilfenoxi)metil]benzeneacetato (también conocido como kresoxim-metil) como inhibidor del complejo bc<sub>1</sub> en Biochemical Society Transactions 1993, 22, 64S. Se describe (E)-2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metilbenzen-eacetamida como inhibidor del complejo bc<sub>1</sub> en Biochemistry and Cell Biology 1995, 85(3), 306-311.

Famoxadona y fenamidona son otros compuestos que inhiben el complejo bc<sub>1</sub> en la cadena respiratorio mitocondrial. Son de importancia las combinaciones que incluyen el componente (1), el componente (2) y al menos un compuesto que se selecciona del grupo que consiste en famoxadona y fenamidona.

A veces se hace al complejo bc<sub>1</sub> mediante otros nombres en la literatura bioquímica, incluyendo complejo III de la cadena de transferencia electrónica, y ubihidroquinona:citocromo c oxidoreductasa. Se identifica de forma única mediante el Número de la Comisión de Enzimas EC1.10.2.2. El complejo bc<sub>1</sub> se describe, por ejemplo, en J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-38; Métodos Enzymol. 1986, 126, 253-71; y las referencias se citan allí. El Fungicida Resistance Action Committee (FRAC) del Global Crop Protection Federation (GCPF) se refiere a compuestos que inhiben el complejo bc<sub>1</sub> como inhibidores de Qo (QoI) ya que todos ellos actúan en el exterior del sitio de unión de Quinol (Qo) del complejo bc<sub>1</sub> de citocromo.

#### 60 *Los Fungicidas inhibidores de la biosíntesis del esterol (SBI)*

Las clases de inhibidores de la biosíntesis del esterol incluyen compuestos DMI y no-DMI, que controlan los hongos mediante la inhibición de enzimas de la ruta de biosíntesis del esterol. La FRAC agrupa estos fungicidas juntos como fungicidas SBI. Los fungicidas DMI presentan un sitio común de acción dentro la ruta de biosíntesis del esterol de fungoideos; que es, una inhibición de demetilación en la posición 14 de lanosterol o 24-metileno dihidrolanosterol, que son los precursores de los esterol en los hongos. Los compuestos que actúan a menudo se denominan inhibi-

dores de demetilasa, fungicidas DMI, o DMIs. El enzima demetilasa a veces se denomina mediante otros nombres en la literatura bioquímica, incluyendo citocromo P-450 (14DM). El enzima demetilasa se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 y en las referencias que se citan allí. Los fungicidas DMI forman diversas clases: azoles (incluyendo triazoles y imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, ipconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalil, isoconazol, miconazol y procloraz. Son de importancia las combinaciones que incluyen el componente (1), el componente (2) y al menos un fungicida de azol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han mostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI tal y como se describe por K. H. Kuck, *et al.* en *Modern Selective Fungicides-Properties, Applications and Mechanisms of Action*, Lyr, H., Ed.; Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258.

Los fungicidas DMI se han agrupado juntos para distinguirlos de otros inhibidores de la biosíntesis del esteroles, como los fungicidas de morfolina y piperidina y espiroxamina (comúnmente agrupados juntos por la FRAC como los también denominados fungicidas "morfolina"). Las morfolinas incluyen aldiform, dodorm, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidin. La espiroxamina es una espirocetalamina. Las "morfolinas" también son inhibidores de la biosíntesis del esteroles pero se ha mostrado que inhiben otros pasos en la biosíntesis del esteroles. Las investigaciones bioquímicas han mostrado que todos los fungicidas "morfolina" mencionados anteriormente son fungicidas inhibidores de la biosíntesis del esteroles tal y como se describe por K. H. Kuck, *et al.* en *Modern Selective Fungicides-Properties, Applications and Mechanisms of Action*, Lyr, H., Ed.; Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 185-204. Los enzimas isomerasa D8.RTM.D7 y reductasa D14 Inhiben en un nivel variable en la ruta de biosíntesis del esteroles. Son de importancia las combinaciones que incluyen el componente (1), el componente (2) y al menos un fungicida de "morfolina".

Son de importancia las combinaciones del componente (1) (por ejemplo el Compuesto 1) y el componente (2) (por ejemplo dinocap) con azoxistrobin, fluoxastrobin, kesoxim-metilo, trifloxistrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, dimoxistrobin (SSF-129), metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), carbendazim, clorotalonil, ciprodinil, quinoxifen, metrafenona, ciflufenamid, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, hexaconazol, ipconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, tebuconazol, triticonazol, procloraz o nicobifen.

Se prefieren para un mejor control de las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos (por ejemplo, índice de uso menor o espectro más amplio de control de los patógenos de las plantas) o la gestión de la resistencia, las mezclas del componente (1) (por ejemplo el Compuesto 1) y el componente (2) (por ejemplo dinocap) con un fungicida que se selecciona del grupo que consiste en azoxistrobin, kesoxim-metil, trifloxistrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, dimoxistrobin (SSF-129), metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), quinoxifen, metrafenona, ciflufenamid, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, ciproconazol, epoxiconazol, fluquinconazol, flusilazol, metconazol, propiconazol, tebuconazol y triticonazol.

Las composiciones de esta invención son útiles como agentes de control de las enfermedades de las plantas. En consecuencia la presente invención comprende además un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos que comprende aplicar a la planta o a una porción de la planta que se debe proteger, o a la semilla de la planta o al semillero que se debe proteger, una cantidad efectiva de una composición de la invención. Las composiciones en particular son efectivas en el control de las enfermedades de moho causadas por patógenos de las plantas fungoideos. Las enfermedades de moho incluyen moho en la fruta de pepita, la fruta cítrica, en las bayas, la parra (incluyendo uva), el algodón, cucurbitáceas, plantas ornamentales, tabaco, lúpulo, fresas y algunos vegetales, y oidio del grosellero en la grosella espinosa y las grosellas. Son de importancia los métodos para controlar el moho del trigo que comprende aplicar una composición de esta invención. Los patógenos fugales que causan estas enfermedades incluyen *Erysife graminis* (el agente causante del moho del cereal en el cultivo de cereales como trigo, avena y cebada), *Uncinula necatur* (el agente causante de moho en la uva), *Sphaerotheca fuliginea* (el agente causante de moho en cucurbitáceas) y moho relacionados de los géneros y especies de *Erysife*, *Sphaerotheca*, *Microsphaera* y *Podospaera*. Son de importancia los métodos para controlar *Erysife graminis* que incluye aplicar una composición de esta invención.

En particular cuando el componente (1) y el componente (2) se mezclan con componentes de fungicidas adicionales, las composiciones de esta invención también pueden proporcionar el control de las enfermedades causadas por un espectro más amplio de patógenos de las plantas fungoideos en las clases *Basidiomycete*, *Ascomycete*, *Oomycete* y *Deuteromycete*. Pueden ser efectivos en el control de un amplio espectro de enfermedades de las plantas, en particular los patógenos foliares del cultivo ornamental, vegetal, del campo, de cereales, y de la fruta. Estos patógenos incluyen *Plasmopara viticola*, *Phytophthora infestans*, *Peronospora tabacina*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Pythium aphanidermatum*, *Alternaria brassicae*, *Septoria nodorum*, *Septoria tritici*, *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Cercospora beticola*, *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, *Piricularia oryzae*, *Podospaera leucotricha*, *Venturia inaequalis*, *Erysife graminis*, *Uncinula necatur*, *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia arachidis*, *Rhizoctonia solani*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Fusarium oxysporum*, *Verticillium dahliae*, *Pythium aphanidermatum*, *Phytophthora megasperma*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Sclerotium rolfsii*, *Erysife polygoni*, *Pirenophora teres*, *Gaeumannomyces graminis*,

## ES 2 274 242 T3

*Rynchosporium secalis*, *Fusarium roseum*, *Bremia lactucae* y otros géneros y especies muy relacionados con estos patógenos.

Por ejemplo, esta invención proporciona métodos para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos que comprenden aplicar a la planta o a su porción que se debe proteger, o a la semilla de la planta o al semillero que se debe proteger uno de los siguientes:

- A) Una cantidad efectiva de una composición de fungicida que comprenda el componente (1), el componente (2), y al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos; o
- B) una cantidad efectiva de una mezcla física de (i) una cantidad efectiva de una primera composición que comprenda el componente (1) y al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos; y (ii) una cantidad efectiva de una segunda composición que comprenda el componente (2) y al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos.

Esta invención también proporciona un método para controlar las enfermedades de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos que comprenden aplicar a la planta o a una de sus porciones, o a la semilla de la planta o al semillero, una cantidad efectiva fungicidamente de una combinación del componente (1), el componente (2) y al menos otro fungicida que tenga un modo distinto de acción.

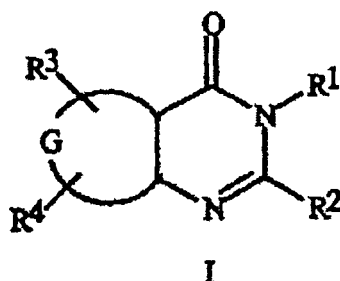
Los métodos ventajosos incluyen aquellos en los que el componente (1) y el componente (2) se añaden en cantidades suficientes para proporcionar una efectividad fungicida mayor que la suma de las efectividades proporcionadas por aquellas cantidades de dichos componentes tomados de forma independiente.

El control de las enfermedades de las plantas se cumple de forma ordinaria mediante la aplicación de una cantidad efectiva de una composición de esta invención pre- o post-infección, a la porción de la planta que se debe proteger como las raíces, el tronco, el follaje, la fruta, las semillas, los tubérculos o los bulbos, o al medio (suelo o arena) en los que se crece la planta que se debe proteger. Las composiciones también se pueden aplicar a la semilla para proteger la semilla y el semillero. Las composiciones de esta invención son en particular útiles cuando se aplican antes de la infección. Las composiciones de fungicidas de esta invención también pueden comprender (además de las cantidades efectivas fungicidamente de la combinación del componente (1) y del componente (2)) al menos un componente adicional que se selecciona del grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos y/o al menos otro fungicida que presente un modo distinto de acción.

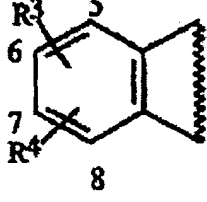
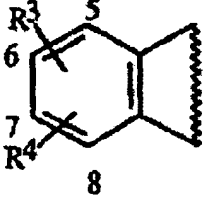
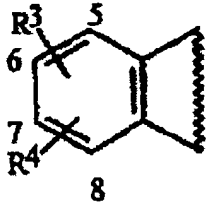
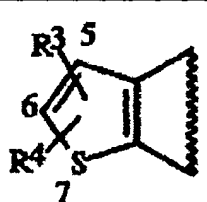
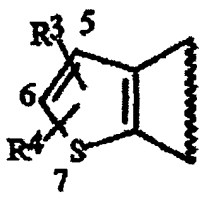
Los índices de aplicación para estas composiciones pueden estar influenciados por muchos factores del entorno y se deben determinar bajo las condiciones de uso reales. El follaje normalmente se puede proteger cuando se trata con un índice de menos de 1 g/ha a 5,000 g/ha de los ingredientes activos. Las semillas y los semilleros normalmente se pueden proteger cuando la semilla se trata con un índice de desde 0.1 a 10 g por kilogramo de semilla.

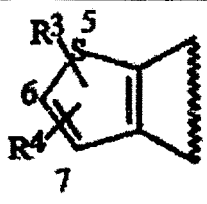
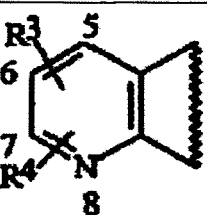
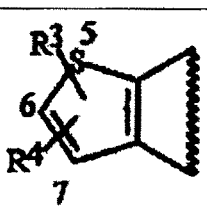
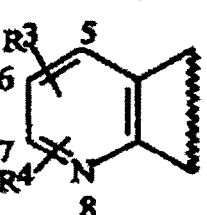
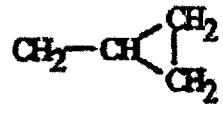
Véase la Tabla A para las descripciones de los compuestos del componente (1) seleccionados.

TABLA ÍNDICE A



ES 2 274 242 T3

Cmpd. No.	G	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	p.f. (°C)
1		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-I	H	48-49
2		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Br	H	57-59
3		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-I	4-I	135- 138
4		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Cl	H	69-70
5		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Br	H	68-71

5	6		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	7-Br	H	162-165
10	7		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Br	H	100-103
20	8		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-Br	7-Br	94-96
30	9			SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-I	H	159-161

40 Los compuestos del componente (2) se encuentran disponibles comercialmente, normalmente en una formulación. Es de importancia el dinocap, que se encuentra disponible comercialmente en forma de polvo humectable al 19.5%. La formulación se conoce como Karathane®.

45 Sin más elaboración, se cree que un especialista en el campo utilizando la descripción expuesta anteriormente puede utilizar la presente invención en toda su extensión. El siguiente ejemplo, en consecuencia, debe interpretarse de forma meramente ilustrativa y no limita en absoluto la divulgación. Los porcentajes son en peso excepto cuando se indica lo contrario.

50 Ejemplo 1

Los siguientes TESTS muestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención sobre un patógeno específico. La protección del control de patógeno proporcionada por los compuestos no está limitada, sin embargo, a estas especies.

55 Las soluciones o las suspensiones del Test que comprenden un solo ingrediente activo se esprayan para demostrar la eficacia en el control del ingrediente activo de forma individual. Para demostrar la eficacia de control de una combinación, (a) los ingredientes activos se pueden combinar en las cantidades apropiadas en una sola suspensión del test, (b) Las soluciones madre de los ingredientes activos individuales se pueden preparar y después combinar en la proporción adecuada, y diluir hasta la concentración final deseada para formar una suspensión del test o (c) las suspensiones del test que comprenden ingredientes activos solos se pueden esprayar de forma secuencial en la proporción adecuada.

Protocolo general para preparar las suspensiones del test:

65 Los compuestos del componente (1) se pueden formular antes de la aplicación en estos tests. Un ejemplo de formulación es el Ejemplo E.

## ES 2 274 242 T3

### Ejemplo E

#### Concentrado Emulsificable

5	Material técnico del Compuesto 1 (97%)	21.1%
	Aceite de semilla metilado	68.6
	Mezcla emulsificable aniónica/no iónica	10.3

10 La formulación que contiene un compuesto del componente (1) se disuelve en agua para formar una solución madre. Para testar el componente (1) de forma individual la solución madre se diluye a la concentración final deseada para formar una solución del test. Por ejemplo, las composiciones del componente (1) (por ejemplo, el Compuesto 1 de la Tabla Índice A), solo o en combinación, se esprayan a 0.08 o 0.4 ppm hasta el punto de final sobre las plantas del test, equivalente a un índice de 0.2 o 1 g/ha, respectivamente.

15 La formulación del componente (2) disponible comercialmente (por ejemplo el Karathane® formulación de polvo humectable al 19.5% de dinocap) se suspende en agua para formar una suspensión madre. Para probar el componente (2) de forma individual la suspensión madre se diluye a la concentración final deseada para formar una suspensión del test. Por ejemplo, el dinocap, sólo o en combinación, se espraya a 10, 40 o 200 ppm hasta el punto final sobre las plantas del test, equivalente a índices de 25, 100 o 500 g/ha, respectivamente.

20 Para probar las combinaciones, las suspensiones madre de los ingredientes activos individuales preparadas, tal y como se ha mostrado anteriormente, entonces se combinan con la proporción adecuada, y se diluyen hasta la concentración final deseada para formar una suspensión de prueba.

25 Las suspensiones del test resultantes entonces se utilizan en los siguientes tests. Las suspensiones del test se esprayan hasta el punto final sobre las plantas del test a los índices del ingrediente activo descritos anteriormente. Los tests se replicaron tres veces y los resultados se comunican como el promedio de los tres replicados.

#### 30 Test A

35 La suspensión del test se esprayó hasta el punto final sobre el semillero de trigo. El siguiente día los semilleros se inocularon con una polvo de spora de *Erysife graminis f. sp. tritici*, (el agente causal del moho del trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20°C durante 8 días, después de los cuales se midieron los índices de las enfermedades.

40 Los resultados para el Test A se muestran en la Tabla A. En la tabla, un índice de 100 indica el 100% de control de la enfermedad y un índice de 0 indica un no control de la enfermedad (respeto a los controles). Las columnas etiquetadas con Control de la Enfermedad controlada indican el promedio de los tres replicados. Las columnas etiquetadas con Control de la Enfermedad Esperada indican el valor esperado para cada mezcla de tratamiento utilizando la ecuación de Colby. Un “-” indica que un valor esperado no se calcula utilizando la ecuación de Colby para los tests de un solo compuesto. Los tests que demuestran un mayor control del esperado se indican con \*.

45

(Tabla pasa a página siguiente)

50

55

60

65

## ES 2 274 242 T3

TABLA A

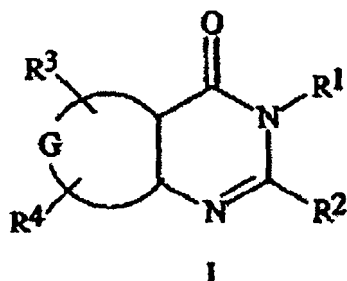
Tratamiento del Test	Índice de aplicación (ppm)	Control de la Enfermedad Observada (%)	Control de la Enfermedad Esperada (%)
Compuesto 1	0.08	80	-
Compuesto 1	0.4	99	-
Dinocap	10	45	-
Dinocap	40	76	-
Dinocap	200	98	-
Compuesto 1 + Dinocap	0.08+ 10	95	89*
Compuesto 1 + Dinocap	0.4 +10	99	99.45
Compuesto 1 + Dinocap	0.08 + 40	99	95.2*
Compuesto 1 + Dinocap	0.4 + 40	99	99.76
	0.08 + 200	99	99.6
Compuesto 1 + Dinocap	0.4 + 200	100	99.98

Basándose en la descripción de la sinergia desarrollada por Colby, las composiciones de la presente invención se consideran que son sinérgicamente útiles. En consecuencia, esta invención proporciona un método mejorado para combatir la enfermedad de moho, como el trigo moho (*Erysife graminis*) en el cultivo, especialmente de cereales.

## REIVINDICACIONES

1. Una composición fungicida que comprenda:

(1) al menos un compuesto seleccionado entre las pirimidononas combinadas de Fórmula I, sus N-óxidos, y sus sales adecuadas,



donde G es un anillo de fenilo, tiofeno o piridina combinado;

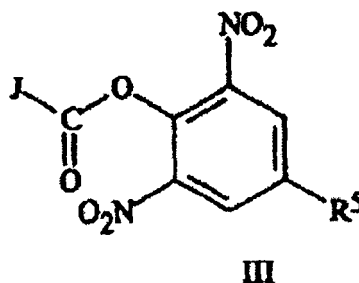
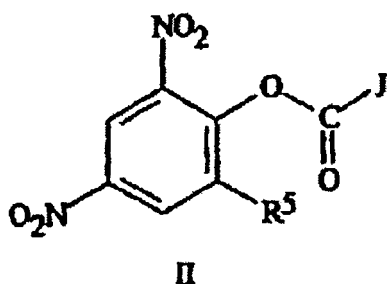
R<sup>1</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilalquil de C<sub>4</sub>-C<sub>7</sub>;

R<sup>2</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxido de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o alquiltio de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es halógeno; y

R<sup>4</sup> es hidrógeno o halógeno; y

(2) al menos un compuesto dinitrofenólico que se selecciona del grupo que consiste en compuestos de Fórmula II y compuestos de Fórmula III



donde J es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxido de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o alquenido de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; y R<sup>5</sup> es alquilo de C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>.

2. Una composición de la reivindicación 1 donde en el componente (1), R<sup>1</sup> es propilo o ciclopropilmetilo y R<sup>2</sup> es propilóxido o propiltio.

3. Una composición de la reivindicación 1 o la reivindicación 2 donde el componente (2) se proporciona mediante dinocap.

4. Una composición de la reivindicación 2 o la reivindicación 3 donde el componente (1) comprende un compuesto que se selecciona del grupo que consiste en

6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6,8-diiodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona,

6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(-3H)-ona,



## ES 2 274 242 T3

6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,

6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona, y

5 3-(ciclopropilmetil)-6-iodo-2-(propiltio)pirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

5. Una composición de la reivindicación 3 donde G es un anillo de fenilo o tiofeno combinado; R<sup>1</sup> es propilo; R<sup>2</sup> es propilóxido; R<sup>3</sup> es Cl, Br o I en la posición 6; y R<sup>4</sup> es hidrógeno.

10 6. Una composición de la reivindicación 3 donde el componente (1) comprende 6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona o 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

15 7. Una composición de la reivindicación 6 donde el componente (1) comprende 6-iodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona.

8. Una composición de la reivindicación 1 que comprende un compuesto de Fórmula II y un compuesto de Fórmula III.

20 9. Una composición de la reivindicación 1 que además comprenda (3) al menos otro fungicida útil en el control de de la enfermedad de moho pero que presente un modo distinto de acción al componente (1) y al componente (2).

25 10. Una composición de la reivindicación 9 donde el componente (3) incluye al menos un fungicida que se selecciona del grupo que consiste en compuestos que actúan al complejo *bc*<sub>1</sub> del sitio de transferencia electrónica de la cadena respiratoria mitocondrial, los compuestos que actúan en el enzima demetilasa de la ruta de biosíntesis del esterol y los compuestos de morfolina y piperidina que actúan en la ruta de biosíntesis del esterol.

30 11. Un método para controlar la enfermedad de moho de las plantas causadas por patógenos de las plantas fungoideos, que comprenda aplicar a la planta o a una porción, o a la semilla de la planta o al semillero, una cantidad efectiva fungicidamente de una composición de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10.

12. El método de la reivindicación 11 donde se controla el moho de trigo.

13. El método de la reivindicación 11 donde se controla los patógenos de las plantas fungoideos *Erysife graminis*.

35

40

45

50

55

60

65