

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 705 618**

51 Int. Cl.:

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 249/14 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.04.2013** **E 16179944 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.10.2018** **EP 3121172**

54 Título: **Sal de sodio de 2-cloro-3-(metilsulfanil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida y su uso como herbicida**

30 Prioridad:

03.05.2012 EP 12166621

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

26.03.2019

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**BRAUN, RALF;
DÖRNER-RIEPING, SIMON;
AHRENS, HARTMUT;
WALDRAFF, CHRISTIAN;
KÖHN, ARNIM;
DIETRICH, HANSJÖRG;
GATZWEILER, ELMAR y
ROSINGER, CHRISTOPHER**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones:

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

ES 2 705 618 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

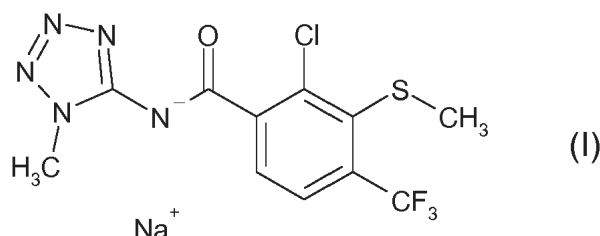
Sal de sodio de 2-cloro-3-(metilsulfanil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida y su uso como herbicida

5 La invención se refiere al área técnica de los herbicidas, especialmente al de los herbicidas para combatir selectivamente malas hierbas y malas gramíneas en cultivos de plantas útiles.

En el documento WO 2012/028579 A1 se revelan las N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)benzamidas como herbicidas. En las solicitudes EP11176378 y EP11187669 de prioridad más antigua que no fueron publicadas previamente se revelan amidas de los ácidos N-(tetrazol-5-il)- y N-(triazol-5-il)arilcarboxílicos como herbicidas. Sin embargo, estos principios activos no siempre evidencian un efecto satisfactorio frente a plantas nocivas y/o en parte no presentan suficiente tolerancia con algunas plantas de cultivo importantes, como especies de cereales, maíz o arroz.

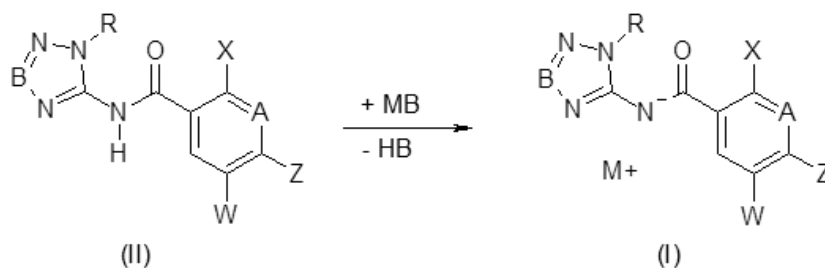
Es objetivo de la presente invención, por lo tanto, poner a disposición otros principios activos de acción herbicida. Este objetivo se consigue por medio de la sal de sodio de acuerdo con la invención descrita a continuación de una amida del ácido N-(tetrazol-5-il) arilcarboxílico.

15 Un objeto de la presente invención es, por lo tanto, la sal de sodio de 2-cloro-3-(metilsulfanil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida de la fórmula (I)



El compuesto de acuerdo con la invención puede representarse, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento indicado en el esquema 1 mediante desprotonación de una N-(tetrazol-5-il)-benzamida con una base adecuada de la fórmula M^+B^- (esquema 11), siendo B^- , por ejemplo, hidruro, aniones de hidroxilo o alcoxi, como metoxi, etoxi, n-propoxi, i-propoxi, n-butoxi o t-butoxi.

Esquema 1



En las fórmulas (I) y (II) los sustituyentes tienen el siguiente significado;

25 A significa CY
B significa N
R significa metilo
X significa cloro
Y significa SCH₃
Z significa CF₃
W significa hidrogeno

30 Puede prepararse la N-(tetrazol-5-il)benzamida de la fórmula (II) por ejemplo según los procedimientos descritos en los documentos WO 2012/028579 A1, EP11176378 y EP11187669.

El compuesto de acuerdo con la invención de la fórmula (I) presenta una excelente efectividad herbicida contra un amplio espectro de plantas dañinas mono- y dicotiledóneas anuales de importancia económica. Los principios activos también combaten bien plantas dañinas perennes que son difíciles de combatir y brotan de rizomas, raíces o

de otros órganos permanentes.

Es por consiguiente también objeto de la presente invención un procedimiento para combatir plantas no deseadas o para regular el crecimiento de plantas, preferentemente en cultivos de plantas, en el que el compuesto de acuerdo con la invención se aplica a las plantas (por ejemplo plantas dañinas tales como malas hierbas monocotiledóneas o dicotiledóneas o plantas de cultivos no deseadas), a las semillas (por ejemplo granos, semillas u órganos de reproducción vegetativa tales como tubérculos o renuevos con brotes) o al área en la que crecen las plantas (por ejemplo el área cultivada). En este contexto, el compuesto de acuerdo con la invención puede aplicarse por ejemplo antes de la siembra (dado el caso también mediante la incorporación en el suelo), en la preemergencia o la post-emergencia. Se mencionarán los ejemplos de representantes individuales de malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas que pueden combatirse mediante el compuesto de acuerdo con la invención, aunque no existe la intención de imponer una restricción a las especies mencionadas.

Plantas dañinas monocotiledóneas de los géneros: Aegilops, Agropiron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Malas hierbas dicotiledóneas de los géneros: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euforbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sfenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Verónica, Viola, Xanthium.

Si el compuesto de acuerdo con la invención se aplica en la superficie del suelo antes de la germinación, se evita por completo la emergencia de los brotes de malas hierbas o las malas hierbas crecen hasta presentar la primera hoja, luego dejan de crecer y finalmente se extinguen por completo en el transcurso de tres a cuatro semanas.

Al aplicar el principio activo a las partes verdes de las plantas en un procedimiento de post-emergencia, también se produce una detención del crecimiento y las plantas dañinas permanecen en el estadio de crecimiento que presentaban en el momento de la aplicación o después de un cierto plazo se extinguen por completo, de modo que la competencia de las malas hierbas tan perniciosa para las plantas de cultivo se eliminan muy temprano y en forma exhaustiva.

Aunque el compuesto de acuerdo con la invención muestra una excelente acción herbicida frente a malas hierbas mono y dicotiledóneas, las plantas de cultivo de cultivos de importancia económica, tales como cultivos dicotiledóneos, por ejemplo del género Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia o cultivos monocotiledóneos del género Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, especialmente Zea y Triticum, solo son dañados de modo insignificante o no son dañados de modo alguno, dependiendo de la cantidad de aplicación. El compuesto presente por estos motivos es muy adecuado para combatir en forma selectiva el crecimiento de plantas no deseadas en plantaciones de cultivos agrícolas u ornamentales.

El compuesto de acuerdo con la invención (dependiendo de la cantidad de aplicación utilizado) además presenta excelentes propiedades de regulación del crecimiento en plantas de cultivo. Incide en forma reguladora en el metabolismo propio de las plantas y pueden así utilizarse para actuar en forma dirigida sobre sustancias contenidas en las plantas y para facilitar la cosecha, como p. ej. al iniciar el secado y limitar el crecimiento. Además es adecuado para el control general y la inhibición de crecimiento vegetativo no deseado, sin por ello eliminar las plantas. Una inhibición del crecimiento vegetativo es de suma importancia en muchos cultivos mono y dicotiledóneos, dado que así se puede reducir o suprimirse por completo el almacenamiento.

Debido a sus propiedades herbicidas y de regulación de crecimiento de las plantas, el principio activo también puede usarse para combatir plantas nocivas en cultivos de plantas genéticamente modificadas conocidas o aún en desarrollo. Las plantas transgénicas en general se caracterizan porque presentan propiedades especialmente beneficiosas, por ejemplo por ser resistentes frente a determinados pesticidas, ante todo determinados herbicidas, resistentes frente a patologías de plantas o agentes de patologías de plantas, como determinados insectos o microorganismos, como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales se refieren, por ejemplo, al material de cosecha respecto de la cantidad, calidad, capacidad de almacenamiento, composición y componentes especiales. Así se conocen plantas transgénicas con contenido de almidón aumentado o calidad de almidón modificada o aquellas con distinta composición del ácido graso del material de cosecha.

Con respecto a cultivos transgénicos es preferente la aplicación de los compuestos de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y de adorno, p. ej., de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, papa, tomate, guisante y otras especies de hortalizas. Preferentemente, el compuesto de acuerdo con la invención puede

usarse como herbicida en cultivos de plantas útiles que son resistentes a los efectos fitotóxicos de los herbicidas, o bien, se hicieron resistentes mediante ingeniería genética..

Es preferente la aplicación del compuesto de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos de importancia económica de plantas útiles y de adorno, p. ej., de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz y maíz o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, papa, tomate, guisante y otras especies de hortalizas. Preferentemente, el compuesto de acuerdo con la invención puede usarse como herbicida en cultivos de plantas útiles que son resistentes a los efectos fitotóxicos del herbicida, o bien, se hicieron resistentes mediante ingeniería genética..

Las vías usuales para la producción de nuevas plantas que en comparación con las plantas que existen hasta ahora, presentan características modificadas consisten por ejemplo en procedimientos clásicos de cultivo y en la producción de mutantes. En forma alternativa pueden producirse nuevas plantas con propiedades modificadas por medio de procedimientos de ingeniería genética (véase p. ej., los documentos EP-A-0221044, EP-A-0131624). Se han descrito por ejemplo en varios casos

- modificaciones por ingeniería genética de plantas de cultivo a efectos de modificar el almidón sintetizado en las plantas (p. ej., documentos WO 92/011376, WO 92/014827, WO 91/019806),
- plantas de cultivo transgénicas que son resistentes a determinados herbicidas del tipo de los glufosinatos (cf. p. ej., los documentos EP-A-0242236, EP-A-0242246) o glifosatos (documento WO 92/000377) o de las sulfonilureas (documentos EP-A-0257993, US-A-5.013.659),
- plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toximas del *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que tornan resistentes las plantas contra determinadas plagas (documentos EP-A-0142924, EP-A-0193259).
- plantas de cultivo transgénicas con composición de ácidos grasos modificada (documento WO 91/13972).
- plantas de cultivo modificadas por ingeniería genética con nuevos componentes o sustancias secundarias, p. ej., nuevas fitoalexinas, que generan una mayor resistencia a enfermedades (documentos EPA 309862, EPA464461)
- plantas de cultivo modificadas por ingeniería genética con fotorrespiración reducida que presentan mayores rendimientos y una mayor tolerancia al estrés (documento EPA 0305398)
- plantas transgénicas de cultivo que producen proteínas de importancia farmacéutica o diagnóstica ("molecular pharming")
- plantas transgénicas de cultivo que se caracterizan por mayores rendimientos o una mejor calidad,
- plantas transgénicas de cultivo que se caracterizan por una combinación p. ej. de las nuevas propiedades antes mencionadas ("gene stacking").

En principio se conocen numerosas técnicas de biología molecular con las cuales se pueden producir nuevas plantas transgénicas con propiedades modificadas, véase p. ej., I. Potrykus y G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer a Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer editorial Berlin, Heidelberg, o Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423–431.

Para tales manipulaciones de ingeniería genética pueden introducirse moléculas de ácido nucleico en plásmidos que permiten una mutagénesis o una modificación de secuencia mediante la recombinación de secuencias de ADN. Con ayuda de procedimientos estándar pueden efectuarse por ejemplo cambios de bases, eliminarse secuencias parciales o agregarse secuencias naturales o sintéticas. Para la unión de los fragmentos de ADN entre sí, pueden colocarse adaptadores o engarces en los fragmentos, véase p. ej., Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2ª edición Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; o Winnacker "Gene y Klone", VCH Weinheim 2ª edición 1996.

La obtención de células de plantas con una menor actividad de un producto génico puede lograrse, por ejemplo, mediante la expresión de al menos un correspondiente ARN de sentido contrario, un ARN en el sentido del marco de lectura para lograr un efecto de cosupresión o la expresión de al menos una ribozima construida de modo correspondiente, que escinda específicamente transcripciones del producto génico que se menciona previamente. Para ello, por una parte pueden usarse moléculas de ADN que incluyan toda la secuencia codificadora de un producto génico, incluyendo las secuencias flanqueantes eventualmente existentes, como también moléculas de ADN que solo comprendan partes de la secuencia codificadora, debiendo tener estas partes la longitud suficiente para lograr un efecto anti sentido en las células. También es posible utilizar secuencias de ADN que presenten un alto grado de homología con las secuencias codificadoras de un producto génico, pero no sean totalmente idénticas.

En la expresión de moléculas de ácido nucleico en plantas, la proteína sintetizada puede estar localizada en cualquier compartimiento de la célula de la planta. Pero para lograr la ubicación en un determinado compartimiento, la región codificadora puede p. ej. enlazarse con secuencias de ADN, que aseguren la ubicación en un determinado compartimiento. Tal tipo de secuencias son conocidas por el experto en la materia (véase por ejemplo, Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219–3227; Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* 85 (1988), 846–850; Sonnewald et al., *Plant J.* 1 (1991), 95–106). La expresión de las moléculas de ácido nucleico también puede realizarse en las organelas de las células de las plantas.

Las células de plantas transgénicas pueden regenerarse según técnicas conocidas para formar plantas completas. En las plantas transgénicas puede tratarse principalmente de plantas de cualquier especie de plantas conocida, es decir, tanto de plantas monocotiledóneas, como también de dicotiledóneas.

5 De ese modo pueden obtenerse plantas transgénicas que presentan propiedades modificadas mediante la sobreexpresión, supresión o inhibición de genes o secuencias de genes homólogos (= naturales) o la expresión de genes o secuencias de genes heterólogos (= ajenos).

10 De preferencia, el compuesto de acuerdo con la invención puede aplicarse en cultivos transgénicos que son resistentes contra sustancias de crecimiento, como p. ej. dicamba o contra herbicidas que inhiben enzimas esenciales de plantas, p. ej. acetolactatosintasas (ALS), EPSP sintasas, glutaminsintasas (GS) o hidroxifenilpiruvato dioxigenasas (HPPD) o bien son resistentes a herbicidas del grupo de las sulfonilureas, los glifosatos, los glufosinatos o benzolisoaxazol y sustancias activas análogas.

15 Al aplicar el agente herbicida de acuerdo con la invención en cultivos transgénicos, además de los efectos que se observan en otros cultivos respecto de plantas nocivas, con frecuencia se producen efectos que son específicos para la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo un espectro de malas hierbas que puede ser combatido modificado o especialmente ampliado de cantidades de aplicación modificadas que se pueden usar para la aplicación, de preferencia una buena capacidad de combinación con los herbicidas a los que es resistente el cultivo transgénico, así como la influencia sobre el crecimiento y el rendimiento de plantas de cultivo transgénicas.

Por lo tanto también es objeto de la invención el uso del compuesto de acuerdo con la invención como herbicida para combatir plantas dañinas en plantas de cultivo transgénicas.

20 El compuesto de acuerdo con la invención muestra en comparación con su correspondiente ácido una mayor solubilidad en agua y con ello por ejemplo propiedades de formulación más ventajosas. Es muy adecuado para la preparación de formulaciones de base acuosa.

25 El compuesto de acuerdo con la invención pueden usarse, por ejemplo, en forma de polvos humectables, concentrados emulsionables, soluciones pulverizables, sustancias de espolvoreo o granulados en las formulaciones usuales. Son por lo tanto también objeto de la invención agentes herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas que comprenden el compuesto de acuerdo con la invención.

30 El compuesto de acuerdo con la invención puede formularse de diferentes maneras dependiendo de los parámetros biológicos y/o fisicoquímicos predeterminados. Como posibles formulaciones se incluyen por ejemplo: polvos humectables (WP), polvos solubles en agua (SP), concentrados solubles en agua, concentrados emulsionables (EC), emulsiones (EW), como emulsiones aceite en agua y agua en aceite, soluciones pulverizables, concentrados en suspensión (SC), dispersiones sobre la base de aceite o agua, soluciones miscibles en aceite, suspensiones en cápsula (CS), sustancias de espolvoreo (DP), desinfectantes, granulados para esparcir y aplicar en el suelo, granulados (GR) en forma de microgranulados, granulados para rociado, aspiración y absorción, granulados dispersables en agua (WG), granulados solubles en agua (SG), formulaciones ULV, micro cápsulas y ceras. Estos distintos tipos de formulación son conocidos en principio y se describen, por ejemplo en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. Hauser Verlag München, 4ª edición 1986, Wade van Valquemburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3ª edición. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

40 Los adyuvantes de formulación necesarios, como materiales inertes, agentes tensioactivos, disolventes y demás aditivos también son de conocimiento general y se describen, por ejemplo en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª edición., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olfen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2ª edición., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2ª edición., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Enciclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Tomo 7, C. Hauser Verlag München, 4ª edición 1986.

50 Sobre la base de estas formulaciones también se pueden preparar combinaciones con otras sustancias de acción pesticida, como por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores, fertilizantes y/o reguladores de crecimiento, p. ej., en forma de una formulación lista para usar o como mezcla de tanque. Protectores adecuados son por ejemplo, mefenpir-dietilo, cipro sulfamida, isoxadifen-etilo, cloquintocet-mexilo y dicloromida.

55 Los polvos humectables son preparados que pueden dispersarse en forma homogénea en agua, que además del principio activo excepto un diluyente o sustancia inerte, contienen también agentes tensioactivos del tipo iónico y/o no iónico (humectantes, agentes dispersantes), p. ej. alquilfenoles polioxietilénados, alcoholes grasos polioxietilénados, aminas grasas polioxietilénadas, poliglicoléter-sulfatos de alcoholes grasos, alcansulfonatos, alquilbencensulfonatos, ligninsulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio, dibutilnaftalen-sulfonato de sodio o también oleoilmetiltaurina de sodio. Para preparar los polvos humectables, los principios activos herbicidas se trituran por ejemplo en los dispositivos habituales, como molinos de martillo, molinos de soplantes y molinos de chorro de aire y

en forma simultánea o sucesiva se mezclan con los coadyuvantes de formulación.

Los concentrados emulsionables se preparan mediante la disolución del principio activo en un disolvente orgánico, p. ej., butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también aromáticos de punto de ebullición superior o hidrocarburos o mezclas de los disolventes orgánicos con adición de uno o varios agentes tensioactivos del tipo iónico o no iónico (emulsionantes). Como emulsionantes pueden usarse p. ej.: sales de calcio de ácido alquilarilsulfónico como Ca-dodecil-bencensulfonato o emulsionantes no iónicos como poliglicoléster de ácido graso, alquil-arilpoliglicoléter, poliglicoléster de alcohol graso, productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, alquilpoliéter, sorbitanéster como p. ej., éster de ácido graso de sorbitán o éster de polioxetilenosorbitán como p. ej., éster de ácido graso polioxietilen-sorbitán.

- 5
- 10 Los productos para espolvoreado se obtienen por molienda del principio activo con sustancias sólidas finamente trituradas, p. ej. talco, arcillas naturales, como caolín, bentonita y pirofilita o tierra de diatomeas.

Los concentrados en suspensión pueden ser sobre la base de agua o de aceite. Pueden prepararse, por ejemplo, triturando en húmedo mediante molinos de perlas usuales en el mercado y eventualmente adicionando sustancias tensioactivas, como ya se indicaron p.ej. en los tipos de formulación antes enunciados.

- 15 Las emulsiones, p.ej. emulsiones de aceite en agua (EW), pueden prepararse por ejemplo mediante agitadores, molinos coloidales y/o mezcladores estáticos usando disolventes orgánicos acuosos y eventualmente agentes tensioactivos, como ya se indicaron p.ej. en los tipos de formulación antes enunciados.

- 20 Los granulados pueden prepararse ya sea por atomización del principio activo sobre material inerte granulado con capacidad de absorción o mediante la aplicación de concentrados de principio activo mediante adhesivos, p. ej. alcohol polivinílico, sal de sodio del ácido poliacrílico o también aceites minerales, en la superficie de vehículos como arena, caolinita o material inerte granulado. También se pueden granular principios activos adecuados del modo usual para la preparación de granulados de fertilizantes, en caso deseado mezclados con fertilizantes.

- 25 Los granulados dispersables en agua, por lo general se preparan según los procedimientos habituales como secado por rociado, granulado en lecho fluidizado, granulado con disco, mezclado con mezcladores de alta velocidad y extrusión sin material inerte sólido.

Para la preparación de granulados con disco, de lecho fluidizado, por extrusión y por rociado, véase p. ej., los procedimientos en "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., Londres; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, páginas 147 y siguientes; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, Nueva York 1973, pág. 8-57.

- 30 Para mayores detalles respecto de la formulación de herbicidas, véase p. ej., G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96 y J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5ª edición., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, páginas 101-103.

Las preparaciones agroquímicas por lo general contienen de 0,1 a 99% en peso, en especial de 0,1 a 95% en peso, del compuesto de acuerdo con la invención.

- 35 En polvos humectables, la concentración de principio activo contienen p. ej. aproximadamente 10 a 90% en peso, el resto 100% en peso de los componentes usuales de formulación. En los concentrados emulsionables, la concentración del principio activo puede ser de alrededor de 1 a 90%, preferentemente de 5 a 80% en peso. Las formulaciones en polvo contienen de 1 a 30% en peso de principio activo, preferentemente en su mayoría 5 a 20% en peso de principio activo, las soluciones pulverizables contienen alrededor de 0,05 a 80%, preferentemente 2 a 50% en peso de principio activo. En granulados dispersables en agua, el contenido de principio activo depende en parte, si el compuesto activo es líquido o sólido y cuáles adyuvantes de granulación, sustancias de relleno etc. se utilizan. En granulados dispersables en agua, el contenido del principio activo se sitúa por ejemplo entre 1 y 95% en peso, preferentemente entre 10 y 80% en peso.

- 45 Además las formulaciones de ingredientes activos mencionadas opcionalmente comprenden los respectivos agentes adhesivos, humectantes, de dispersión, de emulsión, de penetración, conservantes, anticongelantes y disolventes, sustancias de relleno, vehículos y colorantes, antiespumantes, inhibidores de evaporación usuales y agentes que modifican el valor del pH y la viscosidad.

- 50 Sobre la base de estas formulaciones también se pueden preparar combinaciones con otras sustancias de acción pesticida, como por ejemplo, insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, así como con protectores selectivos, fertilizantes y/o reguladores de crecimiento, p. ej., en forma de una formulación lista para usar o como mezcla de tanque.

- 55 Para el uso, las formulaciones disponibles en la forma habitual en el mercado, se diluyen eventualmente en el modo habitual, p. ej. en el caso de polvos humectables, concentrados emulsionables, dispersiones y granulados dispersables en agua mediante el uso de agua. Las preparaciones en polvo, los granulados para el suelo o bien los granulados esparcibles, así como las soluciones pulverizables, por lo general no se diluyen con otras sustancias

inertes antes del uso.

Debido a las condiciones externas como la temperatura, la humedad, el tipo de herbicida utilizado, entre otros factores, varía el requerimiento de cantidad aplicada de los compuestos de acuerdo con la invención. Puede variar dentro de amplios intervalos, p. ej., entre 0,001 y 1,0 kg/ha o mayor cantidad de sustancia activa, pero preferentemente se encuentra entre 0,005 y 750 g/ha.

5

Los ejemplos siguientes explican la invención.

A. Ejemplos químicos

Las abreviaturas usadas significan:

Me = metilo

10 Tabla 1: compuestos de la fórmula general (I) en la que A representa CY, B representa N y W representa hidrógeno

N.º	R	X	Y	Z	M ⁺	Datos físicos (¹ H-RMN, DMSO-d ₆ , 400 MHz)
1-1	Me	Cl	SMe	CF ₃	Na ⁺	

B. Ejemplos de formulación

a) Se obtiene un agente de espolvoreo mezclando 10 partes en peso del compuesto de la fórmula (I) y 90 partes en peso de talco como sustancia inerte y triturándolos en un molino de martillos.

15 b) Se obtiene un polvo humectable de fácil dispersión en agua mezclando 25 partes en peso del compuesto de la fórmula (I), 64 partes en peso de cuarzo con contenido de caolín como sustancia inerte, 10 partes en peso de ligninsulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmetiltaurina de sodio como agente humectante y de dispersión y moliéndolos en un molino de clavijas.

20 c) Se obtiene un concentrado de dispersión de fácil dispersión en agua mezclando 20 partes en peso del compuesto de la fórmula (I) con 6 partes en peso de alquilfenolpoliglicoléter (®Triton X 207), 3 partes en peso de isotridecanolpoliglicoléter (8 EO) y 71 partes en peso de aceite mineral parafínico (rango de ebullición p. ej. aprox. 255 hasta más de 277°C) y moliendo la mezcla en un molino de bolas a una fineza menor de 5 micrómetros.

25 d) Se obtiene un concentrado emulsionable con 15 partes en peso del compuesto de la fórmula (I) y/o de sus sales, 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxetilado como emulsionante.

e) Se obtiene un granulado dispersable en agua mezclando

30 75 partes en peso del compuesto de la fórmula (I),
10 partes en peso de ligninsulfonato de calcio,
5 partes en peso de laurilsulfato de sodio,
3 partes en peso de alcohol polivinílico y
7 partes en peso de caolín,

moliendo la mezcla en un molino a clavijas y granulando el polvo en un lecho fluidizado por medio de rociado con agua como líquido de granulación.

35 f) También se obtiene un granulado dispersable en agua homogenizando y pretriturando

25 partes en peso del compuesto de la fórmula (I),
5 partes en peso de 2,2'-dinaftilmetan-6,6'-disulfonato de sodio
2 partes en peso de oleoilmetiltaurina de sodio,
1 parte en peso de alcohol polivinílico,

17 partes en peso de carbonato de calcio y
50 partes en peso de agua

en un molino de coloides, moliéndolo a continuación en un molino de perlas y pulverizando la suspensión resultante en una torre de pulverizado por medio de una tobera monosustancia y secándola.

5 C. Ejemplos biológicos

1. Acción herbicida contra plantas dañinas en la preemergencia

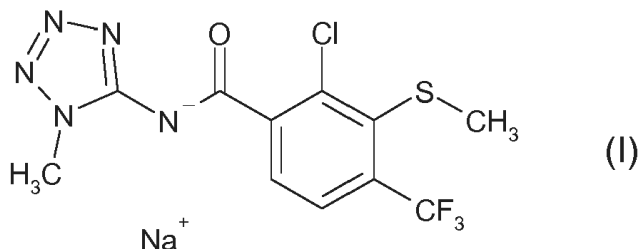
10 Se colocaron semillas de malas hierbas o plantas de cultivo monocotiledóneas o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera en arcilla arenosa y se las cubrió con tierra. El compuesto de acuerdo con la invención formulado en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados de emulsión (EC) se aplicó entonces como suspensión o bien como emulsión acuosa con una cantidad de aplicación agua de un valor convertido de 600 a 800 l/ha añadiendo 0,2% de agente humectante sobre la superficie de la tierra cubierta. Tras el tratamiento, las macetas se colocaron en un invernadero y se mantuvieron en buenas condiciones de crecimiento para las plantas de prueba. La evaluación a simple vista de los daños en las plantas de prueba se efectuó tras un tiempo de ensayo de 3 semanas en comparación con controles no tratados (acción herbicida en porcentaje (%): 100% de efectividad = plantas eliminadas, 0% de efectividad = igual a las plantas de control.

2. Acción herbicida contra plantas dañinas en la post-emergencia

20 Se colocaron semillas de malas hierbas o plantas de cultivo monocotiledóneas o dicotiledóneas en macetas de fibra de madera en arcilla arenosa y se las cubrió con tierra y se cultivaron en invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Al cabo de 2 a 3 semanas después de la siembra se trató a las plantas cuando habían desarrollado una hoja. El compuesto de acuerdo con la invención formulado en forma de polvos humectables (WP) o como concentrados de emulsión (EC) se aplicó entonces como suspensión o bien como emulsión acuosa con una cantidad de agua de un valor convertido de 600 a 800 l/ha añadiendo 0,2% de agente humectante sobre las partes verdes de las plantas. Después de aproximadamente 3 semanas de permanencia en el invernadero en condiciones óptimas de crecimiento se evaluó a simple vista el efecto de los preparados en comparación con controles no tratados (acción herbicida en porcentaje (%): 100% de efectividad = plantas eliminadas, 0% de efectividad = igual a las plantas de control).

REIVINDICACIONES

1. Sal de sodio de 2-cloro-3-(metilsulfanil)-N-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-4-(trifluorometil)benzamida de la fórmula (I)



- 5 2. Agente herbicida, caracterizado por un contenido de acción herbicida del compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1.
3. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 2 mezclados con adyuvantes de formulación.
4. Agentes herbicidas de acuerdo con las reivindicaciones 2 o 3 que contienen al menos una sustancia adicional de acción pesticida del grupo de los insecticidas, acaricidas, herbicidas, fungicidas, protectores selectivos y reguladores de crecimiento.
- 10 5. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 4 que contienen un protector selectivo.
6. Agentes herbicidas de acuerdo con la reivindicación 5 que contienen cipsulfamida, cloquintocet-mexilo, mefenpir-dietilo o isoxadifen-etilo.
7. Agentes herbicidas de acuerdo con una de las reivindicaciones 4 a 6 que contienen un herbicida adicional.
- 15 8. Procedimiento para combatir plantas no deseadas, caracterizado porque se aplica una cantidad efectiva de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, o un agente herbicida de acuerdo con una de las reivindicaciones 2 a 7, sobre las plantas o en el lugar del crecimiento no deseado de plantas.
9. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, o de un agente herbicida de acuerdo con una de las reivindicaciones 2 a 7, para combatir plantas no deseadas.
- 20 10. Uso de acuerdo con la reivindicación 9, caracterizado porque los compuestos de la fórmula (I) para combatir plantas no deseadas se emplean en cultivos de plantas útiles.
11. Uso de acuerdo con la reivindicación 10, caracterizado porque las plantas útiles son plantas útiles transgénicas.