

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 946 280**

51 Int. Cl.:

C07D 403/10 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A61K 31/4155 (2006.01)

A61P 33/14 (2006.01)

A61P 33/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **10.09.2018** **PCT/JP2018/033389**

87 Fecha y número de publicación internacional: **14.03.2019** **WO19050028**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.09.2018** **E 18854335 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.05.2023** **EP 3683215**

54 Título: **Compuesto de tetrazolinona y uso del mismo**

30 Prioridad:

11.09.2017 JP 2017173779

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

14.07.2023

73 Titular/es:

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
2-7-1, Nihonbashi Chuo-ku
Tokyo 103-6020, JP

72 Inventor/es:

NAGASHIMA, YUTA y
KIMURA, NORIO

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 946 280 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

Compuesto de tetrazolinona y uso del mismo

Campo técnico

La presente invención se refiere a un compuesto de tetrazolinona y al uso del mismo.

5 Técnica anterior

Hasta la fecha, se han desarrollado y se han puesto en uso práctico varios compuestos para controlar plagas. Sin embargo, se ha deseado un nuevo compuesto que tenga actividades de control contra plagas debido al desarrollo de resistencia por parte de las plagas y similares.

10 El Documento de Patente 1 divulga compuestos de tetrazolinona que tienen efectos de control contra plagas. Los documentos EP3064492 y JP2014080415 divulgan derivados heterocíclicos útiles como plaguicidas.

Lista de citas**Documento de patente**

Documento de patente 1: Folleto de documento WO 2015/056806

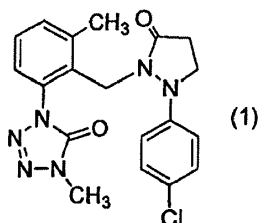
Compendio de la invención**15 Problemas a resolver por la invención**

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga una excelente eficacia de control contra plagas, especialmente plagas de Lepidoptera.

Medios para solucionar los problemas

20 Los autores de la presente invención han estudiado para encontrar un compuesto que tenga una excelente eficacia de control contra plagas, especialmente plagas de Lepidoptera. Como resultado, han descubierto que un compuesto representado por la siguiente fórmula (1) tiene una excelente eficacia de control contra plagas, especialmente plagas de Lepidoptera.

Es decir, la presente invención es la definida en las reivindicaciones.



25 Debe entenderse que, en el método o uso de la presente invención, el compuesto según la reivindicación 1 se aplica a un hábitat donde vive una plaga, donde el hábitat se selecciona entre plantas, suelo e interiores de viviendas.

Efecto de la invención

De acuerdo con la presente invención, pueden controlarse las plagas, especialmente las plagas de Lepidoptera.

Modo de llevar a cabo la invención

30 El Presente compuesto normalmente se mezcla con uno o varios portadores inertes tal como uno o varios portadores sólidos, uno o varios portadores líquidos (por ejemplo, uno o varios aceites) y uno o varios portadores gaseosos, uno o varios tensioactivos y/u otros, y según sea necesario, se añade o se añaden a esto uno o varios agentes auxiliares para la formulación, tales como uno o varios aglutinantes, uno o varios dispersantes, uno o varios colorantes y uno o varios estabilizadores, para formularlos y utilizarlos como el Presente agente de control, tal como

35 un polvo mojable, un polvo mojable granular, un líquido autosuspensible, un gránulo, un líquido autosuspensible seco, un concentrado emulsionable, una solución acuosa, una solución oleosa, un agente humeante, un aerosol y una microcápsula. Estas formulaciones normalmente comprenden de 0,1 a 99%, preferiblemente de 0,2 a 90% en peso del Presente compuesto.

El Presente compuesto puede mezclarse o utilizarse combinado con uno o varios fungicidas, uno o varios de otros

insecticidas, uno o varios herbicidas u otros. Además, se puede esperar la potenciación de sus efectos mediante tal mezcla o uso combinado.

Además, el Presente compuesto se puede mezclar o utilizar combinado con un compuesto tal como antraquinona utilizado como repelente de aves.

- 5 Los ejemplos del portador sólido que se va a utilizar en la formulación incluyen polvos finos y gránulos de arcillas (por ejemplo, arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla de Fubasami o arcilla blanca ácida), óxidos de silicio hidratados sintéticos, talcos, cerámica, otros minerales inorgánicos (por ejemplo, sericita, cuarzo, azufre, carbón activo, carbonato de calcio o sílice hidratada), fertilizantes químicos (por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea o cloruro de amonio), y otros; así como resinas sintéticas (por ejemplo, resinas de poliéster tales como polipropileno, poliacrilonitrilo, polimetilmetacrilato y tereftalato de polietileno; resinas de nailon tales como nailon-6, nailon-11 y nailon-66; resinas de poliamida; cloruro de polivinilo, cloruro de polivinilideno, copolímeros de cloruro de vinilo-propileno, u otros).

- 15 Los ejemplos del portador líquido incluyen agua; alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol o fenoxietanol); cetonas (por ejemplo, acetona, metilacetona o ciclohexanona); hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, tolueno, xileno, etilbenceno, dodecibenceno, fenilxililetano o metilnaftaleno); hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano, queroseno o aceite ligero); ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo o acetato de éter monometílico de propilenglicol); nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo o isobutironitrilo); éteres (por ejemplo, éter diisopropílico, 1,4-dioxano, éter dimetílico de etilenglicol, éter dimetílico de dietilenglicol, éter monometílico de dietilenglicol, éter monometílico de propilenglicol, éter monometílico de dipropilenglicol o 3-metoxi-3-metil-1-butanol); amidas de ácido (por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N,N-dimetilacetamida); hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, tricloroetano o tetracloruro de carbono); sulfóxidos (por ejemplo, dimetilsulfóxido); carbonato de propileno; y aceites vegetales (por ejemplo, aceite de soja o aceite de semilla de algodón).

- 25 Los ejemplos del portador gaseoso incluyen fluorocarbono, gas butano, LPG (gas de petróleo licuado), éter dimetílico y dióxido de carbono.

Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos no iónicos tales como éteres de polioxietilentalquilo, éteres de polioxietilentalquilarilo y ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; y tensioactivos aniónicos tales como sulfonatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno y sulfatos de alquilo.

- 30 Los ejemplos del otro agente auxiliar para la formulación incluyen aglutinantes, dispersantes, colorantes y estabilizadores. Los ejemplos específicos de los mismos incluyen caseína, gelatina, sacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábiga, derivados de celulosa o ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, polímeros sintéticos solubles en agua (por ejemplo, poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona o ácidos poliacrílicos), PAP (fosfato de isopropilo ácido), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol) y BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol).

El método de control de la presente invención se puede utilizar para controlar plagas, especialmente plagas de Lepidoptera en tierras de cultivo tales como campos, arrozales, pastos y huertos.

Los ejemplos específicos de plagas, especialmente plagas de Lepidoptera que pueden controlarse mediante el método de control de la presente invención incluyen, pero no se limitan a, los siguientes.

40 Plagas de lepidópteros:

- 45 Pyralidae, por ejemplo, barrenador del tallo del arroz (*Chilo suppressalis*), barrenador de cabeza oscura del tallo (*Chilo polychrusus*), *Tryporyza incertulas*, barrenador blanco del tallo (*Scirpophaga innotata*), barrenador amarillo del tallo (*Scirpophaga incertulas*), barrenador rosado (*Sesamia inferens*), *Rupela albinella*, enrollahojas de arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), *Marasmia patnalis*, *Marasmia exigua*, enrollahojas del algodón (*Notarcha derogata*), polilla del gusano de la harina (*Plodia interpunctella*), barrenador del maíz (*Ostrinia furnacalis*), gusano de la col (*Hellula undalis*), gusano de la hierba azul (*Pediasia teterrellus*), gusano del arroz (*Nymphula depunctalis*), *Marasmia* spp., barrenador del lúpulo (*Hydraecia immanis*), barrenador europeo del maíz (*Ostrinia nubilalis*), barrenador menor del tallo de maíz (*Elasmopalpus lignosellus*), barrenador de brotes de la judía (*Epinotia aporema*), barrenador de la caña de azúcar (*Diatraea saccharalis*), y barrenador gigante de la caña de azúcar (*Telchin licus*);
- 50 Noctuidae, por ejemplo, gusano del algodón (*Spodoptera litura*), gusano soldado (*Spodoptera exigua*), oruga del corte del arroz (*Pseudaletia separata*), polilla de la col (*Mamestra brassicae*), barrenador rosa (*Sesamia inferens*), gusano cogollero (*Spodoptera mauritia*), *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera exempta*, gusano cortador negro (*Agrotis ipsilon*), gusano de remolacha (*Plusia nigrisigna*), oruga medidora de la soja

(*Pseudoplusia includens*), *Tricoplusia* spp., *Heliothis* spp. (tal como el gusano cogollero del tabaco (*Heliothis virescens*)), *Helicoverpa* spp. (tal como el gusano cogollero del tabaco (*Helicoverpa armigera*)), oruga de la judía terciopelo (*Anticarsia gammatalis*), y gusano de la hoja del algodón (*Alabama argillacea*);

Pieridae, por ejemplo, gusano común de la col (*Pieris rapae*);

Tortricidae, por ejemplo, *Adoxophyes* spp., polilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta*), polilla de la soja (*Leguminivora glicinivorella*), *Matsumuraeses azukivora*, tórtrix de frutas de verano (*Adoxophyes orana fasciata*), tórtrix de té más pequeño (*Adoxophyes honmai*), tórtrix de té japonés (*Homona magnánima*), tórtrix de la manzana (*Archips fuscocupreanus*), y polilla de la manzana (*Cydia pomonella*);

Gracillariidae, por ejemplo, enrollahojas de té (*Caloptilia theivora*) y minador asiático de la hoja del manzano (*Phyllonorycter ringoneella*);

Carposinidae, por ejemplo, polilla del melocotón (*Carposina niponensis*) y barrenador de los cítricos (*Ecdyolopha aurantiana*);

Lyonetiidae, por ejemplo, minador de la hoja de café (*Leucoptera coffeella*) y *Lyonetia* spp.;

Lymantriidae, por ejemplo, *Lymantria* spp. y *Euproctis* spp.;

Yponomeutidae, por ejemplo, polilla dorso de diamante (*Plutella xilostella*);

Gelechiidae, por ejemplo, gusano cogollero rosado (*Pectinophora gossypiella*) y polilla de la patata (*Phthorimaea operculella*);

Arctiidae, por ejemplo, polilla blanca americana (*Hyphantria cunea*); y otros.

Las plagas objetivo que se deben controlar pueden tener una menor sensibilidad al agente o desarrollar resistencia al agente.

El método de control de la presente invención comprende aplicar una cantidad eficaz del Presente compuesto a los hábitats donde viven las plagas (es decir, plantas, suelo o interiores de viviendas).

En el método de control de la presente invención, aunque el Presente compuesto se puede utilizar solo, normalmente se utiliza como Presente agente de control y, según sea necesario, se diluye con el agua que se va a utilizar.

Cuando el Presente agente de control se utiliza para controlar plagas en un campo agrícola, la dosis de aplicación como cantidad del Presente compuesto normalmente está dentro del rango de 1 a 10.000 g por 10.000 m². Cuando el Presente agente de control es un concentrado emulsionable, un polvo mojable o un líquido autosuspendible, normalmente se aplica diluyéndolo con agua de tal manera que la concentración del Presente compuesto esté dentro de un rango de 0,01 a 10.000 ppm.

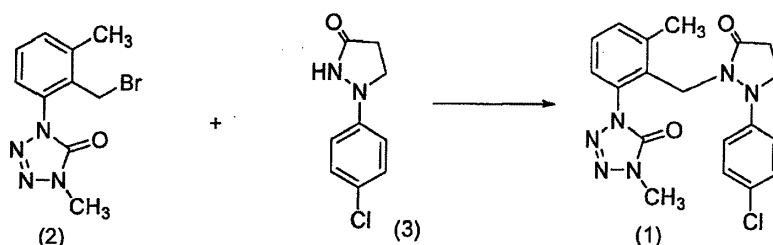
El Presente agente de control o una solución diluida del Presente agente de control con agua se pueden aplicar no solo a los hábitats donde viven las plagas, sino también a las plantas o el suelo que se vayan a proteger de las plagas.

Ejemplos

Los siguientes Ejemplo de Preparación, Ejemplos de Formulación y Ejemplo de Prueba sirven para ilustrar más específicamente la presente invención, pero la presente invención no se limita únicamente a estos ejemplos.

En primer lugar, a continuación, se muestra un Ejemplo de Preparación del Presente compuesto.

Ejemplo de Preparación



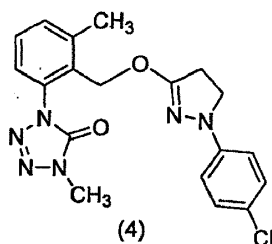
En atmósfera de nitrógeno, se mezclaron un compuesto representado por la fórmula (2) (50,0 g), acetona (122,5 g), carbonato de potasio (35,9 g) y un compuesto representado por la fórmula (3) (37,6 g), la mezcla resultante se calentó a 50°C y a continuación, se agitó durante 9 horas. A continuación, a la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio (300 g), los sólidos resultantes se separaron por filtración y se lavaron adicionalmente con acetato de etilo para proporcionar sólidos (27,5 g). Los sólidos resultantes se disolvieron en tolueno (230,5 g) a 85°C, a continuación, la solución resultante se enfrió gradualmente a 60°C y los cristales resultantes se separaron por filtración. Los cristales resultantes se lavaron con tolueno (20,0 g) y a continuación, se

secaron a presión reducida para proporcionar el Presente compuesto (11,1 g) (porcentaje de área de CL: 99,2%).

Presente compuesto

RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,36-7,23 (4H, m), 7,16-7,13 (1H, m), 6,82-6,77 (2H, m), 4,72 (2H, s), 3,57 (3H, s), 3,56 (2H, t, $J = 7,2$ Hz), 2,34 (2H, t, $J = 7,2$ Hz), 2,25 (3H, s)

- 5 Asimismo, el residuo obtenido al concentrar el producto filtrado de la solución de tolueno en la cristalización se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo/cloroformo) para proporcionar un compuesto representado por la fórmula (4) (1,7 g) (porcentaje de área de CL: 99,2%).



Compuesto representado por la fórmula (4)

- 10 RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,44-7,38 (2H, m), 7,28-7,23 (1H, m), 7,21-7,16 (2H, m), 6,85-6,80 (2H, m), 5,26 (2H, s), 3,69 (2H, t, $J = 9,6$ Hz), 3,60 (3H, s), 2,83 (2H, t, $J = 9,6$ Hz), 2,53 (3H, s)

A continuación, se muestran más abajo Ejemplos de Formulación del Presente compuesto. "Parte" o "partes" representan "partes en peso".

Ejemplo de Formulación 1

- 15 El Presente compuesto (10 partes) se mezcla con una mezcla de xileno (35 partes) y N,N-dimetilformamida (35 partes), y a continuación, se añaden a esto polioxietilen estiril fenil éter (14 partes) y dodecibenceno sulfonato de calcio (6 partes), seguido de su mezcla para obtener una formulación.

Ejemplo de Formulación 2

- 20 Se mezclan laurilsulfato de sodio (4 partes), lignosulfonato de calcio (2 partes), polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético (20 partes) y tierra de diatomeas (54 partes), y adicionalmente se añade a esto el Presente compuesto (20 partes). seguido de su mezcla para obtener una formulación.

Ejemplo de Formulación 3

- 25 Al Presente compuesto (2 partes) se le añaden polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético (1 parte), lignosulfonato de calcio (2 partes), bentonita (30 partes) y arcilla de caolín (65 partes), seguido de mezcla para obtener una mezcla. A continuación, se añade a la mezcla una cantidad apropiada de agua, la mezcla resultante se agita adicionalmente y se somete a granulación con un granulador y secado con aire forzado para obtener un gránulo.

Ejemplo de Formulación 4

- 30 El Presente compuesto (1 parte) se mezcla con una cantidad adecuada de acetona, y a continuación, se añade a esto polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético (5 partes), fosfato ácido de isopropilo (0,3 partes) y arcilla de caolín (93,7 partes), seguido de mezcla con agitación a fondo y eliminación de la acetona de la mezcla por evaporación para obtener una formulación.

Ejemplo de Formulación 5

- 35 El Presente compuesto (0,1 partes) se mezcla con una mezcla de xileno (5 partes) y tricloroetano (5 partes), y la mezcla resultante se mezcla a continuación, con queroseno (89,9 partes) para obtener una solución oleosa.

Ejemplo de Formulación 6

- El Presente compuesto (10 partes), Se mezcla con una mezcla de sal de amonio de polioxietilen alquil éter sulfato y sílice húmeda (razón en peso de 1 : 1) (35 partes) y agua (55 partes), y la mezcla resultante se tritura finamente por un método de molienda húmeda para obtener una formulación.

- 40 A continuación, se utiliza un ejemplo de prueba para mostrar la eficacia del Presente compuesto contra plagas. En el

siguiente ejemplo de prueba, la prueba se llevó a cabo a 25°C.

Ejemplo de Prueba 1 Prueba de control contra polilla dorso de diamante (*Plutella xylostella*)

El Presente compuesto se formuló según el procedimiento descrito en el Ejemplo de Formulación 6 para obtener una formulación, y se le añadió agua que contenía un esparcidor (0,03% en volumen) para preparar una solución diluida que contenía 500 ppm del ingrediente activo.

Se plantaron plántulas (en la etapa de desarrollo de la segunda a la tercera hoja verdadera) de repollo (*Brassicae oleracea*) en un recipiente, y dicha solución diluida se roció sobre las hojas de las plántulas a una razón de 20 ml/plántula. A continuación, se cortaron los tallos y las hojas de las plántulas y se colocaron las hojas en un recipiente forrado con papel de filtro. Se liberaron en el contenedor aproximadamente cinco larvas de segundo estadio de polilla espalda de diamante (*Plutella xylostella*). Después de 5 días, se examinó el número de insectos supervivientes y se calculó el valor de control mediante la siguiente ecuación. El Presente compuesto mostró 100% de los efectos de control.

$$\text{Valor de control (\%)} = \{ 1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb) \} \times 100$$

en donde los símbolos en la ecuación representan los siguientes significados.

- Cb: Número de insectos de prueba en el grupo no tratado;
- Cai: Número de insectos supervivientes en el momento de la investigación en el grupo no tratado;
- Tb: Número de insectos de prueba en el grupo tratado;
- Tai: Número de insectos supervivientes en el momento de la investigación en el grupo tratado

Aquí, el "grupo no tratado" representa un grupo en el que se realiza un procedimiento de tratamiento similar al del grupo tratado, excepto que no se utiliza el Presente compuesto.

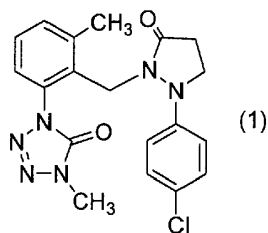
Por su parte, el compuesto representado por la fórmula (4) mostró eficacia preventiva por aplicación foliar contra enfermedades de las plantas, específicamente la mancha foliar por Septoria. (*Septoria tritici*) en trigo y la mancha en red (*Pyrenophora teres*) en cebada

Aplicabilidad industrial

El Presente compuesto tiene efectos de control contra plagas, especialmente plagas de Lepidoptera, y por lo tanto es útil como ingrediente activo de un agente para controlar plagas.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto representado por la fórmula (1)



2. Un agente para controlar una plaga que comprende el compuesto según la reivindicación 1.

5 3. Un método para controlar una plaga que comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto según la reivindicación 1 a un hábitat donde vive una plaga, donde el hábitat se selecciona entre plantas, suelo e interiores de viviendas.

10 4. El uso del compuesto según la reivindicación 1 para controlar una plaga, en donde el compuesto según la reivindicación 1 se aplica a un hábitat donde vive una plaga, en donde el hábitat se selecciona entre plantas, suelo e interiores de viviendas.

5. El agente según la reivindicación 2, el método según la reivindicación 3, o el uso según la reivindicación 4, en donde la plaga es una plaga de Lepidoptera.