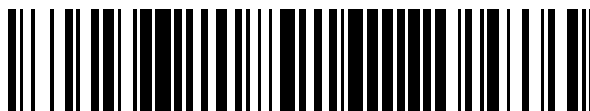


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 882 027**

51 Int. Cl.:

A01N 25/32 (2006.01)

A01N 43/42 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **04.08.2016 PCT/EP2016/068598**

87 Fecha y número de publicación internacional: **16.02.2017 WO17025418**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.08.2016 E 16747521 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.04.2021 EP 3331363**

54 Título: **Nuevos usos de 2-(2,4-diclorofenil)metil-4,4-dimetil-3-isoxazolidona como herbicida foliar**

30 Prioridad:

07.08.2015 EP 15180105

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

01.12.2021

73 Titular/es:

**FMC CORPORATION (100.0%)
2929 Walnut Street
Philadelphia, Pennsylvania 19104, US**

72 Inventor/es:

**TOSSENS, HERVE;
PEREZ CATALAN, JULIO;
AULER, THOMAS y
MENNE, HUBERT**

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

Observaciones:

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

ES 2 882 027 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

Nuevos usos de 2-(2,4-diclorofenil)metil-4,4-dimetil-3-isoxazolidona como herbicida foliar

La presente invención se dirige a nuevos usos del compuesto activo herbicida 2-(2,4-diclorofenil)metil-4,4-dimetil-3-isoxazolidona (compuesto I) como herbicida foliar, en el que el cloquintocet-mexilo se añade como protector.

- 5 Ya se sabe que determinadas 3-isoxazolidinonas, incluyendo también el compuesto de la presente invención, muestran una actividad herbicida selectiva contra la hierba o los cultivos de *Brassica* (documento WO 2012/148689), sin embargo, solo en la forma de aplicación de preemergencia de estos cultivos. Sigue existiendo la necesidad de ampliar la aplicabilidad de los herbicidas, tales como las 3-isoxazolidonas, especialmente para el control de malezas difíciles o malezas que muestren una resistencia a los herbicidas. El documento WO 2009/135492 desvela las mezclas de petoxamid y clomazona usadas contra las malezas. La pulverización es de posemergencia. La composición se puede aplicar con un protector seleccionado de una lista que comprende cloquintocet-mexilo.

- 10 La presente invención aborda tal necesidad. Sorprendentemente y de manera imprevista, se ha descubierto que el compuesto I según la invención también se puede aplicar como aplicación de posemergencia, permitiendo no solo la actividad radicular, sino también la actividad foliar. Por lo tanto, la presente invención proporciona un nuevo procedimiento para el control de malezas o plantas no deseadas mediante la aplicación del compuesto I, en presencia de cloquintocet-mexilo como protector, como aplicación de posemergencia directamente a las plantas o al área en el que crecen las plantas. Por tanto, la presente invención se dirige a un nuevo uso de 2-(2,4-diclorofenil)metil-4,4-dimetil-3-isoxazolidona como herbicida foliar.

- 15 El espectro de aplicabilidad del compuesto I para el control de las malezas no deseadas se puede incluso ampliar mediante la adición de un protector. Se ha descubierto que esto resulta especialmente beneficioso para el control de malezas difíciles evitando o, en la medida de lo posible, reduciendo considerablemente la fitotoxicidad de los cultivos a proteger. Por tanto, la presente invención se dirige a nuevos usos del compuesto I y cloquintocet-mexilo como herbicida foliar para cultivos de cereales, maíz y arroz.

- 20 El cloquintocet-mexilo es un compuesto activo conocido, como se describe en, por ejemplo, Weed Research 26, 441-445 (1986) o "The Pesticide Manual", 16ª edición, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006 y en la literatura citada en el mismo.

- 25 Por lo tanto, la presente invención proporciona un procedimiento para el control de plantas no deseadas o para la regulación del crecimiento de plantas, preferentemente en cultivos de plantas, en los que el compuesto I y el cloquintocet-mexilo se aplican a las plantas (por ejemplo, las malezas mono o dicotiledóneas o las plantas de cultivo no deseadas) o al área en el que crecen las plantas. El compuesto I o las combinaciones según la invención se pueden aplicar en diferentes fases del crecimiento (GS en inglés) de la planta emergente, permitiendo la ampliación de la aplicabilidad del compuesto I o las combinaciones según la invención y proporcionando un procedimiento eficaz de control de malezas o plantas no deseadas en diferentes fases del crecimiento. El compuesto I o las combinaciones según la invención también se pueden aplicar al material de semillas (por ejemplo, granos, semillas u órganos de propagación vegetativa, tales como tubérculos o partes de brote con retoños), por ejemplo, en el procedimiento previo a la siembra (opcionalmente, también a través de la incorporación en el suelo), o al área en el que crecen las plantas (por ejemplo, el área en cultivo), también como procedimiento de preemergencia. La presente invención amplía la aplicabilidad del compuesto I en combinación con el protector cloquintocet-mexilo en los procedimientos de posemergencia, en concreto, sin limitación, en los períodos de posemergencia temprana y los períodos de posemergencia media a tardía.

De manera específica, los ejemplos que se pueden mencionar son algunos de los representativos de la flora de malezas mono y dicotiledóneas, que se pueden controlar mediante la invención, sin que se pretenda una limitación a determinadas especies a través de la enumeración.

- 30 Las plantas nocivas monocotiledóneas de los géneros: *Aegilops*, *Agropyron*, *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* y *Sorghum*.

- 35 Las plantas nocivas 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*, *Euphorbia*, *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*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *Trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola* y *Xanthium*.

- 40 En el nuevo uso como aplicación de posemergencia del compuesto I según la invención a las partes verdes de las plantas, el crecimiento igualmente se detiene después del tratamiento y las plantas nocivas permanecen en la fase de crecimiento en el momento de la aplicación o estas mueren completamente después de un determinado tiempo, de modo que, de esta manera, se elimina la competencia en las malezas, que es nociva para las plantas de cultivo,

en una fase muy temprana y de una manera prolongada.

El compuesto I según la invención se puede aplicar, por tanto, de manera eficaz como aplicación de posemergencia para el control del crecimiento de plantas de malezas no deseadas, preferentemente en cultivos, tales como cereales, maíz y arroz.

- 5 Las combinaciones según la invención no solo se pueden aplicar de manera beneficiosa como aplicación de posemergencia, sino que sorprendentemente muestran también efectos sinérgicos sobre las plantas de malezas no deseadas.

10 Por otra parte, el compuesto I o las combinaciones según la invención, dependiendo de su estructura particular y la tasa de aplicación aplicada, tienen excelentes propiedades reguladoras del crecimiento con respecto a las plantas de cultivo. Estas intervienen en el metabolismo de una planta de una manera reguladora y, por tanto, se pueden usar para la influencia dirigida en los ingredientes de la planta y para la facilitación de la cosecha, tal como, por ejemplo, mediante la activación de la desecación y el retraso del crecimiento. Por otra parte, estas también son adecuadas para, en general, el control y la inhibición del crecimiento vegetativo no deseado sin destruir las plantas en el procedimiento. La inhibición del crecimiento vegetativo desempeña una gran función en muchos cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, permitiendo que se reduzca o prevenga por completo el encamado.

15 Debido a sus propiedades herbicidas y regulatorias del crecimiento de la planta, el compuesto I y el cloquintocet-mexilo también se pueden usar para el control de malezas nocivas en los cultivos de plantas modificadas genéticamente o en los cultivos de plantas que se modifican mediante mutagénesis convencional. Como regla general, las plantas transgénicas se distinguen por las propiedades particularmente ventajosas, por ejemplo, por las resistencias a determinados plaguicidas, principalmente determinados herbicidas, las resistencias a enfermedades/patógenos de las plantas o insectos o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, la calidad, la capacidad de almacenamiento, la composición y los ingredientes específicos. Se da preferencia al uso del compuesto I según la invención como aplicación de posemergencia en los cultivos económicamente importantes de plantas útiles, por ejemplo, de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz y maíz.

20 Preferentemente, el compuesto I con el cloquintocet-mexilo como protector se puede usar como herbicidas en cultivos de plantas útiles que sean resistentes a, o se hayan vuelto resistentes genéticamente a, los efectos fitotóxicos de los herbicidas.

30 Las combinaciones o composiciones según la invención pueden comprender o bien usarse junto con componentes adicionales, siendo ejemplos los principios activos de protección de cultivos de otros tipos y/o los adyuvantes habituales en la protección de cultivos y/o los auxiliares de formulación. Las combinaciones o composiciones según la invención se pueden producir mediante procedimientos conocidos, por ejemplo, como formulaciones mixtas de los componentes individuales, opcionalmente con principios activos, adyuvantes y/o auxiliares de formulación habituales adicionales.

35 En las combinaciones o composiciones de la invención, la tasa de aplicación del compuesto I es habitualmente de 10 a 500 g de principio activo (p.a.) por hectárea, preferentemente de 25 a 250 g de p.a./ha, especial y preferentemente de 50 a 200 g de p.a./ha.

40 La tasa de aplicación de cloquintocet-mexilo es habitualmente de 5 a 2.500 g de principio activo por hectárea, preferentemente de 5 a 1.000 g de p.a./ha, especial y preferentemente de 10 a 200 g de p.a./ha. A determinadas relaciones de concentración, el efecto antagonista (= protección) de las composiciones de herbicida/protector de la invención con respecto a los cultivos es particularmente pronunciado. Sin embargo, las relaciones en peso de los componentes individuales se pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En términos generales, existen de 1:250 a 100:1 partes en peso, preferentemente de 1:40 a 50:1 partes en peso, especial y preferentemente de 1:4 a 20:1 del componente I por parte en peso del protector.

45 En las combinaciones o composiciones de la invención, la tasa de aplicación del compuesto I es habitualmente de 10 a 500 g de principio activo (p.a.) por hectárea, preferentemente de 25 a 350 g de p.a./ha, especial y preferentemente de 50 a 300 g de p.a./ha.

50 La tasa de aplicación de cloquintocet-mexilo es habitualmente de 5 a 2.500 g de principio activo por hectárea, preferentemente de 5 a 1.000 g de p.a./ha, especial y preferentemente de 10 a 400 g de p.a./ha. A determinadas relaciones de concentración, el efecto antagonista (= protección) de las composiciones de herbicida/protector de la invención con respecto a los cultivos es particularmente pronunciado. Sin embargo, las relaciones en peso de los componentes individuales se pueden variar dentro de intervalos relativamente amplios. En términos generales, existen de 1:250 a 100:1 partes en peso, preferentemente de 1:40 a 50:1 partes en peso, especial y preferentemente de 1:4 a 20:1 del componente I por parte en peso del protector.

55 **Ejemplo (no según la invención)**

Efecto herbicida y compatibilidad con la planta del cultivo en posemergencia

Los experimentos se llevaron a cabo como ensayos de campo después de la aplicación con tamaños de parcela de 1.125-1.500 kg (11,25-15 qm), un volumen de aplicación de 250-300 litros de agua por hectárea y de dos a tres repeticiones. O bien se sembraron las semillas de diferentes cultivos y diversas malezas mono y dicotiledóneas o se hicieron crecer las malezas mono y dicotiledóneas de manera natural y se establecieron en condiciones de campo comunes. Las tasas de aplicación de los principios activos herbicidas cuando se usan solos o en combinaciones se proporcionan en las tablas, a continuación. Las aplicaciones se realizaron en diferentes fases del crecimiento (GS), como se indica en las tablas, a continuación. La evaluación 13-46 días después de la aplicación se evaluó visualmente. Las plantas tratadas se compararon con las plantas no tratadas (escala del 0-100 %). Los resultados (como media de 2 a 3 réplicas) se indican en las tablas, a continuación. En las tablas a continuación, GS (fase del crecimiento) corresponde al código BBCH (véase como referencia Lancashire, P.D.; H. Bleiholder; P. Langeluddecke; R. Stauss; T. van den Boom; E. Weber; A. Witzten-Berger (1991). "A uniform decimal code for growth stages of crops and weeds": Ann. Appl. Biol. 119 (3): 561-601; o Witztenberger, A.; H. Hack; T. van den Boom (1989): "Erläuterungen zum BBCH-Dezimal-Code für die Entwicklungsstadien des Getreides - mit Abbildungen". Gesunde Pflanzen 41: 384-388; o Zadoks, J.C., Chang, T. T. & Konzak, C. F. (1974): A decimal code for the growth stages of cereals. Weed Research 14, 415-421).

Los valores generados a partir de las aplicaciones solas y en combinación se usaron para evaluar los efectos combinatorios según S.R. Colby, Weeds 15, páginas 20 a 22 (1967).

Las abreviaturas tienen los siguientes significados:

p.a. = principio activo

E = valor del efecto de combinación observado

EC = valor calculado del efecto de combinación según Colby ($EC = A+B - A \times B / 100$)

Dif. = diferencia (%) entre el valor observado y el valor esperado del efecto de combinación (%) (valor observado menos esperado)

Evaluación de los efectos:

- E > EC: -> sinergia (+ Dif.)
- E = EC: -> efecto aditivo
- E < EC: -> antagonismo (- Dif.)

Los resultados se proporcionan en las siguientes tablas.

Tabla 1: aplicación de posemergencia GS30, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia/selectividad [%] contra <i>Triticum aestivum</i>
COMPUESTO I	200	30
COMPUESTO I + mefenpir-dietilo	200 + 13,5	10 ($E_c = 30$, Dif. = -20)

Tabla 2: aplicación de posemergencia GS29, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia/selectividad [%] contra <i>Hordeum vulgare</i>
COMPUESTO I	200	32
COMPUESTO I + mefenpir-dietilo	200 + 13,5	12 ($E_c = 32$, Dif. = -20)

Tabla 3: aplicación de posemergencia GS29, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia/selectividad [%] contra <i>Triticum aestivum</i>
COMPUESTO I	200	18
mesosulfurón-metilo + mefenpir-dietilo	7,5+22,5	0
COMPUESTO I + mesosulfurón-metilo + mefenpir-dietilo	200 + 7,5+22,5	9 ($E_c = 18$, Dif. = -9)

Tabla 4: aplicación de posemergencia GS23, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Galium asparine</i>
COMPUESTO I	100	25
mesosulfurón-metilo + mefenpir-dietilo	7,5+22,5	0
COMPUESTO I + mesosulfurón-metilo + mefenpir-dietilo	100 + 7,5+22,5	50 (Ec = 25, Dif. = +25)

Tabla 5: aplicación de posemergencia GS18, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Centaurea cyanus</i>
COMPUESTO I	50	25
fluroxipir	150	30
COMPUESTO I + fluroxipir	50 + 150	70 (Ec = 48, Dif. = +22)

Tabla 6: aplicación de posemergencia GS18, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Centaurea cyanus</i>
COMPUESTO I	50	25
diflufenicán	75	0
COMPUESTO I + diflufenicán	50 + 75	78 (Ec = 25, Dif. = +53)

Tabla 7: aplicación de posemergencia GS23, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Galium asparine</i>
COMPUESTO I	100	0
bromoxinil AS octanoato	175	10
COMPUESTO I + bromoxinil AS octanoato	100 + 13,5	50 (Ec = 10, Dif. = +40)

Tabla 8: aplicación de posemergencia GS18, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Papaver rhoeas</i>
COMPUESTO I	50	0
metribuzina	50	0
COMPUESTO I + metribuzina	50 + 50	50 (Ec = 0, Dif. = +50)

Tabla 9: aplicación de posemergencia GS18, ensayo de campo

Compuesto	Dosificación [g de p.a./ha]	Eficacia [%] contra <i>Centaurea cyanus</i>
COMPUESTO I	100	75
aclonifeno	450	0
COMPUESTO I + aclonifeno	100 + 450	97 (Ec = 75, Dif. = +22)

REIVINDICACIONES

1. Uso del compuesto 2-(2,4-diclorofenil)metil-4,4-dimetil-3-isoxazolidona (compuesto I) como herbicida foliar, en el que se añade cloquintocet-mexilo como protector.