



281406

C E R T I F I C A D O  
D E  
A D I C I O N

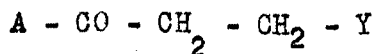
por "MEJORAS EN EL OBJETO DE LA PATENTE PRINCIPAL Nº 266.878  
por "PROCEDIMIENTO PARA LA OBTENCION DE COMPOSICIONES FUNGICI-  
DAS", a favor de la firma italiana MONTECATINI SOCIETA GENERA-  
LE PER L'INDUSTRIA MINERARIA E CHIMICA, residente en MILAN  
(Italia), Largo G. Donegani 1-2.

= . =

MEMORIA DESCRIPTIVA

Este invento se refiere a composiciones fungici-  
das con actividad preventiva y curativa antioidio, junto  
con actividad curativa y preventiva de los endoparásitos  
fungosos.

5. En la solicitud principal de patente se reivindi-  
caba la actividad fungicida, tanto endofitoterapéutica como  
inmunizante y/o esporicida por contacto y fumigación, de los  
compuestos comprendidos en la fórmula general



10. donde A es un grupo arilo simple o sustituido e



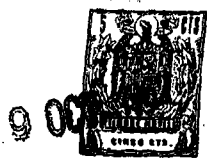
281406

9 00

Y es un grupo amino simple, sustituido o salificado.

- Ahora hemos descubierto que un grupo particular de compuestos comprendidos en la clase antes mencionada, a saber, las sales escasamente solubles en agua de las
5. beta-amino-aril-etil-cetonas y, más particularmente, los picratos, presentan, no solo actividad general esporicida y fungicida por contacto y fumigación, sino también elevadísima actividad antioidio.
- Este hecho es sorprendente porque se sabe que los
10. compuestos antioidio son muy específicos y que ninguno de los compuestos conocidos que actúan sobre ocriptógamas distintas del oidio es activo también contra este último,
- El distinto comportamiento de las varias especies de oidio respecto a las otras ocriptógamas se explica por el
15. hecho de que los dos grupos de parásitos, desde un punto de vista fisiológico, pertenecen a tipos fundamentalmente diferentes (los oidios son ectoparásitos, y los otros endoparásitos).
- Además, ha de tenerse en cuenta que, aunque puede
20. obtenerse preventivamente, por simple acción esporicida, un control eficaz de las fitopatías causadas por los endoparásitos, en el caso del oidio, por el contrario, no solamente deben destruirse los conidios, sino también el micelio, para obtener una protección eficaz.
25. Por consiguiente, no podía preverse que un grupo de los nuevos pesticidas que combaten eficazmente las fitopatías más comunes causadas por los endoparásitos (como se demuestra en la patente principal) pudiera ser eficaz también contra el oidio.
30. Es evidente la gran ventaja económica (por ahorro

281406



de productos y por simplificación de la técnica aplicativa) que se deriva de la identificación de compuestos capaces de combatir al mismo tiempo diversas enfermedades fungosas causadas por los dos grupos antes mencionados de patógenos.

5. Asi, por ejemplo, con un solo producto es posible combatir el mildew de la vid (*Plasmopara viticola*) y el oidio de la vid (*Oidium tuckeri*), el tizón del manzano (*Venturia inaequalis*) y el oidio del manzano (*Oidium farinosum*), etc.

10. En la tabla que sigue se indican los compuestos de dicha clase que se ha comprobado tienen mayor interés, junto con la sigla con que se los designara en lo que sigue.

TABLA I

	<u>Sigla</u>	<u>Designación química</u>	<u>estado físico</u>
15.	S. 558	picrato de beta-dimetilamino-9-antranil-etil-cetona	crystalino
	S. 560	picrato de beta-morfolino-4-cloro-1-naftil-etil-cetona	crystalino
20.	S. 565	picrato de beta-dipropilamino-1-naftil-etil-cetona	crystalino
	S. 628	picrato de beta-morfolino-9-antranil-etil-cetona	crystalino

25. Todos estos productos se prepararon por precipitación con ácido pícrico de soluciones que contenían el clorhidrato de la amina correspondiente.

A continuación se indican los resultados obtenidos en la aplicación de alguno de los productos en cuestión,

281406



en condiciones de campo abierto, contra algunas especies de oidio.

Las mencionadas sustancias activas se utilizaron en un tipo único de formulación, que tenia la composición siguiente:

5.

sustancia activa	30%
aceite mineral Esso 54/20	60%
emulgente	10%

10.

La sustancia activa se redujo a tamaño de micras en presencia del aceite y del emulgente.

a) Oidium tuckeri en cepas

15.

La prueba que a continuación se expone se efectuó para determinar la actividad antioidio del S. 560 junto con su actividad contra un endoparásito importante de la vid, más particularmente el mildew de la vid (Plasmopara viticola), usando para comparación Aspor (que tiene, como es notorio, gran actividad contra el mildew de la vid, pero no contra el oidio).

20.

Las pruebas se basaron en el tesis siguiente: el S.560, el Aspor y un testigo, sometiendo a tratamientos repetidos (según la técnica tradicional adoptada para combatir el mildew de la vid) tres hileras de cepas para cada tesis (alrededor de 120 plantas). Durante la prueba se efectuaron 15 tratamientos.



TABLA II

281406

Datos determinados después del 9º tratamiento, referentes al control del oidio en la vid (+)

Productos	Do- sis	Racimos de uvas examina- dos, N <sup>o</sup>	Racimos de uvas sanos, %	Porcentaje de racimos de uva atacados, dividido según el grado del ataque (++)			
				1	2	3	4
Aspor	2	227	70,1	19,4	8,8	1,3	0,4
Aspor	1	227	56,0	28,2	10,6	4,4	0,8
S 560	2	185	100,0	0	0	0	0
S 560	1	217	91,3	6,4	1,8	0,4	0
Testigo		247	63,2	14,6	12,2	6,1	4,0

(+) La determinación se efectuó únicamente en los racimos de uva, porque en la fecha de la prueba las hojas no habían sido todavía atacadas por las criptógamas.

(++) 1= 1/4 de racimos están atacados

2= 1/2 de racimos están atacados

3= 3/4 de racimos están atacados

10. 4= los racimos de uva están completamente invadidos por el hongo.



TABLA III

Datos determinados después del 9º tratamiento, referentes al control del mildew de la vid en los racimos de uva y en las hojas.

Productos	Dosis ‰	Hojas					
		Numero de hojas examinadas	Porcentaje de hojas sanas	Porcentaje de hojas atacadas, dividido según el grado de ataque (+)			
				1	2	3	4
Aspor	2	1,563	95,1	3,8	0,7	0,3	0,06
Aspor	1	1,530	89,6	7,2	2,1	0,8	0,19
S 560	2	1,490	80,8	9,5	4,7	2,6	2,4
S 560	1	1,430	81,2	8,1	4,1	2,3	3,7
Testigo		1,752	29,7	6,6	12,1	10,8	40,8

5. (+) 1 = hojas con solo una mancha  
 2 = " " dos manchas  
 3 = " " tres manchas  
 4 = " " más de tres manchas

(++) 1 = 1/4 de racimos están atacados

10. 2 = 1/2 " " " "  
 3 = 3/4 " " " "  
 4 = racimos completamente invadidos por el hongo.



281476

racimos de uvas					
Número de racimos de uvas examinados	porcentajes de racimos de uva sanos	porcentajes de racimos de uva atacados, dividido según el grado del ataque (++)			
		1	2	3	4
227	99,6	0,4	0	0	0
227	99,2	0,4	0,4	0	0
185	99,5	0,5	0	0	0
217	91,7	6,0	1,4	0,9	0
247	35,2	10,9	12,9	13,4	27,6



TABLA IV

281406

Datos determinados después del 13º tratamiento, referentes al control del Oidium y el mildew en los racimos de uva.

Productos	Dosis	Número de racimos de uva examinados.	Racimos de uva completamente sanos.	Oidium				
				Racimos sanos %	Porcentaje de racimos de uva atacados, divididos según el grado del ataque (+)			
					1	2	3	4
Aspor	2	227	32,1	34,4	18,1	16,8	13,7	17,1
Aspor	1	227	25,6	25,6	26,0	18,1	18,8	11,4
S 560	2	185	76,3	80,5	18,4	1,08	0	0
S 560	1	219	69,3	81,5	15,7	2,7	0	0
Testigo		247	4,8	37,7	23,1	15,4	11,8	12,1

(+) 1 = 1/4 de los racimos están atacados

2 = 1/2 " " " " "

3 = 3/4 " " " " "

4 = uvas completamente invadidas por el hongo



281406

racimos de uva secos	racimos de uva sanos, %	mildew de la uva				racimos de uva secos %
		porcentaje de racimos de uva atacados, dividido según el grado del ataque (+)				
		1	2	3	4	
0,8	96,5	9,7	0,4	0	0,4	0,4
0	96,5	2,7	0,8	0	0	0
0	93,1	5,9	1,08	0	0	0
0	85,5	11,0	1,3	0,9	1,3	0,4
0,8	19,7	19,1	17,0	6,9	37,3	27,2

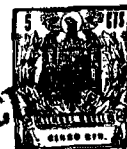


TABLA V

281406

Datos determinados después del 15º tratamiento e inmediatamente antes de la cosecha, referentes al control del oidio en las hojas

Productos	Dosis °/oo	Nº de hojas examinadas	% de hojas atacadas
Aspor	2	1,000	55,1
Aspor	1	1,000	64,6
S 560	2	1,000	6,0
S 560	1	1,000	18,0
Testigo		500	90,4

TABLA VI

## 5. Producción de uva

Productos	Dosis °/oo	Nº de cepas examinadas	Total de uvas cose- chadas en kg	Uvas sanas, en kg	Uvas ataca- das, en kg	Porcenta- je de uvas sa- nas
Aspor	2	72	61,2	22,0	39,2	35,9
Aspor	1	72	44,8	17,0	27,8	37,9
S 560	2	72	75,7	73,4	2,3	96,9
S 560	1	72	69,9	62,1	7,8	88,8
Testigo		36	14,2	1,1	13,1	7,8



28

TABLA VII

Datos determinados después del 15º tratamiento, referentes al control de los ataques deletéreos del mildew de la uva

Productos	Dosis °/oo	Nº de hojas examinadas	% de hojas atacadas
Aspor	2	1,000	12,2
Aspor	1	1,000	11,0
S 560	2	1,000	8,4
S 560	1	1,000	14,2
Testigo		500	86,2



2024009  
b) Oidium farinosum en los manzanos

Dos plantas de manzano cultivadas en maceta en condiciones de campo abierto se trataron con cada uno de los productos siguientes: S 565, S 560, S 558 y S 628 en una formulación de aceite.

5.

En el momento del tratamiento, una parte de las hojas de las plantas de ensayo se hallaban ya atacadas por el Oidium y por consiguiente la prueba se efectuó para determinar tanto la actividad curativa como la preventiva

10.

Los datos finales deben considerarse como un índice significativo de ambas actividades y también de la persistencia del efecto antioidio, pues transcurrió un período de tiempo relativamente largo (50 días) entre el tratamiento y la determinación de los datos.

15.

Para determinar, en caso de existir, un efecto de los productos (aceite y emulgentes) empleados para preparar la formulación y del agua usada para el rociado, se trataron algunos testigos con los mencionados productos de formulación, otros se trataron con agua y otros no se sometieron a ningún tratamiento.

20.



9 00

TABLA VIII

281403

Datos referentes a la actividad antioidio en los manzanos

Productos	Dosis o/oo	Nº total de hojas tratadas	Nº de hojas atacadas			Total de ho- jas ata- cadas	Total de man- chas de oidio	Nº de manchas en 100 hojas
			con 1 mancha	con 2 man- chas	con 3 manchas			
S 565	2	57	4	4	1	9	15	26,3
S 560	2	96	5	2	1	8	12	12,5
S 558	2	143	12	0	0	12	12	8,4
S 628	2	85	4	0	0	4	4	4,7
Testigo (produc- tos de formu- lación)	4	164	30	18	14	62	108	65,8
Testigo (agua)		125	31	12	6	49	73	58,4
Testigo		216	49	25	9	83	126	58,3



9 OCT

281406

o) Oidium tabaci en calabaceras

Plantas de calabaza, cultivadas en campo abierto y sometidas a un intenso ataque de oidio, hasta el punto de que toda la superficie de las hojas estaba cubierta

5. con un espeso entrelazamiento de hifas y abundantes conidios, se trataron con los productos siguientes: S 558, S 560, S 565 y S 628, en formulación de aceite.

También en este caso se emplearon como testigos plantas de calabaza tratadas con los productos de formulación solos (aceite y emulgentes), plantas tratadas con agua sola y plantas no sometidas a ningún tratamiento.

10.

TABLA IX

Datos referentes a la actividad antioidio en las plantas de calabaza, determinados por examen microscópico 8 días después del tratamiento.

15.

Productos	Dosis °/oo	Micelio (+)	Conidios (++)
S 558	2	+++	+++
S 560	2	+++	+++
S 565	2	++	++
S 628	2	++++	++++
Testigo (productos de formulación)	4	0	0
Testigo (agua)		0	0
Testigo		0	0



281406

- (+)++++ = completamente destruido
- +++ = casi completamente destruido
- ++ = parcialmente destruido
- 0 = abundante y en muy buen estado vegetativo.

5. (++)++++ = completamente destruido
- +++ = casi completamente destruido
  - ++ = se observan todavía algunos conidios turgentes
  - 0 = numerosos y turgentes.

d) Oidium erisifoides en plantas de convólvulo

10. Grupos de plantas de convólvulo muy atacadas por el oidio se trataron con los productos siguientes: S 558, S 560, S 565 y S 628 en formulación de aceite. Como productos de comparación se usaron Karathene y Tiovit. También en este caso, lo mismo que en los precedentes, se
15. utilizaron como testigos plantas tratadas con los productos de formulación (aceite y emulgentes), plantas tratadas con agua solamente y plantas no sometidas a ningún tratamiento.
- La determinación de los resultados se efectuó por examen microscópico 5 días después del tratamiento.



TABLA X

281406

Datos de la actividad antioidio en plantas de convólculo, determinados por examen microscópico 5 días después del tratamiento.

	Productos	Dosis o/oo de la substancia activa	Crecimiento del hongo (+)
5.	S 558	2	++
	S 558	1	+
	S 558	0,5	0
10.	S 560	2	++++
	S 560	1	+++
	S 560	0,5	++
	S 565	2	+
	S 565	1	+
15.	S 565	0,5	0
	S 628	2	++++
	S 628	1	++++
	S 628	0,5	+++
	Karathene	2	++++
20.	Karathene	1	++++
	Karathene	0,5	+++
	Tiovit	4	+++
	Tiovit	2	++
	Tiovit	1	+
25.	Testigo (Producto de formulación)	4	0
	Testigo (agua)		0
	Testigo		0

= 17 =



(+) ++++ efecto total  
+++ efecto casi total  
++ efecto mediano  
+ efecto escaso  
0 ningún efecto.

281406

= . =



281406

N O T A

Descrito el objeto del presente invento, se declaran nuevas las siguientes reivindicaciones, con prioridad de la solicitud de patente italiana N° 18247/61 del 10 de Octubre de 1961.

5. 1. Mejoras en el objeto de la patente principal núm. 266.878 por procedimiento para la obtención de composiciones fungicidas, caracterizadas por el hecho de hacer intervenir, como principio activo, ya sea sola, o en mezcla sinérgica con fungicidas conocidos, una sal, por lo menos, escasamente soluble en agua de una beta-amino-aril-etil-cetona.

10. 2. Mejoras conforme a lo definido en la reivindicación 1, caracterizadas por el hecho de que la sal escasamente soluble en agua de una beta-amino-aril-etil-cetona es un picrato.

15. 3. Mejoras conforme a lo definido en las reivindicaciones 1 y 2, caracterizadas por el hecho de que el picrato de una beta-amino-aril-etil-cetona se elige en el grupo constituido por: picrato de beta-dimetilamino-9-antranil-etil-cetona, picrato de beta-morfolino-4-cloro-1-naftiletiloetona, picrato de beta-dipropilamino-1-naftil-cetona y picrato de beta-morfolino-9-antranil-etil-cetona.

20. 4. Mejoras en el objeto de la patente principal núm. 266.878 por "Procedimiento para la obtención de composiciones



fungicidas.

281406

Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva que consta de 19 páginas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras, acompañadas de la documentación reglamentaria.

5.

Madrid, a 9 de Octubre de 1962

MONTECATINI SOCIETA GENERALE PER  
L'INDUSTRIA MINERARIA E CHIMICA

p.a.

JOSÉ ISERN GARCÍA

*[Handwritten signature]*