



316912

P.- 30.047

A-84592  
Case 20525 JHH (WMP)

18 JUL 1965

316912

MEMORIA DESCRIPTIVA

que se presenta para unir a la solicitud

de

P A T E N T E      D E      I N V E N C I O N

formulada el 28 de Agosto de 1.965, con el número 316.912

en

E S P A Ñ A

por VEINTE años

a nombre de AMERICAN CYANAMID COMPANY, entidad norteamericana, establecida en Township of Wayne, Nueva Jersey, Estados Unidos de América, por:

"UN METODO DE REPRESION O DESTRUCCION DE HONGOS Y MICROORGANISMOS O DE PROTECCION CONTRA EL ATAQUE DE LOS MISMOS, EN ZONAS O MATERIALES EXPUESTOS A ATAQUE"

La presente invención se refiere a nuevas composiciones fungicidas que comprenden benzoato de dicianobencilo, y tiene por objeto principal unos métodos para proteger contra el ataque de microorganismos artículos agrícolas, orgánicos, y análogos, tales como productos textiles, pinturas, plásticos y detergentes.

Tal como se usa en esta Memoria descriptiva, en el término "fungicida" se pretenden incluir no sólo los materiales que posean la propiedad de destruir a los hongos, sino también la propiedad de inhibir la germinación de las esporas de los hongos.

316912

20

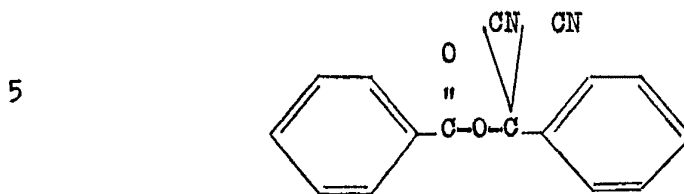


Es bien sabido que los tóxicos fungicidas son generalmente eficaces contra una variedad de patógenos específicos, pero limitados. En general, la actividad se limita al control de patógenos que corresponden a una pseudoclasificación caracterizada por los síntomas de la enfermedad. Por ejemplo, algunos tóxicos fungicidas son eficaces contra los agentes causantes de las manchas y putrefacción de hojas y tallos. Otros son eficaces contra los microorganismos responsables de las ronchas de las hojas, costras de los frutos o cancro y marchitamiento o exantema de los tallos. Otros son además eficaces contra el mildiú. Sin embargo, hasta ahora no se ha desarrollado un tóxico fúngico orgánico satisfactorio, que no sea fitotóxico, para controlar o eliminar con eficacia tanto el mildiú como una diversidad de otros patógenos. Si se pudiera conseguir un fungicida de espectro amplio, se habría satisfecho una necesidad que se siente desde hace tiempo.

Inesperadamente, se ha descubierto ahora que el benzoato de dicianobencilo se puede emplear para controlar el mildiú de los tipos tanto pulverulento como vellosos, así como para controlar las manchas de las hojas, tales como la antracnosis del pepino. Análogamente, se pueden controlar otros agentes causantes de, por ejemplo, las costras de la manzana, tizón tardío del tomate, putrefacción marrón del melocotón o mancha de la hoja de trébol.

Según la presente invención, se ha hallado que las composiciones que comprenden benzoato de dicianobencilo en cantidades eficaces poseen propiedades fungicidas y bactericidas inigualadas. Tales composiciones son particularmente eficaces para evitar e inhibir el crecimiento de hongos, incluso el mildiú, sobre semillas, plantas, frutos, algodón y madera.

El benzoato de dicianobencilo empleado como componente activo en la presente invención, está representado por la estructura:



Este compuesto ha sido preparado por Diels y otros, en Berichte, Vol. 41, pág. 1893.

10 Las composiciones fungicidas y bactericidas tratadas, de amplio espectro, se pueden preparar como suspensión en un no disolvente adecuado, como polvos, o como polvos humedecibles. Las suspensiones o dispersiones del benzoato de dicianobencilo en un no disolvente, tal como agua, se emplean ventajosamente para  
15 tratar el follaje de las plantas.

Se ha descubierto que para obtener la máxima protección de frutos, semillas, tubérculos de plantas y otros materiales orgánicos durante su almacenamiento, es ventajoso el empleo de una solución de benzoato de dicianobencilo en aceite, solución  
20 que luego se emulsifica en agua. Los aceites que se pueden usar como disolventes del compuesto activo son hidrocarburos, tales como, por ejemplo, benceno y tolueno. También se toman en consideración los hidrocarburos halogenados tales como clorobenceno, cloroformo, fluorotriclorometano y diclorodifluorometano.

25 Como alternativa, para aplicar los compuestos de la presente invención al follaje se puede usar el método de los aerosoles. Las soluciones para tratamiento por aerosoles se preparan disolviendo el compuesto activo directamente en un vehículo líquido muy volátil, tal como trifluorometano, o bien disolviendo  
30 el fungicida en un disolvente menos volátil, tal como benceno,

316912

20



y mezclando luego tal solución con el vehículo líquido para aerosol, muy volátil.

Los polvos se pueden preparar mezclando benzoato de dicianobencilo con materiales pulverulentos tales como arcilla, bentonita, pómez, tierra de batán, pirofilita y equivalentes de los mismos. Así, por ejemplo, las semillas se pueden proteger contra los organismos del terreno perjudiciales para ellas, incorporando los compuestos en un vehículo sólido, y mezclando la composición con las semillas, tal como por volteo o rotación.

En general, se emplea un amplio intervalo de concentraciones, incluyendo cantidades pequeñas del compuesto activo, benzoato de dicianobencilo, con un vehículo o diluyente inerte, generalmente de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 10% en peso de compuesto, basado en el peso del aditivo inerte, que se encuentra en cantidad principal. Sin embargo, se ha descubierto que, para preparaciones de dispersiones acuosas, es adecuado de 0,01% a 1,0% de ingrediente activo. Para composiciones en polvo, para la mayoría de las aplicaciones es eficaz un 5% de ingrediente activo.

Cuando se utiliza una suspensión acuosa, la composición global puede contener un agente dispersante del compuesto. En general, para formar tales dispersiones se puede usar cualquier agente dispersante o tensoactivo de que se disponga en el comercio. Son ilustrativos entre tales dispersantes los ésteres de ácido graso con alcoholes polivalentes, tales como "Span"; sal sódica del sulfosuccinato de dioctilo, tal como Aerosol OT; o los poliéteres/alcoholes alcohilarílicos; y los equivalentes de los mismos. Generalmente, de 1 a 5 partes de agente dispersante por 100 partes de fungicida constituyen un intervalo sa-



tisfactorio.

La presente invención se ilustrará más por los siguientes ejemplos, pero no se limita a los mismos. A no ser que se indique otra cosa, las partes indicadas son en peso.

5

#### EJEMPLO 1

La toxicidad fúngica del compuesto activo, benzoato de dicianobencilo, se determina empleando una técnica normalizada de germinación de esporas, que es como sigue: Los hongos típicos a ensayar son: Monilinia fructicola (Wint.) Honey y Stemphylium sarcinaeforme (Cav.) Wiltshire. Una suspensión normalizada de esporas (conidios) de cada hongo se dispone en una solución acuosa del compuesto activo, en una serie de concentraciones graduales. Después de un período de incubación de 24 horas a 24°C, los datos resultantes se indican en la siguiente Tabla I, en forma de tanto por ciento de esporas que no han germinado.

TABLA I

Hongo	Cantidad de BDCB* (ppm)	% de inhibición de la germinación
<u>M. fructicola</u>	100	100
	10	100
	1	25
<u>S. sarcinaeforme</u>	100	100
	10	25

25

\*BDCB = benzoato de dicianobencilo

#### EJEMPLO 2

La eficacia del benzoato de dicianobencilo para controlar enfermedades de las plantas se ilustra empleando costras de la manzana (provocadas por Venturia inaequalis (Cooke) Wint.) y

30

316912



20 NOV 1965

mildió pulverulento de la manzana, Podosphaera leucotricha  
(Ell. y Everh.) Salm.

Para mayor uniformidad, se seleccionan tallos de manzano de aproximadamente 20 cm de altura. Las plantas individuales se someten a pulverización a mano, hasta que chorrean, de soluciones graduales de benzoato de dicianobencilo, en una mezcla consistente en 50 partes de acetona y 50 partes de agua. Una vez secos los depósitos de pulverización, las plantas se inoculan uniformemente con los patógenos a ensayar. Las plantas inoculadas se incuban durante 96 horas a 21°C y humedad relativa igual a 100 %. Después se retiran las plantas, y se almacenan en invernadero. En la siguiente Tabla II se tabulan los datos obtenidos aproximadamente 14 días después del tratamiento.

15

TABLA II

	Concentración (g/litro)	Estado de la enfermedad <sup>¶</sup>	
		Costras	Mildió
Benzoato de dicianobencilo	1,2	5	5
	0,6	5	5
Mezcla acetona/agua (control)	-	1	1

20

<sup>¶</sup>Estado de la enfermedad:

25

5 = control perfecto; no hubo enfermedad en el follaje tratado

4 = trazas de la enfermedad

3 = ligera enfermedad

2 = enfermedad moderada

1 = enfermedad grave; no hubo control de la enfermedad

EJEMPLO 3

30

La eficacia del benzoato de dicianobencilo, formulado y

sin formular, como control de las enfermedades de las plantas, se ilustra usando la antracnosis del pepino (causada por el Colletotrichum lagenarium (Pass.) Ell. y Halst.) y tizón tardío del tomate (causado por el Phytophthora infestans (Mont.) DBy.).

- 5 Unos tallos de pepino con dos hojas expandidas, y tallos de tomate que tienen de 12,5 a 15,5 cm de altura, se someten a pulverización con soluciones o suspensiones graduales de benzoato de dicianobencilo. En el ensayo se incluye Maneb, es decir, etilenbis-ditiocarbamato manganoso, como tratamiento normal.
- 10 Una vez secos los depósitos de pulverización, las plantas se inoculan uniformemente con el patógeno a ensayar. Después se incuban las plantas durante 48 horas a 17° C y con humedad relativa igual a 100 %. Los resultados se tabulan a continuación.

15

TABLA III

Formulación de benzoato de dicianobencilo	Cantidad (ppm)	Indice de control de la enfermedad <sup>***</sup>	
		Antracnosis del pepino	Tizón tardío del tomate
Polvo humedecible <sup>**</sup>	500	5	4
	100	5	4
	50	5	4
	25	5	4
Concentrado líquido <sup>***</sup>	500	5	4
	100	5	4
	50	5	4
	25	4	4
Compuesto activo <sup>***</sup>	500	5	4
	100	5	4
	50	4	3
	25	3	2

<sup>\*\*</sup>Molido con chorros de aire, 50 % de polvo humectable

50 % BDCB (benzoato de dicianobencilo)

49 % Caolinita 41

1 % Aerosol OTB (sal sódica de dioctilsulfosuccinato)

30

20 NOV 1965

\*\*\* Concentrado líquido

316912

23 % BDCB (0,24 kg/litro)

50 % N-metil-2-pirrolidona

21 % Panasol AN-3 (hidrocarburo de alto punto de ebullición; marca registrada de Amoco Chemical Co., de Chicago, Ill.)

5

6 % Toximul R (mezcla aniónica/no iónica de dodecilsulfonato cálcico y alcoholfenol etoxilado; marca registrada de Stepan Chemical Co., de Chicago, Ill.).

\*\*\*\* En solución en 50 % acetona y 50 % agua

\*\*\*\*\* Índice de control de la enfermedad:

10

5 = igual o mejor que el Maneb en cantidad de 100 ppm

4 = igual o mejor que el Maneb en cantidad de 50 ppm, pero no tan bueno como el Maneb en cantidad de 100 ppm

3 = control moderado de la enfermedad, no tan bueno como el Maneb en cantidad de 50 ppm

15

2 = ligero control de la enfermedad

1 = no hubo control significativo de la enfermedad

EJEMPLO 4

La inocuidad del benzoato de dicianobencilo sobre las plantas convenientes se determina aplicando concentraciones variables del compuesto activo, sobre plantas de tomate y pepino. Incluso en cantidades de pulverización de 4,8 g/litro (4800 ppm), no se notaron daños en observaciones diarias, durante 3 semanas después del tratamiento.

25

EJEMPLO 5

La actividad antibacteriana del benzoato de dicianobencilo se determina empleando una técnica normal de dilución de caldo.

Los organismos a ensayar son: Pseudomonas aeruginosa (Schroeter) Migula, Salmonella gallinarum (Klein) Bergey, y Staphy-

30



lococcus pyogenes aureus Rosenbach. Una suspensión bacteriana normalizada se mezcla con concentraciones graduales de benzoato de dicianobencilo en una solución nutritiva, y se incuba durante 48 horas a 30° C. Los resultados se indican en la siguiente Ta-  
5 bla IV, en forma de crecimiento o de no crecimiento, indicando la actividad o eficacia del benzoato de dicianobencilo.

TABLA IV

10 <u>Bacteria del ensayo</u>	<u>Actividad<sup>**</sup></u>			
	<u>Conc. de BDCB<sup>***</sup>, ppm</u>			
	<u>1000</u>	<u>500</u>	<u>250</u>	<u>125</u>
P. aeruginosa	+	0	0	0
S. gallinarum	+	+	0	0
S. pyogenes aureus	+	+	+	+

15      <sup>\*\*</sup> 0 = inactivo

         + = activo

<sup>\*\*\*</sup> BDCB = benzoato de dicianobencilo

20      Esta solicitud que corresponde a la presentada en Estados Unidos de América, el día 14 de septiembre de 1964, bajo el nº 396.385, se acoge a los beneficios del artículo 51 del vigente Estatuto sobre Propiedad Industrial.

25

- N O T A -

         Los puntos de invención propia y nueva que se presentan para que sean objeto de esta solicitud de Patente de Invención  
30 en España, por VEINTE años, son los siguientes:

316912



1.- Un método de represión o destrucción de hongos y microorganismos o de protección contra el ataque de los mismos, en zonas o materiales expuestos a ataque, especialmente plantas, materiales de origen vegetal y materiales y artículos orgánicos, caracterizado por aplicar una cantidad eficaz de benzoato de dicianobencilo a las zonas o materiales expuestos a ataque.

2.- Un método según la reivindicación 1, caracterizado por el hecho de que se utiliza una cantidad pequeña de benzoato de dicianobencilo en un vehículo o diluyente inerte.

3.- Un método según la reivindicación 2, caracterizado por el hecho de que se utiliza de 0,0001 % a 10 % en peso de benzoato de dicianobencilo basado en el peso del vehículo o diluyente inerte.

4.- Un método de represión o destrucción de hongos y microorganismos o de protección contra el ataque de los mismos, en zonas o materiales expuestos a ataque.

Tal y como se ha descrito en la Memoria que antecede y con los fines que se han especificado.

Esta Memoria consta de diez hojas escritas a máquina por una sola cara.

Madrid, 18 DIC. 1965

P.A.

Alberto de Ekaburu  
Por Poder.

A.F.A.