

230



/ Exp. 22.135.

321111

memoria descriptiva

CLASE DE
REGISTRO

una PATENTE DE INVENCION
por veinte años en España.

NOMBRE Y
NACIONA-
LIDAD DEL
SOLICITANTE

SANKYO COMPANY LIMITED
- sociedad japonesa -

RESIDENCIA
Y DOMICILIO

Tokyo (Japón)
Nº 1-6, 3-chome Nihonbashi Hon-cho, Chyuo-ku

OBJETO

"MEJORAS EN LA OBTENCION DE COMPOSICIONES
PARA EL TRATAMIENTO DEL SUELO".

PRIORIDAD:

Solicitud patente japonesa Nº 39-73350 del 26-12-1964 y
" " " " 40-76893 14-12- 1965

INVENTORES:

Hiroji Sumi; Yukiyoishi Takahi; Norio Nakamura y
Kazuo Tomita.
(todos de nacionalidad japonesa)



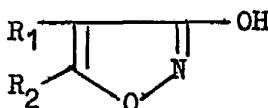
1

5

10

El presente invento se refiere a composiciones agrícolas y métodos para el tratamiento del suelo o de medios para el crecimiento de plantas. Más particularmente se refiere a una composición agrícola para el control de organismos que habitan en el suelo, que pueden atacar las partes subterráneas de varias plantas. Todavía más particularmente este invento se refiere a una composición para el tratamiento del suelo, comprendiendo como ingrediente activo esencial, un compuesto teniendo la fórmula:

(I)



15

20

25

el que R_1 es hidrógeno, un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono o un átomo de halógeno y R_2 es hidrógeno, un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 10 átomos de carbono, un grupo de fenilo, un grupo de dialcoxialquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono en cada mitad de alcoxi y conteniendo de 1 a 5 de carbono en la mitad de alquilo, o un grupo de alcóxicarbonilo conteniendo de 2 a 6 átomos de carbono, cuando R_1 representa hidrógeno; hidrógeno o un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono, cuando R_1 representa un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono; y un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono cuando R_1 representa un átomo de halógeno.

Hasta ahora, como un ingrediente activo en aque-

321111

23



- 2.-

1
llas composiciones para el tratamiento del suelo se ha em-
pleado ampliamente compuestos orgánicos tales como tricloro
nitrometano (cloropicrina), pentacloronitrobenceno o varios
compuestos orgánicos de mercurio, por ejemplo, etilfenetil
5 mercurio. Sin embargo, estos compuestos conocidos se sabe
que tienen inconvenientes, que deben ser mejorados o supri-
midos. Por ejemplo, el tricloronitrometano, que se emplea
ampliamente como fungicida del suelo, es altamente activo
en una amplia variedad de organismos, que habitan el suelo.
10 Sin embargo, se encuentra que es muy tóxico para los seres
humanos y animales domésticos, difícil de manipular y perju-
dicial para las plantas vivas. El pentacloronitrobenceno,
que también se usa ampliamente como fungicida del suelo, es
eficaz contra enfermedades residentes en el suelo causadas
15 por Pellicularia filamentosa, pero ineficaces contra enfer-
medades situadas en el suelo causadas por Pythium aphanider-
matum o Fusarium oxysporum. Los compuestos orgánicos del mer-
curio se emplean ahora como fungicida útil al suelo. Sin em-
bargo, son indeseables a causa de sus considerables residuos
20 tóxicos en el suelo.

De acuerdo con esto, es un objeto del presente in-
25 vento procurar un nuevo compuesto agrícola para el tratamien-
to del suelo, comprendiendo, como un ingrediente activo esen-
cial, un compuesto de la arriba citada fórmula (I), que se
caracteriza por la amplia disponibilidad en cualquier gene-
ración deseada de las plantas por razón de menor fitotoxici-
dad, por el excelente efecto al controlar enfermedades resi-

321111

230



- 3.-

1
dentes en el suelo causadas por varios organismos que habitan en el suelo, especialmente aquellas del género de Pellicularia, Fusarium y Pythium y también por la no toxicidad para seres humanos y animales domésticos.

5
Otros objetos del invento quedarán aparentes en la exposición detallada que sigue de este invento.

Ahora se ha hallado que aquellos compuestos de 3-hidroxiisoxazol teniendo la fórmula (I) arriba citada, son altamente eficaces contra varias enfermedades residentes en el suelo causadas por organismos que habitan en el suelo, especialmente aquellos del género de Pellicularia, Fusarium y Pythium.

10
Los compuestos de 3-hidroxiisoxazol de la fórmula (I) arriba indicada son nuevos compuestos desconocidos en la técnica, excepto aquellos de la fórmula (I) arriba citada, en que ambos R_1 y R_2 representan metilo y R_1 representa hidrógeno y R_2 representa fenilo. Estos nuevos compuestos de isoxazol pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula $R_2-C=C-COOR_3$, en que R_2 es como se ha definido arriba, y R_3 es un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono, con hidroxilamina en presencia de un hidróxido de metal de álcali y tratando después la sal resultante de metal de álcali de isoxazol con un ácido.

15
20
25
Los grupos precedidos de los compuestos 3-hidroxiisoxazol de la fórmula (I) arriba citada, que pueden emplearse eficazmente como un ingrediente activo esencial en la composición de acuerdo con este invento, incluyen los siguientes

321111

230



- 4.-

tes isoxazoles:

- 3-hidroxiisoxazol (punto de fusión 98 99°C),
3-hidroxi-5-metilisoxazol (punto de fusión 80 82°C),
3-hidroxi-5-etilisoxazol (punto de fusión 45 46°C),
3-hidroxi-5-n-propilisoxazol (punto de fusión 41 42°C),
3-hidroxi-5-isopropilisoxazol (punto de fusión 41 42°C),
3-hidroxi-5-isobutilisoxazol (punto de ebullición
3 128 133°C),
3-hidroxi-5-n-decilisoxazol (punto de fusión 66,5°C),
3-hidroxi-5-fenilisoxazol (punto de fusión 172 173°C.),
3-hidroxi-4,5-dimetilisoxazol (punto de fusión
127 128°C.),
3-hidroxi-5-dietoximetilisoxazol (punto de fusión
86 87°C.),
3-hidroxi-5-metoxicarbonilisoxazol (punto de fusión
166 168°C.),
3-hidroxi-4-bromo-5-metilisoxazol (punto de fusión
143°C.),
y 3-hidroxi-4-metilisoxazol.

Los compuestos activos usados en la composición según este invento pueden convenientemente formularse por procedimientos conocidos y usarse en varias formas incluyendo líquidos, polvos, gránulos y polvos humedecibles, etc.

Los líquidos suelen prepararse disolviendo el compuesto activo en un disolvente adecuado con o sin uno o más de los numerosos aditamentos conocidos, tales como agentes emulsionadores o agentes dispersadores. Los disolventes adecuados incluyen agua, alcoholes, tales como metanol o etanol, acetona, benceno, tolueno, xilenos, nafta disolvente, éter

321111

200



- 5.-

1

de petróleo y semejantes. Pueden ser aditamentos adecuados cualesquiera de aquellos que se emplean ordinariamente en la técnica e incluyen, por ejemplo, los productos de condensación de óxidos de alquileno con fenoles o ácidos orgánicos, alquilarilsulfonato, derivados de polioxietileno de alcoholes de éter y semejantes.

5

10

Pueden prepararse polvos y gránulos mezclando dicho compuesto activo dentro y sobre un portador sólido inerte por un procedimiento convencional. Los portadores sólidos adecuados para el uso en el compuesto de este invento incluyen, por ejemplo, talco, pirofilita, Kieselgur, arcilla, bentonita, tierra de diatomáceas, caolín, cal precipitada y semejantes.

15

Los polvos humedecibles suelen prepararse mezclando dicho compuesto activo con uno o varios de los antes mencionados portadores sólidos y adecuados agentes dispersantes. Los agentes dispersantes adecuados incluyen, por ejemplo, los aditivos antes mencionados, tales como sulfonatos de alquilbenceno o éteres o ésteres de glicol de polioxialquileno.

20

25

La concentración del compuesto activo en la composición de este invento puede ser normal y preferentemente desde alrededor de 0,5 hasta 50% de peso, basado sobre el peso total de la composición, aunque la cantidad del ingrediente activo dependerá grandemente de factores tales como el tipo y la gravedad de las enfermedades, la forma de una composición o el compuesto activo específico. Sin embargo, se entenderá que la cantidad de un compuesto activo empleado

321111

230



- 6.-

1 no será la característica crítica de este invento.

La composición agrícola de este invento puede incluir también otros fungicidas conocidos, insecticidas, fertilizantes y/u otros aditivos o ayudantes.

5 Para ilustrar el excelente efecto de la composición de este invento contra varias enfermedades residentes en el suelo, se darán más abajo los resultados de ensayos con compuestos activos representativos en la composición de este invento:

10 (1) Método experimental:

15 Dos grupos de las parcelas de ensayo de terreno se prepararon mezclando uniformemente los organismos habitantes en los dos terrenos, es decir, Pythium aphanidernatum y Fusarium oxysporum F. Cucumerium, que habían sido incubados en salvado de trigo a 28°C durante dos semanas con tierra. Los compuestos ensayados, enumerados abajo, se formularon en un polvo al 10% que después fué mezclado uniformemente con la tierra ya indicada en la cantidad del compuesto activo, que se indicará más abajo. Después de esto se sembraron con un número adecuado de semillas de pepinos (variedad: Sagamihanshiro) las parcelas de terreno de ensayo arriba citadas. Después de catorce días de la aplicación de los compuestos ensayados, se investigaron los efectos controladores contra enfermedades residentes en el suelo, causadas por los dos organismos arriba citados, de acuerdo con el siguiente método.

25 (2) Método de investigación:

321111 230



1

El 14º día después del tratamiento se investigó el número de las plantas enfermas de pepino y las condiciones de los daños de las plantas huéspedes enfermas.

5

La eficacia de los compuestos ensayados se expresó y evaluó en términos de "índice del año".

El "índice del año" se calcula del "grado de daño" que puede estimarse sobre las condiciones de daños de las plantas huéspedes de acuerdo con la siguiente ecuación:

10

$$\text{Indice de daños} = \frac{\text{"Grado de daños" de las parcelas tratadas}}{\text{"Indice de daños" de las parcelas de control}} \times 100 \text{ (A)}$$

En la ecuación (A) arriba citada el "Grado de daño" se calcula según la siguiente ecuación (D):

$$\text{Grado de daño} = \frac{(5xa) + (4xb) + (3xc) + (2xd) + (1xe) + (0xf)}{(a+b+c+d+e+f)} \text{ (B)}$$

15

En la ecuación (B) arriba citada, las seis letras, a, b, c, d, e, y f significan un valor numérico definido más abajo respectivamente:

<u>Letra</u>	<u>Valor numérico</u>
a	número de las plantas huéspedes completamente dañadas
b	número de las plantas huéspedes dañadas gravemente
c	número de las plantas huéspedes considerablemente dañadas
d	número de las plantas huéspedes moderadamente dañadas
e	número de las plantas huéspedes ligeramente dañadas
f	número de las plantas huéspedes sanas

20

25

(3) Resultados experimentales:
Los resultados se resumen en la tabla siguiente:

T a b l a

321111

23
- 8. -



Compuesto ensayado	Dosificación. de compuesto activo g/10a	Indice de daños.		Fitotoxicidad.
		Fusarium	Pythium	
2-hidroxi-isoxazol	1000	1.4	2.2	--
	500	9.8	11.1	--
3-hidroxi-5- metilisoxazol	1000	2.0	1.8	--
	500	11.2	14.1	--
3-hidroxi-5- etilisoxazol	1000	21.1	6.5	--
	500	30.2	15.1	--
3-hidroxi-5- isopropilisoxazol	1000	45.2	14.2	--
	500	62.3	35.2	--
3-hidroxi-5-n- propilisoxazol	1000	44.7	4.7	--
	500	54.3	9.2	--
3-hidroxi-5- isobutilisoxazol	1000	5.2	4.8	--
	500	10.5	8.3	--
3-hidroxi-5-n- decilisoxazol	1000	6.7	7.2	--
	500	14.5	12.6	--
3-hidroxi-5- fenilisoxazol	1000	8.5	7.2	--
	500	12.7	12.4	--
3-hidroxi-4,5- dimetilisoxazol	1000	11.5	12.4	--
	500	24.3	20.7	--
3-hidroxi-5- dietoximetilisoxazol	1000	6.2	2.6	--
	500	12.9	5.4	--
3-hidroxi-5- metoxicarbonilisoxazol	1000	7.5	6.5	--
	500	11.3	18.5	--
3-hidroxi-5-bromo- 4-metilisoxazol	1000	2.0	0.4	--
	500	5.2	7.1	--
control	---	100.0	100.0	

Resultará aparente de los resultados arriba indicados que los compuestos de 3-hidroxi-isoxazol de la fórmula (I) arriba citada, muestran excelente efecto contra enfermedades residentes en el suelo causadas por organismos que habitan en el suelo.



321111

1

De acuerdo con ésto, estos compuestos de 3-hidroxiisoxazol son útiles como un ingrediente activo en la composición para el tratamiento del suelo.

5

Los ejemplos siguientes se dan solamente para la ilustración de este invento y no deben entenderse como limitando el alcance del mismo.

Ejemplo 1.

10

Diez partes de peso de 3-hidroxi-5-metilisoxazol, 40 partes de peso de arcilla y 50 partes de peso de talco se mezclan y pulverizan para dar un polvo fino.

Ejemplo 2.

15

Diez partes de peso de 3-hidroxiisoxazol, 1 parte de peso de alcohol de polivinilo, 3 partes de peso de un agente de superficie-activo comercial conteniendo dodecilsulfonato de sodio y 86 partes de peso de arcilla se mezclan y pulverizan para dar un polvo humectable.

Ejemplo 3.

20

Cinco partes de peso de 3-hidroxi-5-dietoximetilisoxazol y 95 partes de peso de arcilla se mezclan y pulverizan para dar un polvo fino.

Ejemplo 4.

25

Veinte partes de peso de 3-hidroxi-5-metoxicarbonilisoxazol, 1 parte de peso de alcohol de polivinilo, 3 partes de peso de un agente superficie-activo comercial conteniendo dodecilsulfonato de sodio y 76 partes de peso de arcilla se mezclan y pulverizan para dar un polvo humectable.

Ejemplo 5.

Cinco partes de peso de 3-hidroxi-5-fenilisoxazol y

321111

23



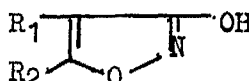
- 10.-

1 95 partes de peso de talco se mezclan y pulverizan para dar un polvo fino.

N O T A . -

5 La presente patente de invención, comprende las siguientes reivindicaciones:

1.- Mejoras en la obtención de composiciones para el tratamiento del suelo, caracterizadas porque la composición comprende como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de un compuesto que tiene la fórmula



15 en que R₁ es hidrógeno, un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono o un átomo de halógeno, y R₂ es hidrógeno, un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 10 átomos de carbono, un grupo de fenilo, un grupo de dialcoxilquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono en cada parte de alcoxi y conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono en la parte de alquilo, o un grupo de alcoxi-carbonilo conteniendo de 2 a 6 átomos de carbono, cuando R₁ representa hidrógeno; hidrógeno o un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono, cuando R₁ representa un grupo de alquilo conteniendo de 1 a 5 átomos de carbono cuando R₁ representa un átomo de halógeno.

20 2.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende como ingrediente activo esencial una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-metilisoxazol.

25 3.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende, como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-etilisoxazol.

321111

23 DIC



- 11.-

1 4.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende, como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-n-propilisoxazol.

5 5.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende, como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-isopropilisoxazol.

6.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende, como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-isobutilisoxazol.

10 7.- Mejoras según la reivindicación 1, caracterizadas porque la composición comprende, como ingrediente activo esencial, una cantidad tóxica de 3-hidroxi-5-n-decilisoxazol.

8.- Mejoras en la obtención de composiciones para el tratamiento del suelo.

15 Según se describe y reivindica en la presente memoria descriptiva, la cual consta de once hojas foliadas y escritas a máquina por una sola de sus caras.

Madrid, a 23 de Diciembre de 1965.

CARLOS ROEB

20

25