



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



⑪ Número de publicación: **2 328 552**

⑫ Número de solicitud: 200801087

⑬ Int. Cl.:
A01N 47/28 (2006.01)
A01P 17/00 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

⑫

SOLICITUD DE PATENTE

A1

⑫ Fecha de presentación: **16.04.2008**

⑬ Prioridad: **19.04.2007 JP 2007-110171**

⑭ Fecha de publicación de la solicitud: **13.11.2009**

⑭ Fecha de publicación del folleto de la solicitud:
13.11.2009

⑰ Solicitante/s:
SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LIMITED
27-1 Shinkawa 2-chome
Chuo-ku, Tokyo 104-8260, JP

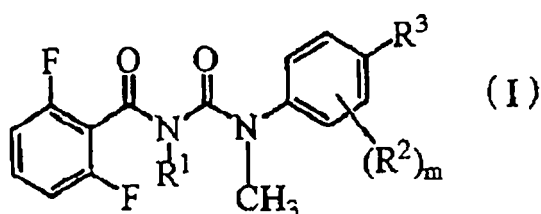
⑱ Inventor/es: **Sakamoto, Norihisa y**
Konobe, Masato

⑲ Agente: **Ungría López, Javier**

⑳ Título: **Uso novedoso de un compuesto de (N'-metil)benzoilurea.**

㉑ Resumen:

Uso novedoso de un compuesto de (N'-metil)benzoilurea. Un método para prevenir en una planta tal como hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera o soja la lesión por plagas de insectos después de la germinación de la planta que comprende las etapas de tratar las semillas de la planta con una composición que contiene un compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I):



donde R¹ indica un átomo de hidrógeno o similar; R² indica un átomo de halógeno o similar, R³ indica un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado, o similar, y sembrar las semillas tratadas, seguido de cultivo.

ES 2 328 552 A1

DESCRIPCIÓN

Uso novedoso de un compuesto de (N'-metil)benzoilurea.

5 Antecedentes de la invención

Campo técnico

La presente invención se refiere al uso novedoso de un cierto compuesto de (N'-metil)benzoilurea para el tratamiento de semillas de plantas tales como hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera, o soja para prevenir en las plantas las plagas de insectos que causan lesiones en las plantas después de la germinación. Se ha encontrado que los compuestos de benzoilurea cuyo sustituyente en la posición N' de la benzoilurea es un átomo de hidrógeno son eficaces para prevenir en las plantas las plagas de insectos y se pueden utilizar como componentes eficaces de los agentes para el tratamiento de semillas (véase JP 01-168661A y JP 11-240859 A).

15 Compendio de la invención

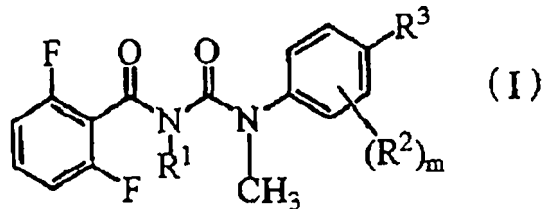
La presente invención proporciona el uso novedoso de un cierto compuesto de (N'-metil)benzoilurea para el tratamiento de semillas de una planta para prevenir en la planta las plagas de insectos que causan lesiones en la planta después de la germinación.

Los autores de la presente invención han estudiado intensamente y han completado la presente invención.

Esto es, la presente invención proporciona:

25 (1) un método para proteger una planta de las lesiones por plagas de insectos después de la germinación que comprende las etapas de:

30 tratar las semillas de la planta con una composición que comprende un compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I):



45 donde R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alqueno C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo arilo C₆-C₁₄, un grupo aralquilo C₇-C₁₁, un grupo alcoxialquilo C₂-C₆, un grupo ariloxialquilo C₇-C₁₄, un grupo dialquilaminoalquilo C₃-C₆, un grupo alquiltioalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfonilalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfonilalquilo C₂-C₆, un grupo alcoxialcoxialquilo C₃-C₉, un grupo alcoxi (C₂-C₆) carbonilo, un grupo aralquil (C₈-C₁₂) oxicarbonilo, un grupo dialquil (C₃-C₁₃) carbamoilo, un grupo alquil (C₂-C₆) carbonilo opcionalmente halogenado, un grupo formilo, un grupo alquil(C₁-C₅)sulfonilo opcionalmente halogenado, o un grupo arilsulfonilo C₆-C₁₀, R² indica un átomo de halógeno, o un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado; R³ indica un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C₁-C₄ opcionalmente halogenado, un grupo alcoxialcoxi C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alqueno(C₂-C₄)oxi, opcionalmente halogenado, o un grupo alquino(C₂-C₄)oxi opcionalmente halogenado, y m indica un número entero de 0 a 4, y

55 sembrar las semillas tratadas, seguido de su cultivo;

60 (2) El método de acuerdo con el apartado (1) anterior, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja;

(3) Un método para producir semillas tratadas de una planta que comprende someter las semillas a tratamiento con una composición que comprende el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) como se define en el apartado (1) anterior con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación;

65 (4) El método de acuerdo con el apartado (3) anterior, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, algodón, maíz, arroz, remolacha azucarera y soja;

(5) Una composición para el tratamiento de semillas de una planta con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación que comprende el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en el apartado (1) anterior;

(6) La composición de acuerdo con el apartado (5) anterior, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja;

(7) Semillas de una planta que se tratan con una composición que contiene el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en el apartado (1) anterior;

(8) Las semillas de acuerdo con el apartado (7) anterior, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja;

(9) El uso del compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en el apartado (1) anterior para el tratamiento de semillas de una planta con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación;

(10) El uso de acuerdo con el apartado (9) anterior, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja; y similares.

El tratamiento de semillas de una planta con el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (1) (en adelante referido como compuesto de la presente invención) puede prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación de estas plantas.

Descripción detallada de la invención

Los ejemplos de los sustituyentes indicados por R¹ en el compuesto de la presente invención son los siguientes.

Los ejemplos de "un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado" incluyen metilo, clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, etilo, 2-bromoetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, propilo, 3,3,3-trifluoropropilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, t-butilo, 4,4,4-trifluorobutilo, pentilo, isopentilo, neopentilo, 5,5,5-trifluoropentilo, hexilo y 6,6,6-trifluorohexilo.

Los ejemplos de "un grupo alqueno C₂-C₆ opcionalmente halogenado" incluyen vinilo, 1-propenilo, 2-propenilo, isopropenilo, 2-butenilo, isobutenilo y 3,3-dicloro-2-propenilo.

Los ejemplos de "un grupo alquino C₂-C₆" incluyen etinilo, 2-propinilo y 1-propinilo.

Los ejemplos de "un grupo arilo C₆-C₁₄" incluyen fenilo, 1-naftilo, 2-naftilo y bifenilo.

Los ejemplos de "un grupo aralquilo C₇-C₁₁" incluyen bencilo y fenetilo.

Los ejemplos de "un grupo alcoxialquilo C₂-C₆" incluyen metoximetilo, etoximetilo, 1-propoximetilo, 2-metoxietilo, 2-etoxietilo, 3-metoxipropilo y 3-etoxipropilo.

Los ejemplos de "un grupo ariloxialquilo C₇-C₁₄" incluyen fenoximetilo y 2-fenoxietilo.

Los ejemplos de "un grupo dialquilaminoalquilo C₃-C₆" incluyen dimetilaminometilo, 2-(dimetilamino)etilo, dietilaminometilo y 2-(dietilamino)etilo.

Los ejemplos de "un grupo alquiltioalquilo C₂-C₆" incluyen metiltiometilo, etiltiometilo, 2-(metiltio)etilo y 2-(etiltio)etilo.

Los ejemplos de "un grupo alquilsulfinilalquilo C₂-C₆" incluyen metilsulfinilmetilo, etilsulfinilmetilo, 2-(metilsulfinil)etilo y 2-(etilsulfinil)etilo.

Los ejemplos de "un grupo alquilsulfonilalquilo C₂-C₆" incluyen metilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2-(metilsulfonil)etilo y 2-(etilsulfonil)etilo.

Los ejemplos de "un grupo alcoxialcoxialquilo C₃-C₉" incluyen (2-metoxietoxi)metilo.

Los ejemplos de "un grupo alcoxycarbonilo C₂-C₆" incluyen metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, n-butoxycarbonilo y t-butoxycarbonilo.

Los ejemplos de "un grupo aralquilo oxycarbonilo C₈-C₁₂" incluyen benciloxycarbonilo.

Los ejemplos de "un grupo dialquil(C₃-C₁₃)carbamoilo" incluyen dimetilcarbamoilo y dietilcarbamoilo.

Los ejemplos de “un grupo alquil(C₂-C₆)carbonilo opcionalmente halogenado” incluyen acetilo, propionilo, trifluoroacetilo y cloroacetilo.

Los ejemplos de “un grupo alquil(C₁-C₃)sulfonilo opcionalmente halogenado” incluyen metanosulfonilo, etanosulfonilo y trifluorometanosulfonilo.

Los ejemplos de “un grupo aril(C₆-C₁₀)sulfonilo” incluyen bencenosulfonilo y toluenosulfonilo.

Los ejemplos del sustituyente indicado por R² en el compuesto de la presente invención son los siguientes.

Los ejemplos de “un átomo de halógeno” incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos de “un grupo alquilo C₁-C₄ halogenado” incluyen metilo, clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, etilo, 2-bromoetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, propilo, 3,3,3-trifluoropropilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, t-butilo y 4,4,4-trifluorobutilo.

Los ejemplos de “un átomo de halógeno” incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos de “un grupo alquilo C₁-C₄ halogenado” incluyen metilo, clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, etilo, 2-bromoetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, propilo, 3,3,3-trifluoropropilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, t-butilo y 4,4,4-trifluorobutilo.

Los ejemplos del sustituyente indicado por R³ en el compuesto de la presente invención son los siguientes.

Los ejemplos de “un átomo de halógeno” incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los ejemplos de “un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado” incluyen metilo, clorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, etilo, 2-bromoetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, propilo, 3,3,3-trifluoropropilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, t-butilo y 4,4,4-trifluorobutilo.

Los ejemplos de “un grupo alcoxi C₁-C₄ opcionalmente halogenado” incluyen metoxi, etoxi, 1-propiloxi, isopropoxi, t-butoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoro-1-propoxi y 1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propoxi.

Los ejemplos de “un grupo alcoxialcoxi C₂-C₆ opcionalmente halogenado” incluyen 2-trifluorometoxi-1,1,2-trifluoroetoxi.

Los ejemplos de “un grupo alquenal (C₂-C₄) oxi opcionalmente halogenado” incluyen 2-propeniloxi y 3,3-dicloro-2-propeniloxi.

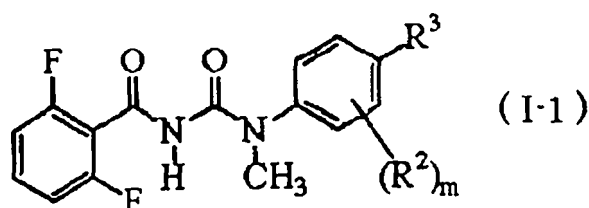
Los ejemplos de “un grupo alquínal(C₂-C₄)oxi opcionalmente halogenado” incluyen 2-propiniloxi.

A continuación, se ilustrará la síntesis del compuesto de la presente invención.

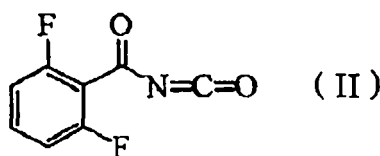
El compuesto de la presente invención se puede producir mediante el siguiente Procedimiento Sintético 1 al Procedimiento Sintético 4.

Procedimiento Sintético 1

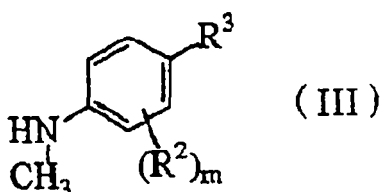
Entre los compuestos de la presente invención, se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-1):



donde R^2 , R^3 y m se definen como antes, mediante reacción de un compuesto representado por la fórmula (II):



y un compuesto representado por la fórmula (III):



donde R^2 , R^3 y m se definen como antes.

La reacción se realiza normalmente en un disolvente.

Los ejemplos de los disolventes que se van a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no próticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetilsulfóxido, y una mezcla de los mismos.

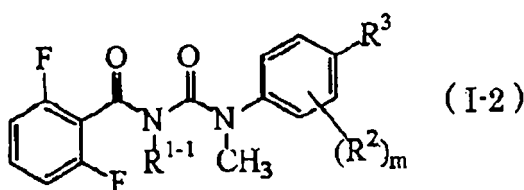
La cantidad del compuesto representado por la fórmula (III) es normalmente de 0,5 a 2 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (II).

Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 100 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (I-1) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (I-1) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía en columna o similar.

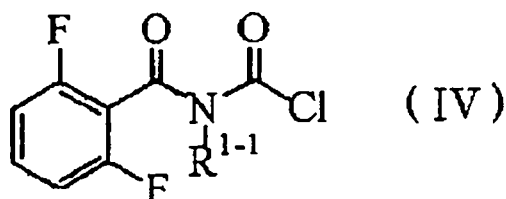
Procedimiento Sintético 2

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I-2):



donde R^2 , R^3 y m se definen como antes; R^{1-1} indica un grupo alquilo C_1-C_6 opcionalmente halogenado, un grupo alquenoilo C_2-C_6 opcionalmente halogenado, un grupo alquinoilo C_2-C_6 , un grupo arilo C_6-C_{14} , un grupo aralquilo C_7-C_{11} , un grupo alcoxialquilo C_2-C_6 , un grupo ariloxialquilo C_7-C_{14} , un grupo N,N-di(alquil)aminoalquilo C_3-C_6 , un

grupo alquiltioalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfonyl-alquilo C₂-C₆ o un grupo alcoxialquilo C₃-C₉, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV):



donde X, Y y R¹⁻¹ se definen como antes; y un compuesto representado por la fórmula (III).

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares apróticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetil-sulfóxido; y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos de litio orgánicos tal como n-butil litio y diisopropilamido de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undeceno (en adelante abreviado como DBU).

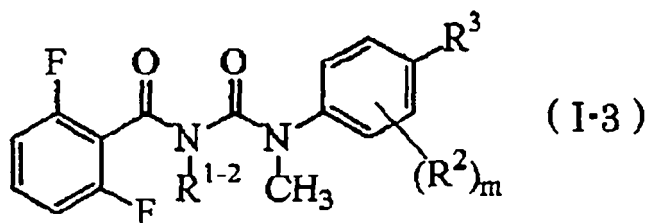
En el caso en el que los reactivos que se van a utilizar sean líquidos en las condiciones de reacción, las cantidades de los mismos pueden ser tales que se vuelvan disolventes de los respectivos reactivos y, normalmente, la cantidad del compuesto representado por la fórmula (III) es de 1 a 4 moles y la cantidad de la base es de 1 a 4 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (IV).

Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 200 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (I-2) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (I-2) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía en columna o similar.

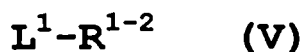
Procedimiento Sintético 3

El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I-3):



donde R², R³ y m se definen como antes; R¹⁻² indica un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alqueno C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo aralquilo C₇-C₁₁, un grupo alcoxialquilo C₂-C₆, un grupo aroxialquilo C₇-C₁₄, un grupo dialquilaminoalquilo C₃-C₆, un grupo alquiltioalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfonyl-alquilo C₂-C₆, un grupo alcoxialcoxialquilo C₃-C₉, un grupo alcocarbonilo C₂-C₆, un grupo aralquilocarbonilo C₈-C₁₂, un grupo dialquilcarbamoilo C₃-C₁₃, un grupo alquil (C₂-C₆) carbonilo opcionalmente halogenado, un grupo formilo, un grupo alquil(C₁-C₅)sulfinilo opcionalmente

halogenado, y un grupo aril(C₆-C₁₀)sulfonilo, se puede producir mediante reacción de un compuesto representado por la fórmula (I-1) y un compuesto representado por la fórmula (V):



donde R¹⁻² se define como antes; L¹ indica un átomo de halógeno (p. ej. un átomo de cloro y un átomo de bromo);

metanosulfonilo, bencenosulfonilo, tolueno-sulfonilo, metoxisulfonilo o etoxisulfonilo, en presencia de una base.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no proticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetilsulfóxido, y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos litio orgánicos tal como n-butil litio y diisopropilamido de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y DBU.

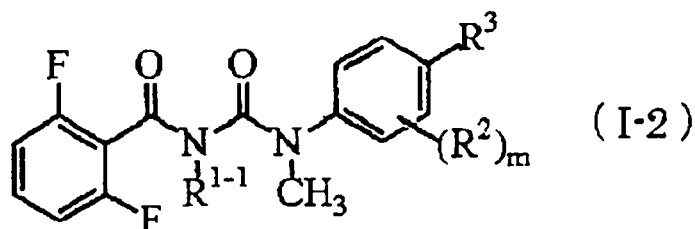
En el caso en el que los reactivos que se van a utilizar son líquidos en las condiciones de reacción, las cantidades de los mismos pueden ser tales que se vuelvan disolventes de los respectivos reactivos y, normalmente, la cantidad del compuesto representado por la fórmula (V) es de 1 a 4 moles y la cantidad de la base es de 1 a 4 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (I-1).

Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 100 horas.

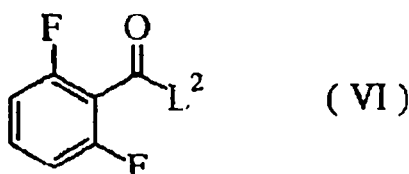
Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (I-3) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (I-3) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía en columna o similar.

Procedimiento Sintético 4

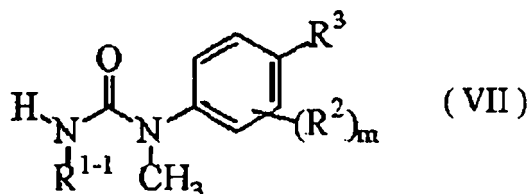
El compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I-2):



donde R², R³, R¹⁻¹, y m se definen como antes se puede producir mediante reacción de un compuesto representado por la fórmula (VI):



donde L^2 indica un átomo de halógeno (p. ej. un átomo de cloro, un átomo de bromo, y un átomo de yodo), y un compuesto representado por la fórmula (VII):



donde R^{1-1} , R^2 , R^3 y m se definen como antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no próticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona, dimetil-sulfóxido, y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos de litio orgánicos tales como n-butil litio y diisopropilamiduro de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y DBU.

En el caso en el que los reactivos que se van a utilizar sean líquidos en las condiciones de reacción, las cantidades de los mismos pueden ser tales que se vuelvan disolventes de los respectivos reactivos y, normalmente, la cantidad del compuesto representado por la fórmula (VI) es de 1 a 4 moles y la cantidad de la base es de 1 a 4 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VII).

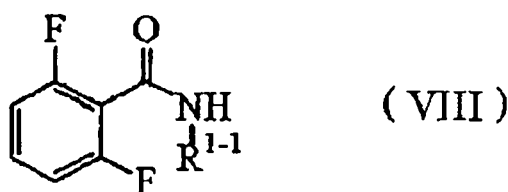
Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 180°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 200 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (I-2) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (I-2) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía en columna o similar.

A continuación, se ilustrarán los procedimientos de producción de referencia del compuesto de la presente invención.

Procedimiento de Producción de Referencia 1

El compuesto representado por la fórmula (IV) se puede producir mediante reacción de un compuesto representado por la fórmula (VIII):



donde R^{1-1} se define como antes, y un compuesto de trialquilclorosilano y un agente clorocarbonilante.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos haloge-

nados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no próticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetil-sulfóxido, y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos de litio orgánicos tales como n-butil litio y diisopropilamidu de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y DBU.

Los ejemplos del compuesto de trialquilclorosilano incluyen trimetilclorosilano y trimetilclorosilano.

Los ejemplos del agente clorocarbonilante que se va a utilizar incluyen fosgeno, cloroformiato de triclorometilo y carbonato de bis(triclorometilo), o similar.

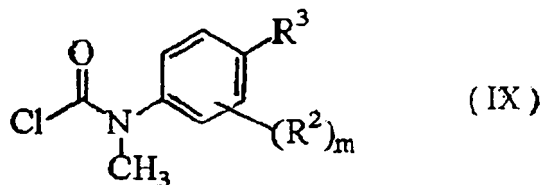
Independientemente de las cantidades de los reactivos, la cantidad del compuesto de trialquilclorosilano es de 1 a 4 moles y la cantidad de la base es de 1 a 4 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VIII).

Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 200 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (IV) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, concentrando la mezcla de reacción tal cual. El compuesto aislado representado por la fórmula (IV) se puede utilizar en la siguiente etapa sin purificación.

Procedimiento de Producción de Referencia 2

El compuesto representado por la fórmula (VII) se puede producir por reacción de un compuesto representado por la fórmula (IX):



donde R^2 , R^3 y m se definen como antes, y un compuesto representado por la fórmula (X):



donde R^{1-1} se define como antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no próticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetil-sulfóxido, y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos de litio orgánicos tales como n-butil litio y diisopropilamidu de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina y DBU. Alternativamente, también se puede utilizar como base una cantidad en exceso de (X).

ES 2 328 552 A1

Independientemente de las cantidades de los reactivos que se van a utilizar, la cantidad del compuesto representado por la fórmula (X) es de 1 a 6 moles y la cantidad de la base es de 1 a 6 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la fórmula (IX).

5 Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 200 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (VII) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y
10 secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (VII) se puede purificar adicionalmente mediante recristalización, cromatografía en columna o similar.

Procedimiento de Producción de Referencia 3

15 El compuesto representado por la fórmula (IX) se puede producir por reacción de un compuesto representado por la fórmula (III) con un agente clorocarbonilante.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

20 Los ejemplos del disolvente que se va a utilizar incluyen cetonas tales como acetona y metiletilcetona; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; éteres tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano y 1,2-dietoxietano; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos tales como acetonitrilo; disolventes polares no
25 próticos tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1-metil-2-pirrolidona, 1,3-dimetilimidazolinona y dimetilsulfóxido, y una mezcla de los mismos.

Los ejemplos de la base que se va a utilizar incluyen hidróxidos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio e hidróxido de calcio; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos
30 tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio e hidruro de calcio; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos tales como carbonato de sodio y carbonato de potasio; alcoholatos de metales alcalinos tales como etilato de sodio y metilato de sodio; compuestos de litio orgánicos tales como n-butil litio y diisopropilamidiuro de litio; y bases orgánicas tales como trietilamina, piridina y DBU.

35 Los ejemplos del agente clorocarbonilante que se va a utilizar incluyen fosgeno, cloroformiato de triclorometilo y carbonato de bis(triclorometilo), o similar.

Independientemente de las cantidades de los reactivos que se van a utilizar, la cantidad del agente clorocarbonilante es de 1 a 4 moles y la cantidad de la base es de 1 a 4 moles con respecto a 1 mol del compuesto representado por la
40 fórmula (III).

Normalmente, la temperatura de reacción se encuentra en el intervalo de -78 a 150°C y el tiempo de reacción se encuentra en el intervalo de 0,1 a 200 horas.

45 Una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (IX) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo, vertiendo la mezcla de reacción en agua, extrayendo la mezcla con un disolvente orgánico, y secando y concentrando la capa orgánica resultante. El compuesto aislado representado por la fórmula (IX) se puede purificar adicionalmente mediante cromatografía en columna o similar. Alternativamente, una vez completada la reacción, el compuesto representado por la fórmula (IX) se puede aislar mediante post-tratamiento, por ejemplo,
50 concentrando la mezcla de reacción tal cual.

Los compuestos producidos mediante los procedimientos sintéticos mencionados antes se pueden someter adicionalmente a alquilación, alquenilación, alquinilación, acilación, aminación, sulfuración, sulfinilación, sulfonilación, oxidación, reducción, halogenación y nitración para remplazar los sustituyentes por otros sustituyentes deseados.

55 Los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención son los siguientes:

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquenilo C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquinilo C₂-C₆, un grupo arilo C₆-C₁₄, un grupo aralquilo C₇-C₁₁ o un grupo alcoialquilo C₂-C₆;

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, o un grupo alcoialquilo C₂-C₆;

65 compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo metoximetilo;

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que m indica 0 o 1;

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R² indica un átomo de halógeno y m indica 0 o 1;

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R³ indica un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₄ opcionalmente halogenado o un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado;

5

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R³ indica un átomo de halógeno, un grupo trifluorometoxi, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, o un grupo trifluorometilo;

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alqueno C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo arilo C₆-C₁₄, un grupo aralquilo C₇-C₁₁, o un grupo alcoxialquilo C₂-C₆; R² indica un átomo de halógeno; y R³ indica un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C₁-C₄ opcionalmente halogenado, o un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado; y

compuestos de (N'-metil)benzoilurea en los que R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ o un grupo alcoxialquilo C₂-C₆; R² indica un átomo de halógeno; y R³ indica un átomo de halógeno, un grupo trifluorometoxi, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi o un grupo trifluorometilo.

En el método para producir semillas tratadas de la presente invención (en adelante, referido como método de producción de la presente invención y semillas de plantas de la presente invención, respectivamente), las semillas se pueden tratar con el compuesto de la presente invención tal cual. No obstante, en general, las semillas se tratan con una composición que comprende el compuesto de la presente invención. En cuanto a semejante composición, normalmente, el compuesto de la presente invención se puede utilizar en forma de una preparación obtenida mezclando el compuesto de la presente invención con un portador tal como un portador sólido o líquido y si fuera necesario, un tensioactivo, un agente suspensor, un disolvente de desarrollo, un agente de penetración, un agente humectante, un agente espesante, un estabilizador, o similar, o una solución diluida en agua de la preparación. Los ejemplos de la composición incluyen preparaciones líquidas tales como emulsiones, soluciones, micro-emulsiones, preparaciones verticales, y preparaciones con una base oleosa; preparaciones sólidas tales como preparaciones hidratadas, preparaciones solubles en agua, preparaciones de sol, preparaciones en polvo, bolitas, comprimidos y preparaciones en película; y preparaciones encapsuladas obtenidas encapsulando o recubriendo preparaciones que contienen el compuesto de la presente invención.

Los ejemplos del portador sólido que se va a utilizar para las preparaciones anteriormente mencionadas incluyen polvos de vegetales (polvo de soja, polvo de tabaco, polvo de trigo, polvo de madera, etc.), polvo mineral (arcilla tal como caolín, bentonita y arcilla blanca ácida, talco tal como polvo de talco y agalmatolita; y sílice tal como tierra de diatomeas y polvo de mica); alúmina, polvo de azufre, carbón activado, carbonato de calcio, sulfato de amonio, hidrogenocarbonato de sodio, lactosa, y urea. Cuando se utilizan estos portadores sólidos para la composición protectora de las plantas de la presente invención, uno o más de estos portadores sólidos se pueden utilizar a una razón de mezcla apropiada. Los ejemplos del portador líquido incluyen alcoholes (alcohol metílico, alcohol etílico, alcohol n-propílico, alcohol isopropílico, y etilenglicol), cetonas (acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, y ciclohexanona), éteres (tetrahidrofurano, monometiléter de etilenglicol, monometiléter de dietilenglicol, y monometiléter de propilenglicol), hidrocarburos alifáticos (queroseno, aceite pesado, y aceite pesado para maquinaria), hidrocarburos aromáticos (tolueno, xileno, nafta disolvente, y metilnaftaleno), hidrocarburos halogenados (diclorometano, cloroformo, y tetraclorometano), amidos de ácido (N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, y N-metilpirrolidona), ésteres (acetato de etilo, acetato de butilo, éster de glicerina y ácidos grasos, γ -butirolactona), y nitrilos (acetonitrilo, y propionitrilo). Cuando se utiliza un portador líquido para una composición protectora de las plantas de la presente invención, uno o más de estos portadores líquidos pueden estar a una razón de mezcla apropiada.

Adicionalmente, los ejemplos del tensioactivo que se va a utilizar según se necesite incluyen jabones y tensioactivos no iónicos y aniónicos tales como polioxietilen-alquilaryléteres [p. ej. NOIGEN (marca de fábrica), y EA 142 (marca de fábrica), fabricado por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., y NONAL (marca de fábrica) fabricado por Kao Corporation]; alquilsulfatos [p. ej., EMAL 10 (marca de fábrica) y EMAL 40 (marca de fábrica); fabricados por Kao Corporation]; sales alquilbencenosulfonato [p. ej. NEOGEN (marca de fábrica) y NEOGEN T (marca de fábrica), fabricados por Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., y Nepelex (marca de fábrica), fabricado por Kao Corporation]; polietilenglicoléteres [p. ej. Nonipol 85 (marca de fábrica), NONIPOL 100 (marca de fábrica), y NONIPOL 160 (marca de fábrica); fabricados por Sanyo Chemical Industries, Ltd.]; ésteres de alcoholes polihidroxilados [p. ej. TWEEN 20 (marca de fábrica), y TWEEN 80 (marca de fábrica); fabricados por Kao Corporation]; alquilsulfosuccinatos [p. ej. Sanmorin OT20 (marca de fábrica), fabricado por Sanyo Chemical Industries, y Newkalgen EX 70 (marca de fábrica); fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.], alquilnaftalenosulfonatos y alquenisulfonatos [p. ej. Sorpol 5115 (marca de fábrica), fabricado por Toho Chemical Industry Co., Ltd.].

Los ejemplos del método de tratamiento de las semillas de las plantas con la composición que comprende el compuesto de la presente invención incluyen los métodos para el tratamiento de semillas conocidos convencionales tales como impregnación y adhesión.

65

En la presente invención, la impregnación incluye un método tal que las semillas de las plantas se sumergen o se empapan en una composición líquida que contiene como componentes principales agua y el compuesto de la presente invención (disuelto o disperso) para impregnar las semillas de las plantas con el compuesto de la presente invención.

La composición líquida que se va a utilizar para la impregnación puede contener un disolvente adicional, que a veces es útil para incrementar la solubilidad del compuesto de la presente invención y la penetrabilidad en las semillas de las plantas, tal como metanol, etanol, isopropanol, etilenglicol, propilenglicol, carbonato de propileno, alcohol bencílico, ésteres de ácido dibásico, acetona, acetato de metilo, acetato de etilo, ciclohexanona, dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y una mezcla de los mismos con tal que el disolvente no ocasione efectos adversos en la planta. Adicionalmente, cuando se utiliza un tensioactivo, éste facilita la humectación de las semillas de las plantas y la impregnación de las semillas con el compuesto de la presente invención. Preferiblemente, se utilizan una solución diluida en agua de las preparaciones en emulsión, preparaciones en micro-emulsión, preparaciones hidratadas, preparaciones solubles en agua y preparaciones en sol mencionadas antes como composición líquida. La concentración del compuesto de la presente invención en la composición líquida es normalmente de aproximadamente 0,01 ppm a 100.000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 1.000 ppm.

En la presente invención, el tratamiento de adherencia se puede llevar a cabo pulverizando una composición líquida que contiene el compuesto de la presente invención a la superficie de las semillas de las plantas y secando después las semillas; pegando un material de tipo polvo que contiene el compuesto de la presente invención a la superficie de las semillas de las plantas utilizando un agente fijador (p. ej. metilcelulosa y goma arábiga); mezclando el compuesto de la presente invención y un aglutinante (p. ej. polímeros sintéticos tales como poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo) hidrolizado, polivinilmetiléter, copolímero de polivinilmetiléter-anhídrido maleico, y polivinil-pirrolidinona, alginatos, goma Karaya, goma Guar, goma de tragacanto, y goma de polisacáridos) y un portador sólido (p. ej. harina de madera, arcilla, carbón activado, tierra de diatomeas, sólido inorgánico finamente dividido, y carbonato de calcio), moldeando la mezcla en forma de bolitas, y secando; y envolviendo las semillas de las plantas con un material formador de película (p. ej. polímeros y copolímeros de acetato de vinilo, copolímeros de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, y ceras solubles en agua) que contiene el compuesto de la presente invención.

El grosor de la capa de la composición que contiene el compuesto de la presente invención formada sobre las superficies de las semillas de las plantas se encuentra en el intervalo del de una película fina al de una capa de bolitas, esto es, en el intervalo de aproximadamente 0,1 a 10 mm. La cantidad del compuesto de la presente invención que se va a pegar a las superficies de las semillas de las plantas se encuentra normalmente en el intervalo de aproximadamente 0,0001% a 500%, preferiblemente en el intervalo de 0,001% a 200% con respecto al peso de las semillas de las plantas de la presente invención.

En el tratamiento de adherencia, a veces, resulta ventajoso añadir un disolvente tal como metanol, etanol, acetato de metilo, acetato de etilo, acetona, y ciclohexanona a la capa de la composición que contiene el compuesto de la presente invención que está pegada a las superficies de las semillas de las plantas para mejorar las propiedades de solubilidad y adherencia del compuesto de la presente invención con tal que el disolvente no tenga un efecto adverso sobre la planta. Adicionalmente, se puede añadir un tensioactivo para facilitar que las semillas de las plantas estén mojadas.

La composición para el tratamiento de las semillas de la presente invención puede contener adicionalmente otros componentes activos además del compuesto de la presente invención. Los ejemplos del ingrediente activo adicional incluyen insecticidas (p. ej. insecticidas piretroides, insecticidas organofosfatados, insecticidas de carbamato, insecticidas de neonicotinoides, insecticidas naturales), acaricidas, aceites para maquinaria, nematocidas, herbicidas, hormonas vegetales, sustancias reguladoras del crecimiento de las plantas, fungicidas (p. ej. fungicidas de cobre, fungicidas organoclorados, fungicidas organosulfurados, fungicidas fenólicos), sinergistas, atrayentes, repelentes, agentes para aliviar las lesiones químicas, colorantes, fertilizantes y similares.

Los ejemplos de los insecticidas incluyen

(1) Insecticidas organofosfatados;

fosfuro de aluminio, butatíofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfeninfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos (CYAP), diazinon, DCIP (diclorodiisopropil éter), diclofention (ECP), diclorvos (DDVP), dimetoato, dimetilinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, ezrimfos, fention (MPP), fenitrotion (MEP), fostiazato, formotion, fosfuro de hidrógeno, isofenfos, isoxation, malation, mesulfenfos, metidation (DMTP), monocrotofos, naled (BRP), oxideprofos (ESP), paration, forato, fosalona, fosmet (PMP), pirimifos-metilo, piridafention, quinalfos, fentoato (PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salition, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometon, triclorfon (DEP), vamidotion, y similares;

(2) insecticidas de carbamato:

alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbaril, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb (MIPC), metolcarb, metomil, metiocarb, NAC, oxamil, pirimicarb, propoxur (PHC), XMC, tiodicarb, xililcarb, y similares;

ES 2 328 552 A1

(3) insecticidas piretroides sintéticos:

acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, ciclotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotina, permemtrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofen, teflutrina, tralometrina, transflutrina, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclo-propanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclo-propanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencilo, (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoxifenil)bencilo, y similares;

(4) compuestos de nereistoxina:

cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, bisultap, y similares;

(5) compuestos neonicotinoides:

imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, y similares;

(6) compuestos de benzoilurea:

clorfluazuron, bistrifluron, diafenthiuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triazuron, triflumuron, y similares;

(7) compuestos de fenilpirazol:

acetoprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol, y similares;

(8) insecticidas con toxinas de Bt:

esporas vivas derivadas de y toxinas cristalizadas producidas por *Bacillus thuringiensis* y mezclas de las mismas;

(9) compuestos de hidrazina:

cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, y similares;

(10) compuestos organoclorados:

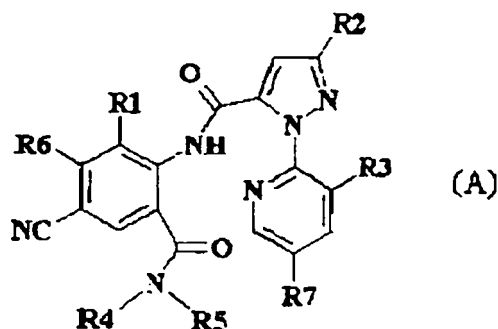
aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfan, metoxiclor, y similares;

(11) insecticidas naturales:

Aceite para maquinaria, sulfato de nicotina, y similares;

(12) otros insecticidas:

avermectina B, cienopirafen, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, cienopirafen, ciromazina, D-D (1,3-dicloropropeno), emamectin-benzoato, fenazaquin, flupirazofos, hidropreno, indoxacarb, lepimectina, metoxadiazona, milbemicina A, pimetozina, piridilil, piriproxifen, espinosad, sulfluramid, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, ci-flumetofen, ácido arsénico, benclofliaz, cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, clordane, DDT, DSP, flufenerim, flonicamid, flurimfen, formetanato, meta-amonio, meta-sodio, bromuro de metilo, nidinotefuran, oleato de potasio, protrifenbute, espiromesifen, azufre, metaflumizona, espirotetramat, pirifluquinazon, tralopril, un compuesto representado por la siguiente fórmula (A):



donde R¹ representa Me, Cl, Br o F, R² representa F, Cl, Br, haloalquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, R³ representa F, Cl o Br, R⁴ representa H, o alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₅ o cicloalquilalquilo C₄-C₆ que puede estar sustituido con uno o mas sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en un átomo de halógeno, CN, SMe, S(O)Me, S(O)₂Me y OMe, R⁵ representa H o Me, R⁶ representa H, F o Cl, y R⁷ representa H, F o Cl; y similares.

Los ejemplos del acaricida incluyen acequinocil, amitraz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, CPCBS (clorfenson), clofentezina, cienopirafen, ciflumetofen, keltano (dicofol), etoxazol, fenbutatin óxido, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim, fluproxifen, hexitiazox, propargita (BPPS), polinactinas, piri-daben, pirimidifen, tebufenpirad, tetradifon, espiroclifofen, espiromesifen, espirotetramat, amido flumet, y similares.

Los ejemplos del nematocida incluyen DCIP, fostiazato, levamisol hidrocloreuro, metilisotiocianato, morantel tartrato, imiciafos, y similares.

Los ejemplos del fungicida incluyen acibenzolar-S-metilo, amobam, amisulbrom, ampropilfos, anilazina, azoxis-trobina, benalaxil, benodanil, benomilo, bentiavalicarb, benzotiazol, bentoxazin, bitertanol, blasticidina-S, mezcla de Bordeaux, boscalid, bromuconazol, butiobato, hipoclorito de calcio, polisulfuro de calcio, captano, carbendazol, carboxin, carpropamid, clobentiazona, cloroneb, cloropicrin, clorotalonil (TPN), clortiofos, cinamaldehído, clozilacon, CNA (2,6-dicloro-4-nitroanilina), hidróxido de cobre, sulfato de cobre, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, ciprofuram, dazomet, debacarb, diclofluanid, D-D (1,3-dicloropropeno), diclocimet, diclomezina, dietofencarb, difenoconazol, diflumerim, dimefluazol, dimetirimol, dimetomorf, diniconazol-M, dinocap, edifenfos, enestroburin, epoxiconazol, dimetilditiocarbamato de níquel, etaconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fendazosulfam, fenhexamid, fenoxanil, fempliconil, fenpropidin, fenpropimorf, fentiazon, hidróxido de fentin, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorf, fluoroimida, fluotrimazol, fluo-xastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, fosest-A, ftaluro, fuberidazol, furalaxil, fura-metpir, furcarbanil, furconazol-cis, hexaconazol, himexazol, IBP, imazalil, imibenconazol, iminocadina-albesilato, iminocadina- triacetato, yodocarb, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, menapirim, mepronil, meptildinocap, metaxalil, metaxalil-M, metam-sodio, metasulfocarb, bromuro de metilo, metconazol, metfuroxam, metominostrobina, metrafenona, metsulfovax, mildiomicina, milneb, miclobutanil, miclozolin, nabam, orisasstrobina, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, oxitetraciclina, perfurazato, penconazol, pencicuron, picoxistrobina, policarbamato, polioxin, hidrogenocarbonato de potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb-hidrocloreuro, propiconazol, propineb, proquinazid, protio-carb, protioconazol, piracarbolid, piraclostrobina, pirazofos, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, piroquilon, quinoxifen, quintozeno (PCNB), siltiofam, simeconazol, sipocconazol, bicarbonato de sodio, hipoclorito de sodio, espiroxamina, SSF-129, ((E)-[2-(2,5-dimetoxifenoximetil)fenil]-2-metoxiimino-N-metilacetamida), estreptomycin, azufre, tebuco-nazol, tecloftalam, tiabendazol, tiabendazol, tiadinil, tiram (TMTD), tifluzamida, tiofanato-metilo, tolclofos-metilo, TPN, triadimefon, triadimenol, triazoxido, triclamil, tricloclazol, tridemorf, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, triti-conazol, validamicina, vinclozolin, viniconazol, zineb, ziram, zoxamida, y similares.

Los ejemplos del herbicida y/o la sustancia reguladora del crecimiento de las plantas incluyen ácido abscísico, ace-toclor, acidluofen-sodio, alaclor, aloxidim, ametrin, amicarbazona, amidosulfuron, aminoetoxivinil-glicina, aminopi-ralid, AC94, 377, amiprofos-metilo, ancimidol, asulam, atrazina, aviglicina, azimsulfuron, beflubutamid, benfluralin, benfuresato, bensulfuron-metilo, bensulida (SAP), bentazona, bentiocarb, benzamizol, benzfendizona, benzobiciclon, benzofenap, benciladenina, bencilaminopurina, bialafos, bifenox, brasinólida, bromacil, bromobutida, butaclor, buta-fenacilo, butamifos, butilato, canfestrol, carbonato de calcio, peróxido de calcio, carbaril, clometoxinil, cloridazon, clorimuron-etilo, clorftalim, clorprofam, clorsulfuron, clortal-dimetilo, clortiamida (DCBN), cloruro de colina, cini-don-etilo, cinmetilin, cinosulfuron, cletodim, clomeprop, cloxifonac-sodio, cloruro de cloromequat, 4-CPA (ácido 4-clorofenoxiacético), cliprop, clofencet, cumiluron, cianazina, ciclanilida, ciclosulfamron, cihalofop-butilo, sal 2,4-D (sales de ácido 2,4-diclorofenoxiacético), dicloprop (2,4-DP), daimuron, dalapon (DPA), dimetenamid-P, daminozi-da, dazomet, alcohol n-declico, dicamba-sodio (MDBA), diclobenilo (DBN), diflufenicam, dikegulac, dimepiperato, dimetametrina, dimetenamida, dicuat, ditiopir, diuron, endotal, epocoleon, esprocarb, etefon, etidimuron, etoxisul-furon, eticlozato, etobenzanid, fenarimol, fenoxaprop-etilo, fentrazamida, flazasulfuron, florasulam, fluazifop-butilo, fluazolato, flucarbazona, flucetosulfuron, flufenacet, flufenpir, flumetralin, fluomioxazin, flupropanato-sodio, flupir-sulfuron-metilo-sodio, flurprimidol, flutiacet-metilo, foramsulfuron, forclorfenuron, formesafen, giberelina, glufosi-

nato, glifosato, halosulfuron-metilo, hexazinona, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazasulfuron, inabenfide, ácido indolacético (IAA), ácido indolbutírico, yodosulfuron, ioxinil-octanoato, isouron, isoxaclortol, isoxadifen, karbutilato, lactofen, lenacil, linuron, LGC-42153, hidrazida maleica, mecoprop (MCP), sales de MCP (sales de ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético), MCPA-tioetilo, MCPB (éster etílico de ácido 2-metil-4-clorofenoxibutanoico), mefenacet, mefluidida, mepicuat, mesosulfuron, mesotriona, metil daimuron, metolaclor, metribuzin, metsulfuron-metilo, molinato, ácido naftilacético, NAD (1-naftalenoacetamida), naproanilida, napropamida, alcohol N-decílico, nicosulfuron, ácido n-fenilftalámico, orbencarb, ortosulfanuron, oxadiazon, oxaziclomefona, oxina-sulfato, paclobutrazol, paracuat, ácido pelargónico, pendimetalin, pentoxazona, petoxamida, fenmedifan, picloram, picolinafen, pinoxaden, butóxido de piperonilo, piperofos, pretilaclor, primisulfuron-metilo, procarbazona, prodiamina, profluzol, profoxidim, prohexadiona-calcio, prohidrojasmon, prometrina, propanil, propoxycarbazona, propirzamia, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazolato, pirazosulfuron-etilo, pirazoxifen, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, pirif-talid, piriminobac-metilo, piritiobac, quiclorac, quinoclamina, quizalofop-etilo, rimsulfuron, setoxidim, siduron, si-mazina, simetrina, clorato de sodio, sulfosulfuron, swep (MCC), tebutiuron, tefuritriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacil, terbucarb (MBPMC), tenilclor, tiazafluron, tiazazuron, tiencarbazona metilo, tifenilsulfuron-metilo, triazi-flam, tribufos, triclopir, tridifano, trifloxisulfuron, trifluralin, trinexapac-etilo, tritosulfuron, uniconazol-P, vemolato (PPTC), flucetosulfuron, ortosulfanuron, pinoxaden, pirasulfotol, tefuritriona, tembotriona, tiencarbazona metilo, y similares.

Los ejemplos del sinergista incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, sulfóxido, (MGK 264), WARF-antirresis-tente, y maelato de dietilo, y los ejemplos de los componentes activos del antídoto incluyen benoxacor, cloquintocet-mexil, ciometrinil, daimuron, diclormid, fenclorazol-etilo, fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, mefenpir-dietilo, MG191, anhídrido naftálico, y oxabetrinil.

El método para prevenir las lesiones por plagas de insectos que ocasionan daños en las plantas después de la germi-nación en la presente invención se puede llevar a cabo sembrando las semillas tratadas obtenidas mediante el método de producción de la presente invención en suelo tal como campos de arroz bien drenados, arrozales, campos secos, etc.; suelo para semilleros para plantar plantas en semilleros; entramados para plantas de semilleros; y soluciones hidropónicas y plantando las plantas en condiciones normales.

Los ejemplos de las semillas de plantas a las cuales se puede aplicar la composición para el tratamiento de las semillas de la presente invención incluyen semillas de plantas seleccionadas del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha y soja.

Más específicamente, los ejemplos de las hortalizas incluyen hortalizas Solanáceas (berenjena, tomate, pimiento verde, pimiento rojo, patata, etc.); hortalizas Cucurbitáceas (pepino, calabaza, calabacín, sandía, melón, etc.); horta-lizas Crucíferas (rábano Japonés, nabo, rábano picante, colirrábano, col China, col, mostaza negra, brécol, coliflor, canola, etc.); hortalizas Compositae (cadillo, crisantemo Garland, alcachofa, lechuga, etc.); hortalizas Liliáceas (ce-bolla Welsh, cebolla, ajo, espárrago, etc.); hortalizas Umbelíferas (zanahoria, perejil, apio, chirivía, etc.); hortalizas Quenopodiáceas (espinacas, acelgas, etc.); hortalizas labiadas (acalifa, menta, albahaca, etc.); fresa, batata, ñame Ja-ponés, aráceas, etcétera.

Adicionalmente, en el caso de que una planta se pueda diferenciar o propagar por medio de cuerpos reproductivos tales como rizomas, tubérculos con tallos, tallos discoides, bulbos sólidos, etc., la composición para el tratamiento de las semillas de la presente invención puede prevenir en las plantas las lesiones de los insectos nocivos tratando los cuerpos reproductivos tras la diferenciación o la propagación con la composición para el tratamiento de las semillas.

Las semillas de las plantas también incluyen semillas de cultivos provistas de resistencia a herbicidas por medio de métodos de cría tradicionales y técnicas de ingeniería genética. No se produce ningún problema causado por herbicidas en los cultivos provistos de resistencia a herbicidas ni siquiera cuando se aplican herbicidas, por ejemplo inhibidores de HPPD tales como isoxaflutol; inhibidores de ALS tales como imazatapir y tifensulfuron-metilo; inhibidores de la enzima sintetizadora de EPSP; inhibidores de la enzima sintetizadora de glutamina; inhibidores de la acetil CoA sintetasa; y bromoxinil.

Los ejemplos de los cultivos provistos de resistencia a herbicidas mediante métodos de cría convencionales inclu-yen Clearfield, marca registrada; Canola, provista de resistencia a herbicidas de imidazolinona; soja STS provista de resistencia a herbicidas de sulfonilurea; y maíz SR provisto de resistencia a inhibidores de acetil CoA carboxilasa. Los cultivos provistos de resistencia a inhibidores de acetil CoA carboxilasa se describen en Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1990, 87, 7175. Se informa sobre una acetil CoA carboxilasa mutada que desarrolla resistencia a los inhibidores de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo, en Weed Science 53:728-746, 2005. Cuando un gen que codifica esta acetil CoA carboxilasa mutada se introduce mediante técnicas de ingeniería genética o cuando se introduce una mutación relacio-nada para proporcionar resistencia a acetil CoA carboxilasa en un gen que codifica acetil CoA carboxilasa, provee a los cultivos de resistencia a los herbicidas de tipo inhibidor de la acetil CoA carboxilasa.

Los ejemplos de los “cultivos” provistos de resistencia a herbicidas por medio de técnicas de ingeniería genética incluyen variedades de cría de maíz conocidas provistas de resistencia frente al glifosato y el glifosinato. Algunas de tales variedades de cría de maíz han sido comercializadas con las marcas de fábrica RoundupReady (marca registrada) y LibertyLink (marca registrada).

Los “cultivos” mencionados antes incluyen cultivos provistos de capacidad para producir toxinas insecticidas por medio de técnicas de ingeniería genética. Tales toxinas insecticidas incluyen las proteínas insecticidas derivadas de *Bacillus cereus* y *Bacillus popilliae*; las δ -endotoxinas derivadas de *Bacillus thuringiensis*, tales como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C, y VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A; las proteínas insecticidas derivadas de Nematoda; las toxinas producidas por animales tales como las toxinas de escorpión, las toxinas de araña, las toxinas de abeja y las toxinas neuronales específicas de insectos; las toxinas bacterianas filamentosas; las lectinas vegetales; la aglutinina; los inhibidores de proteasas tales como los inhibidores de tripsina, los inhibidores de serina proteasa, la patatina, la cistatina, y los inhibidores de papaína; las proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP) tales como lisina, RIP de maíz, abrina, saporina, y briodina; las enzimas metabolizadoras de esteroides tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-UDP-glucosiltransferasa, y colesterol oxidasa; los inhibidores de ecdisona; la HMG-CoA-reductasa; los inhibidores de canales iónicos tales como inhibidores del canal del sodio e inhibidores del canal del calcio; la esterasa de la hormona juvenil; los receptores de hormonas diuréticas; la estilbeno sintetasa; la dibencil sintetasa; la quitinasa; y la glucanasa. Las toxinas insecticidas incluyen proteínas híbridas de las proteínas anteriormente mencionadas y las proteínas anteriormente mencionadas en las cuales una parte de los aminoácidos es suprimida o sustituida. Las proteínas híbridas se elaboran combinando diferentes dominios de las proteínas insecticidas anteriormente mencionadas mediante técnicas de ingeniería genética. Se conoce CryAb como una toxina de las proteínas anteriormente mencionadas en las que se han suprimido porciones de aminoácidos. Las toxinas insecticidas, y los “cultivos” provistos de capacidad de producir toxinas insecticidas mediante técnicas de ingeniería genética se describen, por ejemplo, en EP 0 374 753 A, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-0 427 529 A, EP-451 878 A, y WO 03/052073.

Los “cultivos” con capacidad de producir toxinas insecticidas mediante técnicas de ingeniería genética tienen resistencia a los ataques por insectos nocivos coleópteros, insectos nocivos dípteros, y/o insectos nocivos lepidópteros.

Entre los “cultivos” provistos de capacidad de producir toxinas insecticidas mediante técnicas de ingeniería genética, los ejemplos de los cultivos disponible en el mercado incluyen YieldGard, marca registrada (maíz de tipo cría que desarrolla toxinas); YieldGard Rootworm, marca registrada (maíz de tipo cría que desarrolla la toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus, marca registrada (maíz de tipo cría que desarrolla las toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1); Herculex I, marca registrada (maíz de tipo cría que desarrolla la toxina Cry1Fa2 y la fosfinotricin-N-acetil-transferasa (PAT) para conferir resistencia al glufosinato); NuCOTN33, marca registrada (algodón de tipo cría que desarrolla la toxina Cry1Ac); Bollgard I, marca registrada (algodón de tipo cría que desarrolla la toxina Cry1Ac); Bollgard II, marca registrada (algodón de tipo cría que desarrolla las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab); VIPCOT, marca registrada (algodón de tipo cría que desarrolla la toxina VIP); NewLeaf, marca registrada (patata de tipo cría que desarrolla la toxina Cry3A); NatureGard, marca registrada; Agrisure, marca registrada; GT Advantage (GA21, carácter de resistencia al glifosato); Agrisure, marca registrada; CB Advantage (carácter del Barrenador del Maíz (CB) Bt11); y Proteca, marca registrada.

Los “cultivos” anteriormente mencionados incluyen cultivos provistos de capacidades de producir sustancias anti-patogénicas por medio de técnicas de ingeniería genética. Los ejemplos de las sustancias anti-patogénicas producidas por microorganismos incluyen las proteínas PR (PR descritas en EP 0 392 225 A), los inhibidores de canales iónicos tales como los inhibidores del canal del sodio y los inhibidores del canal del calcio (toxinas KP1, KP4, KP6 producidas por virus; la estilbeno sintetasa; la dibencil sintetasa; la quitinasa; la glucanasa; las proteínas PR; los antibióticos peptídicos y los antibióticos que tienen heteroanillos; y las proteínas relevantes para la resistencia a las enfermedades vegetales (descritas en la publicación WO 03/000906).

Los ejemplos de los cultivos con capacidad para producir sustancias anti-patogénicas mediante técnicas de ingeniería genética incluyen los descritas en EP 0 392 225 A, en la publicación WO 95/33818, y EP 0 353 191 A.

En la presente invención, los insectos que ocasionan daños a los cuerpos de las plantas después de la germinación incluyen los insectos nocivos (chinchas nocivos y ácaros nocivos) que se comen y chupan los cuerpos de las plantas. Los ejemplos específicos de tales insectos son los siguientes:

Hemiptera:

(Delphacidae) *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera* y similares, Deltocephalidae tales como *Nephotettix cinctipes*, *Nephotettix virescens* y similares, Aphididae tales como *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicorne brassicae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus* y similares, Pentatomidae tales como *Nezara antennata*, *Riptortus clavatus*, *Leptocoris chinensis*, *Eysarcoris parvus*, *Halyomorpha mista*, *Lygus lineolaris* y similares, Aleyrodidae tales como *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia argentifolii* y similares, Coccidae tales como *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens*, *Icerya purchasi* y similares, Tingidae), Psyllidae y similares.

Lepidoptera:

Pyalidae tales como *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plo-dia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula unadalis*, *Pediasia teterrellus* y similares, Noctuidae tales como *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Thoricoplusia spp.*, *Heliothis spp.*, *Helicoverpa spp.* y similares, Pieridae tales como *Pieris rapae*, Tortricidae tales como *Adoxophyes spp.*, *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraes azukivora*, *Adoxophyes orana fas-*

ciata, *Adoxophyes* sp., *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, *Cydia pomonella* y similares, Gracillariidae tales como *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoneella* y similares, Carposinidae *Carposina niponensis* y similares, Lyonetiidae tales como *Lyonetia* spp. y similares, Lymantriidae tales como *Lymantria* spp., *Euproctis* spp. y similares, Yponomeutidae tales como *Plutella xylostella* y similares, Gelechiidae tales como *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella* y similares, Tineidae tales como *Hyphantria cunea* y similares, Tineidae tales como *Tinea translucens*, *Tineola bisselliella* y similares.

Thysanoptera:

Thripidae tales *Franckliniella occidentalis*, *Trips palmi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*, *Franckliniella intonsa*, *Frankliniella fusca* y similares.

Diptera:

Hylemia antiqua, *Hylemia platura*, *Anopheles sinensis*, *Agromyza orizae*, *Hydrellia griseola*, *Chlorops oryzae*, *Dacus cucurbitae*, *Ceratitis capitata*, *Liriomyza trifolii* y similares.

Coleoptera:

Epilachna vigintioctopunctata, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata*, *Oulema oryzae*, *Echinocnemus squameus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Anthonomus grandis*, *Callosobruchus chinensis*, *Sphenophorus venatus*, *Popillia japonica*, *Anomala cuprea*, *Diabrotica* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Agriotes* spp., *Lasioderma serricorne*, *Anthrenus verbasci*, *Tribolium castaneum*, *Lyctus brunneus*, *Anoplophora malasiaca*, *Tomicus piniperda*, y similares.

Orthoptera:

Locusta migratoria, *Gryllotalpa africana*, *Oxya yezoensis*, *Oxya japonica*, y similares.

Hymenoptera:

Athalia rosae, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., y similares.

Acarina:

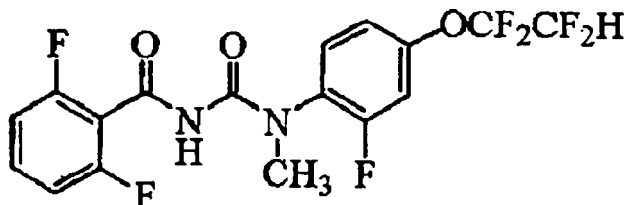
Tetranychidae tales como *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Oligonychus* spp. Y similares, Eriophyidae tales como *Aculops pelekassi*, Tarsonemidae tales como *Polyphagotarsonemus latus* y similares, Tenuipalpidae y similares.

En la presente invención, los insectos que causan daños en las plantas después de la germinación son concretamente insectos nocivos Dípteros, insectos nocivos Coleópteros, y/o insectos nocivos Lepidópteros.

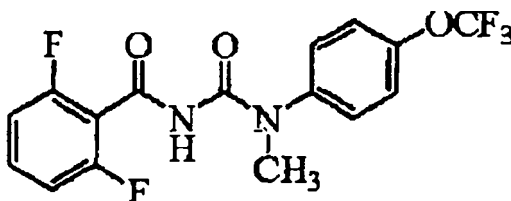
La presente invención se ilustrará con más detalle por medio de los siguientes Ejemplos, pero la presente invención no está limitada a estos.

Primero, se describirán más abajo los ejemplos del compuesto de la presente invención.

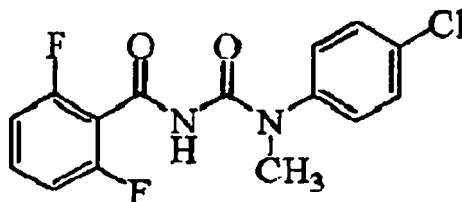
3-(2,6-Difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1-metilurea (en adelante, referido como compuesto (1) de la presente invención) representado por la fórmula:



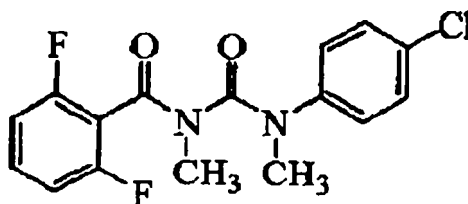
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(4-trifluorometoxifenil)-1-metilurea (en adelante, referido como compuesto (2) de la presente invención) representado por la fórmula:



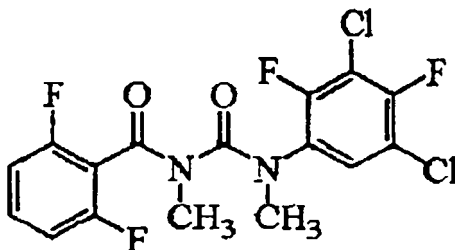
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(4-clorofenil)-1-metilurea (en adelante referido como compuesto (3) de la presente invención) representado por la fórmula:



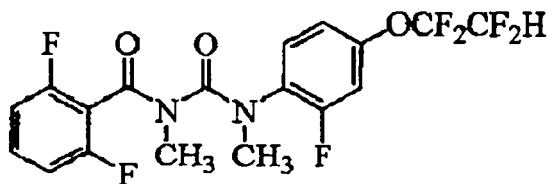
3-(2,6-Difluorobenzoyl)-1-(4-(clorofenil)-1,3-dimetilurea (en adelante referido como compuesto (4) de la presente invención) representado por la fórmula:



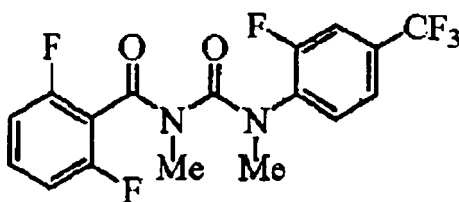
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(3,5-dicloro-2,4-difluoro-fenil)-1,3-dimetilurea (en adelante referido como compuesto (5) de la presente invención) representado por la fórmula:



3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1,3-dimetilurea (en adelante referido como compuesto (6) de la presente invención) representado por la fórmula:

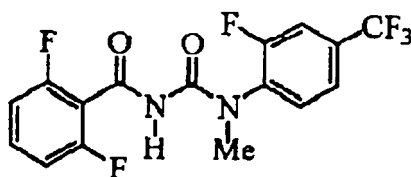


3-(2,6-Difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)-fenil]-1,3-dimetilurea (en adelante referido como compuesto (7) de la presente invención) representado por la fórmula:

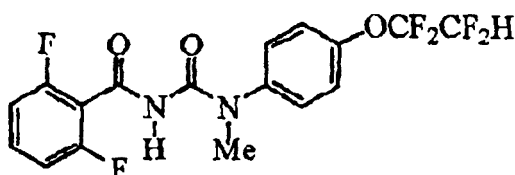


ES 2 328 552 A1

3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)-fenil]-1-metilurea (en adelante referido como compuesto (8) de la presente invención) representado por la fórmula:



3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)-fenil]-1-metilurea (en adelante referido como compuesto (9) de la presente invención) representado por la fórmula:



Los compuestos mencionados antes se produjeron por medio de los siguientes métodos.

Ejemplo de Síntesis 1

Una solución obtenida disolviendo 0,75 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoyl en 1,0 ml de éter dietílico se añadió a una solución obtenida disolviendo 1,00 g de 2-fluoro-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)-anilina en 4,0 ml de éter dietílico enfriando con hielo y la mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 2 horas. Después de añadir 10 ml de hexano a la mezcla de reacción, la mezcla se filtró, y la sustancia del filtro se secó para obtener 1,58 g del compuesto (1) de la presente invención.

Compuesto (1) de la presente invención

RMN- ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,20 (3H, s), 6,67-6,93 (1H, m), 7,09-7,20 (3H, m), 7,33-7,36 (1H, m), 7,45-7,53 (2H, m), 10,77 (1H, s ancho).

Ejemplo de Síntesis 2

Una solución obtenida disolviendo 0,57 g de isocianato de 2,6-difluorobenzoyl en 0,5 ml de éter dietílico se añadió a una solución obtenida disolviendo 0,60 g de N-metil-4-trifluorometoxianilina en 2,4 ml de éter dietílico enfriando con hielo y la mezcla se agitó a la temperatura ambiente durante 2 horas. Después de añadir 6,0 ml de hexano a la mezcla de reacción, la mezcla se filtró, y la sustancia del filtro se secó para obtener 1,13 g de este compuesto (2).

Compuesto (2) de la presente invención

RMN- ^1H (DMSO- d_6) δ (ppm): 3,25 (3H, s), 7,12-7,16 (2H, m), 7,41-7,55 (5H, m), 10,68 (1H, s ancho).

Ejemplo de Síntesis 3

Después de añadir 128 mg de hidruro de sodio a una solución obtenida disolviendo 1,01 g de 3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]-1-metilurea en 10,0 ml de 1-metil-2-pirrolidona y agitada a aproximadamente 2°C durante 30 minutos, se añadieron a la mezcla a 2°C, 0,40 ml de yoduro de metilo. Después de agitar la mezcla resultante a 2-3°C durante 3 horas, se añadió una solución mixta de 10 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio y 10 ml de agua enfriando con hielo y se extrajo con 20 ml de acetato de etilo 3 veces. Las capas orgánicas obtenidas se reunieron y se lavaron con agua saturada de sal tres veces y el producto obtenido se secó con sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se refinó mediante una columna de gel de sílice (acetato de etilo:cloroformo:hexano = 1:1:4) para obtener 0,79 g del compuesto (7) de la presente invención.

Compuesto (7) de la presente invención:

RMN- ^1H (DMSO, 80°C) δ (ppm): 3,07 (3H, s), 3,28 (3H, s), 7,09-7,13 (2H, m), 7,50-7,60 (3H, m), 7,69-7,71 (1H, m)

ES 2 328 552 A1

Ejemplo de Síntesis 4

De acuerdo con el mismo método del Ejemplo de Síntesis 1, se produjo el compuesto (8) de la presente invención.

Compuesto (8) de la presente invención:

RMN- ^1H (DMSO) δ (ppm): 3,24 (3H, s), 7,12-7,16 (2H, m), 7,47-7,49 (1H, m), 7,51-7,67 (2H, m), 7,81-7,84 (1H, m), 10,89 (1H, s ancho).

Ejemplo de Síntesis 5

De acuerdo con el mismo método del Ejemplo de Síntesis 1, se produjo el compuesto (9) de la presente invención.

Compuesto (9) de la presente invención:

RMN- ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 3,22 (3H, s), 5,81-6,09 (1H, m), 6,92-7,05 (2H, m), 7,32-7,55 (6H, m).

El compuesto (3) de la presente invención se describe en DE2123236 y se puede producir mediante el método allí descrito. El compuesto (4) de la presente invención y el compuesto (5) de la presente invención son compuestos descritos en JP 2-3659 A y se pueden producir mediante los métodos allí descritos. El compuesto (6) de la presente invención se describe en JP 4-26667 A y se puede producir mediante el método allí descrito.

Los siguientes Ejemplos de Producción ilustrarán la producción de la composición de la presente invención y las semillas de la presente invención. Todas las "partes" son en peso.

Ejemplo de Producción 1

A 25 partes de cada uno de los compuestos (1) a (9) de la presente invención se añaden 65 partes de ciclohexanona, 5 partes de NINATE 401-A y 5 partes de BRAUNONE BR-450 y la mezcla se mezcla cuidadosamente con agitación para obtener una emulsión al 25%. La emulsión se diluye 1/1.000 con agua para obtener una solución diluida. Se sumergen semillas de arroz en la solución diluida durante 24 horas hasta que el componente eficaz es absorbido en el interior de las semillas de arroz para obtener las semillas tratadas.

Ejemplo de Producción 2

Se obtiene un material para moldear bolitas mezclando cuidadosamente 25 partes de cada uno de los compuestos (1) a (9) de la presente invención con 25 partes de arcilla, 25 partes de poli(alcohol vinílico) que contiene 50 partes de Sorgen TW-20, y 25 partes de agua con agitación. Después, se embeben semillas de col en el centro de 20 mg del material obtenido antes para moldear bolitas, seguido de moldeo en forma esférica para obtener las semillas tratadas.

Ejemplo de Producción 3

Se obtiene una preparación vertible que contiene un 25% del componente eficaz mezclando 25 partes de cada uno de los compuestos (1) a (9) de la presente invención, 20 partes de hulla blanca que contiene 50% (en peso) de sal de amonio de polioxietilenoalquilétersulfato, y 55 partes de agua y se pulveriza finamente la mezcla resultante mediante un método de pulverización en húmedo. Se colocan semillas de algodón en un tiesto (diámetro interno 12 cm y profundidad 11 cm) fabricado de acero inoxidable que está equipado con dos palas elevadoras dispuestas en lados opuestos entre sí en direcciones opuestas de manera que las semillas son elevadas cuando se hace girar el tiesto y se inclina a un ángulo de 40 a 45 grados y se hace girar mecánicamente a 640 rpm, mezclando bien de ese modo las semillas y proporcionando una acción de granulación rodante en el tiesto. Después, se diluye la preparación vertible a 1/100 con agua y se ajusta un aparato de pulverización de mano hacia el interior del tiesto y se pulveriza directamente la preparación vertible diluida hacia el centro de la capa de gránulos rotatoria de semillas de algodón a una presión de aire de 69 a 76 kPa (10 a 11 psi). La pulverización es continua hasta que la superficie de las semillas se vuelve pegajosa como para aglutinar las semillas. Una vez detenido el aparato de pulverización, se hace pasar aire a baja presión hacia las semillas a la temperatura ambiente mediante una boquilla instalada de tal manera que la corriente de aire se puede mandar hacia el interior del tiesto para secar rápidamente el recubrimiento de las semillas. Después de eso, la corriente de aire se interrumpe y se reinicia la pulverización utilizando el aparato de pulverización de mano. Estos ciclos de pulverización-secado se repiten hasta que se aplica la cantidad deseada de la suspensión fluidificante a las semillas. Adicionalmente, después de una exposición al aire ambiente a una velocidad de flujo baja durante 60 horas, el recubrimiento de las semillas está completamente seco para obtener semillas tratadas.

Ejemplo de Ensayo 1

Se produjeron semillas nodulizadas que contenían cualquiera de los compuestos (1) y (6) de la presente invención de acuerdo con el Ejemplo de Producción 2 anteriormente mencionado. Las semillas nodulizadas se sembraron en una bandeja de celdas individuales (volumen de cada celda: 27 ml, profundidad: 5,0 cm) llenas de suelo para semilleros, y la planta se desarrolló durante 28 días después de la siembra. Una vez que se hubieron separado las partes de la raíz de las plántulas de col desarrolladas, se colocaron los tallos y las hojas en un tiesto de polietileno (capacidad 180 ml), se liberaron 10 larvas del segundo instar de *Plutella xylostella*. Se mantuvo el tiesto a 25°C durante 7 días. Después de eso, se investigó el grado de lesión por alimentación de las plántula de col por las larvas de *Plutella xylostella* y se compararon el caso del tratamiento con los compuestos de muestra (grupo tratado) y el caso sin tratamiento (grupo no tratado) para medir el efecto inhibidor de la lesión de acuerdo con la siguiente ecuación.

$$\text{Efecto inhibidor de la lesión (\%)} = 1 - \left(\frac{\text{grado de lesión por alimentación en el grupo tratado}}{\text{grado de lesión por alimentación en el grupo no tratado}} \right) \times 100$$

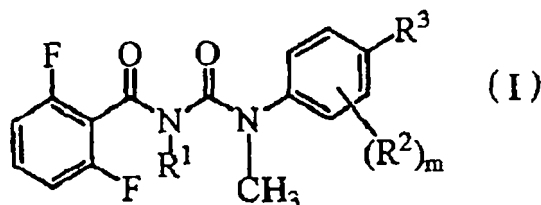
Como resultado, en el grupo tratado con los compuestos (1) y (6) de la presente invención, el efecto inhibidor de la lesión fue respectivamente de 90% o más y de este modo se pudieron prevenir las lesiones por *Plutella xylostella* en las plántulas de col después de la germinación.

Como se ha descrito aquí antes, el tratamiento de las semillas de una planta con una composición que contiene el compuesto de la presente invención puede prevenir en las plantas las lesiones debidas a la alimentación por plagas de insectos después de la germinación.

REIVINDICACIONES

1. Un método para prevenir en una planta la lesión por plagas de insectos después de la germinación en la planta que comprende las etapas de:

tratar las semillas de la planta con una composición que comprende un compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I):



donde R¹ indica un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alqueno C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquino C₂-C₆, un grupo arilo C₆-C₁₄, un grupo aralquilo C₇-C₁₁, un grupo alcoxialquilo C₂-C₆, un grupo ariloxialquilo C₇-C₁₄, un grupo dialquilaminoalquilo C₃-C₆, un grupo alquiltioalquilo C₂-C₆, un grupo alquiltioalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, un grupo alquilsulfonilalquilo C₂-C₆, un grupo alcoxialcoxialquilo C₃-C₉, un grupo alcoxi (C₂-C₆) carbonilo, un grupo aralquil(C₈-C₁₂)oxicarbonilo, un grupo dialquil(C₃-C₁₃) carbamoilo, un grupo alquil (C₂-C₆) carbonilo opcionalmente halogenado, un grupo formilo, un grupo alquil(C₁-C₅)sulfonilo opcionalmente halogenado, o un grupo arilsulfonilo C₆-C₁₀, R² indica un átomo de halógeno, o un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado; R³ indica un átomo de halógeno, un grupo alquilo C₁-C₄ opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C₁-C₄ opcionalmente halogenado, un grupo alcoxialcoxi C₂-C₆ opcionalmente halogenado, un grupo alquenoil(C₂-C₄)oxi, opcionalmente halogenado, o un grupo alquini(C₂-C₄)oxi opcionalmente halogenado, y m indica un número entero de 0 a 4, y

sembrar las semillas tratadas, seguido de cultivo.

2. El método de acuerdo con la reivindicación 1, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja.

3. Un método para producir semillas tratadas de una planta que comprende someter las semillas a tratamiento con una composición que comprende el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) como se define en la reivindicación 1 con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación.

4. El método de acuerdo con la reivindicación 3, donde la planta se selecciona del grupo que consiste hortalizas, algodón, maíz, arroz, remolacha azucarera y soja.

5. Una composición para el tratamiento de semillas de una planta con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación que comprende el compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en la reivindicación 1.

6. La composición de acuerdo con la reivindicación 5, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja.

7. Semillas de una planta que se tratan con una composición que contiene el compuesto de (N'-metil)-benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en la reivindicación 1.

8. Las semillas de acuerdo con la reivindicación 7, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja.

9. El uso del compuesto de (N'-metil)benzoilurea representado por la fórmula (I) definida en la reivindicación 1 para el tratamiento de semillas de una planta con el fin de prevenir en la planta las lesiones por plagas de insectos después de la germinación.

10. El uso de acuerdo con la reivindicación 9, donde la planta se selecciona del grupo que consiste en hortalizas, maíz, algodón, arroz, remolacha azucarera y soja.



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

⑪ ES 2 328 552

⑫ Nº de solicitud: 200801087

⑬ Fecha de presentación de la solicitud: 16.04.2008

⑭ Fecha de prioridad: 19.04.2007

INFORME SOBRE EL ESTADO DE LA TÉCNICA

⑮ Int. Cl.: Ver hoja adicional

DOCUMENTOS RELEVANTES

Categoría	⑯ Documentos citados	Reivindicaciones afectadas
X	WO 9916316 A1 (UNIROYAL CHEMICAL COMPANY, INC) 08.04.1999, resumen; página 9, línea 1; página 11, línea 16 - página 12, línea 23.	1-10
A	WO 9745017 A1 (UNIROYAL CHEMICAL COMPANY) 04.12.1997	1-10

Categoría de los documentos citados

X: de particular relevancia

Y: de particular relevancia combinado con otro/s de la misma categoría

A: refleja el estado de la técnica

O: referido a divulgación no escrita

P: publicado entre la fecha de prioridad y la de presentación de la solicitud

E: documento anterior, pero publicado después de la fecha de presentación de la solicitud

El presente informe ha sido realizado

☒ para todas las reivindicaciones

☐ para las reivindicaciones nº:

Fecha de realización del informe

29.10.2009

Examinador

M. Ojanguren Fernández

Página

1/2

CLASIFICACIÓN DEL OBJETO DE LA SOLICITUD

A01N 47/28 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)