



MINISTERO DELLO SVILUPPO ECONOMICO
DIREZIONE GENERALE PER LA LOTTA ALLA CONTRAFFAZIONE
UFFICIO ITALIANO BREVETTI E MARCHI

DOMANDA NUMERO	102008901618412
Data Deposito	15/04/2008
Data Pubblicazione	15/10/2009

Priorità	110171/2007
Nazione Priorità	JP
Data Deposito Priorità	

Sezione	Classe	Sottoclasse	Gruppo	Sottogruppo
A	01	N		

Titolo

USO DI UN COMPOSTO DI (N'-METIL)BENZOILUREA.
--

DESCRIZIONE dell'invenzione industriale dal titolo:

"Nuovo uso di un composto di (N'-metil)benzoilurea",

di: SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED, nazionalità giapponese, 27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 (Giappone).

Inventori designati: SAKAMOTO, Norihisa; KONOBE, Masato.

Depositata il: **15 APR 2008**

* * * * *

DESCRIZIONE

SFONDO DELL'INVENZIONE

Campo tecnico

La presente invenzione si riferisce ad un nuovo uso di un certo composto di (N'-metil)benzoilurea per il trattamento dei semi di una pianta, come ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero oppure soia per proteggere la pianta da insetti nocivi che causano danni alla pianta dopo la germinazione.

Tecnica di sfondo

È noto che i composti di benzoilurea, il cui sostituyente in posizione N' della benzoilurea è un atomo di idrogeno, sono efficaci per proteggere le piante da insetti nocivi e possono venire usati co-

FC/lg

me componenti efficaci di agenti per il trattamento di semi (si veda JP 01-168661 e JP 11-240859 A).

SOMMARIO DELL'INVENZIONE

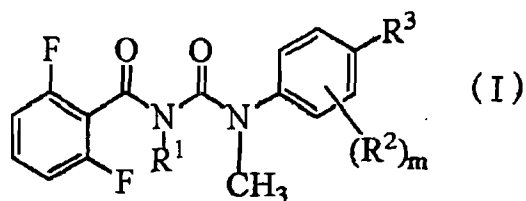
La presente invenzione fornisce un nuovo uso di un certo composto di (N'-metil)benzoilurea per il trattamento dei semi di una pianta per la protezione della pianta da insetti nocivi che causano danni alla pianta dopo la germinazione.

I presenti inventori hanno studiato intensamente e hanno completato la presente invenzione.

Quindi, la presente invenzione fornisce:

(1) Un procedimento per prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione della pianta, il quale comprende le fasi di:

trattare i semi della pianta con una composizione comprendente un composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I):



in cui R¹ indica un atomo di idrogeno, un gruppo C₁₋₆-alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-alchenile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-

alchinile, un gruppo C₆₋₁₄-arile, un gruppo C₇₋₁₁-aralchile, un gruppo C₂₋₆-alcossialchile, un gruppo C₇₋₁₄-arilossialchile, un gruppo C₃₋₆-dialchilamminoalchile, un gruppo C₂₋₆-alchiltioalchile, un gruppo C₂₋₆-alchiltioalchile, un gruppo C₂₋₆-alchilsolfinilalchile, un gruppo C₂₋₆-alchilsolfonilalchile, un gruppo C₃₋₉-alcossialcossialchile, un gruppo C₂₋₆-alcossicarbonile, un gruppo C₈₋₁₂-aralchilossicarbonile, un gruppo C₃₋₁₃-dialchilcarbamoile, un gruppo C₂₋₆-alchilcarbonile opzionalmente alogenato, un gruppo formile, un gruppo C₁₋₅-alchilsolfonile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C₆₋₁₀-arilsolfonile, R² indica un atomo di alogeno oppure un gruppo C₁₋₄-alchile opzionalmente alogenato; R³ indica un atomo di alogeno, un gruppo C₁₋₄-alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C₁₋₄-alcossile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-alcossialcossile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₄-alchenilossile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C₂₋₄-alchinilossile opzionalmente alogenato, e m indica un numero intero da 0 a 4, e

seminare i semi trattati, seguiti da coltivazione;

(2) il procedimento secondo il suddetto punto (1), in cui la pianta viene scelta dal gruppo co-

stituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia;

(3) un procedimento per produrre semi trattati di una pianta, il quale comprende il sottoporre i semi ad un trattamento con una composizione comprendente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nel suddetto punto (1) in modo da prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione;

(4) il procedimento secondo il suddetto punto (3), in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia;

(5) una composizione per il trattamento dei semi di una pianta in modo da prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione, comprendente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nel suddetto punto (1);

(6) la composizione secondo il suddetto punto (5), in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia;

(7) semi di una pianta che vengono trattati

con una composizione contenente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nel suddetto punto (1);

(8) i semi secondo il suddetto punto (7), in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia;

(9) uso del composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nel suddetto punto (1) per il trattamento dei semi di una pianta in modo da prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione;

(10) uso secondo il suddetto punto (9), in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia; e simili.

Il trattamento dei semi di una pianta con il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) (di seguito indicato come il presente composto) può prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione di questa pianta.

DESCRIZIONE DETTAGLIATA DELL'INVENZIONE

Esempi del sostituito indicato da R¹ nel presente composto sono i seguenti.

Esempi di "un gruppo C₁₋₆-alchile opzionalmente alogenato" comprendono metile, clorometile, difluorometile, triclorometile, etile, 2-bromoetile, 2,2,2-trifluoroetile, propile, 3,3,3-trifluoropropile, isopropile, butile, isobutile, sec-butile, terz-butile, 4,4,4-trifluorobutile, pentile, isopentile, neopentile, 5,5,5-trifluoropentile, esile e 6,6,6-trifluoroesile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchenile opzionalmente alogenato" comprendono vinile, 1-propenile, 2-propenile, isopropenile, 2-butenile, isobutenile e 3,3-dicloro-2-propenile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchinile" comprendono etinile, 2-propinile, e 1-propinile.

Esempi di "un gruppo C₆₋₁₄-arile" comprendono fenile, 1-naftile, 2-naftile, e bifenile.

Esempi di "un gruppo C₇₋₁₁-aralchile" comprendono benzile e fenetile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alcossialchile" comprendono metossimetile, etossimetile, 1-propossimetile, 2-metossietile, 2-etossietile, 3-metossipropile, e 3-etossipropile.

Esempi di "un gruppo C₇₋₁₄-arilossialchile" comprendono fenossimetile e 2-fenossietile.

Esempi di "un gruppo C₃₋₆-dialchilamminalchil-

le" comprendono dimetilamminometile, 2-(dimetilammino)etile, dietilamminometile, e 2-(dietilammino)etile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchiltioalchile" comprendono metiltiomietile, etiltiomietile, 2-(metiltio)etile, e 2(etiltio)etile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchilsolfinilalchile" comprendono metilsolfinilmietile, etilsolfinilmietile, 2-(metilsolfinil)etile, e 2-(etilsolfinil)etile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchilsolfonilalchile" comprendono metilsolfonilmietile, etilsolfonilmietile, 2-(metilsolfonil)etile, e 2-(etilsolfonil)etile.

Esempi di "un gruppo C₃₋₉-alcossialcossialchile" comprendono (2-metossietossi)mietile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alcossicarbonile" comprendono metossicarbonile, etossicarbonile, n-propossicarbonile, isopropossicarbonile, n-butossicarbonile, e terz-butossicarbonile.

Esempi di "un gruppo C₈₋₁₂-aralchilossicarbonile" comprendono benzilossicarbonile.

Esempi di "un gruppo C₃₋₁₃-dialchilcarbamoile" comprendono dimetilcarbamoile e dietilcarbamoile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alchilcarbonile op-

zionalmente alogenato" comprendono acetile, propionile, trifluoroacetile e cloroacetile.

Esempi di "un gruppo C₁₋₅-alchilsolfonile opzionalmente alogenato" comprendono metansolfonile, etansolfonile, e trifluorometansolfonile.

Esempi di "un gruppo C₆₋₁₀-arilsolfonile" comprendono benzensolfonile e toluensolfonile.

Esempi del sostituyente indicato da R² nel presente composto sono i seguenti.

Esempi di "un atomo di alogeno" comprendono un atomo di fluoro, un atomo di cloro, un atomo di bromo ed un atomo di iodio.

Esempi di "un gruppo C₁₋₄-alchile alogenato" comprendono metile, clorometile, difluorometile, triclorometile, trifluorometile, etile, 2-bromoetile, 2,2,2-trifluoroetile, pentafluoroetile, propile, 3,3,3-trifluoropropile, isopropile, butile, isobutile, sec-butile, terz-butile e 4,4,4-trifluorobutile.

Esempi del sostituyente indicato da R³ nel presente composto sono i seguenti.

Esempi di "un atomo di alogeno" comprendono un atomo di fluoro, un atomo di cloro, un atomo di bromo ed un atomo di iodio.

Esempi di "un gruppo C₁₋₄-alchile opzionalmente

alogenato" comprendono metile, clorometile, difluorometile, triclorometile, trifluorometile, etile, 2-bromoetile, 2,2,2-trifluoroetile, pentafluoroetile, propile, 3,3,3-trifluoropropile, isopropile, butile, isobutile, sec-butile, terz-butile e 4,4,4-trifluorobutile.

Esempi di "un gruppo C₁₋₄-alcossile opzionalmente alogenato" comprendono metossile, etossile, 1-propilossile, isopropossile, terz-butossile, difluorometossile, trifluorometossile, 2,2,2-trifluoroetossile, 1,1,2,2,2-pentafluoroetossile, 1,1,2,2-tetrafluoroetossile, 1,1,2,2,3,3,3-eptafluoro-1-propossile, e 1,1,2,3,3,3-esaffluoro-1-propossile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₆-alcossialcossile opzionalmente alogenato" comprendono 2-trifluorometossi-1,1,2-trifluoroetossile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₄-alchenilossile opzionalmente alogenato" comprendono 2-propenilossile e 3,3-dicloro-2-propenilossile.

Esempi di "un gruppo C₂₋₄-alchinilossile opzionalmente alogenato" comprendono 2-propinilossile.

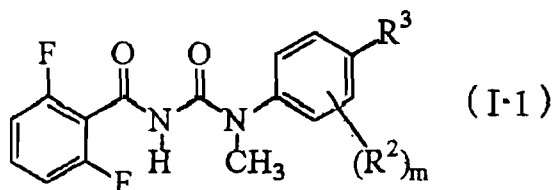
In seguito, verrà mostrata la sintesi del presente composto.

Il presente composto può venire prodotto mediante i seguenti Procedimenti di sintesi 1 a Pro-

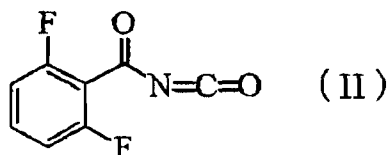
cedimento di sintesi 4.

Procedimento di sintesi 1

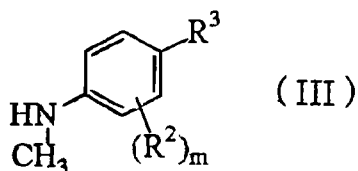
Tra i presenti composti, un composto rappresentato dalla formula (I-1):



in cui R^2 , R^3 e m hanno il significato precedentemente definito, può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula (II):



ed un composto rappresentato dalla formula (III):



in cui R^2 , R^3 e m hanno il significato precedentemente definito.

Solitamente, la reazione viene eseguita in un solvente.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocar-

buri alifatici, come esano ed eptano; eteri, come dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene, e diclorobenzene; nitrili, come acetonnitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

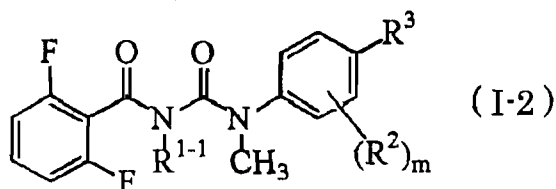
La quantità del composto rappresentato dalla formula (III) è solitamente da 0,5 a 2 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (II).

Solitamente, la temperatura di reazione è nel campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è nel campo da 0,1 a 100 ore.

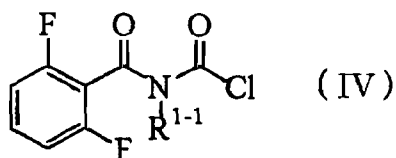
Dopo il completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (I-1) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico, ed essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (I-1) può venire ulteriormente purificato mediante ricristallizzazione, cromatografia su colonna oppure simili.

Procedimento di sintesi 2

Il presente composto rappresentato dalla formula (I-2):



in cui R^2 , R^3 e m hanno il significato precedentemente definito; R^{1-1} rappresenta un gruppo C_{1-6} -alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchene opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchidile, un gruppo C_{6-14} -arile, un gruppo C_{7-11} -aralchile, un gruppo C_{2-6} -alcossialchile, un gruppo C_{7-14} -arilossialchile, un gruppo C_{3-6} -N,N-di(alchil)-amminoalchile, un gruppo C_{2-6} -alchiltioalchile, un gruppo C_{2-6} -alchilsolfinilalchile, un gruppo C_{2-6} -alchilsolfonilalchile, oppure un gruppo C_{3-9} -alcossialcossialchile, può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula (IV):



in cui X , Y , e R^{1-1} hanno il significato precedentemente definito: ed un composto rappresentato dalla formula (III).

La reazione viene solitamente eseguita in un solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare nella reazione comprendono chetoni, come acetone e metiletilcheton; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri, come dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene, e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformamide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirroli-done, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idrossido di sodio, idrossido di potassio ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di sodio, idruro di potassio ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammide; e basi orga-

niche, come trietilammina, piridina e 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undecene (di seguito abbreviato come DBU).

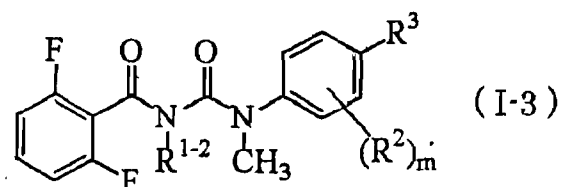
Nel caso in cui i reagenti da usare siano liquidi alle condizioni di reazione, le loro quantità possono essere tali che diventano solventi di rispettivi reagenti e, solitamente, la quantità del composto rappresentato dalla formula (III) è da 1 a 4 moli e la quantità della base è da 1 a 4 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (IV).

Solitamente, la temperatura di reazione è in un campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è nel campo da 0,1 a 200 ore.

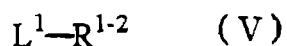
Dopo il completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (I-2) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico, e quindi essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (I-2) può venire ulteriormente purificato mediante ricristallizzazione, cromatografia su colonna oppure simili.

Procedimento di sintesi 3

Il presente composto rappresentato dalla formula (I-3):



in cui R^2 , R^3 e m hanno il significato precedentemente definito; R^{1-2} indica un gruppo C_{1-6} -alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchenile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchinile, un gruppo C_{7-11} -aralchile, un gruppo C_{2-6} -alcos-sialchile, un gruppo C_{7-14} -arilossialchile, un gruppo C_{3-6} -dialchilamminoalchile, un gruppo C_{2-6} -alchiltioalchile, un gruppo C_{2-6} -alchilsolfinilalchile, un gruppo C_{2-6} -alchilsolfonilalchile, un gruppo C_{3-9} -alcossialcossialchile, un gruppo C_{2-6} -alcossicarbonile, un gruppo C_{8-12} -aralchilossicarbonile, un gruppo C_{3-13} -dialchilcarbamoile, un gruppo C_{2-6} -alchilcarbonyl opzionalmente alogenato, un gruppo formile, un gruppo C_{1-5} -alchilsolfonile opzionalmente alogenato, ed un gruppo C_{6-10} -arilsolfonile, può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula (I-1) ed un composto rappresentato dalla formula (V):



in cui R^{1-2} ha il significato precedentemente definito; L^1 indica un atomo di alogeno (ad esempio un atomo di cloro ed un atomo di bromo);

metansolfonilossile, benzensolfonilossile, toluensolfonilossile, metossisolfonilossile oppure etossisolfonilossile: in presenza di una base.

La reazione viene solitamente eseguita in un solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri, come dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano, e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini oppure metalli alcalino terrosi, come idrossido di sodio, idrossido di potassio, ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di

sodio, idruro di potassio ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammide; e basi organiche, come trietilammia, piridina e DBU.

Nel caso in cui i reagenti da usare siano liquidi alle condizioni di reazione, le loro quantità possono essere tali che diventano solventi di rispettivi reagenti e, solitamente, la quantità del composto rappresentato dalla formula (V) è da 1 a 4 moli e la quantità della base è da 1 a 4 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (I-1).

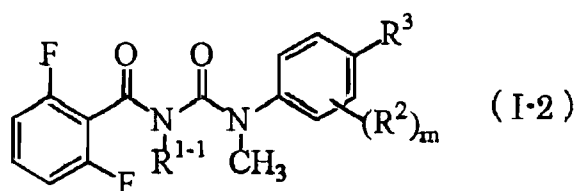
Solitamente, la temperatura di reazione è in un campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è nel campo da 0,1 a 100 ore.

Dopo completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (I-3) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico, ed essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (I-3) può

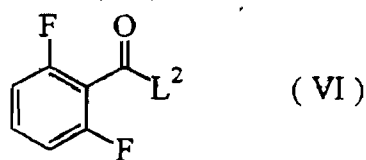
venire ulteriormente purificato mediante ricristallizzazione, cromatografia su colonna oppure simili.

Procedimento di sintesi 4

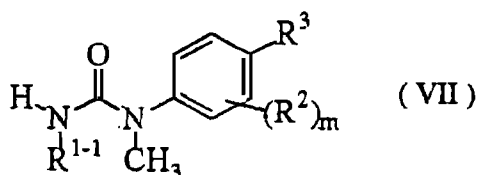
Il presente composto rappresentato dalla formula (I-2):



in cui R^2 , R^3 , R^{1-1} e m hanno il significato precedentemente definito, può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula (VI):



in cui L^2 indica un atomo di alogeno (ad esempio un atomo di cloro, un atomo di bromo ed un atomo di iodio) ed un composto rappresentato dalla formula (VII):



in cui R^{1-1} , R^2 , R^3 e m hanno il significato precedentemente definito.

La reazione viene solitamente eseguita in un

solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri, come dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano, e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idrossido di sodio, idrossido di potassio ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di sodio, idruro di potassio ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini oppure metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammide; e basi organiche, come trietilammia, piridina e DBU.

Nel caso in cui i reagenti da usare siano liquidi alle condizioni di reazione, le loro quantità possono essere tali che diventano solventi di rispettivi reagenti e, solitamente, la quantità del composto rappresentato dalla formula (VI) è da 1 a 4 moli e la quantità della base è da 1 a 4 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (VII).

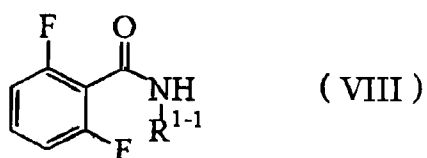
Solitamente, la temperatura di reazione è nel campo da -78 a 180°C ed il tempo di reazione è solitamente nel campo da 0,1 a 200 ore.

Dopo il completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (I-2) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico, e quindi essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (I-2) può venire ulteriormente purificato mediante ricristallizzazione, cromatografia su colonna oppure simili.

In seguito, verranno illustrati procedimenti di produzione di riferimento degli intermedi del presente composto.

Procedimento di produzione di riferimento 1

Il composto rappresentato dalla formula (IV) può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula (VIII):



in cui R^{1-1} ha il significato precedentemente definito, ed un composto di trialchilclorosilano ed un agente di clorocarbonilazione.

La reazione viene solitamente eseguita in un solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri come dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano, e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini e metalli alcalino terro-

si, come idrossido di sodio, idrossido di potassio ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di sodio, idruro di potassio ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammide; e basi organiche, come trietilammina, piridina e DBU.

Esempi del composto di trialchilclorosilano comprendono trimetilclorosilano e trietilclorosilano.

Esempi dell'agente di clorocarbonilazione da usare comprendono fosgene, triclorometilcloroformiato, bis(triclorometil)carbonato, oppure simili.

Per quanto riguarda le quantità dei reagenti, la quantità del composto di trialchilclorosilano è da 1 a 4 moli e la quantità della base è da 1 a 4 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (VIII).

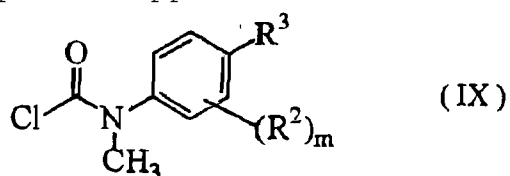
Solitamente, la temperatura di reazione è in un campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è in un campo da 0,1 a 200 ore.

Dopo completamento della reazione, il composto

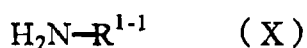
rappresentato dalla formula (IV) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio concentrando la miscela di reazione come tale. Il composto isolato rappresentato dalla formula (IV) può venire usato nella fase successiva senza purificazione.

Procedimento di produzione di riferimento 2

Il composto rappresentato dalla formula (VII) può venire prodotto mediante la reazione di un composto rappresentato dalla formula generale (IX):



in cui R², R³ e m hanno il significato precedentemente definito, con un composto rappresentato dalla formula (X):



in cui R¹⁻¹ ha il significato precedentemente definito.

La reazione viene solitamente eseguita in un solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri, come

dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dimetossietano, e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile, solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idrossido di sodio, idrossido di potassio ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di sodio, idruro di potassio ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammina; e basi organiche, come trietilammina, piridina e DBU. In alternativa, come base si può anche usare una quantità in eccesso di (X).

Per quanto riguarda le quantità di reagenti da usare, la quantità del composto rappresentato dalla formula (X) è da 1 a 6 moli e la quantità della ba-

se è da 1 a 6 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (IX).

Solitamente, la temperatura di reazione è in un campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è in un campo da 0,1 a 200 ore.

Dopo il completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (VII) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico, ed essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (VII) può venire ulteriormente purificato mediante ricristallizzazione, cromatografia su colonna oppure simili.

Procedimento di produzione di riferimento 3

Il composto rappresentato dalla formula (IX) può venire prodotto mediante la reazione del composto rappresentato dalla formula (III) ed un agente di clorocarbonilazione.

La reazione viene solitamente eseguita in un solvente in presenza di una base.

Esempi del solvente da usare comprendono chetoni, come acetone e metiletilchetone; idrocarburi aromatici, come benzene, toluene e xilene; idrocarburi alifatici, come esano ed eptano; eteri, come

dietiletere, tetraidrofurano, 1,4-diossano, 1,2-dietossietano, e 1,2-dietossietano; idrocarburi alogenati, come cloroformio, clorobenzene e diclorobenzene; nitrili, come acetonitrile; solventi polari non protonici, come N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide, 1-metil-2-pirrolidone, 1,3-dimetilimidazolidinone, dimetilsolfossido, ed una loro miscela.

Esempi della base da usare comprendono idrossidi di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idrossido di sodio, idrossido di potassio ed idrossido di calcio; idruri di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come idruro di sodio, idruro di potassio, ed idruro di calcio; carbonati di metalli alcalini e metalli alcalino terrosi, come carbonato di sodio e carbonato di potassio; alcolati di metalli alcalini, come etilato di sodio e metilato di sodio; composti litio organici, come n-butillitio e litio diisopropilammide; e basi organiche, come trietilammia, piridina e DBU.

Esempi dell'agente di clorocarbonilazione da usare comprendono fosgene, triclorometilcloroformiato, bis(triclorometil)carbonato e simili.

Per quanto riguarda le quantità di reagenti da usare, la quantità dell'agente di clorocarbonilazione è da 1 a 4 moli e la quantità della base è

da 1 a 4 moli rispetto ad 1 mole del composto rappresentato dalla formula (III).

Solitamente, la temperatura di reazione è in un campo da -78 a 150°C ed il tempo di reazione è in un campo da 0,1 a 200 ore.

Dopo il completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (IX) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio versando la miscela di reazione in acqua, estraendo la miscela con un solvente organico ed essiccando e concentrando il risultante strato organico. Il composto isolato rappresentato dalla formula (IX) può venire ulteriormente purificato mediante cromatografia su colonna oppure simile. In alternativa, dopo completamento della reazione, il composto rappresentato dalla formula (IX) può venire isolato mediante post-trattamento, ad esempio, concentrando la miscela di reazione come tale.

I composti prodotti mediante i procedimenti di sintesi precedentemente menzionati possono venire ulteriormente sottoposti ad alchilazione, alchenilazione, alchinilazione, acilazione, amminazione, solforazione, solfinilazione, solfonazione, ossidazione, riduzione, alogenazione e nitratura per sostituire i sostituenti con altri sostituenti desiderati.

Esempi specifici del presente composto sono i seguenti.

Composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^1 indica un atomo di idrogeno, un gruppo C_{1-6} -alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchenile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchinile, un gruppo C_{6-14} -arile, un gruppo C_{7-11} -aralchile oppure un gruppo C_{2-6} -alcossialchile;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^1 indica un atomo di idrogeno, un gruppo C_{1-6} -alchile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C_{2-6} -alcossialchile;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^1 indica un atomo di idrogeno, un gruppo metile oppure un gruppo metossimetile;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui m indica 0 oppure 1;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^2 indica un atomo di alogeno e m indica 0 oppure 1;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^3 indica un atomo di alogeno, un gruppo C_{1-4} -alcossile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C_{1-4} -alchile opzionalmente alogenato;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^3 indica un atomo di alogeno, un gruppo trifluorome-

tossile, un gruppo 1,1,2,2-tetrafluoroetossile oppure un gruppo trifluorometile;

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^1 indica un atomo di idrogeno, un gruppo C_{1-6} -alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchenile opzionalmente alogenato, un gruppo C_{2-6} -alchinile, un gruppo C_{6-14} -arile, un gruppo C_{7-11} -aralchile oppure un gruppo C_{2-6} -alcossialchile; R^2 indica un atomo di alogeno; R^3 indica un atomo di alogeno, un gruppo C_{1-4} -alcossile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C_{1-4} -alchile opzionalmente alogenato; e

composti di (N'-metil)benzoilurea in cui R^1 indica un atomo di idrogeno, un gruppo C_{1-6} -alchile, oppure un gruppo C_{2-6} -alcossialchile; R^2 indica un atomo di alogeno; R^3 indica un atomo di alogeno, un gruppo trifluorometossile, un gruppo 1,1,2,2-tetrafluoroetossile, oppure un gruppo trifluorometile.

Nel procedimento per la produzione dei semi trattati della presente invenzione (di seguito indicati rispettivamente come il presente procedimento di produzione ed i presenti semi di piante), i semi possono venire trattati con il presente composto come tale. Tuttavia, in generale, i semi vengono trattati con una composizione comprendente il presente composto. Come tale composizione, solita-

mente, il presente composto può venire usato in forma di preparazione ottenuta mediante miscelazione del presente composto oppure un suo sale con un veicolo, come un veicolo solido oppure liquido e, se necessario, un tensioattivo, un agente di sospensione, uno sviluppatore, un agente di penetrazione, un agente idratante, un agente addensante, uno stabilizzante, oppure simili, oppure una soluzione diluita con acqua della preparazione. Esempi della composizione comprendono preparazioni liquide, come emulsioni, soluzioni, micro-emulsioni, preparazioni scorrevoli e preparazioni a base di olio; preparazioni solide, come preparazioni idratate, preparazioni idrosolubili, preparazioni in sol, preparazioni in polvere, pellet, compresse e preparazioni di pellicole; e preparazioni incapsulate ottenute mediante incapsulamento oppure preparazioni di sovrarivestimento contenenti il presente composto.

Esempi del veicolo solido da usare per le preparazioni precedentemente menzionate comprendono polveri vegetali (polvere di soia, polvere di tabacco, farina di frumento, farina di legno, ecc.); polveri minerali (argille, come caolino, bentonite e caolino acido; talco, come polvere di talco ed

agalmatolite; e silice, come terra di diatomacee e polvere di mica); allumina, polvere di zolfo, carbone attivo, carbonato di calcio, solfato di ammonio, bicarbonato di sodio, lattosio ed urea. Quando si usano questi veicoli solidi per la composizione per la protezione della pianta della presente invenzione, possono venire usati uno oppure più di questi veicoli solidi ad un rapporto di miscelazione appropriato. Esempi del veicolo liquido comprendono alcoli (alcool metilico, alcool etilico, alcool n-propilico, alcool isopropilico, ed etilenglicole), chetoni (acetone, metiletilchetone, metilisobutilchetone e cicloesano), eteri (tetraidrofuran, etilenglicole monometil etero, dietilenglicole monometil etero, e propilenglicole monometil etero), idrocarburi alifatici (cherosene, olio combustibile ed olio per macchine), idrocarburi aromatici (toluene, xilene, nafta solvente, e metilnaftalene), idrocarburi alogenati (diclorometano, cloroformio, e tetracloruro di carbonio), ammidi acide (N,N-dimetilformammide, N,N-dimetilacetammide e N-metilpirrolidone), esteri (acetato di etile, acetato di butile, esteri di glicerina di acido grasso, γ -butirrolattone), e nitrili (acetonitrile e propionitrile). Quando un veicolo liquido viene usato per

la composizione di protezione delle piante della presente invenzione, uno oppure più di questi veicoli liquidi possono essere presenti ad un rapporto di miscelazione appropriato.

Inoltre, esempi del tensioattivo da usare secondo necessità comprendono saponi e tensioattivi non ionici ed anionici, come poliossietilentalchileteri [ad esempio Noigen (nome commerciale) ed EA 142 (nome commerciale), prodotti dalla Dai-ichi Kogyo Seiyaku CO., Ltd. e Nonal (nome commerciale), prodotto dalla Kao Corporation]; alchilsolfati [ad esempio Emal 10 (nome commerciale) ed Emal 40 (nome commerciale) prodotti dalla Kao Corporation]; sali di acido alchilbenzensolfonico [ad esempio Neogen (nome commerciale) e Neogen T (nome commerciale), prodotti dalla Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., e Nepelex (nome commerciale), prodotto dalla Kao Corporation]; polietilenglicoleteri [ad esempio Nonipol 85 (nome commerciale), Nonipol 100 (nome commerciale) e Nonipol 160 (nome commerciale), prodotti dalla Sanyo Chemical Industries, Ltd.]; esteri di polialcool [ad esempio Tween 20 (nome commerciale) e Tween 80 (nome commerciale), prodotti dalla Kao Corporation]; alchilsolfosuccinati [ad esempio Sanmorin OT 20 (nome commerciale), prodotto dalla

Sanyo Chemical Industries, Ltd., e Newkalgen EX 70 (nome commerciale), prodotto dalla Takemoto Oil e Fat Co., Ltd.]; alchilnaftalensolfonati, ed alchenilsolfonati [ad esempio Sorpol 5115 (nome commerciale), prodotto dalla Toho Chemical Industry Co., Ltd.].

Esempi del procedimento di trattamento dei semi di piante con la composizione comprendente il presente composto comprendono procedimenti per il trattamento di semi noti convenzionali, come impregnazione ed adesione.

Nella presente invenzione, l'impregnazione comprende un procedimento tale che i semi di piante vengono immersi oppure imbibiti in una composizione liquida contenente, come componenti principali, acqua ed il presente composto (disciolto oppure disperso) per impregnare i semi di piante con il presente composto.

La composizione liquida da usare per l'impregnazione può contenere un ulteriore solvente, il quale è talvolta utile per aumentare la solubilità del presente composto e la penetrabilità nei semi delle piante, come metanolo, etanolo, isopropanolo, etilenglicole, propilenglicole, propilencarbonato, alcool benzilico, esteri di acido dibasico, aceto-

ne, acetato di metile, acetato di etile, cicloesane, dimetilsolfossido, N-metilpirrolidone ed una loro miscela, a condizione che il solvente non causi alcun effetto sfavorevole alla pianta. Inoltre, quando si usa un tensioattivo, esso facilita la bagnatura della pianta e l'impregnazione dei semi con il presente composto. Preferibilmente, come composizione liquida vengono usate una soluzione diluita con acqua delle preparazioni in emulsione, preparazioni in micro-emulsione, preparazioni idratate, preparazioni idrosolubili e preparazioni in sol precedentemente menzionate. La concentrazione del presente composto nella composizione liquida è solitamente da circa 0,01 ppm a 100.000 ppm e preferibilmente da 1 ppm a 1.000 ppm.

Nella presente invenzione, il trattamento di adesione può venire eseguito mediante spruzzatura di una composizione liquida contenente il presente composto sulla superficie dei semi delle piante e quindi essiccamento dei semi; adesione di un materiale tipo polvere contenente il presente composto alle superfici dei semi delle piante usando un agente di fissaggio (ad esempio metilcellulosa e gomma arabica); miscelazione del presente composto ed un legante (ad esempio polimeri sintetici, come

alcool polivinilico, polivinilacetato idrolizzato, polivinilmetilene, copolimero polivinilmetilene-anidride maleica, e polivinilpirrolidinone, alginati, gomma karaya, gomma guar, gomma adragante e gomma di polisaccaride) ed un veicolo solido (ad esempio farina di legno, argilla, carbone attivo, terra di diatomacee, solido inorganico finemente suddiviso, e carbonato di calcio), stampaggio della miscela in forma tipo pellet, ed essiccamento; ed avvolgimento dei semi delle piante con un materiale che forma una pellicola (ad esempio polimeri e copolimeri di acetato di vinile, copolimeri polivinilpirrolidina-acetato di vinile, e cere idrosolubili) contenente il presente composto.

Lo spessore di uno strato della composizione contenente il presente composto formato sulle superfici dei semi delle piante è in un campo da quello di pellicola sottile a quello di strato di pellet, vale a dire in un campo da circa 0,1 a 10 mm. La quantità del presente composto da applicare alle superfici dei semi delle piante è solitamente in un campo da circa lo 0,0001% al 500%, preferibilmente in un campo dallo 0,001% al 200% rispetto al peso dei presenti semi di piante.

Nel trattamento di adesione, talvolta è van-

taggioso aggiungere un solvente, come metanolo, etanolo, acetato di metile, acetato di etile, acetone e cicloesano allo strato della composizione contenente il presente composto, il quale viene applicato alle superfici dei semi delle piante per migliorare la solubilità e la proprietà di adesione del presente composto, a condizione che il solvente non abbia alcun effetto sfavorevole per la pianta. Inoltre, per facilitare la bagnatura dei semi delle piante può venire aggiunto un tensioattivo.

La composizione per il trattamento dei semi della presente invenzione può inoltre contenere altri componenti attivi oltre al presente composto. Esempi dell'ulteriore ingrediente attivo comprendono insetticidi (ad esempio insetticidi piretroidi, insetticidi di organofosfato, insetticidi di carbammato, insetticidi neonicotinoidi, insetticidi naturali), acaricidi, oli per macchine, nematocidi, erbicidi, ormoni vegetali, sostanze che regolano la crescita delle piante, fungicidi (ad esempio fungicidi a base di rame, fungicidi a base di cloro organico, fungicidi a base di zolfo organico, fungicidi fenolici), sostanze sinergiche, sostanze attrattive, repellenti, agenti per attenuare danni chimici, coloranti, fertilizzanti e simili.

Esempi dell'insetticida comprendono

(1) insetticidi di organofosfato:

fosfuro di alluminio, butathiofos, cadusafos, chlorethoxyfos, chlorfenviphos, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metile, cyanophos (CYAP), diazinon, DCIP (diclorodiisopropiletere), dichlofenthion (ECP), dichlorvos (DDVP), dimetioato, dimethylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimfos, fenthion (MPP), fenitrothion (MEP), fosthiazate, formothion, fosfuro di idrogeno, isofenphos, isoxathion, malathion, mesulfenfos, methidathion (DMTP), monocrotophos, naled (BRP), oxydeprofos (ESP), parathion, phorate, phosalone, phosmet (PMP), pirimiphos-metile, pyridafenthion, quinalphos, phenthoate (PAP), profenofos, propaphos, prothiofos, pyraclophos, salithion, sulprofos, tebupirimfos, temephos, tetrachlorvinphos, terbufos, thiometon, trichlorphon (DEP), vamidothion, e simili;

(2) insetticidi di carbammato:

alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, chloethocarb, ethiofencarb, fenobucarb, fenothiocarb, fenoxycarb, furathiocarb, isoprocarb (MIPC), metolcarb, methomyl, methiocarb, NAC, oxamyl, pirimicarb, pro-

poxur (PHC), XMC, thiodicarb, xylylcarb e simili;

(3) insetticidi piretroidi sintetici:

acrinathrin, allethrin, benfluthrin, beta-cyfluthrin, bifenthrin, cycloprothrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cypermethrin, deltamethrin, esfenvalerate, ethofenprox, fenpropathrin, fenvalerato, flucythrinate, flufenoprox, flumethrin, fluvalinato, halfenprox, imiprothrin, permethrin, prallethrin, pyrethrins, resmethrin, sigma-cypermethrin, silafluofen, tefluthrin, tralomethrin, transfluthrin, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metossimetil)benzil-(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropancarbossilato, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbenzil-(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropancarbossilato, 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metossimetil)benzil-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropancarbossilato, e simili;

(4) composti di nereistoxin:

cartap, bensultap, thiocyclam, monosultap, bisultap e simili;

(5) composti di neonicotinoidi:

imidacloprid, nitenpyram, acetamiprid, thiamethoxam, thiacloprid e simili;

(6) composti di benzoilurea:

chlorfluazuron, bistrifluron, diafenthiuron, diflubenzuron, fluazuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triazuron, triflumuron e simili;

(7) composti di fenilpirazolo:

acetoprolo, fipronil, vaniliprolo, piriprolo, pirafluprolo e simili;

(8) insetticidi a base di tossina Bt

spore vive derivate da tossine cristalline prodotte da *Bacillus thuringiensis* ed una loro miscela;

(9) composti di idrazina:

chromafenozide, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide e simili;

(10) composti organici di cloro:

aldrin, dieldrin, dienochlor, endosulfan, methoxychlor e simili;

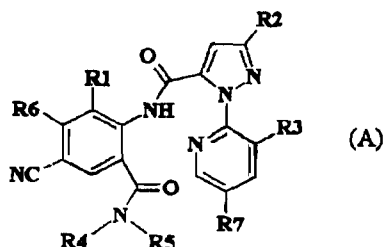
(11) insetticidi naturali:

olio per macchine, nicotina solfato e simili;

(12) altri insetticidi:

avermectina-B, cyenopyrafen, bromopropilato, buprofezin, chlorphenapyr, cyenopyrafen, cyromazine, D-D (1,3-dicloropropene), enamectin-benzoato, fenazaquin, flupyrzofos, idroprene, indoxacarb,

lepimectin, metoxadiazone, milbemycin-A, pymetrozine, pyridalyl, pyriproxyfen, spinosad, sulfluramid, tolfenpyrad, triazamato, flubendiamide, cyflumetofen, acido arsenico, benclothiaz, calciocianammide, polisolfuro di calcio, chlordane, DDT, DSP, flufenimer, flonicamid, flurimfen, formetanato, metammonio, metam-sodio, bromuro di metile, nidinotefuran, oleato di potassio, protrifenbute, spiromesifen, zolfo, metaflumizone, spirotetramat, pyrifluquinazon, tralopyril, un composto rappresentato dalla seguente formula (A):



in cui R^1 rappresenta Me, Cl, Br oppure F, R^2 rappresenta F, Cl, Br, C_{1-4} -alcoale, oppure C_{1-4} -alcoossile, R^3 rappresenta F, Cl oppure Br, R^4 rappresenta H, oppure C_{1-4} -alchile, C_{3-4} -alchenile, C_{3-4} -alchinile, C_{3-5} -cicloalchile oppure C_{4-6} -cicloalchilalchile, il quale può essere sostituito con uno oppure più sostituenti scelti dal gruppo costituito da un atomo di alogeno, CN, SMe, S(O)Me, S(O)₂Me e OMe, R^5 rappresenta H oppure Me, R^6 rappresenta H, F

oppure Cl, e R⁷ rappresenta H, F oppure Cl; e simili.

Esempi dell'acaricida comprendono acequinocyl, amitraz, benzossimato, bifenazato, bromopropilato, chinomethionat, chlorobenzilate, CPCBS (chlorfenson), clofentezine, cyenopyrafen, cyflumetofen, kelthane (dicofol), etoxazole, ossido di fenbutatin, fenothiocarb, fenpyroximate, fluacrypyrim, fluproxyfen, hexythiazox, propargite (BPPS), polynactins, pyridaben, pyrimidifen, tebufenpyrad, tetradifon, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, amidoflumet e simili.

Esempi del nematocida comprendono DCIP, fosthiazate, levamisol cloridrato, metilisotiocianato, morantel tartarate, imicyafos e simili.

Esempi dei fungicidi comprendono acibenzolar-S-metile, amobam, amisulbrom, ampropylfos, anilazine, azoxystrobin, benalaxyl, benodanil, benomyl, benthiavalicarb, bentiazolo, benthoxazin, bitertanol, blasticidin-S, poltiglia bordolese, boscalid, bromuconazolo, buthiobate, ipoclorito di calcio, polisolfuro di calcio, captan, carbendazol, carboxin, carpropamid, chlobenthiazone, chloroneb, chloropicrin, chlorothalonil (TPN), chlorthiophos, cinnamaldehyde, clozylacon, CNA (2,6-dicloro-4-ni-

troanilina), idrossido di rame, solfato di rame, cyazofamid, cyfluphenamid, cymoxanil, cyproconazolo, cyprodinil, cyprofuram, dazomet, debacarb, dichlofluanid, D-D (1,3-dicloropropene), diclocymet, diclomezina, diethofencarb, difenoconazolo, diflunetorim, dimefluazolo, dimethirimol, dimethomorph, diniconazolo-M, dinocap, edifenphos, enestroburin, epossiconazolo, dimetilditiotiocarbammato di nichel, etaconazolo, ethaboxam, ethirimol, etridiazolo, famoxadone, fenamidone, fenarimol, fenbuconazolo, fendazosulam, fenhexamid, fenoxanil, fempiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentiazon, idrossido di fentin, ferimzone, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorph, fluoroimide, fluotrimazolo, fluoxastrobin, fluquinconazolo, flusilazolo, flusulfamide, flutolanil, flutriafol, fosetyl-Al, fthalide, fuberidazolo, furalaxyl, furametpyr, furcarbanil, cis furconazolo, esaconazolo, hymexazol, IBP, imazalil, imibenconazolo, imminottadina-albesilato, imminottadina-triacetato, iodocarb, ipconazolo, iprodione, iprovalicarb, isoprotiolano, kasugamycin, kresoxim-metile, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipyrim, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl, metalaxyl-M, metam-sodio, methasulfocarb, bromuro di metile, metconazolo, methfuroxam, metominostro-

bin, metrafenone, metsulfovax, mildiomicin, milneb, myclobutanil, myclozolin, nabam, orysastrobin, ofurace, oxadixyl, acido ossolinico, oxpoconazolo, oxycarboxin, ossitettraciclina, pefurazoato, penconazolo, pencycuron, picoxystrobin, policarbammato, polyoxin, bicarbonato di potassio, probenazolo, prochloraz, procymidone, propamocarb cloridrato, propiconazolo, propineb, proquinazid, prothiocarb, protioconazolo, pyracarbolid, pyraclostrobin, pyrazophos, pyributicarb, pyrifenox, pyrimethanil, pyroquilon, quinoxifen, quintozene (PCNB), silthio-pham, simeconazolo, sipconazolo, bicarbonato di sodio, ipoclorito di sodio, spiroxamine, SSF-129 ((E)-2-[2-(2,5-dimetilfenossimetil)fenil]-2-metos-siimmino-N-metilacetammide), streptomicina, zolfo, tebuconazolo, tecloftalam, tetraconazolo, tiabendazolo, thiadinil, thiram (TMTD), thifluzamide, tiofanate-metile, tolclofos-metile, TPN, triadimefon, triadimenol, triazoxide, triclamide, triciclazolo, tridemorph, triflumizolo, trifloxystrobin, triforina, triticonazolo, validamycin, vinclozolin, viniconazolo, zineb, ziram, zoxamide e simili.

Esempi dell'erbicida e/oppure della sostanza che regola la crescita della pianta comprendono acido abscisico, acetochlor, acidluorfen-sodio, ala-

chlor, alloxymid, ametryn, amicarbazone, amidosulfuron, amminoetossivinilglicina, aminopyralid, AC94, 377, amiprofos-metile, ancymidol, asulam, atrazina, aviglicina, azimsulfuron, beflubutamid, benfluralin, benfuresato, bensulfuron-metile, bensulide (SAP), bentazone, benthocarb, benzamizolo, benzfendizone, benzobicyclon, benzofenap, benziladenina, benzilamminopurina, bialaphos, bifenox, brassinolide, bromacil, bromobutide, butachlor, butafenacil, butamifos, butilato, canfestrolo, carbonato di calcio, perossido di calcio, carbaryl, chlomethoxynil, chloridazon, chlorimuron-etile, chlorphtalim, chlorpropham, chlorsulfuron, chlorthal-dimetile, chlorthiamid (DCBN), cloruro di colina, cinidon-etile, cinmethylin, cinosulfuron, clethodim, clomeprop, cloxyfonac-sodio, cloruro di chlormequat, 4-CPA (acido 4-clorofenossiacetico), cliprop, clofencet, cumyluron, cianazina, cyclanilide, cyclosulfamron, cyhalofop-butile, sale di 2,4-D (sali di acido 2,4-diclorofenossiacetico), dichlorprop (2,4-DP), daimuron, dalapon (DPA), dimethenamid-P, daminozide, dazomet, alcool n-decili-co, dicamba-sodio (MDBA), dichlobenil (DBN), diflufenican, dikegulac, dimepiperato, dimethametryn, dimethenamid, diquat, dithiopyr, diuron, endothal,

epocholeone, esprocarb, ethepon, ethidimuron, ethoxysulfuron, ethychlozate, etobenzanid, fenarimol, fenoxaprop-etile, fentrazamide, flazasulfuron, florasulam, fluazipop-butile, fluazolato, flucarbazonne, flucetosulfuron, flufenacet, flufenpyr, flumetralin, flumioxazin, flupropanato-sodio, flupyrsulfuron-metile-sodio, flurprimidol, fluthiacet-metile, foramsulfuron, forchlorfenuron, formesafen, gibberelina, glufosinato, glifosato, alosulfuron-metile, hexazinone, imazamox, imazapic, imazapyr, imazaquin, imazosulfuron, inabenfide, acido indolacetico (IAA), acido indolbutirrico, iodosulfuron, ioxynil-ottanoato, isouron, isoxachlortole, isoxadifen, karbutilate, lactofen, lenacil, linuron, LGC-42153, idrazide maleica, mecoprop (MCP), sali di MCP (sali di acido 2-metil-4-clorofenossiacetico), MCPA-tioetile, MCPB (etilestere di acido 2-metil-4-clorofenossibutanoico), mefenacet, mefluidide, mepiquat, mesosulfuron, mesotrione, metil-daimuron, metolachlor, metribuzin, metsulfuron-metile, molinato, acido naftilacetico, NAD (1-naftalenacetammide), naproanilide, napropammide, alcool n-decilico, nicosulfuron, acido n-fenilftalammico, orbencarb, orthosulfanuron, oxadiazon, oxaziclomefone, oxine-solfato, paclobutrazol, paraquat, acido

pelargonico, pendimethalin, pentossazone, pethoxamide, phenmedipham, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperonilbutossido, piperophos, pretilachlor, primisulfuron-metile, procarbazon, prodiammina, profluazol, profoxydim, prohexadione-calcio, prohydrojasmon, prometryn, propanil, propossicarbazon, propyrzamide, pyraflufen-etile, pyrasulfotole, pirazolato, pyrazosulfuron-etile, pirazoxyfen, pyribenzoxim, pyributicarb, pyridafol, piridato, pyriftalid, pyriminobac-metile, pyrithiobac, quiclorac, chinoclammina, quizalofop-etile, rimsulfuron, sethoxydim, siduron, simazina, simetryn, clorato di sodio, sulfosufuron, swep (MCC), tebuthiuron, tefurytrione, tembotrione, tepraloxym, terbacil, terbucarb (MBPMC), thenylchlor, thiazafluron, thidiazuron, tiencarbazon metile, thifensulfuron-metile, triaziflam, tribufos, triclopyr, tri-diphane, trifloxysulfuron, trifluralin, trinexapacetile, tritosulfuron, uniconazolo-P, vemolato (PPTC), flucetosulfuron, orthosulfanuron, pinoxaden, pyrasulfotole, tefuryltrione, tembotrione, tiencarbazon metile e simili.

Esempi del prodotto sinergico comprendono piperonilbutossido, sesamex, solfossido, MGK 264, WARF-antiresistente, e dietilmaleato, ed esempi di

componenti attivi di un agente protettivo comprendono benoxacor, cloquintocet-mexyl, cyometrinil, daimuron, dichlormid, fenclorazolo-etile, fenclo-rim, flurazolo, fluxofenim, furilazolo, mefenpyr-dietile, MG191, anidride naftalica, ed ossabetri-nil.

Il procedimento per la prevenzione di danni da parte di insetti nocivi, i quali causano danni alle piante dopo la germinazione, nella presente invenzione può venire eseguito seminando i semi trattati ottenuti mediante il procedimento di produzione della presente invenzione nel terreno, come risaie ben drenate, risaie, campi secchi, ecc.; terreno per vivai per piantare piante da vivaio; strati fibrosi per piante da vivaio; e soluzioni idroponiche e piantatura delle piante in condizioni normali.

Esempi dei semi di piante ai quali può venire applicata la composizione per il trattamento dei semi della presente invenzione comprendono semi di piante scelte dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.

Più specificamente, esempi degli ortaggi comprendono ortaggi della famiglia delle Solanacee (melanzana, pomodoro, peperone verde, peperone ros-

so, patata, ecc.); ortaggi della famiglia delle Cucurbitacee (cetriolo, zucca, zucchini, anguria, melone, ecc.); ortaggi della famiglia delle Crucifere (ravanello giapponese, rapa, barbaforse, cavolo rapa, cavolo cinese, cavolo, senape marrone, broccoli, cavolfiore, canola, ecc.); ortaggi della famiglia delle Composite (lappola, crisantemo a ghirlanda, carciofo, lattuga, ecc.); ortaggi della famiglia delle Liliacee (cipollina, cipolla, aglio, asparago, ecc.); ortaggi della famiglia delle Umbellifere (carota, prezzemolo, sedano, pastinaca, ecc.); ortaggi della famiglia delle Chenopodiacee (spinaci, bietola, ecc.); ortaggi della famiglia delle labiate (pianta delle bistecche (Perilla frutescens), menta, basilico, ecc.); fragola, patata dolce, yam giapponese, aracee, eccetera.

Inoltre, nel caso in cui la pianta possa differenziarsi oppure propagarsi mediante corpi riprodotti, come gambi di radici, tuberi di gambi, gambi discoidi, bulbi solidi, ecc., la composizione per il trattamento di semi della presente invenzione può proteggere le piante dai danni di insetti nocivi dopo differenziazione oppure propagazione mediante trattamento dei corpi riprodotti con la composizione per il trattamento dei semi.

I semi di piante comprendono inoltre semi di raccolti a cui è stata conferita resistenza ad erbicidi mediante procedimenti di selettocoltura tradizionali e tecniche di ingegneria genetica. Non si verifica alcun problema causato da erbicidi ai raccolti ai quali è stata fornita resistenza ad erbicidi, anche quando si applicano erbicidi, ad esempio inibitori di HPPD, come isoxaflutole; inibitori di ALS, come imazatapyr e thifensulfuron-metile; inibitori enzimatici che sintetizzano EPSP; inibitori enzimatici che sintetizzano glutammina; inibitore di acetil-CoA carbossilasi; e bromoxynil.

Esempi di raccolti a quali è stata conferita resistenza ad erbicidi mediante procedimenti di selettocoltura tradizionali comprendono Clearfield, nome commerciale depositato; Canola, avente resistenza ad erbicida di imidazolidinone; soia STS, avente resistenza ad un erbicida di solfonilurea; e mais SR, avente resistenza ad inibitori di acetil-CoA carbossilasi. Raccolti aventi resistenza ad inibitori di acetil-CoA carbossilasi sono descritti in Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1990, 87, 7175. Acetil-CoA-carbossilasi mutata che sviluppa resistenza ad inibitori di CoA-carbossilasi è riportata, ad esempio, in Weed Science 53:728-746, 2005. Quando

un gene che codifica questa acetil-CoA-carbossilasi mutata viene introdotto mediante una tecnica di ingegneria genetica, oppure quando viene introdotta la mutazione relativa al conferimento di resistenza ad acetil-CoA-carbossilasi ad un gene che codifica acetil-CoA carbossilasi di una pianta da raccolto, i raccolti hanno resistenza ad erbicidi del tipo con inibizione ad acetil-CoA carbossilasi.

Esempi dei "raccolti" ai quali è stata conferita resistenza a erbicidi mediante la tecnica di ingegneria genetica comprendono varietà di specie note di mais ai quali è stata conferita resistenza a glifosato e glufosinato. Alcune di queste varietà di specie di mais sono state commercializzate con i nomi commerciali di RoundupReady (nome commerciale depositato) e LibertyLink (nome commerciale depositato).

I "raccolti" precedentemente menzionati comprendono raccolti ai quali è stata conferita la capacità di produrre tossine insetticide mediante una tecnica di ingegneria genetica. Tali tossine insetticide comprendono proteine insetticide derivate da *Bacillus cereus* e *Bacillus popilliae*; δ -endotossine derivate da *Bacillus thuringiensis*, come Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 e

Cry9C, VIP 1, VIP 2, VIP 3 e Vip 3A; proteine insetticide derivate da nematodi; tossine prodotte da animali, come tossine dello scorpione, tossine del ragno, tossine dell'ape e neurotossine specifiche di insetti; tossine batteriche filamentose; lectina vegetale; agglutinina; inibitori di proteasi, come inibitori di tripsina, inibitori di serina proteasi, papaina, cistatina ed inibitori di papaina; proteine che inattivano ribosomi (RIP), come lisi-na, RIP di mais, abrina, saporina e briodina; enzimi che metabolizzano steroidi, come 3-idrossisteroide ossidasi, ecdisteroide-UDP-glucosiltransferasi, e colesterolo ossidasi; inibitore di ecdisone; HMG-COA riduttasi; inibitori del canale degli ioni, come inibitori del canale del sodio e inibitori del canale del calcio; ormone allato esterasi; recettore di ormoni diuretici; stilbene sintasi; dibenzil sintasi; e glucanasi. Le tossine insetticide comprendono proteine ibride delle proteine precedentemente menzionate e le proteine precedentemente menzionate nelle quali porzioni di amminoacidi vengono eliminate oppure sostituite. Le proteine ibride vengono prodotte combinando domini diversi delle proteine insetticide precedentemente menzionate mediante una tecnica di ingegneria genetica. Come

tossina delle proteine precedentemente menzionate, in cui porzioni di amminoacidi vengono eliminate, è nota Cry1Ab. Le tossine insetticide ed i "raccolti" ai quali sono state conferite capacità di produrre tossine insetticide mediante una tecnica di ingegneria genetica sono descritte, ad esempio, in EP 0 374 753 A, WO 93/07278, WO 95/34656, EP 0 427 529 A, EP 451 878 A e WO 03/052073.

I "raccolti" ai quali sono state conferite capacità di produrre tossine insetticide mediante una tecnica di ingegneria genetica hanno resistenza ad attacchi da parte di insetti nocivi dei coleotteri, insetti nocivi dei ditteri, e/oppure insetti nocivi dei lepidotteri.

Tra i "raccolti" ai quali sono state conferite capacità di produrre tossine insetticide mediante una tecnica di ingegneria genetica, esempi di raccolti commercializzati comprendono YieldGard, nome commerciale depositato (varietà di mais che sviluppa tossine); YieldGard Rootworm, nome commerciale depositato (varietà di mais che sviluppa la tossina CryBb1); YieldGard Plus, nome commerciale depositato (varietà di mais che sviluppa le tossine Cry1Ab e Cry3Bb1); Herculex I, nome commerciale depositato (varietà di mais che sviluppa la tossina Cry1Fa2

e fosfinotricina N-acetiltransferasi (PAT) per conferire resistenza a glufosinato); NuCOTN33B, nome commerciale depositato (varietà di cotone che sviluppa la tossina Cry1Ac); Bollgard I, nome commerciale depositato (varietà di cotone che sviluppa la tossina Cry1Ac); Bollgard II, nome commerciale depositato (varietà di cotone che sviluppa le tossine Cry1Ac e Cry2Ab); VIPCOAT, nome commerciale depositato (varietà di cotone che sviluppa la tossina VIP); NewLeaf, nome commerciale depositato (varietà di patata che sviluppa la tossina Cry3A); NatureGard, nome commerciale depositato, Agrisure, nome commerciale depositato; GT Advantage (GA21, carattere con resistenza a glifosato); Agrisure, nome commerciale; CB Advantage (carattere per la piralide del mais (CB) Bt11); e Proteca, nome commerciale.

I "raccolti" precedentemente menzionati comprendono raccolti ai quali sono state conferite capacità di produrre sostanze antipatogene mediante una tecnica di ingegneria genetica. Esempi di sostanze antipatogene prodotte da microrganismi comprendono proteine PR (PRP, descritte in EP 0 392 225 A), inibitori del canale degli ioni, come inibitori del canale del sodio ed inibitori del canale

del calcio (tossine KP1, KP4 e KP6 prodotte da virus; stilbene sintasi; dibenzil sintasi; chitinasi; glucanasi; proteine PR; antibiotici peptidici ed antibiotici aventi eteroanelli; e proteine pertinenti alla resistenza a malattie vegetali (descritte in WO 03/000906).

Esempi di raccolti ai quali sono state conferite capacità di produrre sostanze antipatogene mediante una tecnica di ingegneria genetica comprendono quelli descritti in EP 0 392 225 A, WO 95/-33818 ed EP 0 353 191 A.

Nella presente invenzione, insetti che causano danni ai corpi delle piante dopo la germinazione comprendono insetti nocivi (insetti dannosi ed acarri dannosi) i quali mangiano e succhiano i corpi delle piante. Esempi specifici di tali insetti sono i seguenti.

Emitteri:

Delphacidae, come *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera* e simili, Deltocefalidi, come *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix virescens* e simili, Aphididae, come *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus* e simili, Pen-

tatomidi, come *Nezara antennata*, *Riptortus clavatus*, *Leptocorisa chinensis*, *Eysarcoris parvus*, *Halymorpha mista*, *Lygus lineolaris* e simili, Aleirodidi, come *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia argentifolii* e simili, Coccidi, come *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens*, *Icerya purchasi* e simili, Tingidae, Psyllidae e simili;

Lepidotteri:

Piraliidi, come *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis*, *Pediasia teterrellus* e simili, Noctuidi, come *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separate*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Thoricoplusia* spp., *Heliothis* spp., *Helicoverpa* spp. e simili, Pieridi, come *Pieris rapae* e simili, Tortricidi, come *Adoxophyes* spp., *Grapholita molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes* sp., *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, *Cydia pomonella* e simili, Gracillariidae, come *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoneella* e simili, Carposinidi, come *Carposina niponensis* e simile, Lionetidi,

come *Lyonetia* spp. e simili, *Limantridi*, come *Lymantria* spp., *Euproctis* spp. e simili, *Iponomeu-*
tidi, come *Plutella xylostella* e simile, *Gelechidi*,
come *Pectinophora gossypiella*, *Phtorimaea opercu-*
lella e simili, *Tineidi*, come *Hyphantria cunea* e
simile, *Tineidae* come *Tinea translucens*, *Tineola*
bisselliella e simili;

Tisanotteri:

Tripidi, come *Frankliniella occidentalis*,
Thrips palmi, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*,
Frankliniella intonsa, *Frankliniella fusca* e simi-
li;

Ditteri:

Hylemya antique, *Hylemya platura*, *Anopheles*
sinensis, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*,
Chlorops oryzae, *Dacus cucurbitae*, *Ceratitis capi-*
tata, *Liriomyza trifolii* e simili;

Coleotteri:

Epilachna vigintioctopunctata, *Aulacophora fe-*
moralis, *Phyllotreta striolata*, *Oulema oryzae*, *E-*
chinocnemus squameus, *Lissorhoptrus oryzophilus*,
Anthonomus grandis, *Callosobruchus chinensis*, *Sphe-*
nophorus venatus, *Popillia japonica*, *Anomala cupre-*
a, *Diabrotica* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *A-*
*griot*es spp., *Lasioderma serricorne*, *Anthrenus ver-*

baschi, *Tribolium castaneum*, *Lyctus brunneus*, *Anoplophora malasiaca*, *Tomicus piniperda* e simili;

Ortotteri:

Locusta migratoria, *Gryllotalpa africana*, *Oxya yezoensis*, *Oxya japonica* e simili;

Imenotteri:

Athalia rosae, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp. e simili;

Acari:

Tetranichidi, come *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Oligonychus* spp. e simili, Eriofidi, come *Aculops pelekassi* e simili, Tarsonemidi, come *Polyphagotarsonemus latus* e simile, Tenuipalpidi e simili.

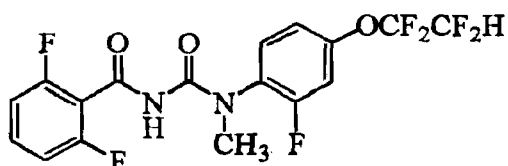
Nella presente invenzione, gli insetti che causano danni alle piante dopo la germinazione sono particolarmente insetti dannosi dei ditteri, insetti dannosi dei coleotteri, e/oppure insetti dannosi dei lepidotteri.

La presente invenzione verrà illustrata più dettagliatamente mediante i seguenti Esempi, ma la presente invenzione non è limitata a questi.

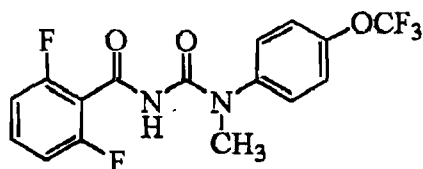
Dapprima, verranno descritti di seguito esempi del presente composto.

3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-fluoro-4-(1,1,2,2-te-

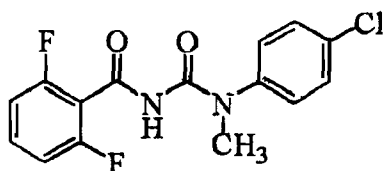
trafluoroetossi)fenil]-1-metilurea (di seguito indicato come il presente composto (1)) rappresentato dalla formula:



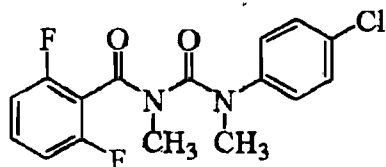
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(4-trifluorometossifenil)-1-metilurea (di seguito indicato come il presente composto (2)) rappresentato dalla formula:



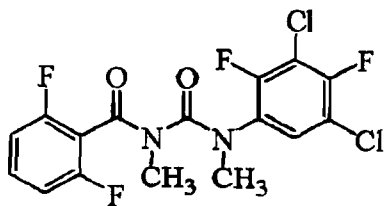
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(4-clorofenil)-1-metilurea (di seguito indicato come il presente composto (3)) rappresentato dalla formula:



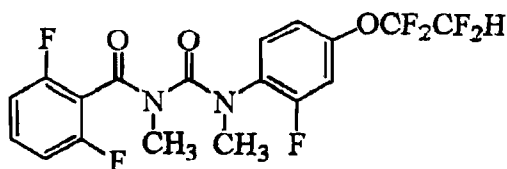
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(4-clorofenil)-1,3-dimetilurea (di seguito indicato come il presente composto (4)) rappresentato dalla formula:



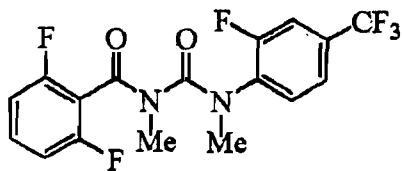
3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-(3,5-dicloro-2,4-difluorofenil)-1,3-dimetilurea (di seguito indicato come il presente composto (5)) rappresentato dalla formula:



3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetossi)fenil]-1,3-dimetilurea (di seguito indicato come il presente composto (6)) rappresentato dalla formula:

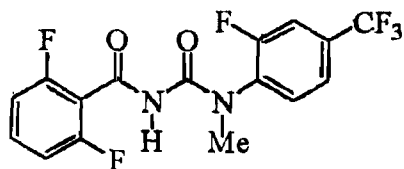


3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]-1,3-dimetilurea (di seguito indicato come il presente composto (7)) rappresentato dalla formula:

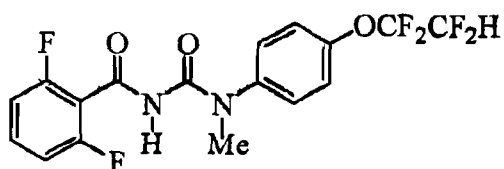


3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]-1-metilurea (di seguito indicato come il presente composto (8)) rappresentato dalla for-

mula:



3-(2,6-difluorobenzoyl)-1-[4-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)fenil)-1-metilurea (di seguito indicato come il presente composto (9)) rappresentato dalla formula:



I composti precedentemente menzionati sono stati prodotti mediante i seguenti procedimenti. Esempio di sintesi 1

Una soluzione ottenuta mediante dissoluzione di 0,75 g di 2,6-difluorobenzoylisocianato in 1,0 ml di dietilere è stata aggiunta ad una soluzione ottenuta mediante dissoluzione di 1,00 g di 2-fluoro-N-metil-4-(1,1,2,2-tetrafluoroetossi)anilina in 4,0 ml di dietilere con raffreddamento con ghiaccio e la miscela è stata agitata a temperatura ambiente per 2 ore. Dopo aver aggiunto 10 ml di esano alla miscela di reazione, la miscela è stata filtrata e la sostanza sul filtro è stata essiccata ottenendo 1,58 g del presente composto (1).

Presente composto (1):

$^1\text{H-NMR}$ (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, brs)

Esempio di sintesi 2

Una soluzione ottenuta mediante dissoluzione di 0,57 g di 2,6-difluorobenzoilisocianato in 0,5 ml di dietil-etere è stata aggiunta ad una soluzione ottenuta mediante dissoluzione di 0,60 g di N-metil-4-trifluorometossianilina in 2,4 ml di dietil-etere in condizioni di raffreddamento con ghiaccio e la miscela è stata agitata a temperatura ambiente per 2 ore. Dopo aver aggiunto 6,0 ml di esano alla miscela di reazione, la miscela è stata filtrata e la sostanza sul filtro è stata essiccata ottenendo 1,13 g del presente composto (2).

Presente composto (2):

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ (ppm): 3.25 (3H, s), 7.12-7.16 (2H, m), 7.41-7.55 (5H, m), 10.68 (1H, brs)

Esempio di sintesi 3

Dopo aver aggiunto 128 mg di idruro di sodio ad una soluzione ottenuta mediante dissoluzione di 1,01 g di 3-(2,6-difluorobenzoil)-1-[2-fluoro-4-(trifluorometil)fenil]-1-metilurea in 10,0 ml di 1-metil-2-pirrolidone ed agitazione a circa 2°C per

30 minuti, sono stati aggiunti alla miscela 0,40 ml di ioduro di metile a 2°C. Dopo che la miscela risultante è stata agitata ad una temperatura da 2 a 3°C per 3 ore, è stata aggiunta una soluzione mista di 10 ml di soluzione acquosa di cloruro di ammonio saturo e 10 ml di acqua in condizioni di raffreddamento su ghiaccio ed è stata estratta con 20 ml di acetato di etile, 3 volte. Gli strati organici ottenuti sono stati uniti e lavati tre volte con acqua salata saturo ed il prodotto ottenuto è stato essiccato con solfato di magnesio anidro e concentrato sotto pressione ridotta. Il residuo ottenuto è stato purificato mediante colonna su silicagel (acetato di etile:cloroformio:esano = 1:1:4) ottenendo 0,79 g del presente composto (7).

Presente composto (7):

¹H-NMR (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)

Esempio di sintesi 4

Il presente composto (8) è stato prodotto secondo lo stesso procedimento dell'Esempio di sintesi 1.

Presente composto (8):

¹H-NMR (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, brs).

Esempio di sintesi 5

Il presente composto (9) è stato prodotto secondo lo stesso procedimento dell'Esempio di sintesi 1.

Presente composto (9):

¹H-NMR (CDCl₃) δ (ppm): 3.22 (3H, s), 5.81-6.09 (1H, m),
6.92-7.05 (2H, m), 7.32-7.55 (6H, m).

Il presente composto (3) è descritto in DE 2123236 e può venire prodotto mediante il procedimento descritto nella presente. Il presente composto (4) ed il presente composto (5) sono composti descritti in JP 2-3659 A e possono venire prodotti mediante i procedimenti descritti nella presente. Il presente composto (6) è descritto in JP 4-26667 e può venire prodotto mediante il procedimento descritto nella presente.

I seguenti Esempi di produzione illustreranno la produzione della composizione della presente invenzione e dei presenti semi. Tutte le "parti" sono in peso.

Esempio di produzione 1

A 25 parti di ciascuno dei presenti composti

(1) a (9) vengono aggiunte 65 parti di cicloesano-
ne, 5 parti di NINATE 401-A e 5 parti di BRAUNONE
BR-450 e la miscela viene completamente miscelata
con agitazione, per ottenere un'emulsione al 25%.
L'emulsione viene diluita a 1/1.000 con acqua, ot-
tenendo una soluzione diluita. Riso come semi viene
immerso nella soluzione diluita per 24 ore fino a
quando il componente efficace viene assorbito
all'interno del riso a semi ottenendo semi tratta-
ti.

Esempio di produzione 2

Un materiale per stampaggio di pellet viene
ottenuto miscelando completamente 25 parti di cia-
scuno dei presenti composti (1) a (9) con 25 parti
di argilla, 25 parti di alcool polivinilico conte-
nente 50 parti di Sorgen TW-20 e 25 parti di acqua
con agitazione. Quindi, semi di cavolo vengono in-
corporati al centro di 20 mg del prodotto prece-
dentemente ottenuto per stampaggio di pellet, se-
guito da stampaggio in forma sferica per ottenere
semi trattati.

Esempio di produzione 3

Una preparazione scorrevole contenente il 25%
del componente efficace viene ottenuta miscelando
25 parti di ciascuno dei presenti composti (1) a

(9), 20 parti di silice in polvere contenente il 50% (in peso) di sale di ammonio di poliossietilenchiliteresolfato e 55 parti di acqua e polverizzando finemente la miscela risultante mediante un procedimento di polverizzazione a umido. Semi di cotone vengono disposti in un vaso (diametro interno 12 cm e profondità 11 cm) prodotto con acciaio inossidabile che ha due lame di sollevamento disposte l'una opposta all'altra in direzioni opposte, in modo che i semi vengano sollevati quando il vaso viene fatto ruotare ed inclinato ad un angolo da 40 a 45 gradi e fatto ruotare meccanicamente a 640 giri al minuto, miscelando quindi perfettamente i semi e fornendo un'azione di rotolamento-granulazione nel vaso. Quindi, la preparazione scorrevole viene diluita a 1/100 con acqua, un dispositivo per spruzzatura portatile viene regolato verso l'interno del vaso e la preparazione scorrevole diluita viene spruzzata direttamente verso il centro dello strato di granuli rotanti di semi di cotone con una pressione di aria alimentata da 10 a 11 psi (da 69 a 76 kPa). La spruzzatura viene continuata fino a quando le superfici dei semi diventano adesive agglomerando i semi. Dopo l'arresto del dispositivo di spruzzatura, aria a bassa pressione viene

soffiata verso i semi a temperatura ambiente mediante un ugello installato in modo tale che la corrente d'aria possa venire inviata verso l'interno del vaso per asciugare velocemente il rivestimento dei semi. Quindi, la corrente di aria per essiccamento viene interrotta e viene nuovamente iniziata la spruzzatura usando il dispositivo di spruzzatura di tipo portatile. Questi cicli di essiccamento a spruzzo vengono ripetuti fino a quando la quantità desiderata della sospensione fluidizzante viene applicata ai semi. Inoltre, dopo esposizione ad aria ambiente a basso scorrimento per 60 ore, il rivestimento dei semi viene completamente asciugato ottenendo semi trattati.

Esempio di prova 1

Semi pellettizzati contenenti uno dei presenti composti (1) e (6) sono stati prodotti secondo l'Esempio di produzione 2 precedentemente menzionato. I semi pellettizzati sono stati seminati in una cassetta con celle a tampone (volume di ciascuna cella: 27 ml, profondità: 5,0 cm) riempita con terra di vivaio e la pianta è stata fatta crescere per 28 giorni dopo la semina. Dopo che le parti di radici sono cresciute, le piantine di cavolo sono state rimosse, le piantine e le foglie sono state

collocate in un vaso di polietilene (capacità 180 ml) e sono state rilasciate 10 larve al secondo stadio di *Plutella xylostella*. Il vaso è stato mantenuto a 25°C per 7 giorni. Quindi, è stata valutata l'entità dei danni delle piantine di cavolo da parte delle larve di *Plutella xylostella* ed il caso di trattamento con i composti del campione (gruppo trattato) ed il caso senza trattamento (gruppo non trattato) sono stati confrontati per misurare l'effetto di inibizione del danno secondo la seguente equazione.

$$\text{Effetto di inibizione del danno (\%)} \left(1 - \frac{\text{entità del danno nel gruppo trattato}}{\text{entità del danno nel gruppo non trattato}} \right) \times 100$$

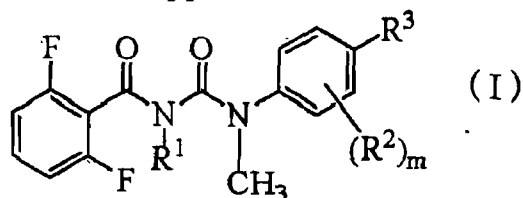
Come risultato, nel gruppo trattato dei presenti composti (1) e (6), l'effetto di inibizione del danno era rispettivamente del 90% oppure superiore e quindi le piantine di cavolo dopo la germinazione sono state protette dai danni da parte di *Plutella xylostella*.

Come precedentemente descritto nella presente, il trattamento dei semi di una pianta con una composizione contenente il presente composto può prevenire che le piante vengano danneggiate da insetti nocivi che le mangiano dopo la germinazione.

RIVENDICAZIONI

1. Procedimento per prevenire che una pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione della pianta, il quale comprende le fasi di:

trattare i semi della pianta con una composizione comprendente un composto di (N'-metil)benzotilurea rappresentato dalla formula (I):



in cui R¹ indica un atomo di idrogeno, un gruppo C₁₋₆-alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-alchenile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-alchinile, un gruppo C₆₋₁₄-arile, un gruppo C₇₋₁₁-aralchile, un gruppo C₂₋₆-alcossialchile, un gruppo C₇₋₁₄-arilossialchile, un gruppo C₃₋₆-dialchilamminoalchile, un gruppo C₂₋₆-alchiltioalchile, un gruppo C₂₋₆-alchiltioalchile, un gruppo C₂₋₆-alchilsolfinilalchile, un gruppo C₂₋₆-alchilsolfonilalchile, un gruppo C₃₋₉-alcossialcossialchile, un gruppo C₂₋₆-alcossicarbonile, un gruppo C₈₋₁₂-aralchilossicarbonile, un gruppo C₃₋₁₃-dialchilcarbamoile, un gruppo C₂₋₆-alchilcarbonile opzionalmente alogenato, un

gruppo formile, un gruppo C₁₋₅-alchilsolfonile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C₆₋₁₀-arilsolfonile, R² indica un atomo di alogeno oppure un gruppo C₁₋₄-alchile opzionalmente alogenato; R³ indica un atomo di alogeno, un gruppo C₁₋₄-alchile opzionalmente alogenato, un gruppo C₁₋₄-alcossile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₆-alcossialcossile opzionalmente alogenato, un gruppo C₂₋₄-alchenilossile opzionalmente alogenato, oppure un gruppo C₂₋₄-alchinilossile opzionalmente alogenato, e m indica un numero intero da 0 a 4, e

seminare i semi trattati, seguiti da coltivazione.

2. Procedimento secondo la rivendicazione 1, in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.

3. Procedimento per produrre semi trattati di una pianta, il quale comprende il sottoporre i semi ad un trattamento con una composizione comprendente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nella rivendicazione 1, in modo da prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione.

4. Procedimento secondo la rivendicazione 3,

in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.

5. Composizione per il trattamento dei semi di una pianta in modo da prevenire che la pianta venga danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione, comprendente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nella rivendicazione 1.

6. Composizione secondo la rivendicazione 5, in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.

7. Semi di una pianta che sono stati trattati con una composizione contenente il composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nella rivendicazione 1.

8. Semi secondo la rivendicazione 7, in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.

9. Uso del composto di (N'-metil)benzoilurea rappresentato dalla formula (I) come definito nella rivendicazione 1 per il trattamento dei semi di una pianta in modo da prevenire che la pianta venga

danneggiata da insetti nocivi dopo la germinazione.

10. Uso secondo la rivendicazione 9, in cui la pianta viene scelta dal gruppo costituito da ortaggi, mais, cotone, riso, barbabietola da zucchero e soia.