

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 574 821**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01)
C07D 213/40 (2006.01)
C07D 213/81 (2006.01)
C07D 213/82 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 213/61 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **11.04.2008 E 08740305 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.04.2016 EP 2132987**

54 Título: **Composición de agente nematocida y método de uso de la misma**

30 Prioridad:

12.04.2007 JP 2007104494

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

22.06.2016

73 Titular/es:

**NIHON NOHYAKU CO., LTD. (100.0%)
2-5 NIHONBASHI 1-CHOME
CHUO-KU, TOKYO 103-8236, JP**

72 Inventor/es:

SUWA, AKIYUKI

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 574 821 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Composición de agente nematocida y método de uso de la misma

Campo técnico

5 La presente invención se refiere al uso de una composición que comprende un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida como nematocida y a un método de usar tal composición.

Antecedentes de la invención

10 Convencionalmente, se sabe que los derivados de N-2-(piridil)etilcarboxamida son útiles como agentes de represión de enfermedades de plantas (véase, por ejemplo, Documento de patente 1 o 2). Sin embargo, estos documentos de la técnica anterior no afirman o sugieren que los derivados de N-2-(piridil)etilcarboxamida posean actividad nematocida.

Documento de patente 1: WO2004/016088

Documento de patente 2: WO2004/074280

15 El documento JP-A-07/010841 describe derivados de 4-trifluorometilpiridina-2-carboxamida como ingredientes activos para agentes de represión de plagas tales como insecticidas, mitocidas, nematocidas y agentes de represión de plagas del suelo.

Descripción de la invención

Problemas a resolver por la invención

20 En la producción de cultivos en agricultura y horticultura, el daño por nematodos es aún grande; hay una demanda de desarrollo de un nuevo nematocida que inhiba un amplio espectro de represión de nematodos a bajas tasas de aplicación en forma de disolución para problemas tales como la aparición de resistencia a agentes existentes y el impacto en el medioambiente global. Adicionalmente, el envejecimiento de los granjeros y otros factores han conducido a una necesidad de varios métodos de aplicación con esfuerzo reducido, y hay una demanda para la creación de un nematocida que viene bien a tales métodos de aplicación. Deseando cumplir estas demandas, la presente invención proporciona el uso de una composición que comprende un derivado de N-2-

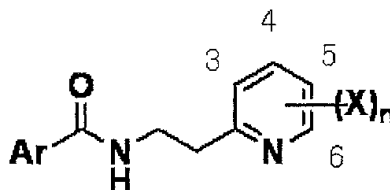
25 (piridil)etilcarboxamida o una de sus sales como ingrediente activo, como nematocida.

Medios de resolver los problemas

30 Los presentes inventores realizaron extensas investigaciones para resolver los anteriormente descritos problemas, y encontraron que un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida, que es un conocido compuesto representado por la fórmula (I), o una de sus sales exhibe excelente rendimiento para un nematocida, que dio como resultado completar la presente invención. Por consiguiente, la presente invención se refiere a:

[1] el uso de una composición, como ingrediente activo, de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I):

fórmula (I)



35 en la que,

40 Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆, y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo

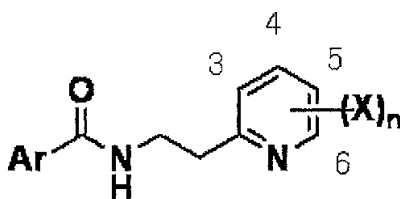
halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; y

n es el número entero de 0 a 4, o una de sus sales, como nematicida,

[2] el uso de [1], en el que Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆ y un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo halo-alquilo de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo alquilo de C₁-C₆; X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno o un grupo halo-alquilo de C₁-C₆; y n es el número entero de 0 a 3,

[3] el uso de [1], en el que la composición comprende una N-[2-(3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-il)etil]-2-trifluorometilbenzamida o una de sus sales como ingrediente activo,

[4] un método de reprimir nematodos, que comprende aplicar una cantidad efectiva de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I):



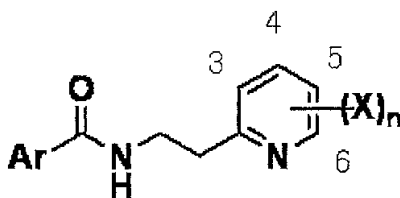
en la que,

Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆;

X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; y

n es el número entero de 0 a 4, o una de sus sales a una planta de cultivo objetivo, semillas de planta de cultivo objetivo, o suelo usado para cultivar la planta, y

[5] un uso de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I):



en la que,

Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆;

X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; y

n es el número entero de 0 a 4, o una de sus sales, como nematicida.

Efecto de la invención

- 5 Según la presente invención, es posible proporcionar un nematicida que ejerce un impacto reducido en el medioambiente global, exhibe un amplio espectro de represión de nematodos a bajas tasas de aplicación, y tiene un excelente efecto de represión de nematodos.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

- 10 Las definiciones de la fórmula (I) para un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida usado en la presente invención se describen a continuación.

"Un átomo de halógeno" se refiere a un átomo de cloro, átomo de bromo, átomo de yodo o átomo de flúor.

- 15 "un grupo alquilo de C₁-C₆" se refiere a, por ejemplo, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tal como un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo normal, grupo isopropilo, grupo butilo normal, grupo isobutilo, grupo butilo secundario, grupo butilo terciario, grupo pentilo normal, grupo neopentilo, o grupo hexilo normal.

"Un grupo halo-alquilo de C₁-C₆" se refiere a, por ejemplo, un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, sustituido con uno o más, los mismos o diferentes átomos de halógeno tal como un grupo trifluorometilo, grupo difluorometilo, grupo perfluoroetilo, grupo perfluoroisopropilo, grupo clorometilo, grupo bromometilo, grupo 1-bromoetilo, o grupo 2,3-dibromopropilo.

- 20 "Un grupo alcoxi de C₁-C₆" se refiere a, por ejemplo, un grupo alcoxi lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, tal como un grupo metoxi, grupo etoxi, grupo propoxi normal, grupo isopropoxi, grupo butoxi normal, grupo butoxi secundario, grupo butoxi terciario, grupo pentiloxi normal, grupo isopentiloxi, grupo neopentiloxi, o grupo hexiloxi normal.

- 25 "Un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆" se refiere a, por ejemplo, un grupo alcoxi lineal o ramificado tiene de 1 a 6 átomos de carbono sustituido con uno o más, los mismos o diferentes átomos de halógeno tal como un grupo trifluorometoxi, grupo difluorometoxi, grupo perfluoroetoxi, grupo perfluoroisopropoxi, grupo clorometoxi, grupo bromometoxi, grupo 1-bromoetoxi, o grupo 2,3-dibromopropoxi.

- 30 "A grupo alquiltio de C₁-C₆" se refiere a, por ejemplo, un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como un grupo metiltio, grupo etiltio, grupo propiltio normal, grupo isopropiltio, grupo butiltio normal, grupo butiltio secundario, grupo butiltio terciario, grupo pentiltio normal, grupo isopentiltio, o grupo hexiltio normal.

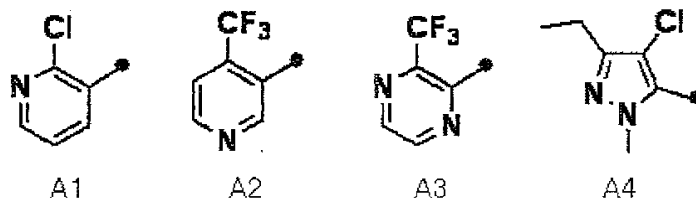
"Un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆" se refiere a un grupo alquiltio lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, sustituido con uno o más, los mismos o diferentes átomos de halógeno, por ejemplo, un grupo trifluorometiltio, grupo difluorometiltio, grupo perfluoroetiltio, grupo perfluoroisopropiltio, grupo clorometiltio, grupo bromometiltio, grupo 1-bromoetiltio, grupo 2,3-dibromopropiltio o similares.

- 35 Los ejemplos de sales de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida usado en la presente invención, representado por la fórmula (I), incluyen sales de ácidos inorgánicos tales como hidrocloruro, sulfato, nitrato, o fosfato; sales de ácidos orgánicos tales como acetato, fumarato, maleato, oxalato, metanosulfonato, bencenosulfonato, o para-toluenosulfonato; y sales con bases inorgánicas u orgánicas tales como ion sodio, ion potasio, ion calcio, o trimetilamonio.

- 40 En un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida usado en la presente invención, representado por la fórmula (I), Ar es preferentemente un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, los mismos o diferentes substituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆ y un grupo alquiltio de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, los mismos o diferentes substituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo halo-alquilo de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, los mismos o diferentes substituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo alquilo de C₁-C₆; y Ar es particular y preferentemente un grupo 2-trifluorometilfenilo. La posición de sustitución para X no está particularmente limitada, con tal de que sea sustituible en el anillo de piridina de la fórmula (I); preferentemente, la posición de sustitución es la posición 3 y la posición 5 en el anillo de piridina de la fórmula (I). X, ya sea el mismo o diferente, es preferentemente un átomo de halógeno o un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, particular y preferentemente una en la que un grupo cloro está presente en la posición 3 en el anillo de piridina de la fórmula (I), y un grupo trifluorometilo está presente en la posición 5. Preferentemente, n es el número entero de 0 a 3, particular y preferentemente 2.

Un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida usado en la presente invención, representado por la fórmula (I), es un compuesto conocido, y se puede producir según un método descrito en un documento de referencia conocido

(véase, por ejemplo, el anteriormente mencionado Documento de Patente 1 o 2). Los ejemplos específicos de tales compuestos se dan en la Tabla 1, a la que, sin embargo, la presente invención no está limitada. En la Tabla 1, "Ph" representa un grupo fenilo, y de "A1" a "A4" representa los siguientes grupos.



5 Tabla 1
Fórmula (I)

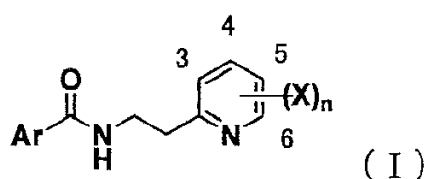


Tabla 1

compuesto No.	Ar	X	punto de fusión
1	2-Cl-Ph	3-Cl-5-CF ₃	95-96°C
2	2-Br-Ph	3-Cl-5-CF ₃	104-106°C
3	2-I-Ph	3-Cl-5-CF ₃	128-129°C
4	2-CH ₃ -Ph	3-Cl-5-CF ₃	107-109°C
5	2-CF ₃ -Ph	H	112-113°C
6	2-CF ₃ -Ph	5-CF ₃	91-92°C
7	2-CF ₃ -Ph	3-Cl-5-CF ₃	106-111°C
8	2-CH ₃ S-Ph	3-Cl-5-CF ₃	89-90°C
9	4-CF ₃ -Ph	3-Cl-5-CF ₃	151-152°C
10	2,6-F ₂ -Ph	3-Cl-5-CF ₃	98-99°C
11	2,6-Cl ₂ -Ph	3-Cl-5-CF ₃	110-111°C
12	A1	3-Cl-5-CF ₃	105-106°C
13	A2	3-Cl-5-CF ₃	140-141°C
14*	A3	3-Cl-5-CF ₃	130-131°C
15	A4	3-Cl-5-CF ₃	97-98°C

* Ejemplo de referencia

10 Los nematocidas que comprenden como ingrediente activo un derivado de N-2-(pirazolilo sustituido)etilcarboxamida de la presente invención, representado por la fórmula (I), o una de sus sales, son apropiados para la represión de nematodos en el suelo en los campos de árboles frutales, verduras, otros cultivos y plantas ornamentales.

Los ejemplos de nematodos a los que es aplicable un nematocida de la presente invención incluyen, pero no están limitados a, los nematodos del género *Meloidogyne*, tales como el nematodo sureño del nódulo de la raíz (*Meloidogyne incognita*), nematodo del nódulo de la raíz de Java (*Meloidogyne javanica*), nematodo norteño del

nódulo de la raíz (*Meloidogyne hapla*), y el nematodo del nódulo de la raíz del cacahuete (*Meloidogyne arenaria*); nematodos del género *Ditylenchus* tales como el nematodo de la pudrición de la patata (*Ditylenchus destructor*) y nematodo del bulbo y del tallo (*Ditylenchus dipsaci*); nematodos del género *Pratylenchus*, tales como el nematodo de la lesión de la raíz de la mazorca (*Pratylenchus penetrans*), nematodo de lesión de la raíz del crisantemo (*Pratylenchus fallax*), nematodo de la lesión de la raíz del café (*Pratylenchus coffeae*), nematodo de la lesión de la raíz del té (*Pratylenchus loosi*), y nematodo de la lesión de la raíz del nogal (*Pratylenchus vulnus*); nematodos del género *Globodera* tales como el nematodo dorado (*Globodera rostochiensis*) y el nematodo del quiste de la patata (*Globodera pallida*); nematodos del género *Heterodera*, tales como el nematodo del quiste de la soja (*Heterodera glycines*) y nematodo del quiste de la remolacha azucarera (*Heterodera shachtouii*); nematodos del género *Aphelenchoides* tales como el nematodo de punta blanca del arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nematodo foliar del crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*), y nematodo de la fresa (*Aphelenchoides fragariae*); nematodos del género *Aphelenchus*, tales como el nematodo micófago *Aphelenchus avenae*; nematodos del género *Radopholus*, tales como el nematodo barrenador (*Radopholus similis*); nematodos del género *Tylenchulus*, tales como el nematodo de los cítricos (*Tylenchulus semipenetrans*); nematodos del género *Rotylenchulus*, tales como el nematodo reniforme (*Rotylenchulus reniformis*); nematodos que aparecen en los árboles, tales como el nematodo de la madera de pino (*Bursaphelenchus xylophilus*). Además, una composición nematicida de la presente invención también es eficaz contra los nematodos parásitos de animales tales como áscaris, oxyurida, anisakis, filaria, *Wuchereria bancrofti*, *Onchocerca volvulus*, y *Gnathostoma*.

Las plantas para las que se puede usar un nematicida de la presente invención no están particularmente limitadas; por ejemplo, se pueden mencionar plantas tales como cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz y kaoliang, legumbres (soja, legumbre azuki, haba, guisantes y cacahuetes), árboles frutales/frutas (manzanas, cítricos, peras, uvas, melocotones, albaricoques japoneses, cerezas, nueces, almendras, plátanos y fresas), verduras (repollo, tomate, espinacas, brécol, lechuga, cebolla, cebolleta y pimiento verde), tubérculos (zanahoria, patata, batata, rábano, raíz de loto y nabo), cultivos industriales (algodón, cáñamo, morera de papel, mitsumata, colza, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, caucho, café, tabaco y té), pepónides (calabaza, pepino, sandía y melón), plantas forrajeras (pasto ovillo, sorgo, hierba timotea, trébol y alfalfa), cesped (hierba de las Mascarenas y agrostis), cultivos para saborizantes, etc. (lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta y jengibre), y plantas de flor (crisantemo, rosas y orquídeas).

En los últimos años, ha habido avances en las tecnologías de MIP (manejo integrado de plagas) usando cultivos modificados genéticamente (cultivos resistentes a los herbicidas, cultivos resistentes a las plagas de insectos que incorporan un gen de producción de proteína insecticida, cultivos resistentes a enfermedades que incorporan un gen de producción de substancia que induce resistencia a la enfermedad, cultivos con palatabilidad mejorada, cultivos con estabilidad de almacenamiento mejorada y cultivos con rendimientos mejorados), feromonas de insectos (interruptores del apareamiento de tortrícidos y noctuidos), enemigos naturales de los insectos; un nematicida de la presente invención se puede usar en combinación o sistematización con estas tecnologías.

Aunque el ingrediente activo derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida o una de sus sales, representado por la fórmula (I), se puede usar tal como está, sin la adición de otros ingredientes, normalmente es preferible que el ingrediente activo se use después de ser preparado como una formulación con una forma conveniente por un método convencional de preparar productos químicos agrícolas.

Específicamente, un derivado de N-2-(propil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I) o una de sus sales se puede mezclar en un vehículo inerte apropiado, junto con un agente auxiliar añadido según sea necesario, en una relación apropiada, y disolver, separar, suspender, mezclar, impregnar, adsorber o pegar para obtener una formulación apropiada, por ejemplo, una suspensión, emulsión, disolución, polvo humedecible, gránulos dispersables en agua, gránulos, polvo, comprimidos y paquetes.

Se puede usar cualquier vehículo inerte en la presente invención, ya sea sólido o líquido; como ejemplo de materiales que pueden servir como vehículo sólido se pueden mencionar, harina de soja, harina de cereales, harina de madera, harina de corteza, polvo de aserradero, tallos de tabaco en polvo, cáscaras de nuez en polvo, salvado, celulosa en polvo, residuos de extracción de extractos de plantas, polímeros sintéticos tales como resinas sintéticas molidas, polvos minerales inorgánicos tales como arcillas (por ejemplo, caolín, bentonita y arcilla ácida), talcos (por ejemplo, talco y pirofillita), sílices {por ejemplo, tierra de diatomeas, arena silícea, mica, carbonos blancos (ácidos silícicos sintéticos altamente dispersos también conocidos como silicio en micropolvo hidratado y ácido silícico hidratado; algunos productos que contienen silicato de calcio como ingrediente principal)}, carbón activado, azufre en polvo, piedra pómez, tierra de diatomeas quemada, ladrillos pulverizados, cenizas volantes, arena, carbonato de calcio, fosfato de calcio, vehículos plásticos tales como polietileno, polipropileno, y poli(cloruro de vinilideno), fertilizantes químicos tales como sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio y compost; éstos se usan solos o en la forma de una mezcla de dos o más tipos.

Un material que puede servir como medio líquido se selecciona de entre los que tienen solvencia por sí mismos, y los que no tienen solvencia, pero son capaces de dispersar el compuesto ingrediente activo con la ayuda de un agente auxiliar; los ejemplos representativos incluyen los siguientes vehículos, y éstos se usan solos o en forma de una mezcla de dos o más tipos; por ejemplo, se pueden mencionar agua, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil-etil-cetona, metil-isobutil-cetona, diisobutil-

5 cetona, ciclohexanona), éteres (por ejemplo, éter etílico, dioxano, cellosolve, éter dipropílico, tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, queroseno, aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente, alquilnaftaleno), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono, benceno clorado), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo, dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo) y dimetilsulfóxidos.

Como otros agentes auxiliares, se pueden mencionar los agentes auxiliares representativos mostrados como ejemplos a continuación; estos agentes auxiliares se usan según su uso previsto, solos o, en algunos casos, en combinación de dos o más de sus tipos; en algunos casos, no se necesita usar agentes auxiliares en absoluto.

10 Se usa un tensioactivo con el propósito de emulsión, dispersión, solubilización y/o humedecimiento del compuesto ingrediente activo; por ejemplo, se pueden mencionar tensioactivos tales como polioxietileno-alkuil-éteres, polioxietileno-alkuilarilo-éteres, ésteres de ácidos grasos superiores y polioxietileno, ésteres de resina ácida y polioxietileno, monolaurato de polioxietilenosorbitán, monooleato de polioxietilenosorbitán, arilsulfonatos de alquilo, productos de condensación de ácido naftalenosulfónico, lignosulfonatos y ésteres de ácido sulfúrico y alcohol superior.

15 Con el propósito de estabilización de la dispersión, cohesión y/o unión del compuesto ingrediente activo, se pueden usar también los agentes auxiliares mostrados como ejemplos a continuación; por ejemplo, se pueden usar también agentes auxiliares tales como caseína, gelatina, almidón, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, goma arábiga, poli(alcohol vinílico), trementina, aceite de salvado, bentonita y lignosulfonatos.

20 Los agentes auxiliares mostrados a continuación se pueden usar para mejorar la fluidez de productos sólidos; por ejemplo, se pueden usar agentes auxiliares tales como ceras, estearatos, y ésteres de alquilo de ácido fosfórico. Como ejemplos de desfloculantes para los productos en suspensión, se pueden usar también agentes auxiliares tales como productos de condensación de naftalenosulfonato y fosfatos condensados. Como ejemplos de agentes antiespumantes, se pueden usar también agentes auxiliares tales como aceite de silicona. Como antisépticos, se pueden añadir también 1,2-bencisotiazolin-3-ona, para-clorometaxilenol y para-oxibenzoato de butilo. Además, se pueden añadir también según sea necesario esparcidores funcionales, mejoradores de la actividad tales como inhibidores de la degradación metabólica, tales como butóxido de piperonilo, agentes anticongelantes tales como propilenglicol, antioxidantes tales como BHT (dibutilhidroxitolueno), y otros aditivos tales como absorbentes de ultravioleta.

30 La relación de mezcla de ingrediente activo se puede ajustar según sea necesario; el ingrediente activo se puede usar en cantidades elegidas como apropiadas en el intervalo de 0,01 a 90 partes en peso por 100 partes en peso de nematocida; por ejemplo, cuando el nematocida se prepara en forma de una emulsión, polvo humedecible, polvo o gránulos, la relación de mezcla es apropiadamente de 0,01 a 50% en peso. Un nematocida de la presente invención se puede usar para reprimir varios nematodos tal como está, o después de ser apropiadamente diluido o suspendido en agua. La cantidad de aplicación de un nematocida de la presente invención varía dependiendo de varios factores, por ejemplo, del uso previsto, de los nematodos a reprimir, del estado de crecimiento de los cultivos, de la tendencia de la aparición de daños, del clima, de las condiciones medioambientales, de la formulación, del método de aplicación, del lugar de aplicación, o del momento de la aplicación; la cantidad de aplicación se puede elegir según sea apropiado en el intervalo de 0,001 g a 10 kg, preferentemente de 0,01 g a 1 kg, por 10 áreas, basado en un compuesto ingrediente activo.

35 Un nematocida usado en un método de la presente invención se puede usar para controlar varios nematodos tal como está, o después de ser apropiadamente diluido o suspendido en agua, mediante la aplicación de una cantidad efectiva para reprimir varios nematodos a una planta objetivo en la que se prevé la aparición del nematodo, a sus semillas o a un vehículo de cultivo de las semillas según un método ordinario; el nematocida se puede usar por métodos de aplicación tales como la aplicación a cajas de vivero de arroz, revestimiento de semillas, desinfección de semillas, tratamiento del hoyo de siembra, tratamiento del pie de la planta, tratamiento de la fila de siembra, e incorporación al suelo; para varios nematodos que aparecen en cultivos en tierras altas de árboles frutales, cereales y verduras, el nematocida se puede aplicar por tratamientos de las semillas, tales como revestimiento e inmersión, por tratamiento de inmersión de la raíz de las plántulas, o por inyección en el suelo, pulverización de la superficie, o tratamiento de incorporación a la fila de siembra en la siembra de semillas, vehículos de cultivo de plántulas tales como vehículos de cultivo para cultivar plántulas, hoyo de siembra, o pies de planta, seguido de riego para permitir que el nematocida se absorba en la planta. El nematocida también se puede aplicar a un medio de cultivo de agua en el cultivo hidropónico.

55 El tratamiento de semillas se puede conseguir por métodos ordinarios; por ejemplo, se puede mencionar un método en el que las semillas se sumergen en una formulación líquida o sólida, en un estado líquido estando o sin estar diluidas, para permitir que el agente penetre, un método en el que se permite que una formulación sólida o formulación líquida se adhiera a las superficies de las semillas mezclándola con semillas o tratamiento de revestimiento, un método en el que una formulación se mezcla con un vehículo altamente adhesivo tal como una resina o polímero, y se reviste sobre las semillas con una sola capa o múltiples capas, un método en el que una formulación se disemina alrededor de las semillas simultáneamente a su siembra. "Semilla" para ser sometida al

tratamiento de semillas, en el sentido más amplio, tiene la misma definición que la de "un cuerpo de planta para la propagación" en la presente invención, y se entiende que incluye, además de lo que se denomina semillas, los cuerpos vegetales para la propagación vegetativa tales como bulbos, tubérculos, patata de siembra, bulbos escamosos, y tallos para esquejes.

5 "Suelo" o "vehículo de cultivo" tal como se usa en la realización de un método de la presente invención se refiere a un soporte para el cultivo de una planta, y el material para ello no está particularmente limitado, con tal de que la planta pueda crecer en el mismo; por ejemplo, lo que se denomina distintos tipos de suelo, esteras de vivero o agua están incluidos, y también se puede incluir arena, vermiculita, algodón, papel, tierra de diatomeas, agar, substancias gelatinosas, substancias poliméricas, lana de roca, lana de vidrio, virutas de madera, cortezas o piedra pómez.

10 Como ejemplos de métodos de aplicación en el suelo, se puede mencionar un método en el que una formulación líquida o sólida, estando o sin estar diluida en agua, se aplica en la proximidad de un lugar donde se coloca la planta o un lecho de vivero para cultivar plántulas, un método en el que se diseminan gránulos en la proximidad de un lugar donde se coloca la planta o un lecho de vivero, un método en el que un polvo espolvoreable, polvo humedecible, gránulos dispersables en agua o gránulos se diseminan antes de sembrar las semillas o antes del trasplante, y se
15 incorporan con todo el suelo, un método en el que un polvo, un polvo humedecible, gránulos dispersables en agua o gránulos se diseminan en el hoyo de siembra o fila de siembra antes de la siembra de las semillas o la colocación de una planta.

Para los métodos de aplicación a una caja de semillero de arroz con cáscara, un nematicida de la presente invención se puede aplicar en forma de formulaciones tales como polvo, gránulos dispersables en agua, y gránulos, aunque la elección de la formulación es variable dependiendo del momento de aplicación, por ejemplo, periodo de
20 siembra de semillas, período de invernadero o período de trasplante. Un nematicida de la presente invención también se puede aplicar por incorporación en suelo en terrazas; un polvo, gránulo o gránulos dispersables en agua se pueden incorporar en suelo en terrazas mediante, por ejemplo, la incorporación en suelo de lecho, incorporación en suelo de cobertura, o la incorporación en todo el suelo en terrazas. Simplemente, en suelo en terrazas, varias formulaciones se pueden aplicar en capas alternas. El tiempo de aplicación puede ser antes, el mismo, o después de la siembra de las semillas, y la aplicación puede tener lugar después de cubrir con tierra.

Para los cultivos de campo, por ejemplo, patata, batata, y soja, se da preferencia al tratamiento de semillas o de un vehículo de cultivo cerca de la planta en periodos de siembra de semillas y de cultivo de plántulas. Para las plantas cuyas semillas se siembran directamente en los campos, además de la aplicación directa a las semillas, es apropiado el tratamiento de un vehículo de cultivo cerca de la planta que se cultiva. Es posible el tratamiento de
30 diseminación con gránulos, tratamiento de inyección del suelo con un agente en estado líquido estando o sin estar diluido en agua.

Para tratamientos de plantas cultivadas para ser trasplantadas en periodos de siembra de semillas y cultivo de plántulas, además de la aplicación directa a las semillas, es aplicable la inyección en el suelo de un agente líquido a un lecho de vivero para cultivo de plántulas o la aplicación a gránulos. También es posible aplicar gránulos a un hoyo de siembra en el momento de la siembra, e incorporarlos en un vehículo de cultivo en la proximidad de un lugar de trasplante.

Un nematicida de la presente invención también se puede usar mezclado con otros agentes tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematicidas y plaguicidas bióticos para expandir adicionalmente la cobertura de enfermedades y plagas que son los objetivos de represión y el período apropiado de represión, o para reducir la cantidad de aplicación, y también se puede usar mezclado con herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas o fertilizantes según la situación en la que se usa el nematicida.

Los fungicidas útiles para estos propósitos incluyen, por ejemplo, azufre, sulfuro de cal, sulfato básico de cobre, iprobenfos, edifenfos, tolclofos-metilo, tiram, policarbamato, zineb, manzeb, mancozeb, propineb, tiofanato, tiofanato-metilo, benomil, acetato de iminoctadina, albesilato de iminoctadina, mepronil, flutolanil, pencicuron, furametpir, tifulzamida, metalaxil, oxadixil, carpropamid, diclofluanid, flusulfamida, clorotalonil, cresoxim metílico, fenoxanil, himexazol, eclomezol, fluoroimida, procimidona, vinclozolina, iprodiona, triadimefon, bitertanol, triflumizol, ipconazol, fluconazol, propiconazol, difenoconazol, miclobutanil, tetraconazol, hexaconazol, tebuconazol, tiadinilo, imibenconazol, procloraz, pefurazoato, ciproconazol, isoprotiolano, fenarimol, pirimetanil, mepanipirim, pirifenox, fluzinam, trifolin, diclomezina, azoxistrobina, tiadiazina, captan, probenazol, acibenzolar-S-metilo, ftalida, triclozazol, piroquilon, quinometionato, ácido oxolínico, ditianone, kasugamicina, validamicina, polioxina, blastidina y estreptomocina;

los insecticidas, acaricidas y nematicidas útiles para los mismos propósitos incluyen, por ejemplo, etión, triclorfón, metamidofos, acefato, diclorvos, mevinfos, monocrotofos, malatión, dimetoato, formotión, mecarbam, vamidotión, tiometón, disulfoton, oxideprofos, naled, paratión metílico, fenitrotión, cianofos, propafos, fentión, protiofos, profenofos, isofenfos, temefos, fentoato, dimetilvinfos, clorfenvinfos, tetraclorvinfos, foxim, isoxation, piraclofos, metidatión, clorpirifos, clorpirifos metílico, piridafentión, diazinón, pirimifos metílico, fosadona, fosmet, dioxabenzofos, quinalfos, terbufos, etoprofos, cadusafos, mesulfenfos, DPS (NK-0795),

fosfocarb, fenamifos, isoamidofos, fostiazato, isazofos, etoprofos, fenti3n, fostietan, diclofention, tionazina, sulprof3s, fensulfotion, diamidafos, piretrina, aletrina, praletrina, resmetrina, permetrina, teflutrina, bifetrina, fenpropatrina, cipermetrina, alfa cipermetrina, cihalotrina, lambda cihalotrina, deltametrina, acrinatrina, fenvalerato, esfenvalerato, cicloprotrina, etofenprox, halfenprox, silafluofeno, flucitrinato, fluvalinato, metomil, oxamil, tiodicarb, aldicarb, alanicarb, cartap, metolcarb, xilicarb, propoxur, fenoxicarb, fenobucarb, tiofencarb, fenotiocarbo, bifenazato, BPMC (2-sec-butilfenil-N-metilcarbamato), carbaril, pirimicarb, carbofurano, carbosulfano, furatiocarbo, benfuracarb, aldoxicarb, diafenturon, diflubenzuron, teflubenzur3n, hexaflumur3n, novalur3n, lufenur3n, flufenoxur3n, clorfluazuron, 3xido de fenbutatin, hidr3xido de triciclohexiltin, oleato de sodio, oleato de potasio, metopreno, hidropreno, binapacril, amitraz, dicofol, keltano, clorobencilato, fenisobromolate, tetradif3n, bensultap, benzomato, tebufenozida, metoxifenocida, piridallil, metaflumizona, flubendiamida, cromafenozida, propargita, acequinocil, endosulf3n, diofenolan, chlorofenapir, fenpiroximato, tolfenpirad, fipronil, tebufenpirad, triazamato, etoxazol, hexitiazox, sulfato de nicotinamida, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, imidacloprid, tiametoxam, clotianidina, dinotefuran, fluazinam, piriproxifeno, hidrametilnon, pirimidifen, piridaben, ciromazina, TPIC (isocianurato de tripropilo), pimetrozina, clofentezina, buprofezin, tiociclam, fenazaquin, quinometionato, indoxacarb, complejo de polinactina, milbemectin, abamectina, benzoato de emamectina, spinosad, BT (Bacillus thuringiensis), azadiractina, rotenona, hidroxipropil almid3n, hidrocloreuro de levamisol, metam sodio, tartrato de morantel, dazomet, triclamida, Pasteuria penetrans y Monacrosporium phymatopagam;

los herbicidas 3tiles para los mismos prop3sitos incluyen, por ejemplo, glifosato, sulfosato, glufosinato, bialafos, butamifos, esprocarb, prosulfocarb, bentiocarbo, piributicarb, asulam, linur3n, isouron, bensulfuron met3lico, ciclosulfamur3n, cinosulfur3n, pirazosulfur3n et3lico, azimsulfur3n, imazosulfur3n, tenilclor, alaclor, pretilaclor, clomeprop, etobenzanid, mafenacet, pendimetalina, bifenox, acifluorfen, lactofen, cihalofop but3lico, ioxinil, bromobutida, aloxidim, setoxidim, napropamida, indanofan, pirazolato, benzofenap, pirafufen-etil, imazapir, sulfentrazona, cafenstrol, pentoxazona, oxadiaz3n, paraquat, diquat, piriminobac, simazina, atrazina, dimetametrina, triaziflam, benfuresato, fluthiacet met3lico, quizalofop et3lico, bentazona y per3xido de calcio.

25 Ejemplos

La presente invenci3n se describe aqu3 a continuaci3n espec3ficamente con referencia a los siguientes Ejemplos.

En los ejemplos de obtenci3n, la(s) parte(s) indica(n) la(s) parte(s) en peso.

Ejemplo de Preparaci3n 1

30	Cada compuesto listado en la Tabla 1	10 partes
	Xileno	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
	Mezcla de polioxi-etileno-nonilfenil-3ter y alquilbencenosulfonato de calcio	10 partes

Estos ingredientes se mezclaron uniformemente y se disolvieron para obtener una emulsi3n.

Ejemplo de Preparaci3n 2

35	Cada compuesto listado en la Tabla 1	3 partes
	Polvo de arcilla	82 partes
	Polvo de tierra de diatomeas	15 partes

Estos ingredientes se mezclaron uniformemente y se molieron para obtener un polvo.

Ejemplo de Preparaci3n 3

40	Cada compuesto listado en la Tabla 1	5 piezas
	Polvo mezcla de bentonita y arcilla	90 partes
	Ligninsulfonato de calcio	5 partes

Estos ingredientes se mezclaron uniformemente, se amasaron con la adici3n de una cantidad apropiada de agua, se granularon y se secaron, para obtener gr3nulos.

45 Ejemplo de Preparaci3n 4

	Cada compuesto listado en la Tabla 1	20 partes
	Caol3n y 3cido sil3cico sint3tico muy disperso	75 partes

Mezcla de polioxietileno-nonilfenil-éter y alquilbencenosulfonato de calcio 5 partes

Estos ingredientes se mezclaron uniformemente y se molieron para obtener un polvo humedecible.

La utilidad de un nematocida de la presente invención se demuestra por medio de Ejemplos de ensayo. Los compuestos se identifican por los números de los compuestos mostrados en la Tabla 1.

5 Ejemplo de ensayo 1

Ensayo nematocida en el nematodo del nódulo de la raíz sureño (*Meloidogyne incognita*)

10 Una emulsión que comprende cada compuesto listado en la Tabla 1 como ingrediente activo se preparó como se indica en el Ejemplo de Preparación 1, y se diluyó hasta obtener concentraciones de ingrediente activo de 300 ppm y 30 ppm. Cada una de estas diluciones (1 ml) se aplicó a los pies de plántulas de melón cultivadas en maceta por inyección; 1 día después de la aplicación de la dilución, una suspensión acuosa de nematodos de nódulo de la raíz sureños (alrededor de 500 nematodos/ml) se inoculó (inyección en el suelo), a una parcela tratada y a una parcela no tratada y las macetas se colocaron en un invernadero a 25°C. Ocho días después de la inoculación, las raíces se lavaron con agua y se examinaron para ver el número de nódulos de la raíz, y los efectos se determinaron según los siguientes criterios de calificación.

15 [Criterios de calificación]

A: sin nódulos de la raíz.

B: los nódulos de la raíz están presentes, pero su número es definitivamente menor que el de parcela no tratada.

C: los nódulos de la raíz están presentes en un número equivalente o en un número mayor que el de parcela no tratada.

20 Como resultado del ensayo anteriormente descrito, los compuestos listados en la Tabla 1 exhibieron una buena actividad con la calificación A a 300 ppm; particularmente, los compuestos números 3, 7 y 12 exhibieron buena actividad con la calificación A, incluso a 30 ppm.

Ejemplo de ensayo 2

Ensayo nematocida en el nematodo del quiste de la soja (*Heterodera glycines*)

25 Un polvo humedecible que comprende cada compuesto listado en la Tabla 1 como ingrediente activo se preparó como se indica en el Ejemplo de Preparación 4, y se pesaron 75 mg y 7,5 mg de manera que el contenido de ingrediente activo fuera 15 mg y 1,5 mg por kg de suelo; estos agentes se mezclaron en suelo (1000 g) contaminado con nematodos del quiste de la soja en una bolsa de plástico. Con el suelo tratado se llenaron macetas, se sembraron semillas de soja, y las macetas se colocaron en un invernadero de vidrio. Cuarenta días después de la siembra, se retiró el suelo de las raíces, se examinó el número de quistes, y se determinó el efecto según los 30 criterios de calificación mostrados a continuación.

[Criterios de calificación]

A: sin quistes.

B: los quistes están presentes, pero su número es definitivamente menor que el de parcela no tratada.

35 C: los quistes están presentes en un número equivalente o un número mayor que el de parcela no tratada.

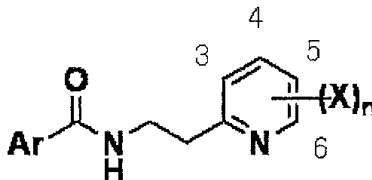
Como resultado del ensayo anteriormente descrito, los compuestos listados en la Tabla 1 exhibieron una buena actividad con la calificación A a 75 mg; particularmente, el compuesto número 7 mostró buena actividad con la calificación A, incluso a 7,5 mg.

[Aplicabilidad industrial]

40 El nematocida usado en la presente invención ejerce un impacto reducido sobre el medio ambiente global, exhibe un amplio espectro de represión de nematodos a bajas tasas de aplicación, y es útil como nematocida que tiene un excelente efecto de represión de nematodos.

REIVINDICACIONES

1. El uso de una composición que comprende, como ingrediente activo, un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I):



5

en la que,

Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyente seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆, y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alquiltio de C₁-C₆, un grupo halo-alquiltio de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ y un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆;

10

15

X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ o un grupo halo-alcoxi de C₁-C₆; y

n es el número entero de 0 a 4, o una de sus sales, como nematocida,

20

25

2. El uso según la reivindicación 1, en el que Ar es un grupo fenilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyente seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo halo-alquilo de C₁-C₆ y un grupo alquiltio de C₁-C₆; un grupo piridilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo halo-alquilo de C₁-C₆; o un grupo pirazolilo sustituido que tiene uno o más, el mismo o diferentes sustituyentes seleccionados de un átomo de halógeno y un grupo alquilo de C₁-C₆; X puede ser el mismo o diferente, y es un átomo de halógeno o un grupo halo-alquilo de C₁-C₆; y n es el número entero de 0 a 3.

3. El uso según la reivindicación 1, en el que la composición comprende una N-[2-(3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-il)etil]-2-trifluorometilbenzamida o una de sus sales como ingrediente activo.

30

4. Un método de reprimir nematodos, que comprende aplicar una cantidad efectiva de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

5. Un uso de un derivado de N-2-(piridil)etilcarboxamida representado por la fórmula (I) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 como nematocida.