

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 665 561**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/42** (2006.01)

**C07D 215/54** (2006.01)

**C07D 221/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **02.04.2013 PCT/JP2013/060061**

87 Fecha y número de publicación internacional: **09.01.2014 WO14006945**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.04.2013 E 13812665 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.03.2018 EP 2871180**

54 Título: **Derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico y bactericida que contiene el mismo como ingrediente activo**

30 Prioridad:

**04.07.2012 JP 2012150421**

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

**26.04.2018**

73 Titular/es:

**AGRO-KANESHO CO., LTD. (100.0%)  
2-19, Akasaka 4-chome Minato-ku  
Tokyo 107-0052, JP**

72 Inventor/es:

**AIZAWA RYO;  
OKADA ITARU;  
FUKUCHI TOSHIKI y  
HATAMOTO MASAHIRO**

74 Agente/Representante:

**ELZABURU, S.L.P**

ES 2 665 561 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

Derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico y bactericida que contiene el mismo como ingrediente activo

**Campo técnico**

5 La presente invención se refiere a un derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico y a un bactericida que contiene el mismo como ingrediente activo.

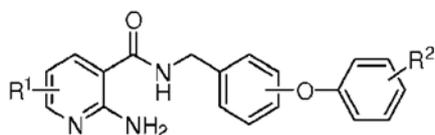
**Antecedentes de la técnica**

En el campo de la agricultura y la horticultura se han desarrollado y usado en la práctica diversos bactericidas destinados a controlar una amplia variedad de bacterias patógenas.

10 Sin embargo, los productos químicos agrícolas convencionales utilizados comúnmente no satisfacen necesariamente los requisitos de sus efectos, su espectro, sus actividades residuales y similares, ni los de reducir las frecuencias de aplicación, las dosis de aplicación y similares. Además, existe el problema de la existencia de bacterias patógenas que han desarrollado resistencia a productos químicos agrícolas convencionales utilizados comúnmente. Por ejemplo, en el cultivo de vegetales, árboles frutales, plantas con flores, plantas de té, cebadas o trigos, plantas de arroz y similares, por ejemplo, se han encontrado en diversas regiones diversas bacterias patógenas que han desarrollado resistencia a diversos tipos de bactericidas, tales como bactericidas de triazol, imidazol, pirimidina, benzimidazol, dicarboximida, fenilamida, estrobilurina y similares, y el control de estas bacterias patógenas resistentes se hace más difícil año tras año. Por consiguiente ha existido una demanda continua del desarrollo de un nuevo producto químico agrícola que presente un efecto suficiente de control sobre una amplia variedad de bacterias patógenas que hayan desarrollado resistencia a bactericidas convencionales utilizados comúnmente, que esté destinado al uso en la agricultura y la horticultura incluso en bajas dosis y que tenga una menor influencia adversa en el medio ambiente.

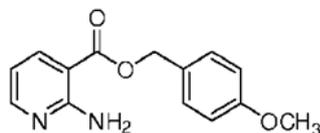
Con el fin de satisfacer estos requisitos se han propuesto diversos nuevos bactericidas, pero éstos no satisfacen necesariamente los requisitos antes descritos.

25 El Documento de Patente 1 describe un derivado de carboxamida que tiene actividad bactericida y que tiene la siguiente estructura. Sin embargo, el compuesto descrito en el Documento de Patente 1 tiene un enlace de carboxamida en la posición 3 del anillo de piridina, pero no tiene un enlace de éster.



(Documento de Patente 1)

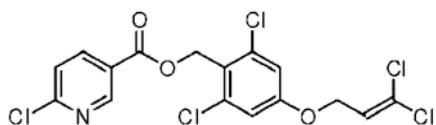
30 El Documento de Patente 2 describe el siguiente derivado de éster que tiene un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina como producto intermedio de reacción (página 265, Ejemplo 35, Compuesto nº 757). Sin embargo, este compuesto tiene un grupo metoxi, pero no un grupo fenoxi. Además, este compuesto se describe simplemente como un producto intermedio en la producción de un compuesto farmacéuticamente activo descrito en el Documento de Patente 2, y el Documento de Patente 2 no describe ninguna actividad bactericida.



35 (Documento de Patente 2, actividad farmacéutica)

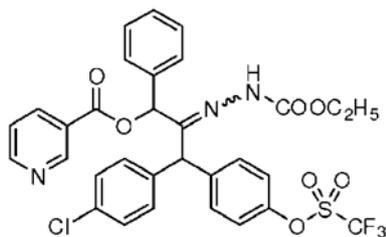
40 Los Documentos de Patente 3-6 describen, como compuestos específicamente sintetizados, derivados de éster que no tienen un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina, como se indica a continuación. Como ejemplos representativos de éstos se ejemplifican los siguientes compuestos. Se describe que estos compuestos tienen actividades insecticidas o herbicidas, pero no se describe en absoluto que estos compuestos tengan alguna actividad bactericida.

El Documento de Patente 3 describe el siguiente compuesto (página 43, Compuesto nº 1.59). Sin embargo, el Documento de Patente 3 se refiere al uso como insecticida, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina.



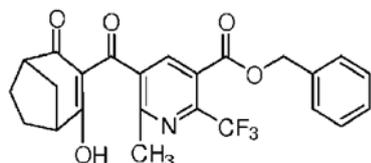
(Documento de Patente 3, actividad insecticida)

- 5 El Documento de Patente 4 describe el siguiente compuesto (página 33, Compuestos 270 y 271). Sin embargo, el Documento de Patente 4 se refiere al uso como insecticida, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina.



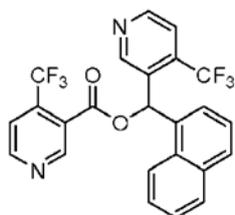
(Documento de Patente 4, actividad insecticida)

- 10 El Documento de Patente 5 describe el siguiente compuesto (página 78, Compuesto nº 1.3717). Sin embargo, el Documento de Patente 5 se refiere al uso como herbicida, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina.



(Documento de Patente 5, actividad herbicida)

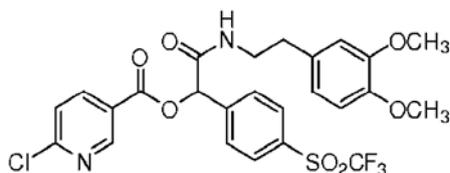
- 15 El Documento de Patente 6 describe el siguiente compuesto (página 42, Compuesto nº 229). Sin embargo, el Documento de Patente 6 se refiere al uso como herbicida, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina.



(Documento de Patente 6, actividad herbicida)

Además, el Documento de Patente 7 y el Documento de Patente 8 describen, como compuestos específicos dotados de actividades bactericidas, los siguientes compuestos.

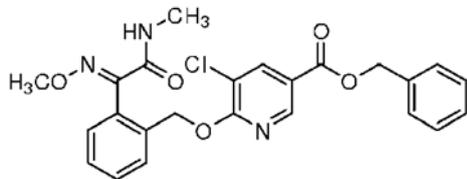
- 20 Específicamente, el Documento de Patente 7 describe el siguiente compuesto (página 50, Compuesto nº 48). Sin embargo, el Documento de Patente 7 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 en el anillo de piridina.



(Documento de Patente 7, actividad bactericida)

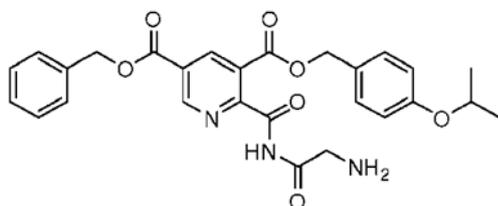
- 25 Además, el Documento de Patente 8 describe el siguiente compuesto (página 40, Compuesto Número 22). Sin embargo, el Documento de Patente 8 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del

anillo de piridina.



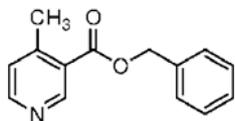
(Documento de Patente 8, actividad bactericida)

- 5 Por otra parte, los Documentos de Patente 9-14 describen específicamente los siguientes compuestos dotados de actividades farmacéuticas. En concreto, el Documento de Patente 9 describe el siguiente compuesto (página 42, Ejemplo 186). Sin embargo, el Documento de Patente 9 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina. Además, el compuesto del Documento de Patente 9 se describe sólo como sustancia farmacéuticamente activa.



- 10 (Documento de Patente 9, actividad farmacéutica)

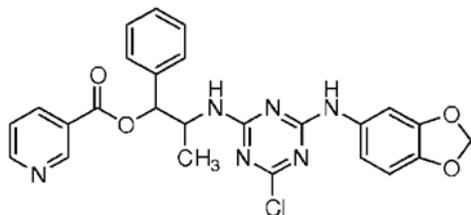
Además, el Documento de Patente 10 describe específicamente el siguiente compuesto (página 32, el compuesto de la derecha en el esquema de reacción de la etapa 3). Sin embargo, este compuesto se describe simplemente como producto intermedio de reacción, y el Documento de Patente 10 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina.



15

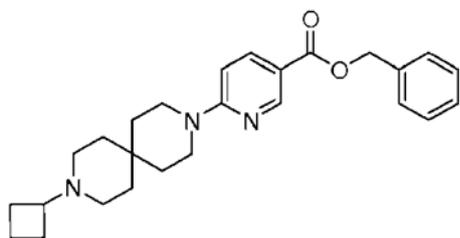
(Documento de Patente 10, actividad farmacéutica)

- 20 El Documento de Patente 11 describe el siguiente compuesto como pro-3-nicotinoilo (página 17). Sin embargo, el Documento de Patente 11 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina. Además, el compuesto del Documento de Patente 11 se describe simplemente como sustancia farmacéuticamente activa.



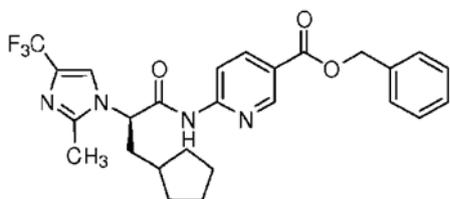
(Documento de Patente 11, actividad farmacéutica)

- 25 El Documento de Patente 12 describe el siguiente compuesto (página 51, E etapa 1). Sin embargo, el Documento de Patente 11 describe este compuesto sólo como producto intermedio, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina. Adicionalmente, el compuesto del Documento de Patente 11 se describe simplemente como sustancia farmacéuticamente activa.



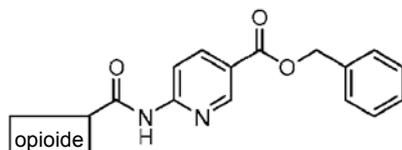
(Documento de Patente 12, actividad farmacéutica)

5 El Documento de Patente 13 describe el siguiente compuesto (página 56 (I-17b)). Sin embargo, el Documento de Patente 13 no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina. Además, el compuesto del Documento de Patente 13 se describe simplemente como sustancia farmacéuticamente activa.



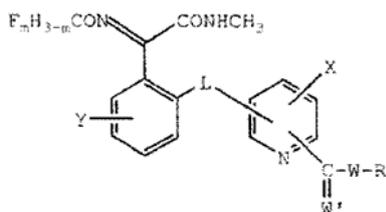
(Documento de Patente 13, actividad farmacéutica)

10 El Documento de Patente 14 describe el siguiente compuesto (página 93, el esquema de síntesis). Sin embargo, el Documento de Patente 13 describe este compuesto sólo como producto intermedio, pero no describe ningún compuesto que tenga un grupo amino en la posición 2 del anillo de piridina. Adicionalmente, el compuesto del Documento de Patente 13 se describe simplemente como sustancia farmacéuticamente activa.



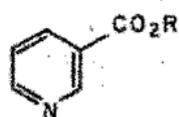
(Documento de Patente 14, actividad farmacéutica)

15 El Documento de Patente 15 describe compuestos de 2-metoxiimino-2-(piridinil-oximetil) fenil acetamida según la siguiente fórmula y su uso en composiciones fungicidas.



20 El Documento no Relacionado con Patentes 1 se refiere a un compuesto farmacéuticamente activo que se utiliza como agente terapéutico para la enfermedad de Chagas. El Documento no Relacionado con Patentes 1 describe un compuesto farmacéuticamente activo que tiene una cadena principal de fenoibenciloxi. Sin embargo, el Documento no Relacionado con Patentes 1 no describe ningún compuesto que tenga esta cadena principal en la que se haya introducido ácido 2-aminonicotínico.

El Documento no Relacionado con Patentes 2 describe ésteres de ácido de nicotina según la siguiente fórmula, siendo R un grupo C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub> alquilo, como bactericidas y fungicidas.



25

**Documentos de la técnica anterior**

Documentos de Patente

Documento de Patente 1: JP-A-2010-083861

Documento de Patente 2: WO2008/082490

5 Documento de Patente 3: WO2004/056735

Documento de Patente 4: WO2002/002515

Documento de Patente 5: WO2000/015615

Documento de Patente 6: JP-A-2004-051628

Documento de Patente 7: WO1994/029267

10 Documento de Patente 8: WO1998/033772

Documento de Patente 9: EP1995-650961

Documento de Patente 10: WO1998/057946

Documento de Patente 11: WO2003/101980

Documento de Patente 12: WO2007/133561

15 Documento de Patente 13: WO2010/029461

Documento de Patente 14: WO2011/083304

Documento de Patente 15: WO1998/33772

Documentos no Relacionados con Patentes

Documento no Relacionado con Patentes 1: Journal of Medicinal Chemistry, vol. 43, página 1.826 (2000)

20 Documento no Relacionado con Patentes 2: Tabata, Takeo: "Nicotine acid esters as a bactericide and fungicide" XP-002157344, recuperado de la BASE DE DATOS Chemical Abstracts nº de entrada 80-129249

**Compendio de la invención**

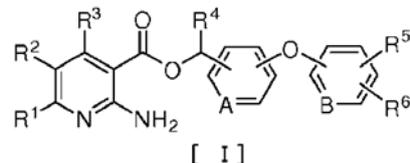
Problema que se ha de resolver

25 La presente invención es para proporcionar un nuevo compuesto útil para controlar una amplia variedad de bacterias y, en particular, para proporcionar un compuesto que presente un gran efecto de control sobre una amplia variedad de bacterias que muestran tolerancia a bactericidas convencionales, así como proporcionar un compuesto que también presente el efecto en una dosis baja y, por lo tanto, tenga una gran seguridad con menos problemas tales como toxicidad residual, contaminación ambiental y similares.

Medios para resolver el problema

30 Los presentes inventores han realizados estudios intensivos con el fin de resolver el problema antes mencionado y, como resultado, han descubierto que el derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico definido por la siguiente fórmula presenta las propiedades que pueden satisfacer los requisitos anteriormente indicados y así han completado la presente invención.

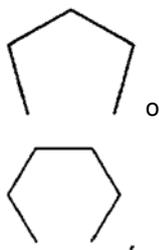
35 Es decir, la presente invención se refiere a un derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico representado por la siguiente fórmula [I]:



(en donde:

R<sup>1</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>2</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están combinados entre sí para formar el siguiente grupo:



5 R<sup>3</sup> representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>4</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo alquiltío C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un grupo haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un grupo haloalquiltío C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

10 A y B representan independientemente un grupo metino (CH) o un átomo de nitrógeno) (denominado en lo que sigue también "el presente compuesto"), así como a un bactericida que comprende el mismo como ingrediente activo.

Efectos de la invención

El presente compuesto presenta un excelente efecto sobre una amplia variedad de bacterias.

Realizaciones para llevar a cabo la invención

15 A continuación se describe la presente invención más detalladamente.

En el presente compuesto representado por la fórmula [I], los grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo y un grupo terc-butilo. Los átomos de halógeno representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

20 Los grupos alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo sec-butoxi y un grupo terc-butoxi.

Los grupos alquiltío C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo metiltío, un grupo etiltío, un grupo n-propiltío, un grupo isopropiltío, un grupo n-butiltío, un grupo isobutiltío, un grupo sec-butiltío y un grupo terc-butiltío.

25 Los grupos alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo n-propilsulfinilo, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo n-butilsulfinilo, un grupo isobutilsulfinilo, un grupo sec-butilsulfinilo y un grupo terc-butilsulfinilo.

Los grupos alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo isobutilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo y un grupo terc-butilsulfonilo.

30 Los grupos haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo monofluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo monobromometilo, un grupo dibromometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 1-bromoetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-dibromoetilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilo, un grupo 2-yodoetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3-bromopropilo, un grupo 1,3-difluoro-2-propilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 1,3-dicloro-2-propilo, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propilo, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propilo, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo heptafluoro-n-propilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo nonafluoro-n-butilo y un grupo nonafluoro-2-butilo.

35 Los grupos haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo monofluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo monoclorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo monobromometoxi, un grupo dibromometoxi, un grupo tribromometoxi, un grupo 1-fluoroetoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, un grupo 1-cloroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2,2-dicloroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo 1-bromoetoxi, un

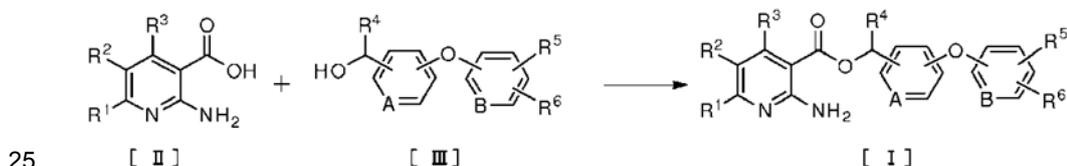
5 grupo 2-bromoetoxi, un grupo 2,2-dibromoetoxi, un grupo 2,2,2-tribromoetoxi, un grupo 2-yodoetoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 3-fluoropropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 1,3-difluoro-2-propoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo 1,3-dicloro-2-propoxi, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propoxi, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propoxi, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propoxi, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propoxi, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxi, un grupo heptafluoroisopropoxi, un grupo heptafluoro-n-propoxi, un grupo 4-fluorobutoxi, un grupo 4,4,4-trifluorobutoxi, un grupo nonafluoro-n-butoxi y un grupo nonafluoro-2-butoxi.

10 Los grupos haloalquiltío representados por R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> incluyen, por ejemplo, un grupo monofluorometiltío, un grupo difluorometiltío, un grupo trifluorometiltío, un grupo monoclorometiltío, un grupo diclorometiltío, un grupo triclorometiltío, un grupo monobromometiltío, un grupo dibromometiltío, un grupo tribromometiltío, un grupo 1-fluoroetiltío, un grupo 2-fluoroetiltío, un grupo 2,2-difluoroetiltío, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltío, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetiltío, un grupo 1-cloroetiltío, un grupo 2-cloroetiltío, un grupo 2,2-dicloroetiltío, un grupo 2,2,2-tricloroetiltío, un grupo 1-bromoetiltío, un grupo 2-bromoetiltío, un grupo 2,2-dibromoetiltío, un grupo 2,2,2-tribromoetiltío, un grupo 2-yodoetiltío, un grupo pentafluoroetiltío, un grupo 3-fluoropropiltío, un grupo 3-cloropropiltío, un grupo 3-bromopropiltío, un grupo 1,3-difluoro-2-propiltío, un grupo 3,3,3-trifluoropropiltío, un grupo 1,3-dicloro-2-propiltío, un grupo 1,1,1-trifluoro-2-propiltío, un grupo 1-cloro-3-fluoro-2-propiltío, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-propiltío, un grupo 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-cloro-2-propiltío, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropiltío, un grupo heptafluoroisopropiltío, un grupo heptafluoro-n-propiltío, un grupo 4-fluorobutiltío, un grupo 4,4,4-trifluorobutiltío, un grupo nonafluoro-n-butiltío y un grupo nonafluoro-2-butiltío.

20 Además, R<sup>4</sup> representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, y los ejemplos de los grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> incluyen grupos alquilo representados por R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup>.

El presente compuesto es un nuevo compuesto que no se ha descrito en ningún documento de la técnica anterior y puede producirse, por ejemplo, según el siguiente esquema de reacción a partir de compuestos de partida conocidos.

Esquema de reacción



(en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, A y B son lo mismo que se ha definido en la fórmula [I] anterior).

30 El derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico representado por la fórmula general [I] de la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el derivado de ácido 2-aminonicotínico representado por la fórmula general [II] con el derivado de alcohol representado por la fórmula general [III] en un disolvente inerte en presencia de un agente condensador y una base.

Los compuestos [II] y [III] son compuestos ya conocidos o compuestos que pueden ser sintetizados fácilmente por los expertos en la técnica a partir de compuestos conocidos.

35 La reacción se lleva a cabo a una temperatura de reacción en un intervalo normalmente de -20 °C - 120 °C, preferiblemente de 0 °C - 40 °C, durante un tiempo de reacción en un intervalo normalmente de 0,2 horas - 24 horas, preferiblemente de 1 hora - 5 horas. El derivado de alcohol fenoxibencílico representado por la fórmula general [III] se utiliza en un intervalo normalmente de 1 - 5 veces en moles, preferiblemente de 1 - 1,5 veces en moles, por el derivado de ácido 2-aminonicotínico representado por la fórmula general [II].

40 Los ejemplos de agentes condensadores utilizados en la reacción incluyen, por ejemplo, fosforocianurato de dietilo (DEPC, por sus siglas en inglés), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida, cloroformatos y yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, y la cantidad de agente condensador utilizada está en un intervalo normalmente de 1 - 3 veces en moles, preferiblemente de 1 - 1,5 veces en moles, por el derivado de ácido 2-aminonicotínico representado por la fórmula general [II].

45 Las bases incluyen, por ejemplo, bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio y bicarbonato de potasio; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; alcóxidos metálicos tales como t-butóxido de potasio, metóxido de sodio, etóxido de sodio; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropilamina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno; compuestos aromáticos con contenido de nitrógeno tales como piridina, y dimetilaminopiridina. La cantidad de la base utilizada está en un intervalo normalmente de 1 - 10 veces en moles, preferiblemente de 1 - 2 veces en moles, por mol del derivado de ácido 2-aminonicotínico representado por la fórmula general [II].

50 En la reacción puede utilizarse o no un disolvente, pero, si se utiliza un disolvente, el disolvente no está sometido a ninguna limitación en particular siempre que no inhiba de forma significativa la reacción. Existe una amplia variedad

de disolventes que pueden utilizarse y son ejemplos adecuados. Los disolventes que pueden utilizarse incluyen, por ejemplo, éteres catenarios o cíclicos tales como éter dimetilico, éter dietílico, éter diisopropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; nitrilos tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de metilo, acetato de etilo y acetato de butilo; disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido, y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Estos disolventes inertes pueden utilizarse solos o en una mezcla de los mismos.

Después de la reacción, el compuesto objetivo puede aislarse fácilmente del sistema de reacción que lo contiene mediante un método convencional. El compuesto objetivo puede prepararse purificándolo mediante, por ejemplo, recristalización y cromatografía en columna.

El derivado de ácido 2-aminocotínico representado por la fórmula general [II] utilizado para la reacción puede sintetizarse fácilmente a partir de un compuesto conocido, por ejemplo, según el método descrito en JP-A-2010-083861 (Documento de Patente 1).

El derivado de alcohol representado por la fórmula general [III] utilizado para la reacción puede sintetizarse fácilmente a partir de un compuesto conocido, por ejemplo, según el método descrito en Journal of Medicinal Chemistry, vol. 43, página 1.826 (2000) (Documento no Relacionado con Patentes 1).

El presente compuesto puede utilizarse para controlar enfermedades de árboles frutales, por ejemplo un aguacate, un albaricoquero, una higuera, un naranjo iyokan, un ume, un mandarino satsuma, un cerezo, un caqui, un kabosu, un kiwi, un ciruelo, un peral, un mandarino tankan, un mandarino dekopon, un peral asiático, un naranjo summer, un nectarino, un naranjo hassaku, un árbol de papaya, un níspero del Japón, un uvero de playa, un pomelo chino, un mango, un melocotonero, un cidro, un manzano y un limonero; cereales, por ejemplo una cebada, un trigo, un arroz con cáscara, un maíz, una lágrimas de Job, un centeno y "Okabo" (arroz cultivado en tierra seca); patatas, por ejemplo un boniato, una patata, una malanga y un ñame; hortalizas, por ejemplo un frijol adzuki, una fresa, una alubia, un guisante, un gombo, un nabo, una calabaza, una col, un pepino, una bardana, un caupí, un melón oriental, una sandía, un apio, un haba, un rábano, una soja, una cebolla, una remolacha azucarera, una pimienta, una calabaza de China, un tomate, una berenjena, un melón amargo, una zanahoria, un puerro, una col china, un perejil, un pimiento morrón, un estropajo, un melón y una lechuga; cultivos industriales, por ejemplo una caña de azúcar, un césped, un tabaco, un té, una colza y un lúpulo; plantas con flores, por ejemplo una hortensia, un clavel, una gerbera, una gazania, un crisantemo, un dragón, una caléndula, una salvia, una saponaria perenne, un guisante de olor, un estáctico, una saintpaulia, una dalia, un fleo, una espuela de caballero, un lisianthus, una verbena, un girasol, rosas, una begonia, una petunia, una flor de Pascua, una lila, una genciana y un romero; árboles, por ejemplo acacias, un arce, encinas, un árbol de Katsura, una paulownia, un keyaki, cerezos, chinkapines, azaleas, camelias, robles, alisos y sauces.

Las enfermedades que pueden tratarse incluyen hongos fitopatógenos, bacterias y actinomicetos e incluyen específicamente *Pyricularia oryzae*, *Cochliobolus miyabeanus*, *Rhizoctonia solani*, *Burkholderia glumae*, *Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*, *Acidovorax avenae* subsp. *avenae*, *Erinia ananas*, *Pseudomonas fuscovaginae* y *Burkholderia plantarii* de una planta de arroz; *Erysiphe graminis*, *Gibberella zeae*, *Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*, *Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*, *Ustilago tritici*, *U. nuda*, *Tilletia caries*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Rhynchosporium secalis*, *Septoria tritici*, *Leptosphaeria nodorum*, *Pyrenophora teres*, *Helminthosporium zonatum* Ikata y *Pseudomonas syringae* pv. *japonica* de cebadas o trigos; *Diaporthe citri*, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium digitatum*, *P. italicum*, *Phytophthora citrophthora*, *P. nicotianae*, *Phyllosticta citricarpa* y *Xanthomonas campestris* pv. *citri* de cítricos; *Monilinia mali*, *Valsa mali*, *Podosphaera leucotricha*, *Alternaria mali*, *Venturia inaequalis*, *Mycosphaerella pomi*, *Colletotrichum acutatum*, *Botryosphaeria berengeriana*, *Gymnosporangium yamadae* y *Monilinia fructicola* de un manzano; *Venturia nashicola*, *V. pirina*, *Alternaria kikuchiana*, *Gymnosporangium haraeum* y *Monilinia fructigena* de un peral asiático; *Monilinia fructicola*, *Cladosporium carpophilum*, *Phomopsis* sp. y *Xanthomonas campestris* pv. *pruni* de un melocotonero; *Elsinoe ampelina*, *Colletotrichum acutatum*, *Uncinula necator*, *Phakopsora ampelopsidis*, *Guignardia bidwellii*, *Plasmopara viticola*, *Monilinia fructigena*, *Cladosporium viticolum* y *Agrobacterium vitis* de un uvero de playa; *Gloeosporium kaki*, *Cercospora kaki* y *Mycosphaerella nawae* de un caqui; *Cercospora kikuchii*, *Elsinoe glycines*, *Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*, *Pseudomonas savastanoi* pv. *glycinea* y *Xanthomonas campestris* pv. *glycines* de una soja; *Colletotrichum lindemthianum*, *Pseudomonas savastanoi* pv. *phaseolicola* y *Xanthomonas campestris* pv. *phaseoli* de una alubia; *Cercospora personata* y *Cercospora arachidicola* de un cacahuete; *Erysiphe pisi* de un guisante; *Colletotrichum lagenarium*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Oidiopsis taurica*, *Didymella bryoniae*, *Fusarium oxysporum*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Phytophthora* sp., *Pythium* sp., *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans* y *Xanthomonas campestris* pv. *cucurbitae* de melones; *Alternaria solani*, *Cladosporium fulvum*, *Phytophthora infestans*, *Ralstonia solanacearum*, *Clavibacter michiganense* subsp. *michiganense*, *Pseudomonas corrugata* y *Erwinia carotovora* subsp. *carotovora* de un tomate; *Phomopsis vexans*, *Erysiphe cichoracearum* y *Ralstonia solanacearum* de una berenjena; *Alternaria japonica*, *Cercospora brassicae*, *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*, *Erwinia carotovora* subsp. *carotovora* y *Pseudomonas syringae* pv. *marginalis* de hortalizas de la familia Cruciferae; *Puccinia allii* de un puerro; *Alternaria solani*, *Phytophthora infestans*, *Rhizoctonia solani*, *Erwinia carotovora* subsp. *carotovora*, *Erwinia carotovora* subsp. *atroseptica*, *Ralstonia solanacearum*, *Streptomyces scabies* y *Streptomyces acidiscabies* de una patata; *Sphaerotheca humuli*, *Ralstonia solanacearum*, *Pseudomonas*

marginalis pv. marginalis, Xanthomonas campestris y Xanthomonas fragariae de una fresa; Exobasidium reticulatum, Elsinoe leucospila, Pseudomonas syringae pv. theae, Ralstonia solanacearum y Xanthomonas campestris pv. theicola de una planta de té; Alternaria longipes, Erysiphe cichoracearum, Colletotrichum tabacum, Peronospora tabacina, Phytophthora nicotianae y Erwinia carotovora subsp. carotovora de un tabaco; Cercospora beticola y

5 Aphanomyces cochliodes de una remolacha azucarera; Alternaria dauci, Rhizobacter dauci, Streptomyces scabies de una zanahoria; Diplocarpon rosae, Sphaerotheca pannosa y Agrobacterium tumefaciens de una rosa; Septoria chrysanthemi-indici, Puccinia horiana y Agrobacterium tumefaciens de un crisantemo; Botrytis cinerea y Sclerotinia sclerotiorum de diversos cultivos, pero las enfermedades no están limitadas a las bacterias descritas en la presente memoria.

10 El presente compuesto puede utilizarse en una amplia variedad de formulaciones. Para preparar estas formulaciones pueden utilizarse adecuadamente una amplia variedad de adyuvantes para pesticidas usados de manera convencional en el campo técnico de los bactericidas para la agricultura y la horticultura. Las formulaciones de bactericidas para la agricultura y la horticultura incluyen, por ejemplo, un concentrado emulsionable, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un polvo soluble en agua, un concentrado soluble, un polvo

15 espolvoreable, un concentrado en suspensión (fluido), un fluido seco, un gránulo fino, un gránulo, un comprimido, una solución en aceite, un propelente y un aerosol. Por supuesto pueden combinarse como ingrediente activo uno o más de los presentes compuestos.

Tales adyuvantes para pesticidas pueden utilizarse con el fin, por ejemplo, de mejorar los efectos de bactericidas para la agricultura y la horticultura, de mejorar la estabilidad y la dispersibilidad. Los adyuvantes para pesticidas

20 incluyen, por ejemplo, un vehículo (un diluyente), un esparcidor, un emulsionante, un humectante-esparcidor, un dispersante y un desintegrador. Los vehículos líquidos incluyen agua, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno y xileno, alcoholes tales como metanol, butanol y glicol, cetonas tales como acetona, amidas tales como dimetilformamida, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, metilnaftaleno, ciclohexano, aceites animales y vegetales y ácidos grasos. Además, los vehículos sólidos incluyen arcilla, caolín, talco, diatomita, sílice, carbonato de calcio, montmorillonita, bentonita, feldespato, cuarzo, alúmina, serrín, nitrocelulosa, almidón y goma arábiga.

Como emulsionante y como dispersante pueden utilizarse tensioactivos convencionales, y éstos incluyen tensioactivos aniónicos tales como sulfatos de alcoholes superiores de sodio, cloruro de estearil trimetil amonio, éteres alquil fenílicos de polioxietileno, y betaína laurílica; tensioactivos catiónicos; tensioactivos no iónicos; y tensioactivos anfóteros. Además pueden utilizarse un esparcidor; un humectante-esparcidor, tal como sulfosuccinatos dialquílicos; un ligante, tal como carboximetil celulosa y alcohol polivinílico; un desintegrador, tal como lignosulfonato de sodio, y lauril sulfato de sodio.

La cantidad del presente compuesto que ha de estar contenida en el bactericida para la agricultura y la horticultura como ingrediente activo es, por ejemplo, de un 0,01 - 99,5 % en masa, preferiblemente de un 0,5 - 90 % en masa. La cantidad puede determinarse adecuadamente basándose en diversas condiciones tales como los tipos de

35 formulación y métodos de aplicación. El bactericida para la agricultura y la horticultura puede prepararse de tal manera que contenga un ingrediente activo en una cantidad de, por ejemplo, aproximadamente un 0,5 - 20 % en masa, preferiblemente un 1 - 10 % en masa en el caso de un polvo espolvoreable, aproximadamente un 1 - 90 % en masa, preferiblemente un 10 - 80 % en masa en el caso de un polvo humectable y aproximadamente un 1 - 90 % en masa, preferiblemente un 10 - 40 % en masa en el caso de un concentrado emulsionable.

40 En el caso de un concentrado emulsionable, por ejemplo, puede prepararse un concentrado emulsionable incorporando por mezcla un disolvente y un tensioactivo al presente compuesto como ingrediente activo y a continuación puede diluirse el concentrado hasta una concentración predeterminada con agua cuando se vaya a usar para aplicarlo. En el caso de un polvo humectable, se mezclan el presente compuesto como ingrediente activo, un vehículo sólido y un tensioactivo para obtener un concentrado líquido y a continuación puede diluirse el

45 concentrado hasta una concentración predeterminada con agua cuando se vaya a usar para aplicarlo. En el caso de un polvo espolvoreable se mezclan el presente compuesto como ingrediente activo y un vehículo sólido y la mezcla resultante puede aplicarse tal cual, y en el caso de un gránulo se mezclan y se granulan el presente compuesto como ingrediente activo, un vehículo sólido y un tensioactivo para obtener una formulación que puede aplicarse tal cual. Sin embargo, en este caso los métodos para preparar las formulaciones anteriores no están limitados a los

50 descritos anteriormente y pueden ser elegidos adecuadamente por los expertos en la técnica dependiendo de los tipos de ingredientes activos y del propósito de la aplicación sin apartarse del alcance de las presentes reivindicaciones.

El bactericida para la agricultura y la horticultura puede contener además un ingrediente activo opcional tal como otro bactericida, un insecticida, un acaricida, un herbicida, un regulador del crecimiento vegetal, un fertilizante y un

55 acondicionador de terrenos, que pueden incorporarse por mezcla adicionalmente al presente compuesto como ingrediente activo. Los métodos de aplicación del bactericida que comprende el presente compuesto no están sometidos a ninguna limitación en particular y los métodos de aplicación que pueden emplearse incluyen aplicación en hojas, aplicación en tierra, ahumado en instalaciones y ahumado de tallos o troncos. Por ejemplo, en el caso de la aplicación en hojas puede utilizarse una solución en un intervalo de concentraciones, por ejemplo, de 5 - 1.000

60 ppm, preferiblemente de 10 - 500 ppm, en una cantidad aplicada de, por ejemplo, aproximadamente 50 - 700 litros por 10 áreas. En el caso de la aplicación en tierra puede utilizarse una solución en un intervalo de concentraciones

de 5 - 1.000 ppm en una cantidad aplicada de aproximadamente 0,1 - 1 litro por 1 m<sup>2</sup>.

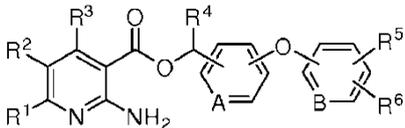
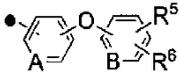
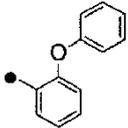
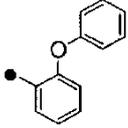
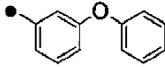
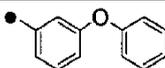
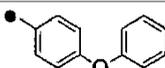
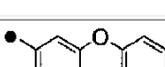
Ejemplos

5 A continuación se describe la presente invención más detalladamente haciendo referencia a Ejemplos, Ejemplos de Preparación y Ejemplos de Ensayo, pero el alcance de la presente invención no está limitado por estos Ejemplos, Ejemplos de Preparación y Ejemplos de Ensayo, sino que está definido por las presentes reivindicaciones.

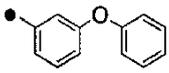
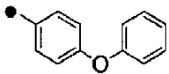
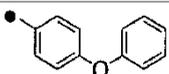
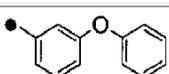
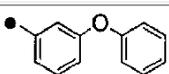
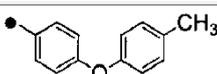
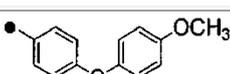
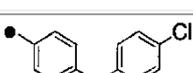
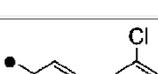
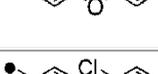
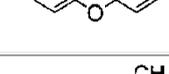
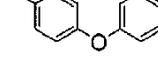
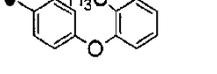
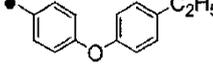
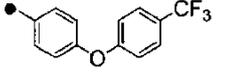
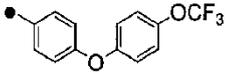
<Ejemplo 1> Síntesis de 2-aminonicotinato de 2-fenoxibencilo

10 Se añadieron 0,200 g de alcohol 2-fenoxibencilico, 0,230 g de clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida y 0,146 g de 4-dimetilaminopiridina a una solución de 0,138 g de ácido 2-aminonicotínico en cloruro de metileno y se calentó la mezcla bajo reflujo durante 3 horas. Después de enfriarla hasta la temperatura ambiente, se extrajo la mezcla con cloruro de metileno y posteriormente se extrajo la capa acuosa con cloruro de metileno. Las capas orgánicas se combinaron y se secaron sobre sulfato de sodio anhidro. Después de concentrar bajo presión reducida, el residuo resultante se purificó mediante una cromatografía en columna de gel de sílice para producir 0,180 g de Compuesto n° 1, en forma de aceite, que se describe en la Tabla 1 siguiente. Además se sintetizaron de manera similar otros compuestos de la presente invención. La Tabla 1  
15 siguiente muestra los compuestos de la presente invención que se produjeron de manera similar al Ejemplo 1.

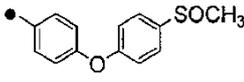
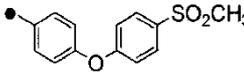
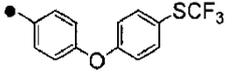
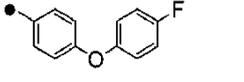
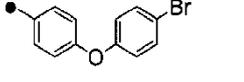
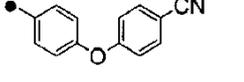
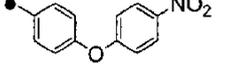
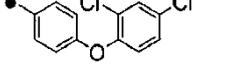
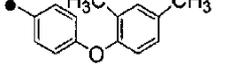
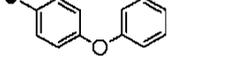
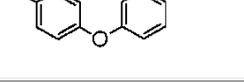
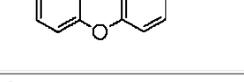
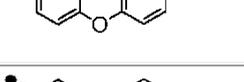
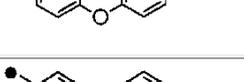
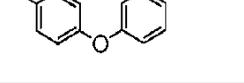
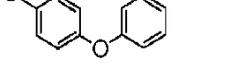
Tabla 1

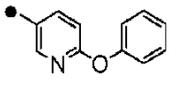
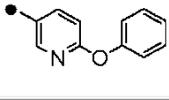
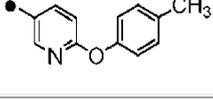
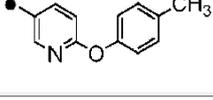
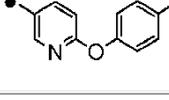
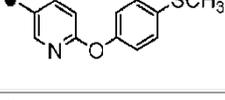
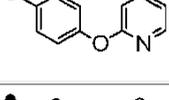
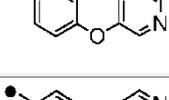
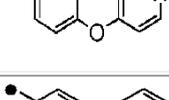
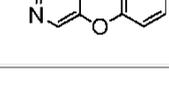
 [ I ]						
Compuesto n°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>		pf (°C)
1	H	H	H	H		Aceite <sup>1)</sup>
2	CH <sub>3</sub>	H	H	H		129-131
3	H	H	H	H		102-103
4	CH <sub>3</sub>	H	H	H		99-100
5	H	H	H	H		116-118
6	CH <sub>3</sub>	H	H	H		107-109
7	H	H	H	CH <sub>3</sub>		Aceite <sup>2)</sup>

ES 2 665 561 T3

8	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>		Aceite <sup>3)</sup>
9	H	H	H	CH <sub>3</sub>		Aceite <sup>4)</sup>
10	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>		96-97
11	H	H	H	CN		Aceite <sup>5)</sup>
12	CH <sub>3</sub>	H	H	CN		146-148
13	CH <sub>3</sub>	H	H	H		94-96
14	CH <sub>3</sub>	H	H	H		107-109
15	CH <sub>3</sub>	H	H	H		111-113
16	CH <sub>3</sub>	H	H	H		85-87
17	CH <sub>3</sub>	H	H	H		115-117
18	CH <sub>3</sub>	H	H	H		106-108
19	CH <sub>3</sub>	H	H	H		89-91
20	CH <sub>3</sub>	H	H	H		114-116
21	CH <sub>3</sub>	H	H	H		Aceite <sup>6)</sup>
22	CH <sub>3</sub>	H	H	H		129-130
23	CH <sub>3</sub>	H	H	H		161-162

ES 2 665 561 T3

24	CH <sub>3</sub>	H	H	H		166-167
25	CH <sub>3</sub>	H	H	H		153-155
26	CH <sub>3</sub>	H	H	H		106-108
27	CH <sub>3</sub>	H	H	H		104-106
28	CH <sub>3</sub>	H	H	H		133-135
29	CH <sub>3</sub>	H	H	H		136-138
30	CH <sub>3</sub>	H	H	H		118-120
31	CH <sub>3</sub>	H	H	H		143-145
32	CH <sub>3</sub>	H	H	H		122-124
33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H		111-113
34	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	H		73-75
35	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H		123-125
36	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H		87-89
37	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H		126-127
38			H	H		148-150
39			H	H		121-123

40	H	H	H	H		117-119
41	CH <sub>3</sub>	H	H	H		106-108
42	H	H	H	H		83-84
43	CH <sub>3</sub>	H	H	H		120-122
44	H	H	H	H		134-136
45	H	H	H	H		118-119
46	CH <sub>3</sub>	H	H	H		120-121
47	CH <sub>3</sub>	H	H	H		111-112
48	CH <sub>3</sub>	H	H	H		140-142
49	CH <sub>3</sub>	H	H	H		94-96

1) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 4,41 (2H, s), 6,55 (1H, m), 6,93 (3H, m), 7,08 (1H, t), 7,18 (1H, t), 7,28-7,35 (3H, m), 7,52 (1H, d), 7,98 (1H, d), 8,19 (2H, d).

5 2) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1,63 (3H, d), 6,01-6,09 (1H, q), 6,62 (1H, m), 6,91 (1H, d), 7,03 (1H, d), 7,09 (1H, s), 7,11-7,18 (1H, t), 7,29-7,38 (4H, m), 8,19 (1H, d), 8,22 (1H, d)

3) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1,64 (3H, d), 2,40 (3H, s), 6,00-6,06 (1H, q), 6,48 (1H, d), 6,92 (1H, d), 7,02 (1H, d), 7,08 (1H, s), 7,09-7,15 (1H, t), 7,30-7,38 (4H, m), 8,06 (1H, d)

4) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1,65 (3H, d), 6,07 (1H, q), 6,62 (1H, m), 7,01 (4H, m), 7,12 (1H, t), 7,31-7,41 (4H, m), 8,21 (2H, m).

10 5) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 6,47 (1H, s), 6,62 (1H, m), 7,05-7,11 (3H, m), 7,18 (1H, t), 7,22 (1H, s), 7,30-7,45 (4H, m), 8,12 (1H, d), 8,29 (1H, d).

6) <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 2,41 (3H, s), 5,31 (2H, s), 6,48 (1H, q), 7,05 (4H, m), 7,44 (2H, d), 7,59 (2H, d), 8,06 (1H, d)

15 A continuación se muestran Ejemplos de Preparación. En los Ejemplos de Preparación, las partes representan partes en masa.

Ejemplo de Preparación 1: Concentrado emulsionable

Se mezclaron y se disolvieron uniformemente un compuesto de la presente invención (10 partes), xileno (60 partes), N-metil-2-pirrolidona (20 partes) y Sorpol 3005X (una mezcla de un tensioactivo no iónico y un tensioactivo aniónico, TOHO Chemical Industry Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (10 partes) para obtener un concentrado

emulsionable.

Ejemplo de Preparación 2: Polvo humectable - 1

5 Se mezclaron y se molieron uniformemente por medio de un molino de aire el compuesto de la presente invención (20 partes), Nipsil NS-K (carbón blanco, Tosoh Silica Corporation, Japón, un nombre comercial) (20 partes), Kaolin Clay (caolinita, TAKEHARA KAGAKU KOGYO CO., LTD., Japón, un nombre comercial) (70 partes), Sanx P-252 (lignosulfonato de sodio, NIPPON PAPER INDUSTRIES CHEMICAL Div., Japón, un nombre comercial) (5 partes) y Runox P-65L (un sulfonato de alquilarilo, TOHO Chemical Industry Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (5 partes) para obtener un polvo humectable.

Ejemplo de Preparación 3: Polvo humectable - 2

10 Se mezclaron y se molieron uniformemente por medio de un molino de aire el compuesto de la presente invención (20 partes), Nipsil NS-K (20 partes), Kaolin Clay (50 partes), Runox 1000C (una sal de condensado de ácido naftalenosulfónico, TOHO Chemical Industry Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (5 partes) y Sorpol 5276 (un tensioactivo no iónico, TOHO Chemical Industry Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (5 partes) para obtener un polvo humectable.

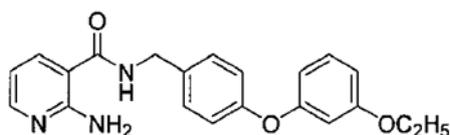
15 Ejemplo de Preparación 4: Concentrado en suspensión (fluido) - 1

20 Se dispersó el compuesto de la presente invención (20 partes) en una mezcla previamente mezclada de propilenglicol (5 partes), Sorpol 7933 (un tensioactivo aniónico, TOHO Chemical Industry Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (5 partes) y agua (50 partes) para producir una mezcla en suspensión, a continuación se molió en húmedo la mezcla en suspensión por medio de un Dyno-Mill (Shinmaru Enterprises Corporation, Japón) y se añadió al material resultante una dispersión bien premezclada de goma xantana (0,2 partes) en agua (19,8 partes) para obtener un concentrado en suspensión (fluido).

Ejemplo de Preparación 5: Concentrado en suspensión (fluido) - 2

25 Se premezclaron un compuesto de la presente invención (20 partes), Newkalgen FS-26 (una mezcla de sulfosuccinato de dioctilo y éter tristiril fenílico de polioxietileno, TAKEMOTO OIL & FAT Co., Ltd., Japón, un nombre comercial) (5 partes), propilenglicol (8 partes) y agua (50 partes) para obtener una mezcla en suspensión y a continuación se molió en húmedo la mezcla en suspensión por medio de un Dyno-Mill (Shinmaru Enterprises Corporation, Japón). A continuación se mezcló bien y se dispersó en agua (16,8 partes) goma xantana (0,2 partes) para obtener un material gelatinoso, y el material gelatinoso se mezcló suficientemente con la suspensión molida para obtener un concentrado en suspensión (fluido).

30 A continuación, los siguientes Ejemplos de Ensayo demostrarán que los presentes compuestos son útiles como ingrediente activo de un bactericida. En los Ejemplos de Ensayo, los presentes compuestos utilizados se muestran mediante sus Números de Compuesto descritos en la Tabla 1, y un compuesto utilizado como control comparativo se muestra mediante el siguiente compuesto (un compuesto descrito en los Ejemplos del Documento de Patente 1).



35 Compuesto A (Documento de Patente 1)

Ejemplo de Ensayo 1: Un ensayo en Botrytis cinerea (moho gris) de un pepino

40 Se preparó para el ensayo una planta de pepino (una variedad de planta: "Sagami Han-shiro") de 12 días después de la siembra. Se cortaron partes de cotiledones de la planta de pepino, dejando aproximadamente 2 cm de su raquis. Aparte de esto, se preparó una caja de plástico con un tamaño de 32 cm x 24 cm x 4,5 cm (longitud x anchura x altura) en cuyo fondo se colocó una toalla de papel suficientemente humedecida con agua, y sobre la toalla de papel se colocó una malla con patas. Sobre la malla se colocaron las partes cortadas de cotiledones antes descritas de tal manera que las hojas estuvieran horizontales. En la parte central de cada uno de los cotiledones se añadieron gota a gota 50 µl de una suspensión de esporas ( $1 \times 10^6$  esporas/ml) de Botrytis cinerea de un pepino. Después se cubrió cada uno de los cotiledones con un disco de papel con un diámetro de 6 mm. Aparte de esto, se diluyó con una solución acuosa de Tween 20 al 0,02 % en agua desmineralizada una emulsión preparada según el Ejemplo de Preparación 1 anterior, para preparar un diluyente con una concentración predeterminada. Se echaron gota a gota 50 µl del diluyente en cada disco de papel. Se tapó la caja de plástico y se puso ésta a 20 °C durante 72 horas y a continuación se midió el diámetro de cada lesión y se calculó la tasa de control para Botrytis cinerea (moho gris) de un pepino según la siguiente ecuación. Los resultados se muestran en la Tabla 1.

50 Tasa de control (%) =  $[1 - (\text{diámetro de lesión en zona tratada} / \text{diámetro de lesión en zona no tratada})] \times 100$

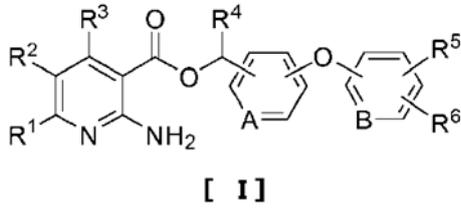
Tabla 2

Botrytis cinerea (moho gris) de un pepino		
Compuesto n°	Conc.(ppm)	Tasa de control(%)
5	25	100
6	25	100
13	25	100
14	25	100
15	25	100
17	25	100
18	25	100
19	25	100
20	25	100
27	25	100
34	25	100
35	25	100
36	25	100
40	25	100
41	25	100
43	25	100
46	25	100
47	25	100
49	25	100
A	25	54

Como se muestra en la Tabla 2 anterior, los presentes compuestos presentan una actividad bactericida mayor, en comparación con la del compuesto A.

REIVINDICACIONES

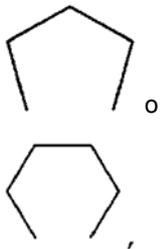
1. Un derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico representado por la siguiente fórmula [I]:



(en donde:

5  $R^1$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^2$  representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo  $C_1-C_4$ , o  $R^1$  y  $R^2$  están combinados entre sí para formar:



$R^3$  representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

10  $R^4$  representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano o un grupo alquilo  $C_1-C_4$ ,

$R^5$  y  $R^6$  representan independientemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo  $C_1-C_4$ , un grupo alcoxi  $C_1-C_4$ , un grupo alquiltío  $C_1-C_4$ , un grupo alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , un grupo alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo haloalquilo  $C_1-C_4$ , un grupo haloalcoxi  $C_1-C_4$  o un grupo haloalquiltío  $C_1-C_4$ ,

A y B representan independientemente un grupo metino (CH) o un átomo de nitrógeno).

15 2. Un bactericida que comprende el derivado de éster de ácido 2-aminonicotínico según la reivindicación 1 como ingrediente activo.