



República Federativa do Brasil
Ministério da Indústria, Comércio Exterior
e Serviços
Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 0816238-7 B1

(22) Data do Depósito: 13/08/2008

(45) Data de Concessão: 02/08/2016



(54) Título: COMPOSIÇÃO NA FORMA DE UM CONCENTRADO DE EMULSÃO, MÉTODO DE PREPARAÇÃO DE UMA COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLE DE UMA PESTE AGRÍCOLA

(51) Int.Cl.: A01N 25/02; A01N 43/36; A01N 47/30; A01N 43/653; A01N 45/02; A01N 43/70; A01N 43/54; A01N 43/56; A01N 51/00; A01N 37/34; A01N 39/02; A01N 35/10; A01N 43/90; A01P 3/00; A01P 7/04; A01P 13/02

(52) CPC: A01N 25/02; A01N 43/36; A01N 47/30; A01N 43/653; A01N 45/02; A01N 43/70; A01N 43/54; A01N 43/56; A01N 51/00; A01N 37/34; A01N 39/02; A01N 35/10; A01N 43/90

(30) Prioridade Unionista: 24/08/2007 GB 07 16592.1

(73) Titular(es): SYNGENTA LIMITED

(72) Inventor(es): GORDON ALASTAIR BELL, CLAIR LOUISE HARRIS, IAN DAVID TOVEY

"COMPOSIÇÃO NA FORMA DE UM CONCENTRADO DE EMULSÃO, MÉTODO DE PREPARAÇÃO DE UMA COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLE DE UMA PESTE AGRÍCOLA"

[001] A presente invenção refere-se a composições, particularmente para uso agroquímico, compreendendo certas lactamidas e compostos biologicamente ativos, e para métodos de preparação e emprego de tais composições. Em particular, a presente invenção refere-se à tais composições quando formuladas como, ou compreendidas por, um concentrado de emulsão (EC).

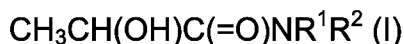
[002] Uma composição agroquímica (fungicida) compreendendo dimetillactamida e triforina é descrita em DE 41 12 873 Al.

[003] Certas lactamidas são descritas em Ratchford, W. P. e Fisher, C. H., Journal of Organic Chemistry, 1950, 15, 317-325; Ratchford, W. P., Journal of Organic Chemistry, 1950, 15, 326-332; Fein, M.L. and Filachione, E.M., Journal of the American Chemical Society, 1953, 75, 2097-2099; e US 4.143.159.

[004] Hoje em dia, a Formulation Chemist é necessária para tratar um número de critérios ambientais quando no desenvolvimento de novas formulações. Em condições ideais, um solvente adequado deve exibir muitas ou todas as propriedades resultantes: um excelente pó dissolvente para pesticidas ou outros compostos biologicamente ativos; fabricado a partir de recursos vegetais ou animais renováveis; baixa irritação na pele; uma capacidade de reduzir a irritação da pele associada com componentes agressivos da formulação, tal como, lauril sulfato de sódio; baixa ecotoxicidade, por exemplo, para dáfnia; baixo conteúdo orgânico volátil; e um ponto de fulgor elevado. As composições da presente invenção compreendem um solvente o qual exibe todas ou muitas destas propriedades atrativas.

[005] No entanto, nem todos os solventes são iguais no que diz respeito à sua capacidade de dissolver compostos biologicamente ativos — a natureza do composto e sua interação com o solvente é substancialmente decisiva. Tem sido surpreendentemente constatado que uma classe particular de solvente é surpreendentemente eficaz em dissolver uma classe particular de composto biologicamente ativo.

[006] De acordo com a presente invenção nesse ponto é obtido uma composição compreendendo um composto de fórmula I



em que R^1 e R^2 são cada qual independentemente hidrogênio; ou C_{1-6} alquila, C_{2-6} alquenila ou C_{3-6} cicloalquila, cada um dos quais é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de fenila, hidróxi, C_{1-5} alcóxi, morfolinila e NR^3R^4 em que R^3 e R^4 são cada qual independentemente C_{1-3} alquila; ou fenila opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de C_{1-3} alquila; ou R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados formam um anel de azepanila, morfolinila, pirrolidinila ou piperidinila, cada um dos quais é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de C_{1-3} alquila;

e pelo menos um composto biologicamente ativo, o qual compreende pelo menos um anel de cinco e/ ou seis membros aromáticos em que o anel contém pelo menos um nitrogênio como um membro de anel, com as condições

(i) de que a composição não contenha ciproconazol quando o composto de fórmula 1 é selecionado a partir do grupo consistindo em N-butoxipropil lactamida; 1-(hidroxietil) piperidinila lactamida; N-metil-N-propil lactamida; N-(1-etilpropil) lactamida; N,N-dimetillactamida; N-1,4-dimetilpentil lactamida; N-(2-hidroxietil)-N-benzil lactamida; N-Morfolinila lactamida; N-metil-N-butil lactamida; N-Isobutil lactamida; N-Alquila lactamida; N-Etil lactamida; N-Etil-N-(2-hidroxietil) lactamida; e N-isopropil lactamida; e

(ii) de que o composto biologicamente ativo não é ácido nicotínico quando o composto de fórmula 1 é dietillactamida .

[007] Porções e grupos de alquila são cadeias ramificadas ou lineares. Os exemplos são metila, etila, iso-propila, n-propila, n-butila, sec-butila, terc-butila, n-amila e iso-amila [3-metilbutila].

[008] Porções e grupos de alquenila podem ser na forma de cadeias ramificadas ou lineares e, quando apropriado, pode ser de qualquer das duas (E)- ou (Z)-configuração. Os exemplos são vinila e alila.

[009] Cicloalquila inclui ciclopropila, ciclopentila e ciclo-hexila.

[0010] Em um aspecto da composição, no composto de fórmula I, R^1 e R^2 são cada qual independentemente hidrogênio; ou C_{1-6} alquila que é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de fenila, hidróxi, C_{1-5} alcóxi, morfolinila e NR^3R^4 em que R^3 e R^4 são cada qual independentemente C_{1-3} alquila; ou R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados formam um anel de morfolinila que é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de C_{1-3} alquila.

[0011] Em um aspecto ainda mais adequado, R^1 e R^2 são cada qual independentemente hidrogênio; ou C_{1-6} alquila; ou R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados formam um anel de morfolinila.

[0012] Em um aspecto, além disso, ainda adequado, R^1 é metila e R^2 é metila, propila ou butila; ou R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados formam um anel de morfolinila. R^3 pode ser metila, como pode R^4 . Para cada substituinte opcional, é preferido que este seja um grupo de metila. Os grupos adequadamente de alquila são ramificados; mais adequadamente por grupos de metila.

[0013] O composto ativo na composição pode ser um agroquímico.

[0014] Em uma modalidade da composição, no composto de fórmula I, R^1 não é hidrogênio, metila, etila, propila, *n*-butila, *sec*-butila, *iso*-butila, *n*-amila, *iso*-amila, *iso*-butilenila, *n*-hexila, 1,3-dimetilbutila, alila, CH_2CH_2OH , 2-hidroxipropila, 2-hidróxi isobutila, 1,3-di-hidróxi-2-metil-2-propila, tris-hidróxi-metil-metila, $CH_2CH_2OCH_3$, ciclo-hexila, fenila, benzila, α -metilbenzila, *p*-feniletila, 3-hidroxipropila ou 1-hidróxi-2-butila quando R^2 é hidrogênio;

R^1 não é metila, alila ou fenila quando R^2 é metila;

R^1 não é etila quando R^2 é etila;

R^1 não é *n*-butila quando R^2 é *n*-butila;

R^1 não é *iso*-butila quando R^2 é *iso*-butila;

R^1 não é *n*-amila quando R^2 é *n*-amila;

R^1 não é *iso*-amila quando R^2 é *iso*-amila;

R^1 não é *n*-hexila quando R^2 é *n*-hexila;

R^1 não é alila quando R^2 é alila;

R^1 não é butila ou fenila quando R^2 é fenila;

R^1 não é benzila quando R^2 é benzila;

R^1 não é $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ou etila quando R^2 é $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$;

R^1 não é 2-hidroxipropila quando R^2 é 2-hidroxipropila; e

R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados não formam um anel não-substituído de piperidinila, pirrolidinila ou morfolinila.

[0015] A composição pode ainda compreender um solvente selecionado a partir do grupo consistindo em solventes alifáticos; parafinas de cadeia ramificada ou linear; hidrocarbonetos cíclicos; solventes aromáticos; solventes contendo fósforo; solventes contendo enxofre; solventes contendo nitrogênio; mono, di ou triésteres alifáticos; mono e di ésteres aromáticos; ésteres cíclicos; cetonas aromáticas, alifáticas ou cíclicas; alquil ciclohexanonas, dialquil cetonas, acetoacetatos, benzil cetonas; acetofenona; alcoóis; cicloalcoóis; glicóis; glicol éteres e seus polímeros; propilenoglicóis; acetatos de éter de glicol; alcoóis aromáticos; carbonatos; éteres e solventes halogenados.

[0016] Os solventes particularmente ainda preferidos são óleo branco; decalina; benzenos mono, di ou tri alquilados; Solvesso 100 ou 200ND (t); fosfato de trietila; fosfato de tributila; tri-2-etil-hexilfosfato; oleato de metila; ácido linoléico; ácido linolênico; ácido oléico; dimetil decanoamida; tetrametil sulfona; dimetil sulfoxido; alquil ureias; alcanolaminas; morfolinas; amides; alquila alcanoates, lactatos e acetoacetatos; fumaratos; succinatos; adipatos; maleatos; ésteres de ácido cítrico e glicerol; alquil benzoatos; benzil alcanoatos; alquil salicilatos; ftalatos e dibenzoatos; gama butirrolactona; caprolactona; terpeno fencone; ciclo-hexanona; alquil ciclohexanonas; 2-etil-hexanol e outros alcoóis de alquila; ciclohexanol; álcool de tetra-hidrofurfurila; etilenoglicol e propilenoglicol e seus polímeros; dipropilenoglicol; éter de monometila ou monobutila; diacetato de dipropilenoglicol ou outros acetatos de éter de glicol, ou tripropilenoglicol monobutil éter; álcool de benzila; carbonato de propileno ou butileno; dimetil isossorbeto; alcóxialca-

nóis; éter de difenila; clorobenzeno e os cloroalcanos.

[0017] O composto biologicamente ativo pode compreender um anel aromático contendo nitrogênio de cinco membros o qual pode ser selecionado a partir do grupo consistindo em pirrol, pirazol, imidazol, 1,2,3-triazoles e 1,2,4-triazol, e/ ou um anel aromático contendo nitrogênio de seis membros que podem ser selecionados a partir do grupo consistindo em piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 1,2,3-triazina, 1,2,4-triazina e 1,3,5-triazina.

[0018] No caso em que o composto é um agroquímico este pode ser selecionado a partir do grupo consistindo em inseticidas, herbicidas, acaricidas reguladores de crescimento de vegetais, nematocidas, acaricidas, ativadores vegetais e fungicidas.

[0019] O inseticida pode ser selecionado a partir do grupo consistindo em neonicotinóides, bisamidas, benzoilureias e carbamatos; o herbicida pode ser selecionado a partir do grupo consistindo em triazinas e outros inibidores do fotossistema 2, 2,6-dinitroanilinas, inibidores da ACCase, inibidores da PPO, auxinas sintéticas, sulfonil ureias, herbicidas bipyrrillium, clo-roacetanilidas, triazolopirimidinas, pirazóis e protetores herbicidas; os reguladores de crescimento de vegetais podem ser selecionados a partir do grupo consistindo em hidrazida maléico e paclobutrazol; e os fungicidas podem ser selecionados a partir do grupo consistindo em triazolopirimidinas, pirimidinas, anilinopirimidinas, triazóis e outros inibidores de demetilação de esteróis, inibidores de MAP cinase, estrobilurinas, inibidores de adenosina desaminase, pirazóis and carboxamidas.

[0020] A figura 1 mostra a estrutura de um fungicida triazolopirimidina particularmente preferido o qual pode estar presente na composição da invenção.

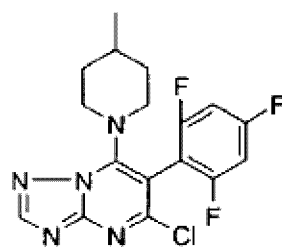


Figura 1

[0021] Os neonicotinóides podem ser tiametoxam e imidacloprida, a bisamida pode ser rinaxipir, a benzoilureia pode ser clorfluazuron, o carbamato pode ser pirimicarb; as triazinas são atrazina, simazina e cianazina, os outros inibidores do fotossistema 2 pode ser diuron, prometrina e ametrina, a 2,4-dinitroanilina pode ser fluazinam, os inibidores da ACCase podem ser fluazifop-P-butila e clodinafop propargila, o inibidor de PPO pode ser butafenacila, as auxinas sintéticas podem ser fluroxipir meptila, as sulfonilureias podem ser nicosulfuron, cinosulfuron, imazosulfuron, primisulfuron metila, prosulfuron e imazosulfuron, os herbicidas bipyrrilium podem ser paraquat e diquat, a cloroacetanilida pode ser metazaclor, as triazolopirimidinas são cloransulam metila, florasulam, e penoxsulam, o pirazol é benzofenap, o protetor herbicida pode ser cloquintocete, os reguladores de crescimento de vegetais podem ser hidrazida maléico e paclobutrazol; o ativador vegetal é acibenzolar-s-metil; as pirimidinas podem ser bupirimato, dimetirimol e etirimol, as anilinopirimidinas podem ser ciprodinila e pirimetanila, os triazóis podem ser bitertanol, diniconazol, epoxiconazol, fembuconazol, fluquinconazol, flutriafol, penconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, difenconazol, propiconazol, e hexaconazol, os outros inibidores de demetilação de esteróis são flutriafol, imazalila, e procloraz, a triazolopirimidina fungicida pode ser aquele mostrado na figura 1, o inibidor MAP cinase pode ser fludioxonila, as estrobilurinas podem ser azoxistrobina e picoxistrobina, o inibidor adenosina desaminase pode ser etirimol, o pirazol é bixafen e as carboxamidas podem ser boscalida furametpir, pentiopirad, tifluzamida, fluopiram e, em particular, o composto de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida, mostrado na figura 2 abaixo.

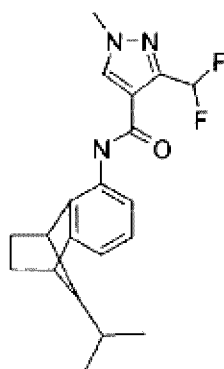


Figura 2

[0022] A figura 3 mostra a estrutura de um outro fungicida preferido o qual pode estar presente na composição da invenção

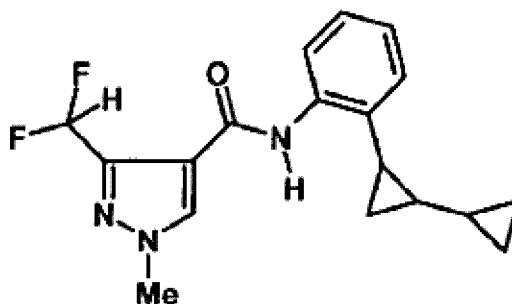


Figura 3

[0023] A composição pode ainda compreender pelo menos um composto selecionado a partir do grupo consistindo em adjuvantes, tensoativos, polímeros, agentes espessantes, matérias corantes ou pigmentos, absorvedores de luz ultravioleta, agentes antibacterianos, sais, modificadores de densidade, agentes de melhora de odor ou de mau cheiro, modificadores de sabor, cosolventes, e umectantes. O tensoativo pode ser não-iônico (por exemplo, um nonilfenol etoxilato ou um álcool etoxilato), aniônico (por exemplo, um sulfato de alquila, tal como, lauril sulfato de sódio, ou um sulfonato, tal como, dodecil benzeno sulfonato de cálcio) ou catiônico (por exemplo, uma amina terciária).

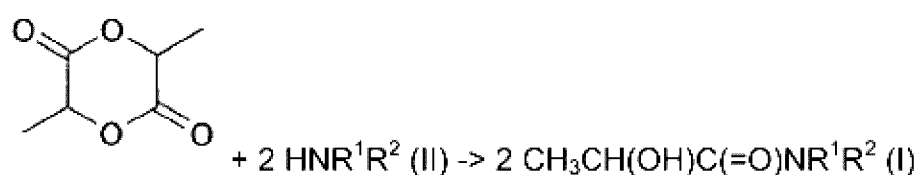
[0024] O composto de fórmula 1 pode estar presente na composição em uma quantidade entre 0,1 a 99 % em peso da composição e o composto biologicamente ativo, que é de preferência um agroquímico, pode estar presente em uma quantidade de 0,1 a 75 %, da mesma maneira em peso.

[0025] Em uma modalidade preferida da composição, o com-

posto de fórmula 1 pode estar presente em uma quantidade entre 0,1 a 99 % em peso da composição, o agroquímico pode estar presente em uma quantidade de 0,1 a 75 %, em peso e o solvente pode estar presente em uma quantidade de 0,1 a 90 %, da mesma maneira em peso.

[0026] A relação do composto de fórmula 1 do agroquímico para o solvente pode ser variada de acordo com a necessidade, uma relação de 1:1:1 ou próximo a estes limites provavelmente deve ser valiosa para muitas das formulações desejadas, de qualquer modo, os limites de cada componente pode ser tão baixo quanto 0,01:1 para a relação de qualquer das duas partes da formulação.

[0027] O componente lactamida das composições presentes pode ser preparado por reação de composto de fórmula (III) $[\text{CH}_3\text{CH}(\text{OH})\text{C}(\text{O})\text{OR}^5 \text{ (III)}]$ em que OR^5 é um grupo de saída, com um composto de fórmula (II) $[\text{HNR}^1\text{R}^2 \text{ (II)}]$ em que R^1 e R^2 são como definido acima. R^5 pode ser C_{1-4} alquila. Este processo produz HOR^5 como um subproduto; uma reação limpadora evita este subproduto: o componente lactamida da composição da presente invenção pode da mesma forma ser preparado por reagir lactídeo [3,6-dimetil-[1,4]-dioxano-2,5-diona] com um composto de fórmula (II) $[\text{HNR}^1\text{R}^2 \text{ (II)}]$ em que R^1 e R^2 são como definido acima. Esquematicamente, uma tal reação é mostrada abaixo:



[0028] A síntese não está limitada ao esquema de reação acima; isto ilustra de que modo o lactídeo [3,6-dimetil-[1,4]-dioxano-2,5-diona] pode ser convertido a uma lactamida por reagir lactídeo com uma amina [adequadamente uma amina primária ou secundária] que pode ser executado sob condições "livre de solvente" como o técnico versado deve observar.

[0029] Em uma modalidade particularmente preferida da presente composição inventiva, a proporção do composto de fórmula 1 para agroquímico para solvente é de 1:1:1 ou 2:1:1 ou 2:1:2 ou 3:1:1 ou 3:1:2 ou 4.5:1:4.5 ou 6:1:3 e em uma modalidade ainda mais particularmente preferi-

da, o composto de fórmula 1 é dimetillactamida (DML) e o agroquímico é o composto ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro -1,4-metano-naftalen-5-il)-amida mostrado na figura 2.

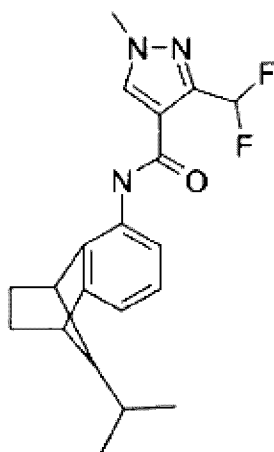


Figura 2

[0030] As modalidades específicas da presente composição compreendem de 5 a 95 % de DML, de 0,5 a 50 % da figura 2 do composto e de 5 a 95 % de um outro solvente selecionado a partir do grupo consistindo em Solvesso 200ND, dipropilenoglicol monobutil éter, diacetato de dipropilenoglicol, benzoato de metila, benzoato de benzila, dimetil decanoamida, dipropilenoglicol monometil éter e benzoato de butila.

[0031] A pessoa versada deve reconhecer que as presentes composições podem ser formuladas como concentrados de emulsão, emulsões em água ou óleo, formulações microencapsuladas, sprays de aerosol ou formulações de escurecimento; e estas podem ser ainda formuladas nos materiais granulares ou pós, por exemplo, para aplicação seca ou como formulações dispersíveis em água. As soluções desse modo formadas podem, da mesma forma, ser empregadas diretamente no solo ou vegetais ou em outras aplicações não-agroquímicas.

[0032] A forma formulada particularmente preferida da composição é como um concentrado de emulsão (EC).

[0033] A baixa toxicidade dos componentes da composição, diferente do composto biologicamente ativo no caso em que é um pesticida,

produzir a composição particularmente adequada para inclusão em, ou formulação como, cremes para pele, loções, cremes para sol, produtos para higiene pessoal e formulações farmacêuticas, tais como, comprimidos, supositórios, inaladores, poções e cremes dérmicos, dependendo da natureza do ingrediente farmacêuticamente ou cosmeticamente ativo.

[0034] As composições inventivas presentes têm uma baixa toxicidade e excelente perfil ambiental significando que são particularmente úteis em aplicações em que a minimização da poluição é desejada. Os exemplos de tais aplicações incluem fabricação de papel, tratamento de água, aplicações na área florestal, tratamentos da saúde pública, uso em piscinas municipais e outros cursos de água, em aplicações próximas a rios, lagos, reservatórios ou mares e em aplicações em que a liberação para a atmosfera tem que ser minimizada ou controlada e em que o dano para a atmosfera não é desejável. Os exemplos incluem o uso de fungicida contendo composições de acordo com a presente invenção pinturas para exterior e interior, revestimentos, esmaltes, ceras ou outras camadas protetoras ou opacificantes, corantes ou protetores; em tingimento, pigmentação ou o uso de tintas; em produtos de limpeza projetados para as aplicações industriais, casa ou jardim; e em aplicações de detergente ou de sabão para uso ambiental, casa ou industrial. As composições da presente invenção podem da mesma forma ser empregadas em xampus, e em detergentes domésticos e limpadores domésticos (por exemplo, limpadores de superfície), em que o ingrediente ativo pode ser um fungicida (possivelmente azoxistrobina) no caso de xampu ou um bactericida no caso dos detergentes e limpadores.

[0035] A presente invenção da mesma forma fornece um método de preparação da composição inventiva descrita acima por misturar um composto de fórmula 1 como indicado acima com um composto biologicamente ativo.

[0036] A presente invenção, da mesma forma, fornece um método de controle de uma peste agrícola compreendendo aplicação à peste ou à superfície a qual é capaz de estar presente em uma quantidade pesticidamente eficaz de uma composição de acordo com a invenção. A peste pode ser um fungo e o agroquímico pode ser um fungicida, em particular ácido

3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida (figura 2 acima) ou o fungicida mostrado na figura 3.

[0037] A invenção, entretanto, também fornece o uso da presente composição para controlar uma peste vegetal. Em um uso particularmente preferido, a peste é um fungo fitopatogênico, o composto de fórmula 1 é dimetillactamida, o agroquímico tem a estrutura ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida (figura 2) e a composição compreende um outro solvente selecionado a partir do grupo consistindo em Solvesso 200ND, dipropilenoglicol monobutil éter ou diacetato de dipropilenoglicol, benzoato de metila, benzoato de benzila, dimetil decanoamida, dipropilenoglicol monometil éter e benzoato de butila.

[0038] As composições da presente invenção são particularmente valiosas em formulações em que o contato com o olho ou pele humana ou animal ou são necessárias ou podem ocorrer por acidente. As aplicações tais como o uso de xampu ou fluídos para limpeza do corpo (tais como, géis de banho, lenços para corpo ou mão e lenços médicos) podem beneficiar-se a partir da natureza sem perigo deste solvente lactamida presente na composição, que pode formar parte de uma formulação de limpeza e que pode, da mesma forma, reduzir a irritação de alguns dos outros ingredientes, tais como tensoativos. Em um estilo similar a irritação da pele ou olhos causada por aplicação direta de composições farmacêuticas ou veterinárias para eles podem ser reduzido, relativo ao tipo de aplicação das composições da técnica anterior contendo os mesmos ingredientes farmacêuticamente ativos. As composições da presente invenção pode, da mesma forma, ser empregadas para propósitos antibacterianos. Os fluídos e os limpadores de mão empregados para limpeza de assoalhos, cozinhas ou veículos podem, da mesma forma, beneficiar-se a partir da redução inerente em risco associada com a natureza de segurança do solvente lactamida.

[0039] A invenção é ilustrada pelos seguintes Exemplos não limitantes.

[0040] Exemplo 1. O seguinte método geral é empregado para

medição da solubilidade das amostras de pesticida em solventes. Uma alíquota de 2 ml de solvente é adicionada um frasco de vidro de 5 ml de volume. O pesticida é adicionado de modo que metade do volume do líquido seja preenchida. A amostra é agitada durante um minuto e deixada em repouso durante 24 horas. As amostras que foram dissolvidas são preenchidas com mais pesticida, agitada e deixada durante ainda 24 horas. Este processo é continuado até que as amostras tenha equilibrado-se durante três dias sem a necessidade para outra adição do pesticida. As amostras são em seguida colocadas em um forno com temperatura controlada a 25°C durante uma semana antes de análise por cromatografia líquida de alta pressão. Todas as amostras são filtradas e centrifugadas antes da análise cromatográfica.

[0041] Dois solventes comuns empregados na indústria de pesticida são Solvesso 200 e acetofenona. Têm sido empregados para a produção de muitas formulações de concentrados de emulsão comercial. Como uma comparação da solubilidade de fludioxnila, hexaconazol, ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida (figura 2), prometrina, tiametoxam e ciprodinila, têm sido comparados nestes dois solventes a dimetillactamida. Todos estes compostos contém anéis heterocíclicos aromáticos de cinco ou seis membros. Em cada caso a solubilidade em dimetillactamida é mais vantajosa do que em ou Solvesso 200ND ou acetofenona.

Tabela 1

Solvente	Fludioxonila % em peso/ peso	Diuron % em peso/ peso	Hexaconazol	Composto da figura 2	Prometrina
Dimetillactamida	30,1	11,0	18	32,1	43
Acetofenona	8,5	4,8	11,7	14,1	19
Solvesso 200ND	0,3	<0,2*	4,4	5,6	12

-continuação-

Solvente	Epoxiconazol	Tiametoxam	Ciprodinila	Rinaxipir	Ametrina
Dimetillactamida	8,0	9,0	65,0	2,8	53,0
Acetofenona	NA	5,0	47,7	0,75	47,4
Solvesso 200ND	2,5	0,2	36,0	0,06	29,3

* A análise da cromatografia não foi viável para esta amostra. O Diuron não foi solúvel a 0,2 % em peso/peso.

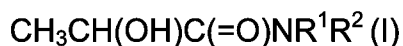
[0042] Exemplo 2. Os compostos clorotalonila, tralcoxidim e napropamida têm estruturas químicas as quais não contém anéis heterocíclicos aromáticos. A Tabela 2 exibe a solubilidade dos três solventes dimetillactamida, Solvesso 200ND e acetofenona. Em cada caso a solubilidade dos compostos em dimetillactamida é mais baixa do que aquela para os outros dois solventes.

Tabela 2

Solvente	Clorotalonila	Tralcoxidim	Napropamida
Dimetilactamida	1,6	3,2	19,2
Acetofenona	5,4	12,7	27,6
Solvesso 200ND	8,3	N/A	20,7

REIVINDICAÇÕES

1. Composição na forma de um concentrado de emulsão (EC), **caracterizada** pelo fato de que compreende um composto de fórmula I



em que R^1 e R^2 são cada um CH_3 , e pelo menos um composto biologicamente ativo, o qual compreende pelo menos um anel aromático de cinco e/ou seis membros em que o anel contém pelo menos um nitrogênio como um membro de anel, com a condição de que o composto ativo não é ciproconazol.

2. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que o composto ativo é um agroquímico.

3. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que ainda compreende um solvente selecionado a partir do grupo consistindo em solventes alifáticos; parafinas de cadeia ramificada ou linear; hidrocarbonetos cíclicos; solventes aromáticos; solventes contendo fósforo; solventes contendo enxofre; solventes contendo nitrogênio; mono, di ou triésteres alifáticos; mono e di ésteres aromáticos; ésteres cíclicos; cetonas aromáticas, alifáticas ou cíclicas; alquil ciclohexanonas, dialquil cetonas, acetoacetatos, benzil cetonas; acetofenona; alquil alcoóis; cicloalcoóis; glicóis; glicol éteres e seus polímeros; propilenoglicóis; acetatos de éter de glicol; alcoóis aromáticos; carbonatos; éteres e solventes halogenados.

4. Composição, de acordo com a reivindicação 3, **caracterizada** pelo fato de que o solvente é selecionado a partir do grupo consistindo em óleo branco; decalina; benzenos mono, di ou tri alquilados; Solvesso™ 100 ou 200ND (t); fosfato de trietila, fosfato de tributila ou tris-2-etil-hexilfosfato; oleato de metila; ácido linoléico; ácido linolênico; ácido oléico; dimetil deca-noamida; tetrametil sulfona; dimetil sulfoxido; alquil ureias; alcanolaminas; morfolinás; amidas; alquila alcenoatos, lactatos e acetoacetatos; fumaratos; succinatos; adipatos; maleatos; ésteres de ácido cítrico e glicerol; benzoatos de alquila; alcenoatos de benzila; salicilatos de alquila; ftalatos e dibenzoatos; gama butirólactona; caprolactona; terpeno fenchone; ciclo-hexanona; alquil ciclohexanonas; 2-etil-hexanol; ciclohexanol; álcool de tetra-hidrofurfurila; etilenoglicol e propilenoglicol e seus polímeros; dipropilenogli-

col; éter de monometila ou monobutila; diacetato de dipropilenoglicol, ou tripropilenoglicol monobutil éter; álcool de benzila; carbonato de propileno ou butileno; isossorbeto de dimetila; alcoxialcanóis; éter de difenila; clorobenzeno e cloroalcanos.

5. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que o anel aromático contendo nitrogênio de cinco membros é selecionado a partir do grupo consistindo em pirrol, pirazol, imidazol, 1,2,3-triazóis e 1,2,4-triazol.

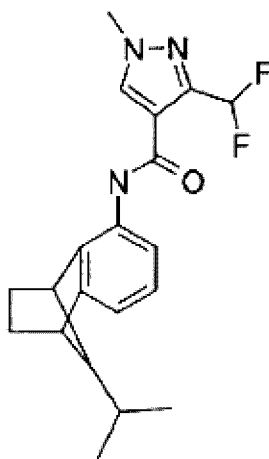
6. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que o anel aromático contendo nitrogênio de seis membros é selecionado a partir do grupo consistindo em piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, 1,2,3-triazina, 1,2,4-triazina e 1,3,5-triazina.

7. Composição, de acordo com a reivindicação 2, **caracterizada** pelo fato de que o agroquímico é selecionado a partir do grupo consistindo em inseticidas, herbicidas, reguladores de crescimento de vegetais, ativadores vegetais, acaricidas, nematocidas, miticidas e fungicidas.

8. Composição, de acordo com a reivindicação 7, **caracterizada** pelo fato de que o inseticida é selecionado a partir do grupo consistindo em neonicotinóides, bisamidas, benzoilureias e carbamatos; o herbicida é selecionado a partir do grupo consistindo em triazinas e outros inibidores do fotossistema 2, 2,6-dinitroanilinas, inibidores da ACCase, inibidores de PPO, auxinas sintéticas, sulfonil ureias, herbicidas *bipyrrillium*, cloroacetanilidas, triazolopirimidinas, pirazóis e protetores herbicidas; os reguladores de crescimento de vegetais são selecionados a partir do grupo consistindo em hidrazida maléico e paclobutrazol; e os fungicidas são selecionados a partir do grupo consistindo em pirimidinas, anilinopirimidinas, triazóis e outros inibidores de demetilação de esterol, triazolopirimidinas inibidores de MAP cinase, estrobilurinas, inibidores de adenosina desaminase, pirazóis e carboxamidas.

9. Composição, de acordo com a reivindicação 8, **caracterizada** pelo fato de que neonicotinóides são tiametoxam e imidacloprida, a bisamida é rinaxipir, a benzoilureia é clorfluazuron, o carbamato é pirimicarb; as triazinas são atrazina, simazina e cianazina, e os outros inibidores do fotossiste-

ma 2 são diuron, prometrina e ametrina, o 2,4-dinitroanilina é fluazinam, os inibidores de ACCase são fluazifop-P-butil e clodinafop propargila, o inibidor de PPO é butafenacila, as auxinas sintéticas são fluroxipir meptila, as sulfonilureias são nicosulfuron, cinosulfuron, imazosulfuron, primisulfuron metila, prosulfuron e imazosulfuron, os herbicidas *bipyrrillium* são paraquat e diquat, a cloroacetanilida é metazaclor, as triazolopirimidinas são cloransulam metila, florasulam, e penoxsulam, o pirazol é benzofenap, o protetor herbicida é cloquintocete, os reguladores de crescimento de vegetais são hidrazida málico e paclobutrazol; o ativador vegetal é acibenzolar-s-metila, as pirimidinas são bupirimato, dimetirimol e etirimol, as anilinopirimidinas são ciprodinila e pirimetanila, os triazóis são bitertanol, diniconazol, epoxiconazol, fembuconazol, fluquinconazol, flutriafol, penconazol, tebuconazol, triadimefona, triadimenol, difenoconazol, propiconazol, e hexaconazol, os outros inibidores de demetilação de esterol são flutriafol, imazalila, e procloraz, o inibidor MAP cinase é fludioxonila, as estrobilurinas são azoxistrobina e picoxistrobina, o inibidor de adenosina desaminase é etirimol, o pirazol é bixafen e as carboxamidas são boscalida furametpir, pentiopirad, tfluzamida, fluopiram e composto de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida:



10. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que ainda compreende pelo menos um composto selecionado a partir do grupo consistindo em adjuvantes, tensoativos, polímeros, agentes espessantes, matérias corantes ou pigmentos, absorvedores de luz ultravioleta, agentes antibacterianos, sais, modificadores de densidade,

agentes de melhora de odor ou de mau cheiro, modificadores de sabor, co-solventes, e umectantes.

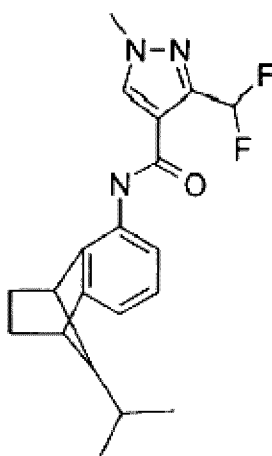
11. Composição, de acordo com a reivindicação 2, **caracterizada** pelo fato de que o composto de fórmula 1 está presente em uma quantidade entre 0,1 a 99 % em peso da composição e o agroquímico está presente em uma quantidade de 0,1 a 75 %, da mesma maneira em peso.

12. Composição, de acordo com a reivindicação 2, **caracterizada** pelo fato de que o composto de fórmula 1 está presente em uma quantidade entre 0,1 a 99 % em peso da composição, o agroquímico está presente em uma quantidade de 0,1 a 75 % em peso e o solvente está presente em uma quantidade de 0,1 a 90 %, da mesma maneira em peso.

13. Composição, de acordo com a reivindicação 12, **caracterizada** pelo fato de que a relação do composto de fórmula 1 para agroquímico para solvente é definida dentro dos limites de 0,01 a 1 : 0,01 a 1 : 0,01 a 1.

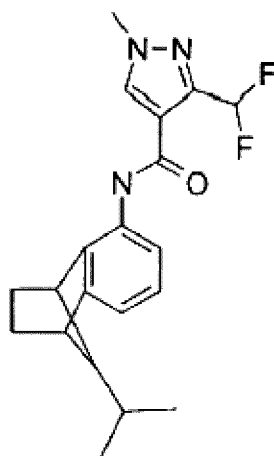
14. Composição, de acordo com a reivindicação 12, **caracterizada** pelo fato de que a relação do composto de fórmula 1 para agroquímico para o solvente é de 1:1:1 ou 2:1:1 ou 2:1:2 ou 3:1:1 ou 3:1:2 ou 4.5:1:4.5 ou 6:1:3.

15. Composição, de acordo com a reivindicação 1, **caracterizada** pelo fato de que o composto de fórmula 1 é dimetillactamida e o agroquímico é ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida:



16. Composição, de acordo com a reivindicação 15, **caracterizada** pelo fato de que compreende de 5 a 95 % de DML, 0,5 a 50 % de áci-

do 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida:



e de 5 a 95 % do solvente selecionado a partir do grupo consistindo nos solventes de acordo com a reivindicação 3.

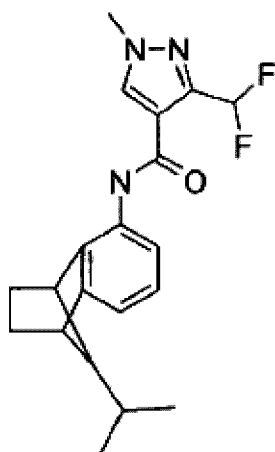
17. Composição, de acordo com reivindicação 16, **caracterizada** pelo fato de que o solvente é selecionado a partir do grupo consistindo em SolvessoTM 200ND, dipropilenoglicol monobutil éter, diacetato de dipropilenoglicol, benzoato de metila, benzoato de benzila, dimetil decanoamida, dipropilenoglicol monometil éter e benzoato de butila.

18. Método de preparação de uma composição conforme definida na reivindicação 1, **caracterizado** pelo fato de que compreende misturar um composto de fórmula 1 conforme definido na reivindicação 1, com um agente biologicamente ativo conforme definido na reivindicação 1.

19. Método de controle de uma peste agrícola **caracterizada** pelo fato de que compreende a aplicação à peste ou à uma superfície em que é capaz de estar presente em uma quantidade pesticidamente eficaz de uma composição conforme definida na reivindicação 1.

20. Método, de acordo com a reivindicação 19, **caracterizado** pelo fato de que a peste é um fungo e o agroquímico é um fungicida.

21. Método, de acordo com a reivindicação 20, **caracterizado** pelo fato de que o fungicida é ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida):



RESUMO

"COMPOSIÇÃO NA FORMA DE UM CONCENTRADO DE EMULSÃO, MÉTODO DE PREPARAÇÃO DE UMA COMPOSIÇÃO E MÉTODO DE CONTROLE DE UMA PESTE AGRÍCOLA"

A presente invenção refere-se a uma composição compreendendo um composto de fórmula (I) $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OH})\text{C}(=\text{O})\text{NR}^1\text{R}^2$ em que R^1 e R^2 são cada qual independentemente hidrogênio; ou C_{1-6} alquila, C_{2-6} alquenila ou C_{3-6} cicloalquila, cada um dos quais é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de fenila, hidróxi, C_{1-5} alcóxi, morfolinila e NR^3R^4 em que R^3 e R^4 são cada qual independentemente C_{1-3} alquila; ou fenila opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de C_{1-3} alquila; ou R^1 e R^2 juntos com o átomo de nitrogênio ao qual eles estão ligados formam um anel de azepanila, morfolinila, pirrolidinila ou piperidinila, cada um dos quais é opcionalmente substituído por até três substituintes independentemente selecionados a partir de C_{1-3} alquila; e pelo menos um composto biologicamente ativo, o qual compreende pelo menos um anel de cinco e/ ou seis membros aromáticos em que o anel contém pelo menos um nitrogênio como um membro de anel, com as condições (i) de que a composição não contenha ciproconazol quando o composto de fórmula (1) é selecionado a partir do grupo consistindo em N-butoxipropil lactamida; 1-(hidroxietil) piperidinila lactamida; N-metil-N-propil lactamida; N-(1-etilpropil) lactamida; N,N-dimetillactamida; N-1,4-dimetilpentil lactamida; N-(2-hidroxietil)-N-benzil lactamida; N-Morfolinila lactamida; N-metil-N-butil lactamida; N-Isobutil lactamida; N-Alila lactamida; N-Etil lactamida; N-Etil-N-(2-hidroxietil) lactamida; e N-isopropil lactamida; e (ii) de que o composto biologicamente ativo não é ácido nicotínico quando o composto de fórmula (1) é dietil lactamida. Tais composições podem ser, ou podem ser compreendidas por, concentrados de emulsão, particularmente assim, no caso, em que o composto de fórmula (I) é dimetillactamida e o composto biologicamente ativo é o fungicida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico de (9-isopropil-1,2,3,4-tetra-hidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida mostrado na figura 2.