

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

(21) **PI 0614199-4 A2**

(22) Data de Depósito: 01/08/2006
(43) Data da Publicação: 21/11/2012
(RPI 2185)



(51) *Int.Cl.:*
A01N 43/54

(54) Título: MÉTODO PARA DESSECAR OU DESFOLHAR SAFRAS RESISTENTES A GLIFOSATO, E, USO DE UMA 3-FENILURACILA

(30) Prioridade Unionista: 01/08/2005 US 60/703892

(73) Titular(es): BASF AKTIENGESELLSCHAFT

(72) Inventor(es): Dan E. Westberg, Glenn W. Oliver, John Harden, Jonh Bradley Guice, Rick Evans

(74) Procurador(es): Momsen, Leonardos & CIA.

(86) Pedido Internacional: PCT EP2006007615 de 01/08/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/014759de 08/02/2007

(57) Resumo: MÉTODO PARA DESSECAR OU DESFOLHAR SAFRAS RESISTENTES A GLIFOSATO, E, USO DE UMA 3-FENILURACILA. A presente invenção diz respeito ao uso de 3-feniluracilas da fórmula I em que as várias R1 e R7 são da forma definida na descrição, opcionalmente em combinação com glifosato, opcionalmente em combinação com auxiliares de colheita C para dessecação ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato.

“MÉTODO PARA DESSECAR OU DESFOLHAR SAFRAS RESISTENTES A GLIFOSATO, E, USO DE UMA 3-FENILURACILA”

A presente invenção diz respeito a um método de dessecação e/ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato.

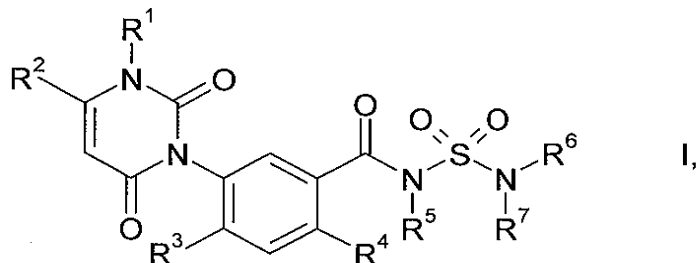
5 Dessecação e/ou desfolhamento de safras é uma prática de pré-colheita padrão em certas safras, tais como de algodão ou batata, para aumentar eficiência da colheita e qualidade da safra. Glifosato é usado como um agente desfolhante em certas safras, tal como de algodão, para prevenir rebrota de algodão. Infelizmente, o uso freqüente de safras resistentes a
10 glifosato elimina o uso de glifosato como um agente desfolhante em tais safras. Existe assim uma necessidade de um método efetivo e eficiente para a dessecação e/ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato.

 Feniluracilas são conhecidas por serem herbicidas úteis. O uso de herbicidas feniluracilas como dessecantes e/ou auxiliares de colheita é
15 revelado em WO 01/83459. Além disso, sabe-se de WO 03/24221 que combinações que compreendem feniluracilas e outros herbicidas incluindo glifosato e/ou certos protetores de cultura apresentam atividade sinergisticamente maior. WO 04/080183 revela combinações das ditas feniluracilas com certos outros herbicidas que têm maior atividade herbicida e
20 maior compatibilidade com plantas úteis.

 Surpreendentemente, observou-se recentemente que feniluracilas da fórmula I ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos, opcionalmente na presença de glifosato ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos, opcionalmente em combinação com pelo menos um agente
25 desfolhante, são efetivas para a dessecação e/ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato. Em particular, observou-se que combinações de feniluracilas da fórmula I ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos e glifosato ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos, opcionalmente em combinação com pelo menos um agente desfolhante, são sinergisticamente

efetivos na dessecação e/ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato.

A presente invenção, portanto, diz respeito a um método de dessecação e/ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato, que compreendem permitir que uma quantidade efetiva de um 3-feniluracila da fórmula I (componente A)



em que, as variáveis R^1 a R^7 são da forma definida a seguir:

R^1 é metila ou NH_2 ;

R^2 é haloalquila C_1-C_2 ;

R^3 é hidrogênio ou halogênio;

R^4 é halogênio ou ciano;

R^5 é hidrogênio ou alquila C_1-C_6 ;

R^6, R^7 independentemente um do outro são hidrogênio, alquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , cicloalquila C_3-C_7 , cicloalquenila C_3-C_7 , fenila ou benzila;

ou um sal agricolamente aceitável dos mesmos atuam nas safras resistentes a glifosato.

As frações orgânicas mencionadas na definição dos substituintes R^2, R^5, R^6, R^7 na fórmula I são - como o termo halogênio - termos coletivos para enumerações individuais dos membros do grupo individuais. Todas as cadeias de hidrocarboneto, isto é, todos os grupos alquila, haloalquila, cicloalquila, alcóxi, cicloalquenila, alquenila e alquinila podem ser cadeia reta ou ramificada, o prefixo C_n-C_m denota em cada caso o possível número de átomos de carbono no grupo. Substituintes halogenados carregam preferivelmente um, dois, três, quatro ou cinco átomos de halogênio idênticos ou diferentes. O termo halogênio denota em cada caso flúor, cloro,

bromo ou iodo.

Exemplos de tais significados são:

- alquila C_1-C_6 : alquila C_1-C_4 tais como CH_3 , C_2H_5 , n-propila, $CH(CH_3)_2$, n-butila, $CH(CH_3)-C_2H_5$, $CH_2-CH(CH_3)_2$, $C(CH_3)_3$, e também, por exemplo, n-pentila, 1-metilbutila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 2,2-dimetilpropila, 1-etilpropila, n-hexila, 1,1-dimetilpropila, 1,2-dimetilpropila, 1-metilpentila, 2-metilpentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 1,1-dimetilbutila, 1,2-dimetilbutila, 1,3-dimetilbutila, 2,2-dimetilbutila, 2,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, 1-etilbutila, 2-etilbutila, 1,1,2-trimetilpropila, 1,2,2-trimetilpropila, 1-etil-1-metilpropila ou 1-etil-2-metilpropila, preferivelmente metila, etila, n-propila, 1-metiletila, n-butila, 1,1-dimetiletila, n-pentila ou n-hexila;
- haloalquila C_1-C_2 —; radical um metila ou etila, que é parcial ou totalmente substituído por flúor, cloro, bromo e/ou iodo, por exemplo, CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CH_2Cl , diclorometila, triclorometila, clorofluorometila, diclorofluorometila, clorodifluorometila, 2-fluoretila, 2-cloroetila, 2-bromoetila, 2-iodoetila, 2,2-difluoretila, 2,2,2-trifluoretila, 2-cloro-2-propila, 2-cloro-2,2-difluoretila, 2,2-dicloro-2-fluoretila, 2,2,2-tricloroetila, C_2F_5 ;
- alcóxi C_1-C_4 : OCH_3 , OC_2H_5 , n-propóxi, $OCH(CH_3)_2$, n-butóxi, $OCH(CH_3)-C_2H_5$, $OCH_2-CH(CH_3)_2$ ou $OC(CH_3)_3$, preferivelmente OCH_3 , OC_2H_5 ou $OCH(CH_3)_2$;
- alcóxi C_1-C_6 : um radical alcóxi C_1-C_4 mencionado anteriormente, e também, por exemplo, pentóxi, 1-metilbutóxi, 2-metilbutóxi, 3-metoxilbutóxi, 1,1-dimetilpropóxi, 1,2-dimetilpropóxi, 2,2-dimetilpropóxi, 1-etilpropóxi, hexóxi, 1-metilpentóxi, 2-metilpentóxi, 3-metilpentóxi, 4-metilpentóxi, 1,1-dimetilbutóxi, 1,2-dimetilbutóxi, 1,3-dimetilbutóxi, 2,2-dimetilbutóxi, 2,3-dimetilbutóxi, 3,3-dimetilbutóxi, 1-etilbutóxi, 2-etilbutóxi, 1,1,2-tri-metilpropóxi, 1,2,2-trimetilpropóxi, 1-etil-1-metilpropóxi e 1-etil-2-

metilpropóxi;

- alquenila C_3-C_6 : prop-1-en-1-ila, alila, 1-metiletenila, 1-buten-1-ila, 1-buten-2-ila, 1-buten-3-ila, 2-buten-1-ila, 1-metilprop-1-en-1-ila, 2-metilprop-1-en-1-ila, 1-metilprop-2-en-1-ila, 2-metilprop-2-en-1-ila, n-penten-1-ila, n-penten-2-ila, n-penten-3-ila, n-penten-4-ila, 1-metilbut-1-en-1-ila, 2-metilbut-1-en-1-ila, 3-metilbut-1-en-1-ila, 1-metilbut-2-en-1-ila, 2-metilbut-2-en-1-ila, 3-metilbut-2-en-1-ila, 1-metilbut-3-en-1-ila, 2-metilbut-3-en-1-ila, 3-metilbut-3-en-1-ila, 1,1-dimetilprop-2-en-1-ila, 1,2-dimetilprop-1-en-1-ila, 1,2-dimetilprop-2-en-1-ila, 1-etilprop-1-en-2-ila, 1-etilprop-2-en-1-ila, n-hex-1-en-1-ila, n-hex-2-en-1-ila, n-hex-3-en-1-ila, n-hex-4-en-1-ila, n-hex-5-en-1-ila, 1-metilpent-1-en-1-ila, 2-metilpent-1-en-1-ila, 3-metilpent-1-en-1-ila, 4-metilpent-1-en-1-ila, 1-metilpent-2-en-1-ila, 2-metilpent-2-en-1-ila, 3-metilpent-2-en-1-ila, 4-metilpent-2-en-1-ila, 1-metilpent-3-en-1-ila, 2-metilpent-3-en-1-ila, 3-metilpent-3-en-1-ila, 4-metilpent-3-en-1-ila, 1-metilpent-4-en-1-ila, 2-metilpent-4-en-1-ila, 3-metilpent-4-en-1-ila, 4-metilpent-4-en-1-ila, 1,1-dimetilbut-2-en-1-ila, 1,1-dimetilbut-3-en-1-ila, 1,2-dimetilbut-1-en-1-ila, 1,2-dimetilbut-2-en-1-ila, 1,2-dimetilbut-3-en-1-ila, 1,3-dimetilbut-1-en-1-ila, 1,3-dimetilbut-2-en-1-ila, 1,3-dimetilbut-3-en-1-ila, 2,2-dimetilbut-3-en-1-ila, 2,3-dimetilbut-1-en-1-ila, 2,3-dimetilbut-2-en-1-ila, 2,3-dimetilbut-3-en-1-ila, 3,3-dimetilbut-1-en-1-ila, 3,3-dimetilbut-2-en-1-ila, 1-etilbut-1-en-1-ila, 1-etilbut-2-en-1-ila, 1-etilbut-3-en-1-ila, 2-etilbut-1-en-1-ila, 2-etilbut-2-en-1-ila, 2-etilbut-3-en-1-ila, 1,1,2-trimetilprop-2-en-1-ila, 1-etil-1-metilprop-2-en-1-ila, 1-etil-2-metilprop-1-en-1-ila ou 1-etil-2-metilprop-2-en-1-ila;

25 - alquinila C_3-C_6 : prop-1-in-1-ila, prop-2-in-1-ila, n-but-1-in-1-ila, n-but-1-in-3-ila, n-but-1-in-4-ila, n-but-2-in-1-ila, n-pent-1-in-1-ila, n-pent-1-in-3-ila, n-pent-1-in-4-ila, n-pent-1-in-5-ila, n-pent-2-in-1-ila, n-pent-2-in-4-ila, n-pent-2-in-5-ila, 3-metilbut-1-in-3-ila, 3-metilbut-1-in-4-ila, n-hex-1-in-1-ila, n-hex-1-in-3-ila, n-hex-1-in-4-ila, n-hex-1-in-5-ila, n-hex-1-

in-6-ila, n-hex-2-in-1-ila, n-hex-2-in-4-ila, n-hex-2-in-5-ila, n-hex-2-in-6-ila, n-hex-3-in-1-ila, n-hex-3-in-2-ila, 3-metilpent-1-in-1-ila, 3-metilpent-1-in-3-ila, 3-metilpent-1-in-4-ila, 3-metilpent-1-in-5-ila, 4-metilpent-1-in-1-ila, 4-metilpent-2-in-4-il ou 4-metilpent-2-in-5-ila, preferivelmente prop-2-in-1-ila;

5 - cicloalquila C_3-C_7 : um anel hidrocarboneto monocíclico saturado tendo 3 a 7 membros do anel, tais como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclo-hexila ou ciclo-heptila;

 - cicloalquenila C_3-C_7 : anel hidrocarboneto monocíclico insaturado tendo 3 a 7 membros do anel, tais como cicloprop-1-enila, 10 cicloprop-2-enila, ciclobut-1-enila, ciclobut-2-enila, ciclobut-1,3-dienila, ciclopent-1-enila, ciclopent-2-enila, ciclopent-3-enila, ciclopent-2,4-dienila, ciclo-hex-1-enila, ciclo-hex-2-enila, ciclo-hex-3-enila; ciclo-hex-1,3-dienila, ciclo-hex-1,5-dienila, ciclo-hex-2,4-dienila, ou ciclo-hex-2,5-dienila.

Um ou mais 3-feniluracilas podem ser usadas.

15 Entre os 3-feniluracilas da fórmula I, é dada a preferência àqueles em que as variáveis R^1 a R^7 independentemente um do outro, têm os significados dados a seguir:

R^1 é metila ou NH_2 ;

R^2 é trifluorometila;

20 R^3 é hidrogênio, flúor ou cloro, em particular flúor;

R^4 é halogênio ou ciano, em particular cloro ou ciano;

R^5 é hidrogênio;

25 R^6 , R^7 independentemente um do outro são hidrogênio ou alquila C_1-C_6 .

R^6 e R^7 são em particular radicais alquila C_1-C_6 idênticos ou diferentes.

Uma modalidade particularmente preferida da invenção

compreende o uso de pelo menos um de 3-feniluracila I em que as variáveis R^1 a R^7 na fórmula I têm os significados seguintes (a seguir também referidos como feniluracilas Ia):

R^1 é metila;

5 R^2 é trifluorometila;

R^3 é flúor;

R^4 é cloro;

R^5 é hidrogênio;

R^6 , R^7 independentemente um do outro são alquila C_1 - C_6 .

10 Uma outra modalidade particularmente preferida da invenção compreende o uso de pelo menos um de 3-feniluracila I em que as variáveis R^1 a R^7 na fórmula I têm o significado a seguir (a seguir também referido como feniluracilas Ib):

R^1 é NH_2 ;

15 R^2 é trifluorometila;

R^3 é flúor;

R^4 é cloro;

R^5 é hidrogênio;

R^6 , R^7 independentemente um do outro são alquila C_1 - C_6 .

20 Exemplos de herbicidas particularmente preferidos Ia ou Ib são os 3-feniluracilas da fórmula I' listados a seguir em que R^1 , R^6 e R^7 têm os significados dado em uma fileira da tabela 1 (compostos I.1 a I.74).

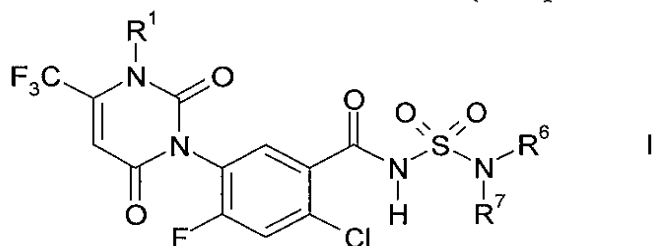


Tabela 1

3-feniluracila I	R ¹	R ⁶	R ⁷
I.1	metila	metila	metila
I.2	amino	metila	metila
I.3	metila	metila	etila
I.4	amino	metila	etila
I.5	metila	metila	propila
I.6	amino	metila	propila
I.7	metila	metila	isopropila
I.8	amino	metila	isopropila
I.9	metila	metila	butila
I.10	amino	metila	butila
I.11	metila	metila	s-butila
I.12	amino	metila	s-butila
I.13	metila	metila	isobutila
I.14	amino	metila	isobutila
I.15	metila	metila	t-butila
I.16	amino	metila	t-butila
I.17	metila	metila	n-pentila
I.18	amino	metila	n-pentila
I.19	metila	metila	n-hexila
I.20	amino	metila	n-hexila
I.21	metila	metila	alila
I.22	amino	metila	alila
I.23	metila	metila	propargila
I.24	amino	metila	propargila
I.25	metila	metila	fenila
I.26	amino	metila	fenila
I.27	metila	metila	benzila
I.28	amino	metila	benzila
I.29	metila	etila	etila
I.30	amino	etila	etila
I.31	metila	etila	propila
I.32	amino	etila	propila
I.33	metila	etila	isopropila
I.34	amino	etila	isopropila
I.35	metila	etila	butila
I.36	amino	etila	butila
I.37	metila	etil	n-pentila
I.38	amino	etila	n-pentila
I.39	metila	etila	n-hexila
I.40	amino	etila	n-hexila
I.41	metila	propila	propila
I.42	amino	propila	propila
I.43	metila	propila	isopropila
I.44	amino	propila	isopropila
I.45	metila	propila	butila
I.46	amino	propila	butila
I.47	metila	propila	n-pentila
I.48	amino	propila	n-pentila

3-feniluracila I	R ¹	R ⁶	R ⁷
I.49	metila	propila	n-hexila
I.50	amino	propila	n-hexila
I.51	metila	isopropila	isopropila
I.52	amino	isopropila	isopropila
I.53	metila	isopropila	butila
I.54	amino	isopropila	butila
I.55	metila	isopropila	n-pentila
I.56	amino	isopropila	n-pentila
I.57	metila	isopropila	n-hexila
I.58	amino	isopropila	n-hexila
I.59	metila	butila	butila
I.60	amino	butila	butila
I.61	metila	butila	n-pentila
I.62	amino	butila	n-pentila
I.63	metila	butila	n-hexila
I.64	amino	butila	n-hexila
I.65	metila	n-pentila	n-pentila
I.66	amino	n-pentila	n-pentila
I.67	metila	n-pentila	n-hexila
I.68	amino	n-pentila	n-hexila
I.69	metila	n-hexila	n-hexila
I.70	amino	n-hexila	n-hexila
I.71	metila	-(CH ₂) ₄ -	
I.72	amino	-(CH ₂) ₄ -	
I.73	metila	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
I.74	amino	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	

Compostos I.1, I.3, I.5, I.7, I.9, I.11 e I.13 são particularmente preferidos.

De acordo com uma modalidade preferida os 3-feniluracilas I são usados em combinação com glifosato ou um sal agricolamente aceitável do mesmo.

De acordo com uma modalidade preferida adicional os 3-feniluracilas I são usados em combinação com pelo menos um (um ou mais) agente desfolhante.

De acordo com uma modalidade preferida adicional os 3-feniluracilas I são usados em combinação com glifosato ou um sal agricolamente aceitável do mesmo (componente B) e pelo menos um agente desfolhante adicional (componente C).

Auxiliares de colheita são ingredientes ativos que, sozinhos ou

em combinação, levam à dessecação e/ou desfolhamento de safras.

Preferivelmente, os auxiliares de colheita adicionais são selecionados do grupo que consiste em etefon, tidiazuron, diuron, paraquat, clorato de sódio, ciclanilida, fosforotritioato *de S,S,S*-tributyla, dimetipin e sais
5 agricolamente aceitáveis dos mesmos.

A categorização dos compostos ativos de acordo com seu modo de ação é baseada no entendimento atual. Se um composto ativo age por mais que um modo de ação, esta substância foi designada somente para um modo de ação.

10 Se os feniluracilas I, e/ou os auxiliares de colheita adicionais são capazes de formar isômeros geométricos, por exemplo, isômeros E/Z, é possível usar tanto os isômeros puros quanto suas misturas nas composições de acordo com a invenção. Se os feniluracilas I, os herbicidas B e/ou os protetores de cultura C têm um ou mais centros de quiralidade e, como uma
15 consequência, estão presentes como enantiômeros ou diastereômeros, é possível usar tanto os enantiômeros puros quanto diastereômeros e suas misturas nas composições de acordo com a invenção.

Se os feniluracilas I e/ou os auxiliares de colheita adicionais têm grupos funcionais que podem ser ionizados, eles podem também ser
20 usados na forma de sais agricolamente aceitáveis dos mesmos. De uma maneira geral, os sais desses cátions ou os sais de adição ácida dos ácidos são adequados, cujos cátions e ânions, respectivamente, não têm efeito adverso na ação dos compostos ativos.

Cátions preferidos são os íons dos metais alcalinos, preferivelmente de lítio, sódio e potássio, dos metais alcalinos terrosos, preferivelmente de cálcio e magnésio, e dos metais de transição, preferivelmente de manganês, cobre, zinco e ferro, além disso amônio e amônio substituído em que um a quatro átomos de hidrogênio são substituídos por alquila C₁-C₄, hidróxi-alquila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, hidróxi-
25

alcóxi C₁-C₄ - alquila C₁-C₄, fenila ou benzila, preferivelmente amônio, metilamônio, isopropilamônio, dimetilamônio, diisopropilamônio, trimetilamônio, tetrametilamônio, tetraetilamônio, tetrabutilamônio, 2-hidroxi-etilamônio, 2-(2-hidroxi-etóxi)-1-ilamônio, di(2-hidroxi-et-1-il)amônio, benziltrimetilamônio, benziltri-etilamônio, além disso íons de fosfônio, íons de sulfônio, preferivelmente tri(alquila C₁-C₄)sulfônio tais como trimetil sulfônio, e íons de sulfoxônio, preferivelmente tri(alquila C₁-C₄)sulfoxônio.

Ânions de sais de adição ácida usados são basicamente cloreto, brometo, fluoreto, iodeto, sulfato de hidrogênio, sulfato de metila, sulfato, dihidrogeno fosfato, fosfato de hidrogênio, nitrato, dicarbonato, carbonato, hexafluorsilicato, hexafluorfosfato, benzoato e o ânions de ácidos alcanóicos C₁-C₄-, preferivelmente formato, acetato, propionato e butirato.

De acordo com a invenção composições binárias e terciárias são usadas se pelo menos um de 3-feniluracila da fórmula I como composto ativo A é usado em combinação com pelo menos um agente desfolhante adicional (composto ativo C).

Aqui e a seguir, o termo "composições binárias" inclui composições que compreendem um ou mais, por exemplo, 2 ou 3, compostos ativos A e glifosato B ou um ou mais, por exemplo, 2 ou 3, auxiliares de colheita C. Correspondentemente, o termo "composições terciária" inclui composições que compreendem um ou mais, por exemplo, 2 ou 3, compostos ativos A, glifosato B e um ou mais, por exemplo, 2 ou 3, auxiliares de colheita C.

Em composições binárias que compreendem pelo menos um de 3-feniluracila da fórmula I como componente A e glifosato B, a razão em peso dos compostos ativos A: B é normalmente na faixa de 1:500 a 10:1, preferivelmente na faixa de 1:100 a 10:1, em particular na faixa de 1:50 a 10:1 e particularmente preferivelmente na faixa de 1:25 a 5:1.

Em composições binárias que compreendem pelo menos um de 3-feniluracila da fórmula I e pelo menos um agente desfolhante C, a razão em peso dos compostos ativos A:C é normalmente na faixa de 1:100 a 10:1, preferivelmente de 1:50 a 10:1 e em particular na faixa de 1:25 a 5:1.

5 Em composições terciárias que compreendem um 3-feniluracila I como componente A, glifosato B e pelo menos um agente desfolhante C, o razões em peso relativas dos componentes A:B:C são normalmente na faixa de 10:1:1 a 1:500:10, preferivelmente de 10:1:1 a 1:100:10, em particular de 10:1:1 a 1:50:1 e particularmente preferivelmente
10 de 5:1:1 a 1:25:5. Nestas composições terciárias, a razão em peso de glifosato B para agente desfolhante C é preferivelmente na faixa de 50:1 a 1:10.

Preparações para aplicação pronta para o uso na forma de produtos de proteção à safra podem ser empregadas. Componente A, opcionalmente componente B e/ou opcionalmente componente C podem estar
15 presentes em forma suspensa, emulsificada ou dissolvida e podem ser formuladas juntas ou separadamente. As formas de aplicação dependem inteiramente do uso pretendido.

As preparações podem ser aplicadas, por exemplo, na forma de soluções aquosas diretamente aspersíveis; pós, suspensões, também
20 suspensões ou dispersões aquosas, oleosas altamente concentradas ou outras mais, emulsões, dispersões em óleo, pastas; poeiras, materiais para espalhamento ou grânulos, por meio de aspersão, atomização, pulverização, espalhamento ou irrigação. As formas de uso dependem do uso pretendido; de qualquer maneira, elas devem garantir a distribuição mais fina possível dos
25 compostos ativos.

Dependendo da forma em que as preparações prontas para o uso estão presentes, elas compreendem um ou mais veículos líquidos ou sólidos, se apropriado agentes tensoativos e, se apropriado, auxiliares adicionais que são costumeiros para formular produtos de proteção à safra.

Versados na tecnologia estão suficientemente familiarizados com as receitas para tais formulações.

As preparações prontas para o uso podem compreender auxiliares que são costumeiros para formular produtos de proteção à safra, cujos auxiliares podem também compreender um veículo líquido.

Adequados aditivos inertes com função de veículo são essencialmente: frações de óleo mineral de médio a alto ponto de ebulição, tais como querosene e óleo diesel, além disso, óleos de alcatrão de carvão e óleos de origem vegetal ou animal, alifático, cíclico e aromático hidrocarbonetos, por exemplo, parafinas, tetraidonaftaleno, naftalenos alquilados e seus derivados, benzenos alquilados e seus derivados, álcoois tais como metanol, etanol, propanol, butanol e ciclo-hexanol, cetonas tal como ciclo-hexanona, solventes fortemente polares, por exemplo, aminas tais como N-metilpirrolidona, e água.

Formas de uso aquosas podem ser preparadas de emulsão concentrados, suspensões, pastas, pós umectáveis ou grânulos dispersíveis em água por adição de água. Para preparar emulsões, pastas ou dispersões em óleo, o composto ativo(s) como este ou dissolvido em um óleo ou solvente, podem ser homogeneizados em água por meio de agente umectante, agente de pegajosidade, dispersantes ou emulsificantes. Alternativamente, é possível preparar concentrados consistindo de substância ativa, agente umectante, agente de pegajosidade, dispersantes ou emulsificantes e, se desejado, solvente ou óleo, e estes concentrados são adequados para diluição com água.

Agentes tensoativos adequados são os sais de metal alcalino, sais de metal alcalino terroso e sais de amônio de ácidos sulfônicos aromáticos, por exemplo, ácido ligno-, fenol-, naftaleno- e dibutilnaftalenossulfônico, e de ácidos graxos, de alquil- e alquilarilsulfonatos, de sulfatos de alquila, sulfatos de éter laurílico e sulfatos de álcool graxo, e sais de hexa-, hepta- e octadecanóis sulfatados e de éteres

glicóis de álcool graxo, condensados de naftaleno sulfonado e seus derivados com formaldeído, condensados de naftaleno ou de ácidos naftalenossulfônicos com fenol e formaldeído, éter de polioxietileno octilfenol, isooctil-, octil- ou nonilfenol etoxilado, glicóis alquilfenil poliéteres, éter de tributilfenil poliglicol, álcoois de éter polialquilarílico, álcool isotridecílico, condensados de álcool graxo/óxido de etileno, óleo de ricino etoxilado, éter polioxietileno alquila ou polioxipropileno alquila, acetato de éter poliglicol de álcool lurílico, ésteres sorbitol, éter de licores de resíduo de lignosulfito ou metilcelulose.

10 Pós, materiais para espalhamento e poeiras podem ser preparados pela mistura ou moagem concomitante das substâncias ativas com um veículo sólido.

Grânulos, por exemplo, grânulos revestidos, grânulos impregnados e grânulos homogêneos, podem ser preparados ligando o(s)
15 ingrediente(s) ativos(s) aos veículos sólidos. Veículos sólidos são minerais terrosos tais como sílicas, géis de sílica, silicatos, talco, caulim, calcário, cal, giz, argila luminosa, limo, argila, dolomita, terra diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio, óxido de magnésio, materiais sintéticos moídos, fertilizantes tais como sulfato de amônio, fosfato de amônio, nitrato de
20 amônio, uréias, e produtos de origem vegetal tais como alimento de cereal, alimento de casca de madeira, alimento de madeira e alimento de casca de noz, pós de celulose, ou outros veículos sólidos.

As concentrações do(s) composto(s) ativo(s) nas preparações prontas para o uso podem ser variadas em amplas faixas. De uma maneira
25 geral, as formulações compreendem de 0,001 a 98% por peso, preferivelmente 0,01 a 95% por peso, de ingrediente (s) ativo(s). O(s) ingrediente(s) ativos(s) são empregados em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente 95% a 100% (de acordo com espectro RMN).

As preparações podem, por exemplo, ser formuladas como a

seguir:

I 20 partes em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão são dissolvidas em uma composição compostas de aduto de 8 a 10 mol de óxido de etileno para 1 mol de ácido N-monoetanolamida oléico, 5 partes em peso de dodecilbenzenosulfonato de cálcio e 5 partes em peso de aduto de 40 mol de óxido de etileno para 1 mol de óleo de rícino. Vertendo a solução em 100.000 partes em peso de água e distribuindo-a finamente dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do ingrediente ativo.

II 20 partes em peso do(s) composto(s) ativo(s) em questão são dissolvidas em uma composição composta de 40 partes em peso de ciclohexanona, 30 partes em peso de isobutanol, 20 partes em peso do aduto de 7 mol de óxido de etileno a 1 mol de isooctilfenol e 10 partes em peso do aduto de 40 mol de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino. Vertendo a solução em 100 000 partes em peso de água e distribuindo-a finamente dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do ingrediente ativo.

III 20 partes em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão são dissolvidas em uma composição composta de 25 partes em peso de ciclohexanona, 65 partes em peso de uma fração de óleo mineral de ponto de ebulição 210 a 280°C e 10 partes em peso do aduto de 40 mol de óxido de etileno a 1 mol de óleo de rícino. Vertendo a solução em 100.000 partes em peso de água e distribuindo-a finamente dá uma dispersão aquosa que compreende 0,02% em peso do ingrediente ativo.

IV 20 partes em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão são misturadas completamente com 3 partes em peso de diisobutilnaftalenosulfonato de sódio, 17 partes em peso do sal de sódio de um ácido lignossulfônico de um licor do resíduo de sulfito e 60 partes em peso de sílica gel pulverulenta, e a composição é moída em um moinho de martelo. Distribuindo finamente a composição em 20.000 partes em peso de água dá uma composição de aspersão que compreende 0,1% em peso do

ingrediente ativo.

V 3 partes em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão são misturadas com 97 partes em peso de caulim finamente dividido. Isto dá uma poeira que compreende 3% em peso do ingrediente ativo.

5 VI 20 partes em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão são misturadas intimamente com 2 partes em peso de dodecilbenzenosulfonato de cálcio, 8 partes em peso de éter poliglicol de álcool graxo, 2 partes em peso do sal de sódio de um condensado de fenol-
10 úreia-formaldeído e 68 partes em peso de um óleo mineral parafínico. Isto dá um dispersão oleosa estável.

VII 1 parte em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão é dissolvida em uma composição composta de 70 partes em peso de ciclohexanona, 20 partes em peso de isooctilfenol etoxilado e 10 partes em peso de óleo de rícino etoxilado. Isto dá um concentrado de emulsão estável.

15 VIII 1 parte em peso de (s) composto(s) ativo(s) em questão é dissolvida em uma composição composta de 80 partes em peso de ciclohexanona e 20 partes em peso de Wettol EM 31 (emulsificantes não iônicos baseados em óleo de rícino etoxilado). Isto dá um concentrado de emulsão estável.

20 Os componentes A, B e C podem ser formulados juntos ou separadamente.

Os componentes A, B e C podem ser aplicados juntos ou separadamente, simultânea ou sucessivamente.

25 Os feniluracilas da fórmula I ou a composição de ingredientes ativos são aplicados em uma taxa que fornece dessecação e/ou desfolhamento efetivos.

Como dessecantes, os 3-feniluracilas I são especialmente adequados para dessecar as partes aéreas de plantas de safra resistentes a glifosato, tais como batatas, semente oleaginosa de colza, algodão, girassóis e

sojas, preferivelmente algodão ou batata. Isto permite colheita completamente mecânica dessas plantas de safra importantes. Desfolhamento facilmente controlável de plantas úteis, em particular algodão, é obtido usando os 3-feniluracilas I para promoção da formação de tecido de abscisão entre fruta ou
5 folha e galho das plantas.

A taxa de aplicação requerida dos compostos ativos puros, isto é, de A, opcionalmente em combinação com B e/ou opcionalmente em combinação com C sem formulação auxiliar, depende da safra a ser dessecada ou desfolhada, das condições climáticas da localização onde a composição é
10 usada e do método de aplicação. De uma maneira geral, a taxa de aplicação é de 0,001 a 3 kg/ha, preferivelmente de 0,005 a 2 kg/ha e em particular de 0,01 a 1 kg/ha, de 0,1 g/ha a 1 kg/ha, de 1 g/ha a 500 g/ha ou de 5 g/ha a 500 g/ha de substância ativa.

As preparações são aplicadas às plantas principalmente por
15 aspersão, em particular por aspersão foliar. Aplicação pode ser realizada por técnicas de aspersão costumeiras usando, por exemplo, água como veículo e taxas líquidas de aspersão de cerca de 50 a 1.000 l/ha (por exemplo, de 300 a 400 l/ha). Aplicação das preparações pelo método de baixo volume e o ultra-baixo volume é possível, como é sua aplicação na forma de microgrânulos.

20 Safra resistente a glifosato inclui uma safra que por meio de múltiplas mudanças do genoma ("traços empilhados") apresenta mais que propriedades de resistência a glifosato, tais como um glifosato e oxinila, glufossinato, imidazolinona, sulfonilúreia, dicamba, ciclo-hexanediona, PPO, HPPD, safra resistente a fungo ou inseto. Mais preferivelmente, a safra de
25 algodão ou batata é uma safra resistente a glifosato ou uma safra que por meio de múltiplas mudanças do genoma ("traços empilhados") tanto é uma safra resistente a glifosato quanto uma safra resistente a inseto. Em uma modalidade mais preferida da invenção, a safra que apresenta um ou mais dos ditos mecanismos de resistência é uma safra de algodão.

Resistência pode ser conferida com safras por engenharia genética. Por exemplo, pelas ditas técnicas tais safras podem adquirir a capacidade de sintetizar (i) uma ou mais toxinas agindo seletivamente, em particular toxinas fungicidas ou toxinas inseticidas, tais como as que são conhecidas da bactéria de produção de toxina, especialmente as do tipo bacilo, por exemplo, endotoxinas, por exemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1), Cry9c, VIP1, VIP2, VIP3 ou VIP3A ou híbridos (isto é, combinações de domínios diferentes de tais toxinas), modificações (por substituição de um ou mais de o aminoácidos comparados com a seqüência de ocorrência natural, por exemplo, CryIIIA055) e/ou versões truncadas desta, e/ou (ii) um quantidade alterada de uma enzima que é o alvo de um herbicida, e/ou (iii) uma forma modificada de um enzima que é o alvo de um herbicida, e/ou (iv) uma ou mais enzimas que são sozinhas ou juntas capazes de converter um herbicida em uma química que não é tóxica na planta e/ou (v) substâncias antipatogênicas, tais como, por exemplo, o assim denominadas “ proteínas relacionadas a patogênese”. Tais safras são ilustradas, mas sem limitações, pelos exemplos descritos na tabela seguinte, que são comercialmente disponíveis ou conhecidas pelos versados na tecnologia ou descritos nas publicações mencionadas, e por quaisquer outros exemplos que surgem do empilhamento mais que um dos traços listados na tabela 2.

Tabela 2

Safra	Gene de resistência, evento, número do código, ou marca registrada	Resistência	Referência (ver parte inferior da tabela)
Algodão	MON1445/1698	Safra resistente a glifosato	1)
Algodão	WideStrike®	Safra resistente a glifosato e inseto	
Algodão	Roundup Ready®	Safra resistente a glifosato	2)
Algodão	Roundup Ready® Flex	Safra resistente a glifosato	
Algodão	Roundup Ready® Flex + Bollgard II®	safra resistente a glifosato e inseto	
Algodão	Roundup Ready® + Bollgard I®	safra resistente a glifosato e inseto	
Algodão	Roundup Ready® + Bollgard II®	safra resistente a glifosato e inseto	

Safra	Gene de resistência, evento, número do código, ou marca registrada	Resistência	Referência (ver parte inferior da tabela)
Algodão	CP4-EPSPS	Safra resistente a glifosato	3)

1) <http://www.agbios.com/dbase.php#>

2) G. Dill, Pest Manag. Sci. 2005, 61, 219-224 e referências aqui citadas.

5 Nos exemplos a seguir, o valor E, que espera-se se a atividade dos compostos individuais for somente aditiva, foi calculado usando o método de S. R. Colby (1967) "Calculating synergistic and antagonistic responses of herbicide combinations", Weeds 15, p. 22 ff.

$$E = X + Y - (XY/100)$$

onde

10 X = efeito em porcentagem usando composto ativo A em uma taxa de aplicação a;

Y = efeito em porcentagem usando composto ativo B em uma taxa de aplicação b;

E = efeito esperado (em%) de A + B em taxas de aplicação a + b.

15 Se o valor experimentalmente determinado for maior que o valor E calculado de acordo com a equação de Colby, um efeito sinérgico está presente.

Os exemplos seguintes ilustram a invenção sem limitá-las.

Exemplos

20 O efeito de desfolhamento e/ou dessecação do uso de feniluracilas I ou suas misturas de acordo com a presente invenção foi demonstrado por testes de campo (exemplo 1).

25 Os feniluracilas I e/ou os outros ingredientes ativos de acordo com a presente invenção foram formulados em uma forma adequada, tanto separadamente quanto em mistura, por exemplo, como concentrados emulsificáveis (EC), concentrados solúveis (SL), suspo-emulsões (SE), concentrados de suspensão (SC)

ou grânulos dispersíveis em água (WG). A (s) formulação(s) foi suspensa ou emulsificada em água como um meio de distribuição imediatamente antes da aspersão. Subseqüentemente, a mistura aquosa foi igualmente aspergida nos gráficos de teste por meio de bicos de distribuição fina.

5 Os gráficos de teste de linhas de plantas de safra completamente maduras no começo de queda de folha foram de tamanho uniforme (tipicamente entre 14 e 37 metros quadrados, cada) e a distribuição de gráficos tratados e não tratados foi organizada de acordo com um projeto de bloco aleatorizado. Os gráficos foram tratados pós-emergência, isto é, a
10 mistura aquosa descrita anteriormente foi aspergida nas plantas de safra.

A avaliação do desfolhamento ou dessecação causada pelos feniluracilas I e/ou os outros ingredientes ativos de acordo com a presente invenção foi realizada usando um escala de 0 a 100%, comparados com os gráficos de controle não tratados. Aqui, 0 significa nenhum desfolhamento ou
15 dessecação, e 100 significa desfolhamento completo das plantas de safra, ou dessecação completa das folhas da planta de safra.

Exemplo 1 – Desfolhamento e dessecação de algodão resistente a glifosato pelo feniluracila I.7 sozinho, bem como, por uma mistura do feniluracila I.7 e glifosato; teste de campo.

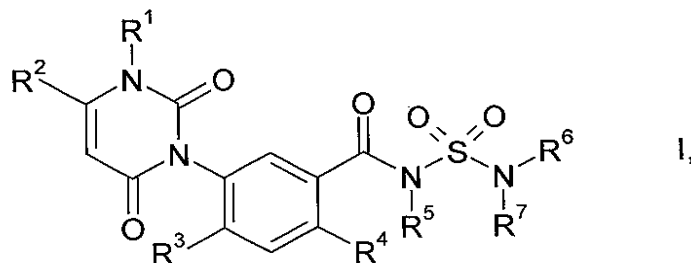
20 **Tabela 3**

Taxa de uso (g/ha)		desfolhamento de algodão resistente a glifosato a 4 DAT (% desfolhamento)		Dessecação de algodão resistente a glifosato a 4 DAT (% dessecação)	
Glifosato	Feniluracila I.7	Encontrado	Calculado de acordo com equação de Colby	Encontrado	Calculado de acordo com equação de Colby
840	-	0	-	3	-
-	12,5	13	-	63	-
840	12,5	40	13	97	64

Neste exemplo, glifosato (sal de isopropilamônio) foi formulado como um SL 360 g/L e Feniluracila I.7 como um EC 120 g/L. Antes da aplicação, os ingredientes ativos formulados foram misturados em um tanque com uma solução de aspersão 140 l/ha aquosa que continha, além
25 do mais, 10 g/L de Agridex.

REIVINDICAÇÕES

1. Método para dessecar ou desfolhar safras resistentes a glifosato, caracterizado pelo fato de que compreende permitir que uma quantidade efetiva de um ou mais 3-feniluracilas da fórmula I



5 em que as variáveis R^1 a R^7 são da forma definida a seguir:

R^1 é metila ou NH_2 ;

R^2 é haloalquila C_1-C_2 ;

R^3 é hidrogênio ou halogênio;

R^4 é halogênio ou ciano;

10 R^5 é hidrogênio ou alquila C_1-C_6 ;

R^6 , R^7 independentemente um do outro são hidrogênio, alquila C_1-C_6 , alcóxi C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , cicloalquila C_3-C_7 , cicloalquenila C_3-C_7 , fenila ou benzila;

15 ou um sal agricolamente aceitável dos mesmos atuam em safras resistentes a glifosato.

2. Método de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que as variáveis R^1 a R^7 na fórmula I são da forma definida a seguir:

R^1 é metila ou NH_2 ;

R^2 é trifluorometila;

20 R^3 é hidrogênio, flúor ou cloro;

R^4 é halogênio ou ciano;

R^5 é hidrogênio;

R^6 , R^7 independentemente um do outro são hidrogênio, alquila C_1-C_6 , alquenila C_3-C_6 , alquinila C_3-C_6 , cicloalquila C_3-C_7 , cicloalquenila C_3-C_7 , fenila ou benzila.

25

3. Método de acordo com as reivindicações 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que R^6 e R^7 na fórmula I são radicais alquila C_1-C_6 idênticos ou diferentes.

5 4. Método de acordo com qualquer uma das reivindicações anteriores, caracterizado pelo fato de que a safra é selecionada de soja, algodão, batatas, semente oleaginosa de colza e girassóis resistentes a glifosato.

5. Método de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de que a safra é algodão.

10 6. Método de acordo com qualquer uma das reivindicações anteriores, caracterizado pelo fato de que o 3-feniluracila da fórmula I é usada em combinação com glifosato ou um sal agricolamente aceitável do mesmo.

15 7. Método de acordo com qualquer uma das reivindicações anteriores, caracterizado pelo fato de que o 3-feniluracila da fórmula I é usada em combinação com um ou mais outros auxiliares de colheita ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos.

8. Método de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que o 3-feniluracila da fórmula I é usada em combinação com glifosato ou um sal agricolamente aceitável do mesmo e um ou mais outros auxiliares de colheita ou sais agricolamente aceitáveis dos mesmos.

20 9. Método de acordo com as reivindicações 7 ou 8, caracterizado pelo fato de que o outro agente desfolhante é selecionado de etepon, tiadiazuron, diuron, paraquat, clorato de sódio, ciclanilida, S,S,S-tributifosforotritioato, dimetipina e sais agricolamente aceitáveis dos mesmos e derivados.

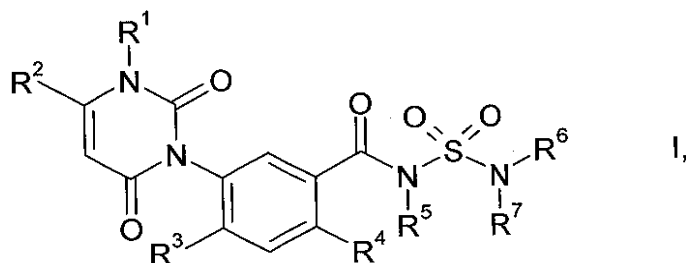
25 10. Uso de uma 3-feniluracila como definida em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, opcionalmente em combinação com glifosato e/ou opcionalmente em combinação com um ou mais auxiliares de colheita como definidos nas reivindicações 7 ou 9, caracterizado pelo fato de ser para dissecar ou desfolhar safras resistentes a glifosato.

RESUMO

“MÉTODO PARA DESSECAR OU DESFOLHAR SAFRAS RESISTENTES A GLIFOSATO, E, USO DE UMA 3-FENILURACILA”

A presente invenção diz respeito ao uso de 3-feniluracilas da

5 fórmula I



em que as variáveis R^1 a R^7 são da forma definida na descrição, opcionalmente em combinação com glifosato, opcionalmente em combinação com auxiliares de colheita C para dessecação ou desfolhamento de safras resistentes a glifosato.