ROYAUME DU MAROC

OFFICE MAROCAIN DE LA PROPRIETE INDUSTRIELLE ET COMMERCIALE
---

(19)

المملكة المغربية

المكتب المغربي للملكية الصناعية و التجارية
---

(12) FASCICULE DE BREVET

(11) N° de publication :
MA 34399 B1

(51) Cl. internationale :
C07C 69/78

(43) Date de publication :
03.07.2013

(21) N° Dépôt :
35609

(22) Date de Dépôt :
28.01.2013

(30) Données de Priorité :
27.07.2010 GB 1012586.2

(86) Données relatives à l'entrée en phase nationale selon le PCT :
PCT/IB2011/053325 26.07.2011

(71) Demandeur(s) :
SYNGENTA LIMITED, EUROPEAN REGIONAL CENTRE, PRIESTLEY ROAD, SURREY RESEARCH PARK GUILDFORD SURREY GU2 7YH (GB)

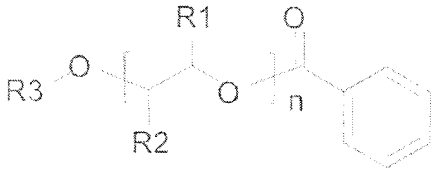
(72) Inventeur(s) :
BELL, Gordon Alastair ; WALLER, Anne ; WAILES, Jeffrey Steven

(74) Mandataire :
ABU-GHAZALEH INTELLECTUAL PROPERTY (TMP AGENTS)

(54) Titre : **FORMULATIONS**

(57) Abrégé : La présente invention concerne une formulation comprenant un composé de formule (I) dans laquelle R1 est un hydrogène, un méthyle, un éthyle, un propyle ou un butyle; R2 est un méthyle ou un éthyle; R3 est un hydrogène, un méthyle ou un éthyle; et n est 1, 2 ou 3; l'utilisation d'un composé de formule (I) en tant que solvant; et certains nouveaux composés de formule (I).

تركيبات



(I)

المُلخص

يتعلق هذا الاختراع بتركيبات تتضمن مركباً من الصيغة (I) حيث R1 هو هيدروجين، مثيل، إثيل، بروبيل أو بيوتيل؛ R2 عبارة عن مثيل أو إثيل؛ R3 عبارة عن هيدروجين، مثيل أو إثيل؛ و n تساوى 1، 2 أو 3؛ وباستخدام مركب من الصيغة (I) كمذنب؛ كما يتعلق بمركبات مبتكرة معينة من الصيغة (I).

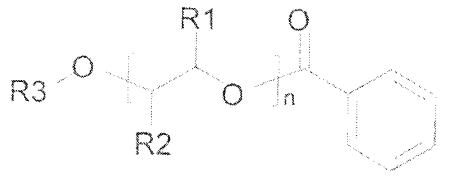
03 JUIL 2013

تركيبات

يتعلق هذا الاختراع باستخدام مركبات معينة من نوع ألكيلين جليكول بنزوات كمذيبات، وبخاصةً في تركيبات، وبخاصة تركيبات زراعية كيميائية وفي تركيبات صديقة للبيئة. كما يتعلق بمركبات مبتكرة معينة. وُجِد أنّ مذيبات هذا الاختراع فعالة بشكل خاص عند إذابة مبيدات الآفات التي تنتمي لعائلات ستروبليورينات، تريازولات وسكسينات والتي تكون مثبطات لإنزيم ديهيدروجيناز (SDHI) (وبخاصةً بيرازولات؛ ومن الملائم في كيمياء بيرازم).

وحالياً، فإن العاملين في مجال كيمياء التركيبات يحتاجون للتوافق مع العديد من المعايير البيئية عند تطوير تركيبات جديدة. في أفضل الحالات، سوف يُظهر المذيب المناسب العديد من أو جميع الخصائص التالية: قوة إذابة ممتازة لمبيدات الآفات أو الجزيئات العضوية الأخرى؛ مصنوع من موارد نباتية أو حيوانية متجددة؛ تسبب تهيجاً منخفضاً للبشرة؛ سمية منخفضة للبيئة، على سبيل المثال تجاه برغوث الماء؛ محتوى منخفض من المركبات العضوية القابلة للتطاير؛ ونقطة وميض عالية. كل المركبات هذا الاختراع بكل أو بعض الخصائص هذه، وعلى وجه الخصوص قوة إذابة ممتازة؛ يمكن استخدام المركبات بشكل فعال كمذيبات.

بالتالي، فإن هذا الاختراع يعمل على إعداد تركيبة تتضمن مركباً من الصيغة (I):



(I)

حيث R^1 هو هيدروجين، مثيل، إثيل، بروبيل أو بيوتيل؛ R^2 عبارة عن ميثيل أو إيثيل؛ R^3 هو هيدروجين، مثيل أو إثيل؛ و n تساوي 1، 2 أو 3.

إن مجموعات بروبيل وبيوتيل تكون سلاسل مستقيمة أو متفرعة. الأمثلة تتضمن أيزوبروبيل، بروبيل عادي، بيوتيل عادي، بيوتيل ثانوي وبيوتيل ثلاثي.

من الملائم أن R^1 تكون H.

من الملائم أن R^2 تكون مثيل.

من الملائم أن R^3 تكون H.

من الملائم أن n تساوي 1.

من الملائم أن هذا الاختراع يعمل على إعداد طريقة لاستخدام مركب من الصيغة (I) في تركيبة زراعية كيميائية.

يمكن استخدام مركبات هذا الاختراع كمذيبات.

هناك العديد من المركبات الموضحة في هذا الاختراع تكون جديدة.

وعلى ذلك، فإن هذا الاختراع يعمل على إعداد مركب من الصيغة (I) كما سبق أن ذكر؛ بشرط أن المركب ليس 2-هيدروكسي بروبيل بنزوات، 2-هيدروكسي-1-مثيل إثيل بنزوات، 1,2-بيوتان دايول-2-بنزوات، 1,2-بيوتان دايول-1-بنزوات أو 1-بروبانول-2-(2-هيدروكسي بروبوكسي)-1-بنزوات.

يوضح الجدول 1 تركيبات وبيانات طيفية معينة للمركبات الملائمة التي بالصيغة (I):

الجدول 1

رقم المركب	R^1	R^2	R^3	n	من MH^+ GCMS	نطاق IR سنتيمتر$^{-1}$ OH	نطاق IR سنتيمتر$^{-1}$ إستر	نطاق IR سنتيمتر$^{-1}$ أروماتي
1	H	CH_3	H	1	181	3340	1712	1600
2	H	CH_2CH_3	H	1	195	3355	1715	1600

من السهل تحضير مركبات هذا الاختراع؛ على سبيل المثال، يتم تفاعل جليكول إثير مع مركب أروماتي بمجموعة تاركة ملائمة، على سبيل المثال بنزويل كلوريد.

يمكن استخدام مركبات هذا الاختراع في عدد من التطبيقات الاستخدام النهائي (بما في ذلك التركيبات الزراعية الكيميائية)، بشكل خاص كمذيبات. يمكن استخدام هذه المذيبات مع مجموعة كبيرة من المواد بما في ذلك مبيدات الأعشاب، مبيدات الفطريات، مبيدات السوس والقرادات، مبيدات الديدان ومبيدات الحشرات [وأيضاً المواد المنظمة لنمو النباتات].

يتضمن هذا الاختراع كل الأيزوميرات، مخاليط من أيزوميرات لمركبات بالصيغة (I)، ويتضمن أيضاً مخاليط من إثنين أو أكثر من مركبات مختلفة بالصيغة (I).

يمكن استخدام مركبات هذا الاختراع لإعداد محاليل لعدد من المواد، بما في ذلك المواد الزراعية الكيميائية، التي يمكن تركيبها كمستحلب أو رُكازات تشتيت، محاليل في الماء أو الزيت، تركيبات بكبسلة دقيقة، بخاخات هباء جوي أو تركيبات ضبابية؛ ويمكن تركيب هذه أيضاًعلى شكل مواد حبيبية أو مساحيق، على سبيل المثال للتطبيقات الجافة أو كتركيبات قابلة للتشتت في الماء. كما يمكن استخدام أي من المحاليل المشكلة بهذه الطريقة بشكل مباشر على التربة أو النباتات أو في تطبيقات غير زراعية كيميائية أخرى.

والأمثلة على تلك التطبيقات تتضمن صناعة الورق، معالجة الماء، التطبيقات الحرجية، معالجات الصحة العامة، الاستخدام في أحواض السباحة البلدية أو مجاري الماء الأخرى، وفي تطبيقات بالقرب من الأنهار، البحيرات، الخزانات أو البحار وفي تطبيقات حيث الإطلاق إلى الجو يجب أن يكون مقللاً أو متحكماً به وحيث يكون الضرر بالجو غير مرغوب به. تتضمن الأمثلة استخدام الدهانات الخارجية والداخلية، الأطلية، الورنيش، الشموع أو الطبقات الحامية الأخرى أو المواد المعتمة، الملونات أو الحجابات؛ في الصبغ، الخضب أو استخدام الأحبار؛ وفي منتجات التنظيف المصممة للاستخدام المنزلي، الحدائق أو التطبيقات الصناعية؛ وفي الصابون والمنظفات للاستخدام الصناعي، المنزلي أو البيئي. كما يمكن استخدام مركبات هذا الاختراع أيضاً مع الشامبو، المعقمات المنزلية وفي المنظفات المنزلية [على سبيل المثال منظفات الأقران ومنظفات الأسطح].

تتمتّع مركبات هذا الاختراع بقوة إذابة استثنائية لعدد كبير من المواد الزراعية الكيميائية، الصيدلية والمركبات الأخرى ذات القيمة التجارية، كما تمتلك قوة الإذابة أيضاً إلى إذابة الأوساخ، الشحم أو الشمع.

توضح الأمثلة التالية الاختراع حيث:

g = غرام °C = درجة مئوية (درجة مئوية)

يتم التعبير عن كل تركيز بالوزن، ما لم يكن خلاف ذلك محدداً.

تكون مذيبات هذا الاختراع فعالة على وجه الخصوص عند إذابة مبيدات الآفات التي تنتمي للعائلات: ستروبيلورينات، تريازولات وسكسينات كمثبطات ديهيدروجيناز (SDHI) (وبخاصةً بيرازولات؛ ومن الملائم كيمياء بيرازام). وتلك الحقيقة توضح في الأمثلة حيث يتم توضيح أن ذوبانية مبيدات الآفات أزوكسي ستروبين) دفينوكونازول وأيزوبيرازام تكون أعلى في المذيب بروبيلين جليكول بنزوات عن مجموعة المذيبات الشائعة الاستخدام. ومن المدهش أن ذوبانية سيبروديتيل، كلوروثالونيل وثاني بيرول حلقي في بروبيلين جليكول بنزوات تكون أقل من نفس المجموعة من المذيبات الشائعة. والذوبانيات تعتبر نسبة مئوية وزن/وزن عند 20 درجة مئوية.

المثال 1

يوضح هذا المثال قابلية الذوبان العالية لكل من العناصر الفعالة زراعياً وكيميائياً في مذيبات هذا الاختراع [المركبات 1 و2 من الجدول 1].

تم ملء قارورة زجاجية إلى الثمن تقريباً بمكون فعال [AI] ومن ثم تم إضافة مذيب [في هذا المثال، يكون بروبيلين جليكول بنزوات أو بيوتيلين جليكول بنزوات] حتى أصبحت القارورة ممتلئة حتى الثلث تقريباً. ولقد تم مزج العينة الناتجة بواسطة جهاز Whirlimixer™ ومن ثم تم تخزينها على 25 درجة مئوية. تم فحص العينة كل عدة أيام؛ وإذا لم يكن هناك مكون فعال صلب يتم عندها إضافة كميات إضافية من المكون الفعال؛ وإذا لم يكن هناك سائل متبق فعندها يتم إضافة كمية إضافية من المذيب. تم تكرار العملية إلى أن أصبحت العينة متوازنة لمدة 4 أسابيع اعتباراً من الإضافة النهائية إما للمكون الفعال أو للمذيب. وبعد ذلك فقد تم تحليل الطبقة السائلة الطافية بواسطة بكروماتوغرافيا الغاز لتركيز المكون الفعال؛ إنّ النتائج معروضة في الجدول 2:

الجدول 2

المكون الفعال	قابلية الذوبان في بروبيلين جليكول بنزوات عند 25°م (% وزن/وزن)	قابلية الذوبان في بيوتيلين جليكول بنزوات عند 25°م (% وزن/وزن)
ديفينوكونازول	50.5	-
كلوروثالونيل	1.32	-
سيبرودينيل	18.4	-
4- هيدروكسي -3- [2-(2-ميثوكسي إيثوكسي مثيل)-6- ثالث فلورو مثيل بيريدين-3- كربونيل]- ثنائي حلقي [3.2.1] أوكت-3-ين-2- ون	27.4	-
أزوكسي ستروبين	5.5	8.1
سيبروكونازول	4.5	6.9
أيزوبيرازام	12.7	12.4

المثال 2

يوضح هذا المثال أن مذيبات هذا الاختراع تكون فعالة على وجه الخصوص عند إذابة مبيدات الآفات التي تنتمي للعائلات: ستروبيلورين، تريازولات وسكسينات كمثبطات ديهيدروجيناز (SDHI) (وبخاصة بيرازولات؛ من الملائم كيمياء بيرازام). يوضح الجدولين 3أ و3ب ذوبانية مبيدات الآفات أزوكسي ستروبين، دفينوكونازول، أيزوبيرازام، سيبرودينيل، كلورو ثالونيل وثاني بيرون حلقي في المذيب بروبيل جليكول بنزوات [المركب 1 من جدول 1]. ولمقارنة الذوبانيات يتم ذكر مجموعة من المذيبات الشائعة الاستخدام أيضاً في الجدول.

يوضح البيانات أنه في أغلب الأحوال فإن بروبيلين جليكول بنزوات يكون مذيب افضل لمبيدات الآفات الثلاثة الأولى (وهي على الترتيب ترىازول، SDHI وستروبيلورين) عن المذيبات الشائعة الأخرى. ويتم التعبير عن الذوبانيات كنسبة مئوية وزن/وزن عند 20°م.

الجدول 3أ

المذيب	دفينوكونازول	أيزوبيرازام	أزوكسي ستروبين
بروبيلين جليكول بنزوات	50.5	12.7	5.5
بيوتيل عادي بنزوات	29.4	7.6	4.0
Solvesso™ 100 ND/ULN	37.8	0.0	1.7
Solvesso™ 200 ND/ULN	37.7	5.8	5.6
Dowanol™ PnB	34.4	8.8	1.3
أيزوبورنيل خلات	24.9	6.8	1.6
Benzoflex™9-88	19.8	6.3	4.2
بيوتيل لاكتات	47.1	16.5	4.6
Dowanol™PGDA	34.1	6.9	9.4
بنزيل أسيتون	44.9	12.6	14.1
خلات بنزيل	46.0	8.9	13.8
ترياسيتين	22.3	4.3	6.4

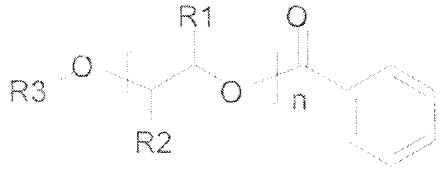
الجدول 3ب

المذيب	سيبرودينيل	ثاني بيرون حلقي	كلوروثالونيل
بروبيلين جليكول بنزوات	18.4	27.4	1.3

2.3	45.6	35.5	بيوتيل عادي بنزوات
7.1	52.3	31.1	Solvesso™100 ND/ULN
9.6	50.7	34.4	Solvesso™200 ND/ULN
0.2	32.0	41.7	Dowanol™ PnB
0.5	38.4	32.8	أيزوبورنيل خلات
1.9	23.2	22.6	Benzoflex™9-88
0.4	48.6	52.5	بيوتيل لاكتات
0.6	38.3	31.3	Dowanol™ PGDA
2.8	53.0	39.6	بنزيل أسيتون
2.0	55.5	36.8	خلات بنزيل
0.4	33.3	18.9	ترياسيتين

عناصر الحماية

1. تركيبة تتضمن مركباً من الصيغة (I)



(I)

حيث R^1 عبارة عن هيدروجين، مثيل، إثيل، بروبيل، أو بيوتيل؛ R^2 عبارة عن مثيل أو إثيل؛ R^3 عبارة عن هيدروجين، مثيل أو إثيل و n عبارة عن 1، 2 أو 3.

2. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 1، حيث R^1 عبارة عن هيدروجين.

3. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 1 او 2، حيث R^3 عبارة عن هيدروجين.

4. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 1، 2 أو 3 حيث n تساوي 1.

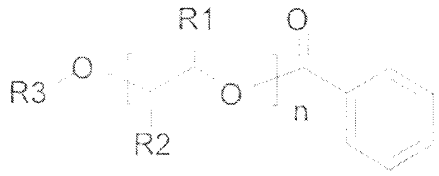
5. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 1، 2، 3 أو 4 حيث أن التركيب هو تركيز قابل للإستحلاب أو مستحلب.

6. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 1، 2، 3، 4 أو 5 حيث أن التركيب يتضمن مادة زراعية كيميائية.

7. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 6 حيث أن المادة الزراعية الكيميائية تكون ستروبيلورين، تريازول أو سكسينات كمثبط ديهيدروجيناز.

8. تركيبة كما هو مذكور في عنصر الحماية 7 حيث أن المركب الكيميائي الزراعي هو أزوكسي ستروبين، دفينوكونازول أو أيزوبيرازام.

9. مركب من الصيغة (I):



(I)

حيث R^1 عبارة هن هيدروجين، مثيل، إثيل، بروبيل، أو بيوتيل؛ R^2 عبارة عن مثيل أو إثيل؛ R^3 عبارة هن هيدروجين، مثيل أو إثيل؛ و n عبارة عن 1، 2 أو 3؛ بشرط أن المركب لا يكون 2-هيدروكسي بروبيل بنزوات، 2-هيدروكسي-1-مثيل إثيل بنزوات، 1,2-بيوتان دايول-2-بنزوات، 1,2-بيوتان دايول-1-بنزوات أو 1-بروبانول-2(2-هيدروكسي بروبوكسي)-1-بنزوات.

10. مركب من الصيغة (I) كما هو مذكور في عنصر الحماية 9 حيث R^1 عبارة عن هيدروجين.

11. مركب من الصيغة (I) كما هو مذكور في عنصر الحماية 9 أو 10 حيث R^3 عبارة عن هيدروجين.

12. مركب من الصيغة (I) كما هو مذكور في عنصر الحماية 9، 10 أو 11 حيث n تساوي 1.

13. مركب من الصيغة (I) كما هو مذكور في عنصر الحماية 9، 10، 11 أو 12 حيث R^2 عبارة عن مثيل.