

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 565 336**

51 Int. Cl.:

A01N 25/02 (2006.01)

A01N 25/30 (2006.01)

A01N 57/20 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.09.2010 E 10762622 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.01.2016 EP 2480070**

54 Título: **Monoalquilsulfosuccinatos en formulaciones pesticidas y aplicaciones como hidrótropos**

30 Prioridad:

24.09.2009 US 245450 P
16.10.2009 EP 09173229

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
04.04.2016

73 Titular/es:

AKZO NOBEL CHEMICALS INTERNATIONAL B.V.
(100.0%)
Velperweg 76
6824 BM Arnhem, NL

72 Inventor/es:

NGUYEN, GIAO VINH y
ALEXANDER, MARK

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 565 336 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

Monoalquilsulfosuccinatos en formulaciones pesticidas y aplicaciones como hidrótrofos

Campo de la invención

5 La presente invención se refiere al uso de monoalquilsulfosuccinatos como hidrótrofos en formulaciones de glufosinato de amonio y aplicaciones de dichas formulaciones.

Antecedentes de la invención

10 El formulador de compuestos químicos agrícolas tiene la difícil tarea de crear un producto que equilibre la bioeficacia, la toxicidad, el coste, la durabilidad y la facilidad de uso para el usuario. De particular importancia para la actividad de una formulación agrícola es la capacidad de una disolución acuosa para extenderse uniformemente sobre una superficie, la denominada capacidad de humectación, y la absorción efectiva del ingrediente activo por la planta que se va a tratar. Por ejemplo, en formulaciones agrícolas, la eficacia se mejora con una buena humectación de la superficie de las plantas y con la absorción del ingrediente activo.

15 Los adyuvantes se añaden a las formulaciones agrícolas para mejorar la actividad, reduciendo de este modo las cantidades de ingredientes activos necesarias, dando lugar a un menor coste de formulación. En general, toman la forma de compuestos tensioactivos o similares a sales y, dependiendo de su modo de acción, se clasifican en modificadores, actuadores, fertilizantes y/o agentes amortiguadores del pH.

20 En general, los tensioactivos se consideran como modificadores y/o actuadores ya que mejoran las propiedades humectantes y la absorción de los ingredientes activos en la formulación agrícola. Adicionalmente, algunos tensioactivos mejoran la solubilidad de los ingredientes activos en las formulaciones eliminando de este modo problemas importantes tales como la separación y/o la cristalización del producto.

25 Los tensioactivos aniónicos, catiónicos, anfóteros y no iónicos son bien conocidos y se usan en aplicaciones agrícolas dependiendo del efecto deseado. Por ejemplo, se sabe que los tensioactivos no iónicos son buenos agentes humectantes, y con frecuencia están presentes en formulaciones agrícolas. Muchos tensioactivos no iónicos no son suficientemente solubles en disoluciones con una alta cantidad de electrólitos, tales como álcalis y/o agentes complejantes alcalinos, sales, y similares y por lo tanto necesitan la presencia de un hidrótrofo para mejorar la solubilidad. Un hidrótrofo es un compuesto que solubiliza los compuestos hidrofóbicos en disoluciones acuosas. Varios hidrótrofos para tensioactivos no iónicos han sido descritos en diversas publicaciones. Ejemplos de dichos hidrótrofos son etanol, xilensulfonato de sodio, cumensulfonato de sodio, glicósidos de alquilo, y alcoholes alcoxilados fosfatados.

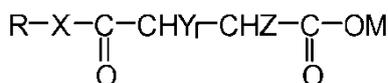
30 Las formulaciones de pesticidas se están haciendo más complejas y concentradas, con un aumento en la carga de ingrediente activo, el número de ingredientes activos usados en una formulación o la inclusión de adyuvantes tales como tensioactivos. Estos cambios llevan a una reducción en el agua usada en algunos tipos de formulaciones, tales como líquidos solubles, dando lugar a problemas de solubilidad en la formulación. Un ejemplo específico es con glufosinato de amonio. El glufosinato de amonio es un herbicida con base de ácido fosfínico soluble en agua usado para el control de un amplio espectro de malas hierbas. Los primeros usos del herbicida fueron para aplicaciones no selectivas, pero se han obtenido cultivos tolerantes, por lo que las aplicaciones actuales incluyen los cultivos alimentarios. El adyuvante usado en combinación con el glufosinato de amonio es típicamente un alcohol éter sulfato que se neutraliza para formar una sal de sodio, aunque también puede usarse la sal de amonio, y el adyuvante se formula con el herbicida en el recipiente. La relación entre el pesticida y el adyuvante puede variar de 1:1 a 1:5. A medida de que la relación entre el pesticida y el adyuvante se acerca a 1:1, la compatibilidad del adyuvante se hace un reto más importante.

45 La cultura de la aplicación ha cambiado con los agricultores. En el pasado, los pesticidas y los fertilizantes se aplicaron separadamente, pero debido a las limitaciones de tiempo y los costes de combustible, están siendo combinados y aplicados en una mezcla en tanque. La fuerza iónica de la disolución del fertilizante lleva a incompatibilidades debido a la reducción de la solubilidad de los tensioactivos/adyuvantes en la formulación del pesticida. Una forma de modificar las propiedades de solubilidad en una formulación y/o mejorar la mezcla y la dispersión de la formulación en el fertilizante es incorporar un hidrótrofo en la fórmula. Los ejemplos de hidrótrofos típicos usados pueden ser xilensulfonato de sodio o ésteres de fosfato. Ambos tipos de productos químicos tienen inconvenientes. El xilensulfonato de sodio es un peligro medioambiental y los ésteres de fosfato, debido a su pH muy bajo, son difíciles de incorporar en la formulación a un nivel suficientemente elevado para ser eficaces cuando se diluyen en el fertilizante. Adicionalmente, la elevada acidez del éster de fosfato lo hace inadecuado para usarlo en una formulación que contiene éter sulfato como adyuvante, ya que produciría la hidrólisis del éter sulfato.

55 Por lo tanto, el objetivo de la presente invención es encontrar un nuevo hidrótrofo agrícola que sea eficaz para la formulación de composiciones agrícolas, composiciones que permanecerán homogéneas tras la dilución, y estables, con una actividad mejorada. Estos y otros objetos se logran mediante las formulaciones de la presente invención.

Sumario de la invención

Consecuentemente, la presente invención se basa en el descubrimiento de una formulación de pesticida que comprende:



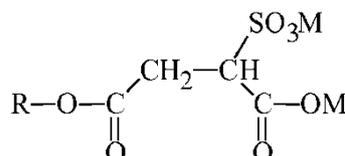
- 5 R es un grupo alquilo lineal o ramificado que comprende 3-8 átomos de carbono;
 - X es O, NH o alquilamino R'N, en el que R' = grupo alquilo lineal o ramificado con 1-4 átomos de carbono;
 - Y y Z pueden ser el mismo o diferentes y comprenden: hidrógeno H , o SO₃M' donde M' = sodio, amonio, potasio o calcio; y
 - M puede ser sodio, amonio, potasio, calcio, etilamina, propilamina, isopropilamina o alcanolamina;
 - 10 La invención se refiere además a un método para proporcionar protección pesticida a un cultivo agrícola mediante la aplicación de la formulación según la reivindicación 1 al cultivo.
- Otros modos de realización de la invención se refieren a detalles relacionados con los adyuvantes y otros ingredientes de formulación del pesticida, todos los cuales se describen en detalle a continuación.

Breve descripción de los dibujos

- 15 La figura 1 comprende tres figuras que muestran contenedores de cristal rellenos con mezclas acuosas de formulaciones de glufosinato de amonio con y sin el hidrótrofo de la invención.
- La figura 2 es un diagrama ternario que muestra las regiones con porcentajes variables de separación de las mezclas acuosas de pesticida, adyuvante y monobutilsulfosuccinato como hidrótrofo.

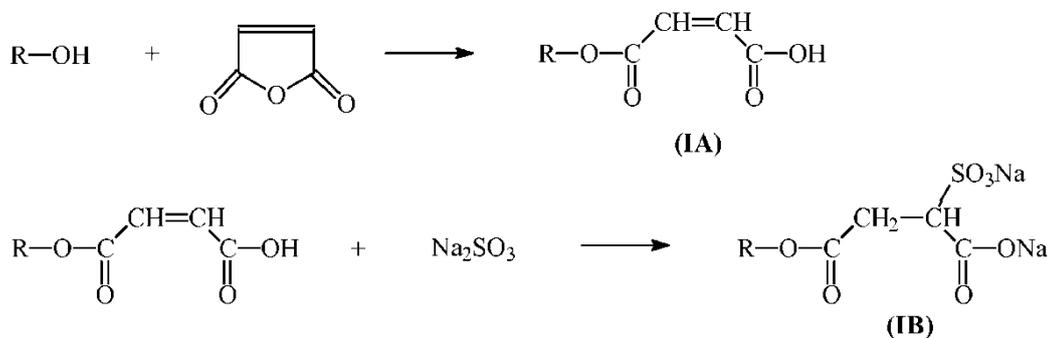
Descripción detallada de la invención

- 20 Con respecto a la fórmula I, la fórmula preferida es un hidrótrofo de monoalquilsulfosuccinato que tiene la estructura:



donde R: grupo alquilo C3-C8, y M: ión sodio, potasio o amonio. La de sodio es la sal más común. Típicamente, los monoalquilsulfosuccinatos de sodio (IB) se preparan mediante dos reacciones consecutivas: la reacción del alcohol elegido con anhídrido maleico y la adición de sulfito de sodio al éster ácido (IA) resultante.

- 25



- 30 En comparación con los hidrótrofos convencionales, tales como el xilensulfonato de sodio y los ésteres de fosfato, los monoalquilsulfosuccinatos son adecuados en todos los sentidos. Su preparación requiere procedimientos sencillos y equipo sencillo. A diferencia del xilensulfonato de sodio, los monoalquilsulfonatos son respetuosos con el medio ambiente. Todos son muy biodegradables. Y a diferencia de los ésteres de fosfato, son suaves para la piel y los ojos y no producen la descomposición química no deseada/inadecuada de otros componentes de las formulaciones de herbicida/pesticida. Pero por encima de todo, sus características como hidrótrofos son al menos iguales, y a menudo superiores, a las de los convencionales.

Características de los monosulfosuccinatos como hidrótropos.

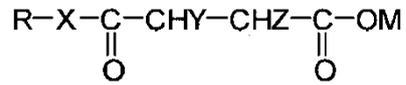
- 5 La estructura singular de los monoalquilsulfosuccinatos de estructura (I) les confiere la capacidad de compatibilizar o estabilizar los componentes muy concentrados en la formulación de pesticida/herbicida. Dicha capacidad se ilustra mejor mediante las características de los monoalquilsulfosuccinatos, particularmente el monobutilsulfosuccinato de sodio en las formulaciones con una carga elevada de glufosinato de amonio. En estas formulaciones, la carga activa es máxima (280 g/l). A medida que el contenido aumenta, el contenido de adyuvante aumenta y el contenido de agua disminuye. Consecuentemente, no hay suficiente agua para solubilizar tanto el ingrediente activo herbicida como el adyuvante. Sin la acción de un hidrótropo, los dos componentes se separarían.
- 10 La figura 1 muestra la estabilidad y la uniformidad de la formulación de carga elevada que contiene una mezcla 1:1 del ingrediente activo glufosinato de amonio y ACAR 7053 - un éter sulfato C8 muy concentrado usado en la formulación como adyuvante. Sin hidrótropo, la formulación es una mezcla turbia cuando está recientemente mezclada (figura 1A) que se separa en dos fases al reposar (figura 1B). En presencia del monobutilsulfosuccinato, que actúa como agente de compatibilidad, la formulación es clara cuando está recientemente mezclada y mantiene dicha claridad y uniformidad después de un reposo prolongado (figura 1C).
- 15 Las características del monobutilsulfosuccinato de sodio como hidrótropo de la formulación de pesticida que contiene ACAR 7053 como adyuvante también fueron confirmadas por los resultados del experimento diseñado. Como se muestra en la figura 2, el sulfosuccinato de comportó como hidrótropo en un amplio intervalo de concentraciones.
- 20 Los números asociados con la columna pequeña coloreada en el vértice superior izquierdo de la figura dan el porcentaje de separación de las muestras. Los colores en la barra se relacionan con las regiones coloreadas en el diagrama ternario. A medida que las regiones en el gráfico cambian del rojo al azul, el porcentaje de separación se aproxima a cero.
- 25 Las características de los hidrótropos de la invención son al menos igual, y a menudo superiores, a los hidrótropos convencionales, pero en cualquier caso se preferirían porque los hidrótropos de la invención son sencillos de preparar, son respetuosos con el medio ambiente y biodegradables. Los sulfosuccinatos se usan generalmente como agentes humectantes, particularmente los dialquilatos, p. ej. di-2-etilhexilsulfosuccinato, que tiene una solubilidad en agua bastante baja. Sin embargo, es bastante sorprendente que los sulfosuccinatos de la invención sean hidrótropos tan eficaces.
- 30 Los tensioactivos de la presente invención se pueden usar como un aditivo para mezclar en tanque o formulados como una formulación envasada. Son adecuados en una formulación de pesticida sólida y, particularmente, en una formulación de pesticida líquida.
- 35 Otros aditivos pueden estar presentes en las formulaciones que contienen los adyuvantes/tensioactivos de la presente invención. Son desespumantes, diluyentes, agentes de compatibilidad, biocidas, espesantes, agentes de control de la deriva de las partículas de polvo, colorantes, fragancias y agentes quelantes. La utilización de un agente de compatibilidad es particularmente importante si el tensioactivo que contiene nitrógeno de la presente invención no es muy compatible en formulaciones de pesticida concentradas. Cuando se usa un agente de compatibilidad es ventajoso que el agente de compatibilidad sea un tensioactivo que también puede aumentar la eficacia del pesticida. Uno de dichos agentes de compatibilidad preferidos es la dimetilamidopropilamina C6-C12.
- 40 El intervalo de temperatura durante la aplicación de la formulación de pesticida de la invención no es crítico y podría variar en función del cultivo y de la región geográfica.
- Tampoco hay un grado crítico de aplicación de la formulación. Esto dependería del cultivo particular y del pesticida empleado y también podría variar considerablemente.

REIVINDICACIONES

1. Una formulación de pesticida que comprende:

glufosinato de amonio como pesticida, y un adyuvante que es una sal de sodio o de amonio de un alcohol éter sulfato, siendo la relación entre el pesticida y el adyuvante de 1:1 a 1:5,

5 en la que la formulación comprende además un monoalquilsulfosuccinato hidrótripo que tiene la estructura:



en la que:

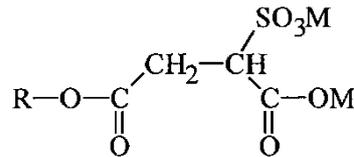
R es un grupo alquilo lineal o ramificado que comprende 3-8 átomos de carbono;

X es O, NH o R'N, en el que R' = grupo alquilo lineal o ramificado con 1-4 átomos de carbono;

10 Y y Z pueden ser el mismo o diferentes y comprenden: H , o SO₃M' donde M' = sodio, amonio, potasio o calcio; y

M puede ser sodio, amonio, potasio, calcio, etilamina, propilamina, isopropilamina o alcanolamina;

2. La formulación de pesticida según la reivindicación 1, en la que el monoalquilsulfosuccinato hidrótripo tiene la estructura:



15 donde R: grupo alquilo C3-C8, y M: ión sodio, potasio o amonio.

3. Un método para proporcionar protección pesticida a un cultivo agrícola mediante la aplicación de la formulación según la reivindicación 1 a dicho cultivo.

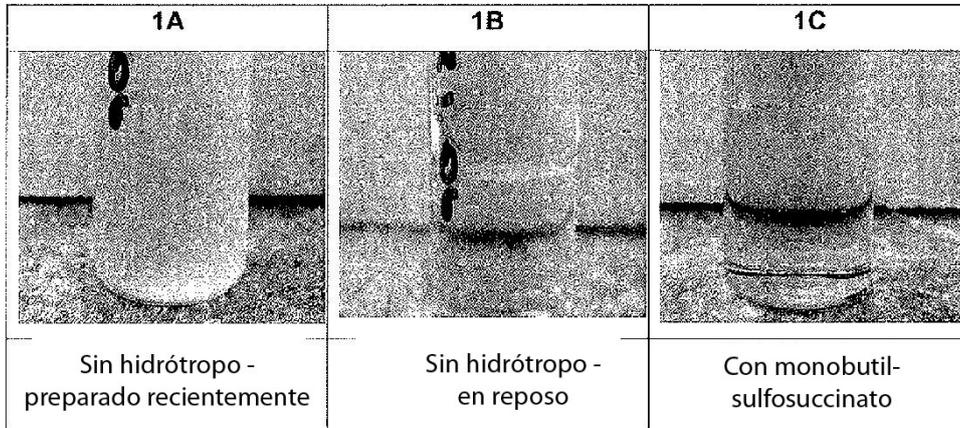


Figura 1: Claridad/uniformidad de una formulación con carga elevada de glufosinato de amonio que contiene ACAR 7053 como adyuvante

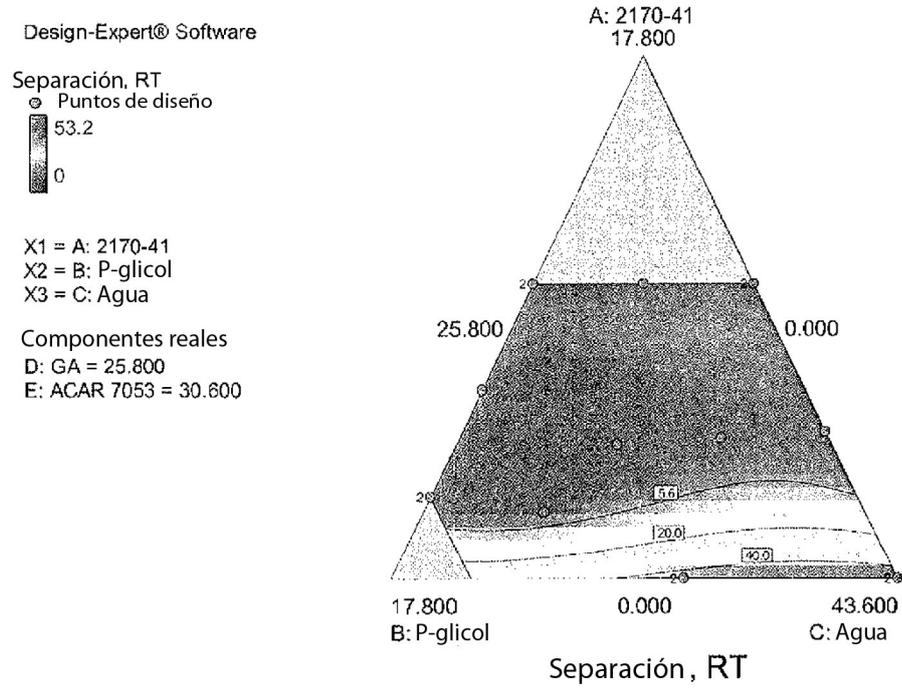


Figura 2: Experimento diseñado en función del monobutilsulfosuccinato de sodio como hidrótopo