



# (12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 102666477 A

(43) 申请公布日 2012. 09. 12

(21) 申请号 201080058420. 5

代理人 肖威 刘金辉

(22) 申请日 2010. 12. 23

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

09180941. 8 2009. 12. 30 EP

61/290, 974 2009. 12. 30 US

*C07C 233/03* (2006. 01)

*C07C 233/05* (2006. 01)

*A01N 25/22* (2006. 01)

*A01N 37/18* (2006. 01)

*A01P 3/00* (2006. 01)

(85) PCT申请进入国家阶段日

2012. 06. 21

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2010/070624 2010. 12. 23

(87) PCT申请的公布数据

W02011/080208 EN 2011. 07. 07

(71) 申请人 阿克佐诺贝尔化学国际公司

地址 荷兰阿默斯福特

(72) 发明人 A·M·格勒内韦根 K·奥弗肯佩

P·韦斯特拜耶

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

11247

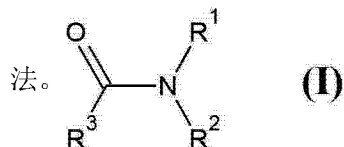
权利要求书 2 页 说明书 9 页

## (54) 发明名称

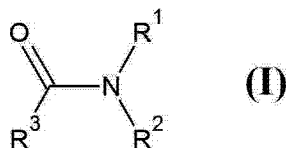
酰胺, 酰胺作为有机化合物溶剂的用途, 包含酰胺的组合物和乳液以及处理植物的方法

## (57) 摘要

本发明通常涉及通式 (I) 酰胺作为有机农业活性成分的溶剂的用途, 其中 R<sup>1</sup>为包含 9-14 个碳原子的直链或支化烷基; R<sup>2</sup>选自甲基、乙基和苄基; 且 R<sup>3</sup>选自氢、甲基和乙基; 还涉及包含有机农业活性成分和所述酰胺的组合物、用所述组合物处理植物的方法以及一些所述酰胺及其制备方



1. 通式 (I) 酰胺作为有机农化活性成分的溶剂的用途：



其中

R<sup>1</sup> 为包含 9-14 个碳原子的直链或支化烷基；

R<sup>2</sup> 选自甲基、乙基和苄基；且

R<sup>3</sup> 选自氢、甲基和乙基。

2. 根据权利要求 1 的用途，其中所述有机农化活性成分选自农药、植物生长调节剂或其混合物。

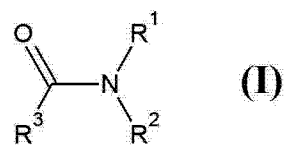
3. 根据权利要求 1 或 2 的用途，其中 R<sup>1</sup> 选自 2-丙基庚基、2-丁基辛基、异癸基、正癸基和单甲基取代的 C<sub>9-10</sub> 烷基。

4. 根据前述权利要求中任一项的用途，其中 R<sup>1</sup> 为 2-丙基庚基且 R<sup>2</sup> 为甲基。

5. 根据权利要求 4 的用途，其中 R<sup>3</sup> 为甲基或氢。

6. 根据前述权利要求中任一项的用途，其中所述有机农业活性成分为选自如下组的农药或植物生长调节剂：三唑类、嗜球果伞素类、苯并咪唑类、苯氧基羧酸类、苯甲酸类、磺酰脲类、吡啶羧酸类、新烟碱类、脘类、拟除虫菊酯类及其两种或更多种的混合物。

7. 一种组合物，其包含至少一种选自农药、植物生长调节剂及其混合物的有机农业活性成分，和通式 (I) 的酰胺：



其中

R<sup>1</sup> 为包含 9-14 个碳原子的直链或支化烷基；

R<sup>2</sup> 选自甲基、乙基和苄基；且

R<sup>3</sup> 选自氢、甲基和乙基。

8. 根据权利要求 7 的组合物，其中所述有机农业活性成分选自农药、植物生长调节剂及其混合物。

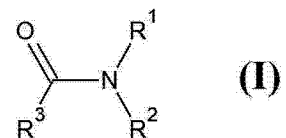
9. 根据权利要求 7 的组合物，其中所述农药或植物生长调节剂选自三唑类、嗜球果伞素类、苯并咪唑类、苯氧基羧酸类、苯甲酸类、磺酰脲类、吡啶羧酸类、新烟碱类、脘类、拟除虫菊酯类及其混合物。

10. 根据权利要求 7-9 中任一项的组合物，进一步包含乳化剂。

11. 根据权利要求 10 的组合物，所述组合物为乳液。

12. 处理植物的方法，包括使所述植物与根据权利要求 7-11 中任一项的组合物接触。

13. 一种通式 (I) 的酰胺：



其中

R<sup>1</sup> 为 2-丙基庚基；

R<sup>2</sup> 选自甲基、乙基和苄基；且

R<sup>3</sup> 选自氢、甲基和乙基。

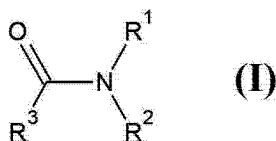
14. 根据权利要求 13 的酰胺，其中 R<sup>3</sup> 为甲基或氢。

15. 根据权利要求 14 的酰胺，其中 R<sup>2</sup> 为甲基。

16. 一种制备根据权利要求 13-15 中任一项的酰胺的方法，包括如下步骤：

- 使式 R<sup>2</sup>-NH<sub>2</sub> 的胺与式 R<sup>1</sup>-OH 的醇反应以形成式 (R<sup>1</sup>) (R<sup>2</sup>)NH 的胺；和

- 使所述式 (R<sup>1</sup>) (R<sup>2</sup>)NH 的胺与式 R<sup>3</sup>-COOH 的羧酸或其衍生物反应以形成通式 (I) 的酰胺：



其中

R<sup>1</sup> 为 2-丙基庚基；

R<sup>2</sup> 选自甲基、乙基和苄基；且

R<sup>3</sup> 选自氢、甲基和乙基。

## 酰胺, 酰胺作为有机化合物溶剂的用途, 包含酰胺的组合物 和乳液以及处理植物的方法

### 技术领域

[0001] 本发明涉及特定酰胺作为有机化合物溶剂的用途以及包含溶解于所述酰胺中的有机农业活性成分的组合物。此外, 本发明涉及使用本发明组合物处理植物的方法。此外, 本发明还涉及特定酰胺本身及其制备方法。

[0002] 本发明的背景技术

[0003] 有机溶剂通常用于溶解水不溶性或具有低水溶性的有机化合物。许多农业活性成分如农药和植物生长调节剂是通常为水不溶性或者具有低水溶性的有机化合物。因此, 在制备农业配制剂中通常使用溶剂以制备其中农业活性物质的浓度超过其在水中的溶解度的含水农业配制剂。

[0004] 农业配制剂通常以浓缩组合物形式提供, 其由最终用户用水稀释以获得最终使用, 例如喷雾至作物田间的工作组合物。例如在水不溶性农业活性物质的情况下, 浓缩组合物可为所述的可乳化浓缩物, 其在水混合时得到所述农业活性物质于水中的乳液。然而, 当用含水介质稀释该浓缩物时, 乳液中的农业活性物质倾向于结晶。这是非常不希望的, 因为这类晶体可堵塞喷嘴和 / 或可导致所述农业活性物质在田间的不均匀分布。为了解决该问题, 最近的研发已使用长链二烷基酰胺作为农业活性物质的溶剂。

[0005] US5, 206, 225 特定农药活性三唑类化合物在可喷雾组合物中结晶的抑制, 包括向其中添加基于  $C_6-C_{20}$  烷基羧酸的烷基羧酸二甲基酰胺。W02008/145063 公开了一种农化组合物, 其包含唑类活性成分和以足以防止或抑制所述唑类衍生物在所述组合物施用至场所的过程中结晶的量存在的 N, N- 二烷基长链酰胺。W095/15685 涉及羧酸酰胺在包含易于结晶的特定唑类衍生物的含水喷雾液施用中作为结晶抑制剂的用途。

[0006] 然而, 对上述现有技术所给出的溶剂应用而言, 尤其是在低温下, 仍存在一定程度的结晶问题。因此, 需要改进的有机溶剂。

[0007] 发明简述

[0008] 本发明的目的是至少部分克服现有技术的缺点并提供对水不溶性有机化合物和具有低水溶性的有机化合物具有高溶解能力, 且其在乳液中的使用可进一步降低有机农化活性成分的结晶倾向的有机溶剂。

[0009] 本发明人令人惊讶地发现, 至少部分鉴于该目的, 本文所进一步定义的特定酰胺可有利地用作水不溶性有机农化活性成分的溶剂。

[0010] 应当注意的是, 本发明涉及所附权利要求的所有可能组合。

[0011] 因此, 在第一方面中, 本发明涉及通式 (I) 的酰胺作为至少一种有机农化活性成分, 优选选自农药、植物生长调节剂及其混合物, 优选具有低水溶性或水不溶性的所述有机农化活性成分的溶剂的用途:

[0012]



胺；更优选为 N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺、N-甲基-N-(2-丙基庚基)乙酰胺和 N-甲基-N-正癸基甲酰胺。

[0034] 因此，其中  $R^1$  为 2-丙基庚基， $R^2$  选自  $C_{1-4}$  烷基、芳基、 $C_{1-4}$  烷基取代的芳基和苄基，优选选自甲基、乙基和苄基，最优选为甲基，且  $R^3$  为氢、甲基或乙基，优选为氢或甲基的通式 (I) 酰胺及其制备构成本发明的一个单独方面。

[0035] 通式 (I) 的酰胺尤其可根据下述一般方法合成。

[0036] 在第一个反应中，使式  $R^1-OH$  的醇与式  $R^2-NH_2$  的胺反应以形成式  $(R^1)(R^2)NH$  的胺。该第一个反应的反应条件对本领域技术人员而言是显而易见的，且该反应尤其可根据 US4, 229, 374 的教导进行。

[0037] 然后在第二个反应中，使胺  $(R^1)(R^2)NH$  与通式  $R^3-COOH$  的羧酸或其衍生物如所述羧酸的酐或酰基氯反应以形成通式 (I) 酰胺。该第二反应的反应条件对本领域技术人员而言是显而易见的，且该反应尤其可根据 March, J “Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure”, 1968, McGraw-Hill Kogakusha, Ltd, 第 336 页的反应 “0-53” 的教导进行。

[0038] 就第一个反应而言，应提及的是式  $R^1-OH$  的醇可呈纯净形式，即基本上仅含一种产品，或者可呈若干种醇的混合物形式。这类若干种醇的混合物的一个实例为获自 Shell Chemicals 的产品 **Neodol**<sup>®</sup> 91，其为包含约 80 重量 % 直链  $C_{9-11}$  醇和约 20 重量 % 单甲基取代的  $C_8$ 、 $C_9$  和  $C_{10}$  醇的混合物。

[0039] 可用于本发明中的有机农化活性成分优选选自具有低水溶性的那些，最优选为水不溶性的那些。可用于本发明中的有机农化活性成分（在本领域中也称为农业活性物质）优选选自农药和植物生长调节剂。

[0040] 本文所用的术语“有机农化活性成分”应理解为涵盖除本文所定义通式 (I) 酰胺和乳化剂（如果任何这些成分为农业活性成分的话）之外作为农化活性成分的任何有机化合物。

[0041] 本文所定义的术语“具有低水溶性的化合物”涉及在水中的溶解度至多为 5g/l，优选至多 1g/l 的化合物。

[0042] 本文所定义的术语“水不溶性化合物”涉及在水中的溶解度至多为 0.2g/l，优选至多 0.1g/l，更优选至多 0.05g/l，最优选至多 0.040g/l 的化合物。

[0043] 在本发明的上下文中，水溶性应理解为根据 ASTM E 1148-87 “Standard Test Method for Measurements of Aqueous Solubility”测定。

[0044] 本文所用的术语“农药”是指可防止、破坏、拒斥或减轻任何害虫的有机化合物。

[0045] 本文所用术语“植物生长调节剂”是指通过生理作用加快或减缓观赏植物或作物或其产品的生长速率或成熟速率或者改变其行为的有机化合物。

[0046] 可用于本发明中的农药包括但不限于杀真菌剂、除草剂、杀昆虫剂、杀螨剂 (miticide)、杀线虫剂、灭螨剂 (acaricide) 和灭螺剂。

[0047] 可用于本发明中的优选农业活性成分包括但不限于如下类别的农药和植物生长调节剂：三唑类、嗜球果伞素类、亚烷基双（二硫代氨基甲酸酯）类化合物、苯并咪唑类、苯氧基羧酸类、苯甲酸类、磺酰胺类、三嗪类、吡啶羧酸类、新烟碱类、有机磷酸酯类和拟除虫菊酯类。

[0048] 可用于本发明的杀真菌剂实例包括但不限于如下类别的杀真菌剂：三唑类（例如戊唑醇 (tebuconazole)、氟醚唑 (tetraconazole)、环唑醇 (cyproconazole)、氧唑菌 (epoxiconazole)、苯醚甲环唑 (difenconazole)、丙环唑 (propiconazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)）；啉球果伞素类（例如肟菌酯 (trifloxystrobin)、腈啉菌酯 (azoxystrobin)、氟啉菌酯 (fluoxastrobin)、唑菌胺酯 (pyraclostrobin)）；亚烷基双（二硫代氨基甲酸酯）类化合物（例如代森锰锌 (mancozeb)）和苯并咪唑类（例如多菌灵 (carbendazim)）。

[0049] 可用于本发明中的除草剂实例包括但不限于苯氧基羧酸类（例如 2,4-滴 (2,4-D) 酸），苯甲酸类（例如麦草畏 (dicamba) 酸），磺酰脲类（例如精甲磺胺黄隆 (methylsulfuron-methyl)、玉嘧黄隆 (rimsulfuron)），三嗪类（例如莠去津 (atrazine) 和西玛津 (simazine)）和吡啶羧酸类（例如定草酯 (triclopyr)）。

[0050] 可用于本发明中的杀昆虫剂实例包括但不限于新烟碱类（例如噻虫啉 (thiacloprid)、吡虫清 (acetamiprid)），脘类（例如虫螨脘 (amitraz)），有机磷酸酯类（例如毒死蜱 (chlorpyrifos)）和拟除虫菊酯类（例如氯菊酯 (permethrin)、氟氯菊酯 (bifenthrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)）。

[0051] 上述农药和植物生长调节剂各自的详细描述例如参见手册“The e-Pesticide Manual v4.0”，BCPC Publications Ltd, Alton, Hampshire. (ISBN 1 901396 42 8)。

[0052] 通式 (I) 酰胺可有利地用作除农业活性成分之外的许多有机化合物的溶剂。因此，上文所定义通式 (I) 酰胺作为至少一种上文所定义的有机化合物，优选具有低水溶性，更优选为水不溶性有机化合物的溶剂的用途也为本发明的一个单独方面。

[0053] 应当注意的是两种或更多种不同通式 (I) 酰胺的混合物也为本发明所设想的溶剂。

[0054] 通式 (I) 酰胺可用于加溶例如至多 800g 这类有机农业活性成分（在最终体积为 1 升中）。

[0055] 本发明还涉及一种组合物，其包含至少一种上文所述的有机农业活性成分，优选具有低水溶性，更优选为水不溶性的有机农业活性成分，和上文所定义通式 (I) 酰胺。优选所述至少一种有机农业活性成分至少部分，更优选完全溶于通式 (I) 酰胺中。

[0056] 所述一种或多种有机农化活性成分在本发明组合物中的浓度通常处于该特定化合物在该特定酰胺中的溶解度范围之内。所述至少一种有机农化活性成分在该组合物中的浓度为至少大于 0g/l，优选为至少 10g/l，最优选为至少 50g/l，且至多为约 800g/l，优选至多为约 500g/l，最优选至多为约 300g/l，基于有机农化活性成分与通式 (I) 酰胺的合并体积。在本发明的代表性组合物中，所述至少一种有机农化活性成分在该组合物中的浓度为约 250g/l。

[0057] 在一个实施方案中，本发明组合物为可乳化浓缩组合物（在下文和本领域中通常称作“可乳化浓缩物”），其包含本文所定义的组合物，且进一步包含乳化剂。因此，所述可乳化浓缩物包含本文所定义通式 (I) 酰胺，至少一种本文所定义的有机农化活性成分，优选为具有低水溶性，更优选为水不溶性的有机农化活性成分，以及乳化剂。

[0058] 在可乳化浓缩物中，活性成分，例如溶解于通式 (I) 酰胺中的有机农化活性成分的浓度通常对最终应用而言过高，且所述可乳化浓缩物的目的是用含水介质稀释成工作组

合物。

[0059] 在一个实施方案中,所述可乳化浓缩物优选包含其量为不形成乳液的水。优选所述可乳化浓缩物包含少于约 10 重量%,更优选少于约 1 重量%的水,基于所述可乳化浓缩物的总重。最优选本发明可乳化浓缩物基本不含水,这意指所述可乳化浓缩物不含超过不可避免的来自与周围气氛平衡的量的水。

[0060] 在另一实施方案中,所述可乳化浓缩物呈乳液形式,但其中所述至少一种有机农化活性成分的浓度显著高于最终应用的浓度,即所述可乳化浓缩物在预期的最终应用之前必须显著稀释。

[0061] 本发明的可乳化浓缩物通常以如下方式配制:当添加至含水介质中时,或者当将含水介质添加至所述可乳化浓缩物中时,形成乳液,优选其中所述至少一种有机农化活性成分溶解于通式 (I) 酰胺中,且该溶液乳化于所述含水介质中。

[0062] 乳化剂以当将所述可乳化浓缩物与含水介质混合时足以形成乳液的浓度包含于所述可乳化浓缩物中。乳化剂的最佳浓度取决于所用乳化剂的种类以及通式 (I) 酰胺的种类。乳化剂通常以基于每升可乳化浓缩物为至少约 10g,优选至少约 30g,最优选至少约 60g,且至多约 250g,优选至多约 150g,最优选至多约 100g 乳化剂的浓度存在。

[0063] 可用于本发明中的乳化剂包括被本领域技术人员称为乳化剂的表面活性剂,例如但不限于阴离子表面活性剂、非离子表面活性剂、聚合物以及其中两种或更多种的混合物,尤其是包含阴离子和非离子表面活性剂的混合物。

[0064] 可单独或组合用作乳化剂的阴离子表面活性剂实例包括 Ca/NaDDBS(十二烷基苯磺酸钙或钠)、磺基琥珀酸盐和磷酸酯。

[0065] 单独或组合用作乳化剂的非离子表面活性剂包括烷氧基化物、三苯乙烯基苯酚烷氧基化物、蓖麻油烷氧基化物和烷基苷。

[0066] 单独或组合用作乳化剂的聚合物实例包括氧化乙烯-氧化丙烯嵌段共聚物、丙烯酸基梳状聚合物和黄原胶。

[0067] 本发明还涉及一种含水乳液,其包含含水介质、乳化剂、至少一种有机农化活性成分,优选具有低水溶性,更优选为水不溶性的有机农化活性成分,和通式 (I) 的酰胺。优选所述至少一种有机农化活性成分溶解于通式 (I) 的酰胺中,且该溶液乳化于所述含水介质中。

[0068] 例如,所述乳液可通过将含水介质与前文所定义的可乳化浓缩物混合,或者通过将含水介质与通式 (I) 酰胺、所述至少一种有机农化活性成分和乳化剂混合而获得。

[0069] 本文所用术语“乳液”应理解为包括粗乳状液、微乳状液和悬浮乳液,即其中悬浮有颗粒状固体的乳液。

[0070] 作为本发明乳液组分的含水介质通常包含水作为主要组分。优选水占所述含水介质的至少 50 重量%,如至少 75 重量%,例如至少 90 重量%。所述含水介质可进一步包含其他组分,例如但不限于缓冲剂、pH 值调节剂如酸或碱、肥料等。

[0071] 当将所述可乳化浓缩物与含水介质混合时,形成乳液,优选形成稳定乳液,所述乳液为最终用户使用的工作组合物,其优点是最终用户不必处理和储存大量工作组合物,而是可制备当下所需的量。

[0072] 本发明乳液通常具有从约 1:50,优选从约 1:100,更优选从约 1:200,至约 1:1000,

优选至约 1:500,更优选至约 1:300 的配制剂与含水介质的体积比,其中“配制剂”表示通式 (I) 酰胺、溶解于其中的有机农化活性成分和乳化剂的组合,即所述配制剂可为所述可乳化浓缩物或者所述可乳化浓缩物的组分。在本发明的代表性乳液中,配制剂:含水介质的体积比为约 1:200。

[0073] 本发明的优点在于,即使在高度稀释所述乳液的情况下,即在所述配制剂与含水介质的低比例情况下,以及在显著低于室温的温度如 5° C 下,溶解于通式 (I) 酰胺中的水不溶性有机农化活性成分的结晶倾向也很低。出于许多原因,这是有利的。例如,本发明乳液也可在冷条件下喷雾,例如在 5° C 下或 5° C 左右,因为所述组合物不显示出形成晶体的倾向。此外,如果最后总用户在消耗完整批料乳液前必须停止喷雾,则未使用的乳液可随后使用,例如在第二天使用,即使该未使用的乳液在降低的温度下储存。

[0074] 一种处理植物的方法也构成本发明的一个单独方面。所述方法包括使所述植物与本发明组合物或乳液接触的步骤。优选植物的接触通过喷雾进行。在本发明处理植物的方法中所用的组合物或乳液中,所述农化活性成分优选溶解于通式 (I) 酰胺中。在本发明处理植物的方法中所用的乳液中,所述农化活性成分溶解于通式 (I) 酰胺中,且该溶液乳化于所述含水介质中。

[0075] 本发明乳液可原样提供,或者可单独提供其组分。因此,一种各部分的成套包装也构成本发明的一个单独方面,所述成套包装包含:(a) 本文所定义的通式 (I) 酰胺;(b) 乳化剂;和 (c) 至少一种有机农化活性成分,优选具有低水溶性或为水不溶性的有机农化活性成分,其中部分 (a) 和 (b)、(a) 和 (c)、或者 (b) 和 (c) 的所述成套包装可任选以组合形式提供。

[0076] 本领域技术人员知晓,除通式 (I) 酰胺、所述至少一种有机农化活性成分和乳化剂之外,本发明组合物、本发明可乳化浓缩物或者本发明乳液中可存在其他组分。这类其他组分的实例包括例如助剂,如通常用于提高农业活性物质的生物功效的生物功效增强剂。这类其他组分可存在于本发明组合物或可乳化浓缩物中,或者可存在于与所述可乳化浓缩物混合以形成本发明乳液的含水介质中,或者可分开添加至本发明乳液中。实验

[0077] 实施例 1—N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺的合成

[0078] 将总量为 846g(4.81 摩尔)的 N-甲基-N-(2-丙基庚基)胺添加至装备有冷凝器的 2L 圆底凸缘烧瓶(flange flask)中。将其量为 223.3g(4.80 摩尔)甲酸装入滴液漏斗中并在加热和用磁搅拌器搅拌下经 1 小时滴加至所述圆底凸缘烧瓶中。最终温度设定为 180° C,而初始反应混合物的沸点为 ~125° C。蒸出水并收集于圆底储存烧瓶中,由此从反应介质中移除水。在反应过程中,反应介质的沸点连续升高。该反应在大气压下进行总计为 3.5 小时的时间。滴定剩余的胺以监控该反应。当胺值不再降低时,通过温和抽真空至 100 毫巴达 2 小时而移除剩余的未反应物质。将反应混合物冷却至 60° C,然后解除真空。

[0079] 在 Varian INOVA 分光计上以 400MHz 质子共振频率,使用 5mm 4NQ-探测器记录溶解于 CDCl<sub>3</sub> 中的产物的 <sup>1</sup>H-NMR。NMR 位移值总结在下表 1 中。

[0080] 表 1 :N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺的 <sup>1</sup>H-NMR 谱中的 NMR 位移

[0081]

$\delta(\text{ppm})$	峰
0.87	多重峰
1.25	多重峰
1.68	多重峰
2.82和2.92	2个单峰
3.10和3.23	2个双峰
8.03	2个单峰

[0082] 将产物在二氯甲烷中稀释至约 20ppm 的浓度,并以 200° C 的注入温度注入气相色谱质谱仪 (Thermo Trace GCMS) 中。将氦气用作载气,其通量为 0.8mL/分钟,且在毛细管柱中 (HP-1ms) 进行分离。在 GC 谱中,在 15.41 分钟时观察到 N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺,且在 MS 谱中于 199m/z 处观察到峰。

[0083] N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺的沸点为 287° C,通过差示扫描量热法 (Mettler Toledo, DCS1) 测定并使用 STARe 软件 (Mettler Toledo) 评估。

[0084] 实施例 2—N-甲基-N-(2-丙基庚基)乙酰胺的合成

[0085] 使用与实施例 1 相同的试验程序,其中使用乙酸酐代替甲酸。使总量为 584.2g (3.32 摩尔) N-甲基-N-(2-丙基庚基)胺与 169.6g (1.66 摩尔) 乙酸酐反应。该反应在大气压下进行总计为 14.5 小时的时间。

[0086] 在 Varian INOVA 400 分光计上以 400MHz 质子共振频率,使用 5mm4NQ- 探测器记录溶解于  $\text{CDCl}_3$  中的产物的  $^1\text{H-NMR}$ 。NMR 位移值总结在下表 2 中。

[0087] 表 2 :N-甲基-N-(2-丙基庚基)乙酰胺个  $^1\text{H-NMR}$  谱中的 NMR 位移

[0088]

$\delta(\text{ppm})$	峰
0.90	多重峰
1.25	多重峰
1.68	多重峰
2.09	单峰
2.89和2.96	2个单峰
3.15和3.28	2个双峰

[0089] 使用与实施例 1 相同的气相色谱质谱仪程序。在 GC 谱中于 15.97 分钟时观察到 N-甲基-N-(2-丙基庚基)乙酰胺,且在 MS 谱中于 213m/z 处观察到峰。

[0090] N-甲基-N-(2-丙基庚基)乙酰胺的沸点为 291° C,通过差示扫描量热法 (Mettler Toledo, DCS1) 测定并使用 STARe 软件 (Mettler Toledo) 评估。

[0091] 实施例 3—活性成分的溶解性

[0092] 将不同农业活性成分溶解于 N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺和 N-甲基-N-正癸基甲酰胺中以评价所述活性物质在所述酰胺中的溶解性。

[0093] 这通过将所述活性成分 (AI) 添加至烧杯中,且随后添加溶剂直至全部 AI 溶解而进行。在试验过程中,在 23° C 的温度下继续搅拌该溶液。当所有物质溶解时,将烧杯静置 24 小时而不搅拌,以观察所述溶液是否稳定 (即无结晶)。

[0094] 作为对比,还列出了上文活性成分在水中的溶解度,所述值取自 e-Pesticide Manual v 4.0。

[0095] 表 3:活性成分溶解进 N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺和 N-甲基-N-正癸基甲酰胺中,以 100g 溶剂中的 AI 克数计

[0096]

溶解度(g AI/100g溶剂)			
活性成分(AI)	N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺	N-甲基-N-正癸基甲酰胺	水
戊唑醇	48	48	0.0036
苯醚甲环唑	38	38	0.0015
肟菌酯	23	23	0.000061
2,4-滴酸	41	>50	0.0311
虫螨脍	>50	>50	<0.00001
氟氯菊酯	>50	>50	<0.0000001

[0097] 实施例 4:乳液稀释液

[0098] 使用各溶剂 N,N-二甲基癸酰胺、N-甲基-N-辛基丙酰胺、N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺或 N-甲基-N-正癸基甲酰胺将包含 250g/l 戊唑醇的配制剂与 100g/l 表面活性剂混合物 (CaDDB 和三苯乙烯基苯酚乙氧基化物 (15EO), 50:50) 一起配制,并稀释至 1 升的最终体积。在环境温度 (~22° C) 下,以 1:100、1:150、1:200 和 1:500 的稀释体积比 (配制剂:水) 将各配制剂乳化进自来水中。将乳液倾入 100ml 锥形玻璃离心管中,并在三个不同温度 5° C、20° C 和 40° C 下随时间监测,以观察活性成分 (戊唑醇) 的结晶。

[0099] 结晶通过肉眼视觉观察而判断,且在下表中使用如下标准:

[0100] + 无可见晶体,

[0101] - 可见晶体。

[0102] 表 4:戊唑醇在 N,N-二甲基癸酰胺、N-甲基-N-辛基丙酰胺、N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺或 N-甲基-N-正癸基甲酰胺于自来水中的乳液中的结晶随时间的变化

[0103]

时间 (h)	5°C下的乳液															
	N,N-二甲基癸酰胺 (对比)				N-甲基-N-辛基丙酰胺 (对比)				N-甲基-N-(2-丙基庚基)甲酰胺				N-甲基-N-正癸基甲酰胺			
	1: 100	1: 150	1: 200	1: 500	1: 100	1: 150	1: 200	1: 500	1: 100	1: 150	1: 200	1: 500	1: 100	1: 150	1: 200	1: 500
3	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+
6	+	+	+	-	+	+	+	-	+	+	+	+	+	+	+	+
12	+	+	-	-	+	+	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+
24	+	-	-	-	+	+	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+
36	+	-	-	-	+	+	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+
48	+	-	-	-	+	-	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+
72	+	-	-	-	+	-	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+
96	+	-	-	-	+	-	-	-	+	+	+	+	+	+	+	+

[0104] 在 20° C 和 40° C 下,任何乳液都未见到结晶。