



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 274 981**

51 Int. Cl.:

A01N 33/00 (2006.01)	A01N 33/16 (2006.01)
A01N 35/00 (2006.01)	A01N 37/18 (2006.01)
A01N 43/00 (2006.01)	A01N 43/34 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)	A01N 55/08 (2006.01)
A01N 47/10 (2006.01)	C08K 11/00 (2006.01)
A01N 25/08 (2006.01)	A01N 25/12 (2006.01)
C08K 5/15 (2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **02747812 .2**

86 Fecha de presentación : **11.04.2002**

87 Número de publicación de la solicitud: **1377163**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **07.01.2004**

54 Título: **Una composición reguladora del crecimiento de las plantas granular soluble en agua concentrada y método de utilización de la misma.**

30 Prioridad: **11.04.2001 US 283217 P**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.06.2007

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.06.2007

73 Titular/es: **Valent Biosciences Corporation**
870 Technology Way
Libertyville, Illinois 60048, US

72 Inventor/es: **Devisetty, Bala, N.;**
Beach, Robert, M.;
Menendez, Ricardo, A. y
Warrior, Prem

74 Agente: **Ungría López, Javier**

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

Una composición reguladora del crecimiento de las plantas granular soluble en agua concentrada y método de utilización de la misma.

Campo de la invención

La presente invención está dirigida a una composición granular soluble en agua que incluye al menos un 40% de al menos un regulador del crecimiento de las plantas, al menos un aglutinante, al menos un disacárido y al menos un surfactante; así como a métodos para producir y utilizar la composición. La composición granular soluble en agua mejora de manera ventajosa la preparación de una formulación de un regulador del crecimiento de las plantas sólido para aplicación mediante pulverización, ya que tal composición se disuelve rápidamente, es fácilmente medida, puede ser preparada a una concentración mayor y está libre de polvo. Una composición granular soluble en agua actualmente preferida incluye al menos un 40% de al menos una giberelina como el regulador del crecimiento de las plantas.

Antecedentes de la invención

Los reguladores del crecimiento de las plantas son útiles para influir sobre un rango de procesos del desarrollo de las plantas incluyendo la elongación del tallo, la germinación, el reposo vegetativo, la floración, la expresión del sexo, la inducción de enzimas, el tamaño y la calidad de los frutos, así como la senescencia de las hojas y frutos. Los reguladores del crecimiento de las plantas pueden ser formulados en al menos cinco tipos de formulaciones diferentes: 1) soluciones, 2) polvos humectables, 3) polvos solubles, 4) tabletas y 5) gránulos dispersables en agua. Para utilizar tales formulaciones, deben ser diluidas en una solución acuosa antes de su aplicación mediante pulverización convencional. Cada uno de los tipos de formulaciones convencionales tiene desventajas, por lo que la investigación para proporcionar formulaciones de reguladores del crecimiento de las plantas mejoradas continúa. Las desventajas de las formulaciones convencionales serán discutidas con referencia a una clase específica de regulador del crecimiento de las plantas, la giberelinas, como representativas de las formulaciones convencionales de reguladores del crecimiento de las plantas en general.

Las giberelinas son una clase de reguladores del crecimiento de las plantas que son ácidos diterpenoides. Las giberelinas son producidas comercialmente mediante la fermentación de un hongo natural, *Gibberella fujikuroi*. Las giberelinas están comercializadas bajo varios nombres comerciales y son utilizadas comercialmente en una variedad de huertos de frutas, cultivos de hortalizas, plantas de escarda y cultivos ornamentales. El ácido giberélico utilizado predominantemente es GA₃, formulado en cualquiera de las cinco formas anteriormente descritas. Las otras giberelinas utilizadas comúnmente son una combinación de dos (GA₄₊₇) que son formuladas principalmente como soluciones en alcohol tetrahidrofurfúrico (THFA) o en propilén glicol.

Formulaciones en Solución

Las formulaciones de giberelinas en solución son desventajosas en varios aspectos. Las soluciones, tales como las de GA₄₊₇ en propilén glicol, están menos concentradas debido a la baja solubilidad de los compuestos activos y tienen una estabilidad limitada. De los solventes utilizados actualmente, el alcohol isopropílico y el alcohol metílico ofrecen graves desventajas tales como inflamabilidad y toxicidad, que dan lugar a restricciones en la fabricación, envasado, etiquetado, transporte y almacenamiento de tales soluciones. El THFA, utilizado en algunas de las formulaciones, es considerado corrosivo para los ojos y la piel. Además, la baja solubilidad de las giberelinas en propilén glicol no permite la preparación de formulaciones en solución de alta potencia. Estas formulaciones en solución de baja potencia requieren también un embalaje más grande, más espacio para su almacenamiento y costes más elevados asociados con el transporte, el almacenamiento y la eliminación de los recipientes. Debido a la muy baja solubilidad y a la hidrólisis indeseable, no ha sido posible formular las giberelinas en sistemas acuosos. Algunos ejemplos de formulaciones en solución de giberelinas incluyen PROGIBB 4%, RALEX, RELEASE LC y RYZUP, todas disponibles en Valent BioSciences Corp.

Formulaciones en Polvo

Una formulación en polvo es aquella que, cuando es mezclada con agua, se disuelve fácilmente en el agua y forma una solución verdadera. Una vez que se ha formado la solución, no se requiere un mezclado o agitación adicional de la mezcla del tanque.

El mezclado es un proceso de combinación de diferentes materiales, normalmente hasta un estado homogéneo. La agitación facilita el proceso de mezclado y es un proceso mecánico que implica ejes rotatorios de palas en el fondo del tanque de pulverización.

Un ejemplo de una formulación de giberelina en polvo es PROGIBB 2X, disponible en Valent BioSciences Corp., que contiene un 20% del ingrediente activo, giberelina. Una formulación de polvo humectable es una formulación seca, finamente triturada. En esta formulación, el ingrediente activo es combinado con un vehículo seco finamente triturado, normalmente una arcilla mineral, junto con otros ingredientes que aumentan la capacidad del polvo para ser suspendido en agua. Después de mezclar el polvo humectable con agua, se forma una suspensión que es posteriormente aplicada

mediante una técnica de pulverización. Ejemplos de una formulación de giberelina en polvo humectable incluyen PROGIBB PLUS, ACTIVOL 10% y RELEASE, todas disponibles en Valent BioSciences Corp.

La desventaja principal de las formulaciones de polvo humectable y de polvo soluble es que tienden a producir polvo en su manipulación, tal como cuando son vertidas, transferidas o medidas. Este polvo puede ser peligroso para la salud. Además, las formulaciones en polvo tienen a humedecerse poco y también se solubilizan lentamente después de su adición al agua. Las formulaciones en polvo tardan por tanto mucho tiempo en humedecerse, dispersarse y solubilizarse en la mezcla del tanque. La formación de grumos o de soluciones para pulverización parcialmente solubilizadas dará lugar a una distribución irregular del regulador del crecimiento de las plantas en la mezcla del tanque, con potencial para un rendimiento reducido en el campo. Algunas veces, la espuma en el tanque de pulverización producida por los adyuvantes del tanque de pulverización puede afectar también al humedecimiento y la solubilidad de los polvos humectables y solubles. Las formulaciones de polvo humectable dejarán también residuos insolubles indeseables en el tanque y en el follaje y los frutos pulverizados.

15 *Formulaciones en Tabletas*

Las formulaciones en tabletas son sistemas de administración de dosificación premedida. Son útiles en áreas pequeñas o con fines ornamentales. Las formulaciones en tabletas pueden ser efervescentes, que se disuelven en agua a lo largo de un periodo de dos a diez minutos, dependiendo del tipo y del tamaño de la tableta.

Sin embargo, las tabletas suministran solamente entre 0,1-1 gramo de ingrediente activo por tableta. No son ideales para operaciones en el campo a gran escala. Además, las tabletas efervescentes son muy susceptibles a la humedad; pueden ser lentas de disolver y son caras.

25 *Formulaciones Granulares Dispersables en Agua*

Los gránulos dispersables en agua son también conocidos como gránulos humectables o fluidos secos. Este tipo de formulación es similar a la de un polvo humectable, excepto en que el ingrediente activo es formulado como un gránulo dispersable. Para preparar los gránulos dispersables en agua para su aplicación mediante pulverización, son dispersados en agua y forman una suspensión después de su agitación. Se conocen muchas formulaciones granulares dispersables en agua diferentes para productos químicos agrícolas. Por ejemplo, EP 0 252 897 y la Patente de EE.UU. N° 4.936.901 describen reguladores del crecimiento de las plantas encapsulados en formulaciones granulares dispersables en agua; y la Patente de EE.UU. N° 5.622.658 describe una composición extruible para preparar gránulos dispersables en agua. Un ejemplo de una formulación de giberelina granular que contiene un 3,1% de ingrediente activo es Gibberellin Kyowa Soluble Powder, disponible en Kyowa Fermentation Industry de Japón.

Los gránulos dispersables en agua normalmente no tienen más de un ocho por ciento de contenido de humedad y forman suspensiones cuando son añadidos a soluciones acuosas. La suspensión resultante debe ser agitada durante un periodo de tiempo con el fin de dispersarla completamente. La agitación o la recirculación a través de una derivación de la mezcla del tanque debe ser también mantenida durante la aplicación. La calidad de los gránulos dispersables en agua es muy dependiente del proceso y del ingrediente activo y puede tener como resultado recuperaciones de bajo rendimiento, poca resistencia al rozamiento que da lugar a un potencial de polvo, un elevado coste de fabricación y una mala dispersión. Generalmente, las pulverizaciones de formulaciones granulares dispersables en agua dejan residuos insolubles indeseables sobre el follaje y los frutos tratados.

Para que los reguladores del crecimiento de las plantas tales como las giberelinas sean eficaces, el ingrediente activo debe solubilizarse en las mezclas del tanque antes de la aplicación. De otro modo, la eficacia del producto se verá gravemente afectada. Cuando se utilizan gránulos dispersables en agua, el agricultor puede no ser capaz a menudo de darse cuenta de si ha conseguido la solubilidad total del ingrediente activo en las soluciones para pulverización. Además, los gránulos dispersables en agua pueden endurecerse con el tiempo y tener por tanto como resultado una mala dispersabilidad y solubilidad del ingrediente activo. El polvo y la aglutinación pueden ser problemas con ciertos gránulos dispersables en agua y con ciertas formulaciones en polvo.

Por tanto, sería ventajosa una formulación de un regulador del crecimiento de las plantas que proporcionara una potencia elevada y una rápida solubilidad, y que evitara los problemas asociados con las formulaciones convencionales.

Breve resumen de la invención

La presente invención está dirigida a una composición granular soluble en agua que incluye al menos un 40% de al menos una giberelina, al menos un aglutinante, al menos un disacárido y al menos un surfactante; así como a métodos para producir y utilizar la composición. La composición granular soluble en agua mejora de manera ventajosa la preparación de una formulación de un regulador del crecimiento de las plantas sólido para su aplicación mediante pulverización, ya que tal composición se disuelve rápidamente, es fácilmente medida, puede ser preparada más concentrada y está libre de polvo para su manipulación. Una composición granular soluble en agua actualmente preferida incluye al menos una giberelina, polivinilpirrolidona, al menos un disacárido y al menos un surfactante.

La invención está dirigida a una composición granular soluble en agua que comprende: al menos un 40% de al menos una giberelina; al menos un aglutinante; al menos un disacárido y al menos un surfactante. Más específicamen-

te, el aglutinante puede ser polivinilpirrolidona, un lignosulfonato, una lignina, una lecitina, un almidón, un gluten, un polietilén glicol o combinaciones de los mismos; el disacárido puede ser sacarosa, lactosa, maltosa, almidones hidrolizados tales como maltodextrina y sólidos del jarabe de maíz, alcoholes de azúcar tales como sorbitol y manitol y otros azúcares tales como glucosa y fructosa o una combinación de los mismos; el surfactante puede ser un ácido graso etoxilado, un éster de glicol, un alcohol etoxilado, un éster de sorbitán ácido graso o una combinación de los mismos. La composición puede contener también al menos un componente adicional tal como un agente activo de superficie, un adhesivo, un adhesivo dispersante, un nematocida, un inductor de resistencia sistémica adquirida, un agente antiespumante, un conservante, un humectante, un colorante, un protector U.V., un tampón, un agente de flujo, un vehículo o una combinación de los mismos.

La composición puede tener de un 40 aproximadamente a un 80 por ciento en peso aproximadamente de al menos un giberelina, de un 0,1 aproximadamente a un 10 por ciento en peso aproximadamente de un aglutinante, de un 5 aproximadamente a un 95 por ciento en peso aproximadamente de un disacárido y de un 0,1 aproximadamente a un 10 por ciento en peso aproximadamente de surfactante.

La formulación es una composición de giberelina granular soluble en agua que contiene: al menos un 40% de al menos una giberelina, al menos un aglutinante, al menos un disacárido y al menos un surfactante. Un disacárido actualmente preferido es lactosa monohidrato, un aglutinante actualmente preferido es polivinilpirrolidona y un surfactante actualmente preferido es monolaurato de polioxietileno 20. La composición puede incluir también un regulador del crecimiento de las plantas adicional tal como una giberelina diferente, una auxina, una citoquinina, un ácido orgánico, un inhibidor de la biosíntesis de etileno o una combinación de los mismos. La composición puede tener de un 40 aproximadamente a un 50 por ciento en peso aproximadamente de giberelina, de un 0,1 aproximadamente a un 4 por ciento en peso aproximadamente de polivinilpirrolidona, de un 40 aproximadamente a un 60 por ciento en peso aproximadamente de lactosa monohidrato y de un 0,5 aproximadamente a un 5 por ciento en peso aproximadamente de monolaurato de polioxietileno 20.

La invención está dirigida también a un método para regular el crecimiento de las plantas que comprende la etapa de tratamiento del suelo, de una semilla o de una planta con una cantidad eficaz reguladora del crecimiento de la composición anteriormente descrita. La composición puede ser diluida con agua y aplicada mediante pulverización. Por ejemplo, cuando la planta es una planta productora de frutas, tal como una vid, la planta productora de uvas así tratada produce uvas más grandes y/o uvas con un mayor porcentaje de sólidos solubles.

La invención está dirigida también a un método para preparar una formulación de un regulador del crecimiento de las plantas granular, soluble en agua, que comprende las etapas de:

el cribado de las partículas de al menos una giberelina y de un disacárido separadamente para producir un polvo fino del regulador del crecimiento de las plantas y un polvo fino del disacárido;

la mezcla de dicho polvo fino del regulador del crecimiento de las plantas y de dicho polvo fino del disacárido para producir una mezcla homogénea;

la preparación de una solución acuosa de polivinilpirrolidona y un surfactante;

la combinación de dicha solución acuosa y dicha mezcla homogénea para formar una mezcla extruible;

la extrusión de dicha mezcla extruible para formar un material extruido;

el secado de dicho material extruido y, posteriormente,

el tamizado y la recuperación de gránulos solubles en agua de una formulación del regulador del crecimiento de las plantas.

En este método, el disacárido puede ser lactosa monohidrato.

La invención está dirigida también a un método para mejorar la utilización de una formulación de un regulador del crecimiento de las plantas sólido para su aplicación mediante pulverización, que comprende la etapa de formular dicho regulador del crecimiento de las plantas en una formulación granular soluble en agua conteniendo al menos un 40% de al menos una giberelina. En el método, la preparación de la formulación para aplicación mediante pulverización puede ser mejorada, ya que el polvo procedente de la formulación sólida puede ser eliminado después de la transferencia; puede obtenerse una medida exacta y una disolución rápida de la formulación sólida. El método es también ventajoso debido a que la formulación sólida contiene el doble de concentración del regulador del crecimiento de las plantas que las formulaciones convencionales de reguladores del crecimiento de las plantas. Una formulación actualmente preferida para ser utilizada en el método es una formulación granular soluble en agua que contiene al menos un 40% de al menos una giberelina, al menos un aglutinante, al menos un disacárido y al menos un surfactante. Una formulación actualmente muy preferida es una formulación granular soluble en agua que contiene al menos una giberelina, polivinilpirrolidona, lactosa monohidrato y monolaurato de polioxietileno 20.

Descripción detallada de la invención

Nosotros hemos descubierto ahora sorprendentemente que formulaciones sólidas de reguladores del crecimiento de las plantas son mejoradas si están en forma de gránulos solubles en agua. La formulación granular soluble en agua se disuelve fácilmente en el agua para formar una solución verdadera, de tal manera que no es necesario un mezclado prolongado ni una agitación ocasional o continua de la mezcla para pulverización en el tanque. La utilización de un disacárido, un aglutinante y un surfactante juntos permite la inclusión de una cantidad más concentrada del regulador del crecimiento de las plantas, al menos un 40%. Esta formulación más concentrada mejora la utilización, como será descrito con mayor detalle en los párrafos siguientes.

Las Composiciones

La formulación es granular. Según se utiliza en la presente, el término “granular” se refiere a un sólido compuesto por partículas visibles a simple vista. Un gránulo es un aglomerado de partículas finas.

La frase “regulador del crecimiento de las plantas”, según se utiliza en la presente, connota un producto que sirve para modificar el desarrollo secuencial normal de una planta tratada hasta su madurez agrícola sin destruir la planta. Tal modificación puede ser el resultado del efecto del material sobre los procesos fisiológicos de la planta, o del efecto de dicho material sobre la morfología de la planta. Estas modificaciones pueden ser también el resultado de cualquier combinación o secuencia de factores fisiológicos o morfológicos.

El regulador del crecimiento de las plantas es una giberelina.

El término “giberelinas” incluye diterpenoides que tienen un sistema de anillos tetracíclico. En términos de su nomenclatura, las giberelinas fueron numeradas según el orden de su descubrimiento, por lo que la numeración no significa la posición de un sustituyente particular. Los compuestos tienen diecinueve o veinte carbonos, y cuatro o cinco sistemas de anillos. Algunos ejemplos de giberelinas incluyen GA₃, referida comúnmente como ácido giberélico; y GA₄ y GA₇, que son precursores inmediatos de GA₃. Existen aproximadamente 90 giberelinas y todas están incluidas en el término general “giberelina”, “giberelinas” o “ácido giberélico”; un regulador del crecimiento de las plantas actualmente preferido. En las formulaciones, el ingrediente activo puede ser una única giberelina o una combinación de dos o más giberelinas.

El aglutinante facilita el trabado, la desintegración y la solubilización de la formulación. Los aglutinantes adecuados incluyen copolímeros de vinilpirrolidona alquilados tales como AGRIMER AL-10 y AGRIMER AL-10LC; polivinilpirrolidonas entrecruzadas tales como AGRIMER AT y AGRIMER ATF; copolímeros de acetato de vinilo y vinilpirrolidona tales como AGRIMER VA-6 y AGRIMER VA-7; lignosulfatos y sales de sodio o calcio de los mismos; silicatos de aluminio tales como MARASPERSE, VANISPERSE, BORRESPERSE, NORLIG, POLYFON y KRAFTSPERSE; ligninas no sulfonadas tales como INDULIN AT; arcillas tales como HYDRITE RS, celulosas microcristalinas tales como AVICEL PH y LATTICE NT; éteres de metil celulosa tales como METHOCEL; polímeros de etil celulosa tales como ETHOCEL; almidón (natural o modificado); gluten; silicatos y sales de sodio o calcio de los mismos; silicatos de aluminio magnesio tales como VEEGUM F; lecitinas naturales o modificadas tales como BEAKIN, CENTROMIX o YELKIN; alcoholes de azúcares tales como NEOSORB, SORBOGEM, MANOGEM y MALTISWEET, y polietilén glicoles, entre otros. Un aglutinante actualmente preferido es polivinilpirrolidona tal como AGRIMER 15, AGRIMER 30, AGRIMER 60, AGRIMER 90 y PLASDONE.

El disacárido es utilizado en la formulación como diluyente y como asistente para la granulación; los disacáridos adecuados incluyen sacarosa, lactosa y maltosa, almidones hidrolizados tales como maltodextrina y sólidos del jarabe de maíz, alcoholes de azúcares tales como sorbitol y manitol y otros azúcares tales como fructosa y glucosa, entre otros. Un disacárido actualmente preferido es lactosa monohidrato.

En la formulación, el surfactante es utilizado como agente humectante, así como asistente para la dispersión y la granulación. Los surfactantes adecuados incluyen surfactantes no iónicos, surfactantes aniónicos y surfactantes anfóteros. Los surfactantes no iónicos incluyen ésteres de sorbitán etoxilados tales como EMSORB, TWEEN y T-MAZE; ésteres de ácidos grasos con sorbitán tales como SPAN y ALKAMUL; ésteres de sacarosa y glucosa y derivados de los mismos tales como MAZON, RHEOZAN y GLUCOPON; alcoholes etoxilados tales como TRYCOL, BRIJ, ARMIX y PLURAFAC; alquilfenoles etoxilados tales como IGEPAL, MACOL y TERGITOL; aminas grasas etoxiladas tales como TRYMEEN y ETOMEEN; ácidos grasos etoxilados tales como EMEREST, ALKAMUL y TRYDET; ésteres grasos etoxilados y aceites tales como ALKAMUL y ATLAS G; ácidos grasos tales como ATLAS G-1556; ésteres de glicerol tales como MAZOL GMO; ésteres de glicol tales como GLYCOL SEG; derivados basados en lanolina tales como AMERCHOL CAB; ésteres metílicos tales como OLEOCAL ME; monoglicéridos y derivados tales como ETHOSPERSE G-26; ácidos grasos propoxilados y etoxilados tales como ANTAROX AA-60; copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno tales como PLURONIC o SURFONIC; surfactantes basados en silicona tales como SILWET, BREAKTHRU y mezclas de un surfactante organosilícico con surfactantes no iónicos o iónicos; polisacáridos, copolímeros de acrilamida y ácido acrílico; y derivados diol acetilénicos tales como SURFYNOL 104 o tristirilfenoles tales como SOPROPHOR, entre otros. Una familia de surfactantes actualmente preferida es la formada por los ésteres de sorbitán etoxilados. Surfactantes no iónicos tales como monolaurato de polioxietileno (20) (TWEEN 20 o POLYSORBATE 20) son actualmente los más preferidos.

ES 2 274 981 T3

Los surfactantes aniónicos adecuados incluyen ésteres de fosfato tales como EMPHOS y RHODAFAC; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos tales como POLYSTEP; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados tales como TRITON X-301; sulfatos de dodecil y tridecibencenos tales como CALMULSE; sulfonatos de naftalenos condensados tales como VULTAMOL; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno tales como MOREWET y sulfosuccinatos y derivados tales como MONAWET, entre otros.

Los surfactantes anfóteros adecuados incluyen lecitina y derivados de lecitina; e imidazolininas y derivados de imidazolininas tales como MIRANOL, entre otros.

Los nombres comerciales utilizados anteriormente para los aglutinantes y surfactantes son a menudo comunes para una clase o serie de aglutinantes o surfactantes. Por tanto, cuando se menciona un nombre comercial, cualquier aglutinante o surfactante de la familia que incluye tal nombre comercial será adecuado.

Otros componentes de la formulación pueden incluir agentes de superficie activos adicionales, adhesivos, dispersantes, nematocidas, inductores de la resistencia sistémica adquirida, vehículos inertes, conservantes, humectantes, colorantes, protectores de U.V. (ultravioleta), tampones, agentes de flujo, antiespumantes u otros componentes que faciliten el manejo y la aplicación del producto.

Ejemplos de vehículos inertes incluyen minerales inorgánicos tales como caolín, mica, yeso, fertilizantes, carbonatos, sulfatos o fosfatos; materiales orgánicos tales como azúcar, almidones o ciclodextrinas; o materiales botánicos tales como productos de madera, corcho, mazorcas de maíz en polvo, cáscaras de arroz, cáscaras de cacahuets y cáscaras de nuez. Un antiespumante actualmente preferido es polidimetilsiloxano y un vehículo actualmente preferido es aluminosilicato de sodio.

Se contempla también que los materiales de esta invención pueden ser utilizados en combinación con otros productos biológicos esenciales o microorganismos beneficiosos o ingredientes activos, tales como herbicidas, antimicrobianos, fungicidas, insecticidas, nematocidas, pesticidas biológicos tales como pesticidas microbianos, pesticidas bioquímicos (semioquímicos, hormonas o reguladores de las plantas naturales), pesticidas producidos por plantas (productos botánicos) o nutrientes de las plantas.

Las composiciones de esta invención pueden ser también formuladas como mezclas activas que pueden incluir diluyentes secos finamente divididos, expansores, agentes de carga, acondicionantes y excipientes, incluyendo varias arcillas, tierra de diatomeas, talco, etcétera, y mezclas de los mismos.

Una composición actualmente preferida contiene el ingrediente activo giberelina de grado técnico; un disacárido; un homopolímero de polivinilpirrolidona y un surfactante. Un ingrediente activo giberelina de grado técnico preferido es GA₃, ya que es el regulador del crecimiento de las plantas más ampliamente utilizado para agricultura, aunque pueden ser utilizadas otras giberelinas incluyendo, pero sin limitarse a GA₄, GA₇ y combinaciones de las mismas o mezclas de las mismas. El rango en peso de las giberelinas en la fórmula puede ser desde el 40% al 80%.

La cantidad de disacárido que puede ser utilizada dependerá del porcentaje de giberelina en la fórmula y puede variar entre el 5% y el 96%.

Cuando en la formulación se utiliza polivinilpirrolidona, puede tener un rango de peso molecular de 6.000 a 1.500.000. Un polímero actualmente preferido es polivinilpirrolidona (PVP) con un peso molecular medio de 57.500 (rango = 40.000 a 80.000, tal como PVP K-30, AGRIMER 30 o PLASDONE). El rango en peso de la polivinilpirrolidona en la fórmula puede variar entre el 0,1% y el 4%, dependiendo de la concentración de las giberelinas y de los demás aditivos.

Una composición específica actualmente preferida incluye de un 43 a un 46% de ácido giberélico; de un 47 a 57% de lactosa monohidrato; 1,4-2% de POLYSORBATE 20; de un 0,7 a un 2% de polivinilpirrolidona (AGRIMER 30).

Los presentes gránulos solubles en agua pueden ser contrastados con los gránulos dispersables en agua en el sentido de que los gránulos solubles en agua se disuelven en agua después de mezclar para formar soluciones acuosas, y pueden tener una mayor concentración del ingrediente activo que los gránulos dispersables en agua, los cuales se dispersan únicamente en el agua después de mezclar con agitación para formar suspensiones acuosas.

Una ventaja particular de las formulaciones granulares solubles en agua descritas anteriormente es que se dispersan y se disuelven fácilmente en agua, sin necesidad de una agitación prolongada o excesiva.

Las composiciones pueden ser producidas mezclando los ingredientes, extruyendo y secando el extruido para obtener la formulación granular soluble en agua deseada. Métodos para producir gránulos dispersables en agua para usos agrícolas están descritos en EP 0 665 714 B1; y en las Patentes de EE.UU. N^{os} 5.589.438; 4.865.842; 5.464.623; 6.087.306 y 6.013.272, entre otras. Sin embargo, el presente método para obtener gránulos solubles en agua no ha sido descrito previamente.

Los Métodos

Las giberelinas son reguladores del crecimiento de las plantas conocidos. Por ejemplo, la Patente de EE.UU. N° 4.242.120 describe una combinación, que no es para pulverización, de giberelinas con un carbohidrato de bajo peso molecular tal como sacarosa, glucosa, fructosa o maltosa para estimular la fructificación; y la Patente de EE.UU. N° 5.163.993 describe una combinación de giberelina y un surfactante para reducir los racimos de uvas. Sin embargo, las formulaciones granulares solubles en agua detalladas anteriormente no han sido descritas previamente.

Las formulaciones descritas anteriormente pueden ser utilizadas para regular el crecimiento de las plantas de plantas productoras de frutos, plantas productoras de hortalizas, plantas de escarda, cultivos de hortalizas, hierbas o árboles. Los beneficios de la utilización de la formulación varían según el tipo de fruto tratado. Por ejemplo, en las uvas, el tratamiento con la formulación puede dar lugar a un alargamiento de los racimos, uvas delgadas y más grandes. En las naranjas, limones, limas y mandarinas, la formulación puede dar lugar a un retraso del envejecimiento de la cáscara y reducir enfermedades tales como tinción de la cáscara, moteado por agua, una superficie pegajosa o viscosa, una cáscara hinchada o rotura bajo presión. En las cerezas, la formulación puede ser utilizada de manera ventajosa para producir frutos más grandes, de color más brillante y/o más firmes.

La formulación es preferiblemente diluida en agua y pulverizada sobre la planta o el árbol que va a ser tratado. La pulverización puede ser realizada mediante un equipamiento de aplicación terrestre o aérea convencional. Los volúmenes de la pulverización son variables dependiendo del huerto o cultivo, de la etapa de crecimiento y de las condiciones climáticas. El rango puede ser de 5 galones a 300 galones/acre o mayor. Un rango actualmente preferido está entre 250 y 300 galones por acre aplicados mediante un equipo de aplicación de pulverización presurizado. Con el fin de preparar una formulación para su aplicación, el tanque es llenado hasta la mitad con agua, seguido por la adición del adyuvante para pulverización y posteriormente por la adición del regulador del crecimiento de las plantas, seguido por la adición de más agua, y posteriormente se mezcla durante al menos 15 minutos antes de la pulverización real.

Alternativamente, la formulación puede ser aplicada directamente al suelo (en el que la planta será cultivada o está creciendo) con o sin fertilizantes granulares para el crecimiento y el mantenimiento mejorados de los cultivos.

Además, la formulación puede ser aplicada a semillas para conseguir el mismo efecto. La semilla puede ser arroz o arroz sin desgranar, alfalfa, algodón, sorgo, soja, maíz u otras hortalizas, semillas ornamentales o de hierba para césped y pastos, entre otros.

La concentración del regulador del crecimiento de las plantas variará dependiendo del tipo de fruto que va a ser tratado, de las peculiaridades del lugar y del resultado deseado. En general, la composición puede ser aplicada en una cantidad de campo de 0,02 aproximadamente a 50 libras/acre aproximadamente; preferiblemente en una cantidad de 0,1 aproximadamente a 5 libras/acre aproximadamente y muy preferiblemente en una cantidad de 0,5 aproximadamente a 3 libras/acre aproximadamente.

Una única aplicación puede ser suficiente aunque, dependiendo del fruto particular y de los resultados deseados, pueden realizarse aplicaciones múltiples.

Las formulaciones granulares pueden ser aplicadas a plantas, suelo o semillas junto con otros adyuvantes. Un adyuvante es un material añadido a una mezcla del tanque para facilitar o modificar la acción de un producto agroquímico, o las características físicas de la mezcla. Existen varios tipos de adyuvantes para la mezcla del tanque tales como agentes tamponantes, agentes de compatibilidad, agentes antiespumantes, concentrados de aceites vegetales modificados, surfactantes no iónicos, penetrantes, aceite de fitomezcla, dispersante/adhesivo, adhesivo, concentrados de aceites vegetales u otros componentes tales como acidificantes, humectantes, activadores y concentrados de aceites de cultivos. Un ejemplo de un agente tamponante es BUFFER-X, una mezcla de alquilarilpolietoxietanol, ácidos grasos, éteres de glicol, dicarboxilato de D-alquil benceno e isopropanol; un ejemplo de un agente de compatibilidad es LATRON AG-44M, una mezcla de surfactantes alquilarilpolioxietilén glicol y ésteres de fosfato; un ejemplo de un antiespumante es FOAM BUSTER, un dimetilpolisiloxano; ejemplos de adhesivos-dispersantes son LATRON B-1956, una resina alquilada de glicerol y ftálico modificada y SURFIX, un polímero de beta-pineno, y un ejemplo de un adhesivo es BOND, un polímero de látex sintético.

El tipo de adyuvante y la cantidad de aplicación variarán dependiendo del adyuvante utilizado, del cultivo, del crecimiento del cultivo, de las condiciones climáticas, del efecto deseado y de los demás aditivos de la mezcla del tanque, si es que se utiliza alguno. Otros aditivos de la mezcla del tanque pueden ser pesticidas o nutrientes foliares, por ejemplo.

Las formulaciones anteriormente descritas son particularmente ventajosas debido a que son más fáciles de manejar para su aplicación mediante pulverización. Cuando la formulación sólida es medida para su dilución en una solución acuosa, tiene una propiedad de resistencia al rozamiento excelente con un potencial mínimo para la producción de polvo durante el manejo, es más fácil de medir y se disuelve rápidamente. Además, las formulaciones granulares solubles en agua contienen una cantidad más concentrada de regulador del crecimiento de las plantas que otros tipos de formulaciones sólidas tales como gránulos dispersables en agua; por tanto las formulaciones granulares solubles en agua pueden ser envasadas, transportadas y almacenadas de manera más compacta.

Según se utiliza en la presente, el término “planta” incluye plantas productoras de frutos, plantas productoras de hortalizas, cultivos de plantas de escarda, cultivos de verduras, hierbas y árboles.

El fruto puede estar constituido por uvas, cerezas, limones, limas, naranjas, pomelo, fresas, piñas, frutos con hueso, manzanas, peras, arándanos o mandarinas. El cultivo de plantas de escarda puede ser de algodón, soja, maíz, caña de azúcar o arroz, entre otros. Los cultivos de verduras pueden ser de lechuga, alcachofas, apio o pimientos, entre otros. Las hierbas pueden ser Hierba de Bahía (*Paspalum notatum* Flugge), Grama (*Agrostis* L.), Grama común (*Cynodon dactylon* L.), Carpetgrass (*Axonopus affinis* Chase), Espiguilla de Kentucky (*Poa pratensis* L.), Bluegrass de Canadá (*Poa compressa* L.), Buffalograss (*Buchloe dactyloides* (Nutt.) Englem.), Césped festuca (*Festuca*), Avena loca anual (*Lolium L. Multiflorum* Lam.), Avena loca perenne (*Lolium perenne* L.), Hierba de San Agustín (*Stenotaphrum secundatum* Kuntze), Césped japonés (*Zoysia japonica* Steud.), Hierba de ciempiés (*Eremochloa ophiuroides* (Munro) Hack), otras hierbas de césped para establecimientos residenciales o comerciales, entre otras.

Por supuesto, la presente invención no está limitada a las realizaciones y modos de operación particulares descritos en la presente y es posible imaginar diferentes variaciones de los detalles sin alejarse del alcance de esta invención.

Los ejemplos siguientes se presentan con el fin de describir las realizaciones y utilidades preferidas de la invención y no tienen la intención de limitar la invención a no ser que se manifieste de otro modo en las reivindicaciones adjuntas a la misma.

Ejemplo 1

La formulación granular, soluble en agua, del regulador del crecimiento de las plantas fue preparada según sigue.

En primer lugar, se cribaron el regulador del crecimiento de las plantas, ácido giberélico, y el disacárido, lactosa monohidrato, con el fin de optimizar el tamaño de las partículas para obtener una mezcla homogénea así como para incrementar la tasa de solubilidad de los gránulos. Las partículas sólidas de ácido giberélico fueron desmenuzadas de tal manera que el 88% de las partículas pasara a través de un tamiz de retícula 100 (150 micrometros), y las partículas sólidas de lactosa monohidrato fueron seleccionadas de tal manera que un mínimo de un 98% de las partículas pasara a través de un tamiz de retícula 80 (180 micrometros). Los componentes así procesados fueron mezclados hasta que se obtuvo una mezcla homogénea.

A continuación, se preparó una solución madre de aglutinante según sigue. Se añadió lentamente polivinilpirrolidona (AGRIMER 30, disponible en International Specialty Products Inc.) a agua desionizada filtrada que había sido precalentada a 45°C-55°C, y posteriormente se mezcló hasta que se obtuvo una solución transparente. La mezcla fue luego enfriada. A continuación, se añadió con agitación a la solución acuosa del aglutinante un surfactante tal como un éster de sorbitán etoxilado (TWEEN 20, disponible en Uniqema) para formar una mezcla de aglutinante acuoso y surfactante.

La mezcla del aglutinante acuoso y el surfactante fue añadida posteriormente a velocidad controlada a la mezcla de partículas cribadas del regulador del crecimiento de las plantas y el disacárido. La masa húmeda no pegajosa resultante fue extruida a través de un extrusor y luego secada hasta menos de un 3% de humedad y tamizada para obtener la formulación final del regulador del crecimiento de las plantas granular soluble en agua. El producto deseado fue recuperado después de tamizar los gránulos mediante el pase a través de un tamiz de retícula 10 que tenía aberturas de 2000 micrometros y retenido sobre un tamiz de retícula 30 que tenía aberturas de 600 micrometros.

El procedimiento descrito anteriormente fue utilizado para preparar las formulaciones 1-3 representativas de la presente invención descritas a continuación en las Tablas 1-3. Muestras representativas de la Formulación 2 fueron sometidas durante cuatro semanas a una temperatura acelerada de 54°C y durante tres meses a una temperatura constante de 40°C, 5°C, 25°C y 30°C. Las propiedades físicas y químicas (% GA₃) de las formulaciones permanecieron estables durante el periodo de ensayo.

El método anterior es un ejemplo específico de la preparación de una formulación. En general, ácido giberélico con un tamaño de partícula en el rango de 30 micrometros a 250 micrometros y lactosa monohidrato con un tamaño de partícula en el rango de 30 micrometros a 180 micrometros, serán útiles para preparar las presentes formulaciones.

ES 2 274 981 T3

TABLA 1

Formulación 1			
Componente	Tipo	fuelle	% en peso
Giberelina GA ₃	regulador del crecimiento de las plantas	Abbott Laboratories	45,6
lactosa monohidrato	disacárido	Foremost Farms, EE.UU.	50,6
polivinilpirrolidona	aglutinante	AGRIMER 30, ISP Technologies, Inc.	0,8
copolímeros de bloque de óxido de etileno y óxido de propileno	surfactante	PLURONIC L-62, BASF Corp.	3,0

TABLA 2

Formulación 2			
Componente	Tipo	fuelle	% en peso
Giberelina GA ₃	regulador del crecimiento de las plantas	Abbott Laboratories	45,6
lactosa monohidrato	disacárido	Foremost Farms, EE.UU.	51,9
polivinilpirrolidona	aglutinante	AGRIMER 30, ISP Technologies, Inc.	1,0
Monolaurato de polioxietileno 20	surfactante	TWEEN 20, disponible en Uniqema	1,5

TABLA 3

Formulación 3			
Componente	tipo	Fuente	% en peso
Giberelina GA ₃	regulador del crecimiento de las plantas	Abbott Laboratories	45,6
lactosa monohidrato	disacárido	Foremost Farms, EE.UU.	51,7
lecitina	aglutinante	ULTRALEC P, disponible en ADM	1,2
monolaurato de polioxietileno 20	surfactante	TWEEN 20, disponible en Uniqema	1,5

Ejemplo 2

Con el fin de determinar la eficacia de la formulación granular soluble en agua, un ejemplo representativo de una formulación de ácido giberélico granular soluble en agua (Formulación 2 del Ejemplo 1) fue evaluado en el campo frente a una formulación disponible comercialmente de giberelina en polvo soluble (PROGIBB 2X, disponible en Valent BioSciences Corp.) para determinar los efectos sobre la producción de uvas Red Globe.

Las formulaciones de ensayo fueron preparadas según sigue. Se disolvieron 200 gramos de PROGIBB 2X disponible comercialmente, equivalentes a 40 gramos de ingrediente activo, en 500 galones de agua en un tanque de pulverización de tamaño comercial. De manera similar, se disolvieron 100 gramos de la formulación granular experimental soluble en agua de la presente invención (Ejemplo 2), equivalentes a los mismos 40 gramos de ingrediente activo, en 500 galones de agua en un tanque de pulverización de tamaño comercial. Ambas soluciones para pulverización contenían también un adyuvante comercial, LATRON B-1956, un surfactante no iónico basado en una resina dispersable en agua (resina alquilada de glicerol y ftálico modificada, disponible en Rohm & Haas), en un 0,05% p/p.

El experimento de campo se llevó a cabo en un huerto de uvas Red Globe en el oeste de Estados Unidos. Cada formulación diluida en agua fue pulverizada en una única cantidad de aplicación de 20 gramos de ingrediente activo en 250 galones de agua/acre sobre uvas Red Globe. Las bayas tenían 14-16 mm de diámetro en el momento del tratamiento. Tres meses después del tratamiento, se recolectaron las uvas y se registraron los datos sobre el tamaño de las bayas en gramos y el porcentaje de sólidos solubles (% Brix).

Los sólidos solubles son medidos mediante una técnica refractométrica estandarizada. Un incremento de sólidos solubles indica que ha mejorado la calidad de las bayas, ya que indica bayas más dulces.

Los datos presentados en la Tabla 4 muestran que los gránulos solubles en agua de la presente invención incrementaron sorprendentemente y significativamente el tamaño de las bayas y la cantidad de sólidos solubles en comparación con la formulación estándar, aunque las cantidades de aplicación sobre la base del ingrediente activo, la variedad y la etapa de crecimiento fueron similares para ambos tratamientos. El análisis estadístico indicó que estos números reflejaban mejoras reales y que no eran el resultado de hechos aleatorios.

TABLA 4

Comparación de los Efectos de Formulaciones de Giberelina sobre el Tratamiento de Uvas Red Globe		
Formulación de Giberelina	Tamaño de la Baya (gramos)	Media del % del peso de la baya/peso de sólidos solubles
gránulos solubles en agua	15,2 a	9,2 a
polvo soluble en agua	13,6 b	8,0 b
Separación de las medias determinada mediante el test de múltiples rangos de Duncan, p=0,05		

Ejemplo 3

Con el fin de determinar la eficacia de una formulación granular soluble en agua, un ejemplo representativo de una formulación de ácido giberélico granular soluble en agua (Formulación 2 del Ejemplo 1) fue evaluado en el campo frente a una formulación disponible comercialmente giberelina en polvo soluble (PROGIBB 2X, disponible en Valent BioSciences Corp.) para determinar los efectos sobre la producción de uvas Thompson Sin Semillas.

Las formulaciones de ensayo fueron preparadas según sigue. Se disolvieron 640 gramos de PROGIBB 2X disponible comercialmente, equivalentes a 128 gramos de ingrediente activo, en 500 galones de agua en un tanque de pulverización de tamaño comercial. De manera similar, se disolvieron 320 gramos de la formulación granular soluble en agua de la presente invención (Formulación 2 del Ejemplo 1), equivalentes a los mismos 128 gramos de ingrediente activo, en 500 galones de agua en un tanque de pulverización de tamaño comercial. Cada solución para pulverización contenía también un adyuvante comercial, LATRON B-1956, un surfactante no iónico basado en una resina dispersable en agua (resina alquilada de glicerol y ftálico modificada, disponible en Rohm & Haas), en un 0,05% p/p.

El experimento de campo se llevó a cabo en un huerto de uvas Thompson Sin Semillas en el oeste de Estados Unidos. Cada formulación diluida en agua fue aplicada dos veces, la primera vez cuando las bayas tenían 4-6 mm de

ES 2 274 981 T3

diámetro y una segunda vez cuando las bayas tenían 8-10 mm de diámetro. Ambas veces, las cantidades de aplicación se mantuvieron iguales para las dos formulaciones, 64 gramos de ingrediente activo pulverizados en una cantidad de 250 galones/acre. Tres meses después de la segunda aplicación, las uvas fueron recolectadas y se registró el tamaño de las bayas en gramos y el % de sólidos solubles (% Brix). Los datos presentados en la Tabla 5 muestran que los gránulos solubles en agua de la presente invención incrementaron sorprendentemente y significativamente el tamaño de las bayas y el contenido de sólidos solubles cuando se compararon con la formulación estándar, aunque las cantidades de aplicación sobre la base del ingrediente activo, la variedad y la etapa de crecimiento fueron similares para ambos tratamientos. El análisis estadístico indicó que estos números reflejaban mejoras reales, y que no eran el resultado de hechos aleatorios.

TABLA 5

Comparación de los Tratamientos de Uvas Thompson Sin Semillas		
Formulación de Giberelina	Tamaño de la Baya (gramos)	Media del % del peso de la baya/peso de sólidos solubles
gránulos solubles en agua	18,6 a	7,3 a
polvo soluble en agua	18,3 b	6,9 b
Separación de las medias determinada mediante el test de múltiples rangos de Duncan, p=0,05		

REIVINDICACIONES

1. Una composición granular soluble en agua que contiene:

al menos un 40% en peso de al menos una giberelina;

al menos un aglutinante;

al menos un disacárido; y

al menos un surfactante.

2. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho aglutinante es seleccionado del grupo que consta de polivinilpirrolidonas, lignosulfatos, ligninas, lecitinas, almidones, glútenes, polietilén glicoles y combinaciones de los mismos.

3. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho disacárido es seleccionado del grupo que consta de sacarosa, lactosa, maltosa, maltodextrina, sólidos del jarabe de maíz, sorbitol, manitol, glucosa, fructosa y combinaciones de los mismos.

4. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho surfactante es seleccionado del grupo que consta de ácidos grasos etoxilados, ésteres de glicol, alcoholes etoxilados, ésteres de ácidos grasos con sorbitán y combinaciones de los mismos.

5. La composición de la reivindicación 1, que contiene además un componente adicional seleccionado del grupo que consta de agentes de superficie activos, adhesivos, adhesivos dispersantes, nematocidas, inductores de resistencia sistémica adquirida, agentes antiespumantes, conservantes, humectantes, colorantes, protectores de U.V., tampones, agentes de flujo, vehículos y combinaciones de los mismos.

6. La composición de la reivindicación 1, en la que dicho disacárido es lactosa monohidrato, dicho aglutinante es polivinilpirrolidona y dicho surfactante es monolaurato de polioxietileno 20.

7. La composición de la reivindicación 6, que tiene de un 40 aproximadamente a un 50 por ciento en peso aproximadamente de giberelina, de un 0,1 aproximadamente a un 4 por ciento en peso aproximadamente de polivinilpirrolidona, de un 40 aproximadamente a un 60 por ciento en peso aproximadamente de lactosa monohidrato y de un 0,5 aproximadamente a un 5 por ciento en peso aproximadamente de monolaurato de polioxietileno 20.

8. La composición de la reivindicación 1, que contiene además al menos un regulador del crecimiento de las plantas adicional seleccionado del grupo que consta de auxinas, citoquininas, ácidos orgánicos, inhibidores de la biosíntesis de etileno y combinaciones de los mismos.

9. Un método para regular el crecimiento de las plantas que comprende la etapa de tratamiento de una semilla, suelo o planta con una cantidad reguladora del crecimiento eficaz de una composición de la reivindicación 1.

10. Un método para preparar una formulación de giberelina granular soluble en agua según se definió en la reivindicación 2, en la que el aglutinante es polivinilpirrolidona, que comprende las etapas de:

el cribado de las partículas de al menos una giberelina y un disacárido separadamente para producir un polvo fino del regulador del crecimiento de las plantas y un polvo fino del disacárido;

la mezcla de dicho polvo fino de giberelina y dicho polvo fino del disacárido para producir una mezcla homogénea;

la preparación de una solución acuosa de polivinilpirrolidona y un surfactante;

la combinación de dicha solución acuosa y dicha mezcla homogénea para formar una mezcla extruible;

la extrusión de dicha mezcla extruible para formar un material extruido;

el secado de dicho material extruido y, posteriormente,

el tamizado y la recuperación de gránulos solubles en agua de al menos una formulación de giberelina,

en la que la al menos una giberelina es al menos un 40% de la formulación.

11. Un método para mejorar la utilización de una formulación de giberelina sólida para aplicación mediante pulverización que comprende la etapa de formulación de dicha giberelina en una formulación granular soluble en agua según se definió en la formulación 1.