



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

(21) **PI0617379-9 A2**

(22) Data de Depósito: 09/10/2006
(43) Data da Publicação: 26/07/2011
(RPI 2116)



★ B R P I 0 6 1 7 3 7 9 A 2 ★

(51) *Int.Cl.:*
A01N 47/46 2006.01
A01N 65/00 2006.01

(54) Título: **COMPOSIÇÃO PESTICIDA**

(30) Prioridade Unionista: 14/10/2005 US 60/726,816

(73) Titular(es): Givaudan SA

(72) Inventor(es): Richard P. Sgaramella, Rodrigo Rodriguez-Kabana, Thomas McGee

(74) Procurador(es): Dannemann ,Siemens, Bigler & Ipanema Moreira

(86) Pedido Internacional: PCT CH2006000556 de 09/10/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/041885 de 19/04/2007

(57) Resumo: COMPOSIÇÃO PESTICIDA Uma preparação de pesticida compreende uma composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárfico e isotiocianatos de alua (AITCs) na relação de peso de 95:5 para 60:40. Ela é especialmente eficaz como um pesticida, especialmente contra nematódeos comumente encontrados no solo.



PI0617379-9

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSIÇÃO PESTICIDA**".

A presente invenção refere-se ao campo de controle de peste, e, em particular, ela refere-se às composições e métodos úteis para controle de pestes, especialmente pestes com base em solo.

Uma variedade de pestes de planta é conhecida causar dano significativo às sementes e plantas ornamentais e de cultivo. Pestes incluem vermes, insetos, nematódeos, lesmas, fungos, e similares. Geralmente estas pestes são controladas por pesticidas químicos, a maior parte das quais é tóxica para humanos ou animais e/ou o meio ambiente e as quais podem persistir por muito tempo após eles serem aplicados.

The United States Federal Insecticide, Fungicide and Rodent Act (FIFRA) define um "pesticida" como qualquer substância ou mistura de substâncias pretendida para prevenção, extermínio, repelimento, ou mitigação de qualquer peste. Por causa dos envolvimento com respeito à toxicidade de pesticidas químicos, a Agência de Proteção Ambiental (EPA) isentou certos pesticidas de risco mínimo do FIFRA. Os ativos na lista incluem diversos óleos essenciais tais como óleo de citronela, óleo de cravo-da Índia, óleo de gerânio, óleo de hortelã, óleo de hortelã-pimenta, óleo de capim limão, óleo gárlico, óleo de tomilho, óleo cedro e óleo de canela.

Óleos essenciais foram usados desde tempos primórdios como pesticidas. Muitas publicações mostram as propriedades fungicidas de óleos essenciais e diversas patentes os reivindicaram para controle de uma variedade de pestes. Por exemplo gárlico é vendido sob diversas marcas registradas; muitas contêm apenas baixo nível de óleo gárlico, o que limita sua eficácia. A Patente dos Estados Unidos 6.511.674 apresenta melhor eficácia quando a composição de uma solução de extrato gárlico tendo uma concentração quantificável maior do que dez por cento em peso de um extrato gárlico, o extrato gárlico compreendendo alitina, alicina, dissulfeto de dialila, e sulfóxido de dimetila.

Outra rotina é usar a família *Cruciferae* de plantas, cujos membros contêm glicosinolatos e enzimas de mirosinase, que em destruição

formam isotiocianatos de alila (AITCs) e outros compostos que são nocivos para pestes, tais como nematódeos, fungos patogênicos, e os que produzem um sabor amargo pungente para predadores de mastigação. Por exemplo a Patente dos Estados Unidos 6.207.705 ensina o uso de derivados sintéticos naturais e intimamente relacionados ou análogos relacionados às duas classes de compostos naturais, isto é glicosinolatos e monoterpenóides. Uma fonte particularmente boa de AITCs é o óleo de mostarda.

No entanto, o uso destes pesticidas naturais como substitutos para pesticidas químicos não foi tão bem-sucedido como antecipado, provavelmente devido a menor eficácia. Tentativas foram feitas para realçar sua eficácia, por exemplo, a Patente dos Estados Unidos 6.231.865 reivindica um inseticida natural para inibir o desenvolvimento de insetos, o inseticida compreendendo extrato gárlico e um óleo selecionado do grupo consistindo de óleo de semente de algodão, e óleo de canela.

Recentemente, o Governo Federal dos Estados Unidos começou oferecendo um processo de registro de "**fast-track**" como a EPA para "biopesticidas", que inclui tanto pesticidas com base natural quanto derivados ou análogos próximos.

Um dos problemas do uso de pesticidas naturais tais como óleos essenciais é que eles são altamente voláteis e sua atividade é apenas durante uma curta duração. Um modo de ter liberação sustentada é encapsular usando tecnologias tais como aquelas delineadas no Pedido de Patente dos Estados Unidos 2005-0214337.

Atualmente foi descoberto que, se gárlico e AITCs são usados juntos em relações particulares, há uma melhora surpreendente e inesperada em desempenho, particularmente na intensidade e duração do efeito. A invenção, em um aspecto, por esse motivo fornece uma composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárlico e AITCs na relação de peso de 95:5 a 60:40.

Em um outro aspecto, a presente invenção fornece uma preparação pesticida compreendendo uma composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárlico e isotiocianatos de alila

(AITCs) na relação de peso de 95:5 a 60:40, e opcionalmente um ou mais constituintes adicionais, por exemplo, veículos.

5 A invenção adicionalmente fornece um método de controle de pestes de planta, compreendendo a aplicação à planta e/ou ao solo no qual ela está desenvolvendo-se de uma composição que consiste essencialmente em uma mistura de óleo gárlico e AITCs na relação de peso de 95:5 a 60:40.

A relação de peso é de preferência entre 90: 10 e 70:30 e mais preferivelmente entre 85:15 e 80:20.

10 Embora AITCs puros possam ser usados, é preferível que uma fonte natural seja usada. Uma fonte especialmente boa é óleo de semente de mostarda.

Outra modalidade preferida é aonde o óleo gárlico e AITC são incorporados em cápsulas que são biodegradáveis.

15 Uma modalidade mais preferida é aonde a cápsula possui uma casca de hidrogel e um núcleo oleoso, o gárlico e AITC sendo carregados a cápsulas vazias na presença de água. Tais cápsulas são descritas, por exemplo, nas Patentes dos Estados Unidos 6.045.835 e 6.106.875, os conteúdos das quais são incorporados aqui por referência. Cápsulas vazias deste
20 tipo estão disponíveis comercialmente de Givaudan Flavors Corp.

A composição da invenção pode também ser incorporada em outros sistemas de liberação controlada. Muitos destes são conhecidos na técnica. Preferidas seriam partículas que são secadas por *spray* ou aglomeradas usando materiais de núcleo na lista da EPA de inertes, por exemplo
25 dextrose, cloreto de sódio e similares.

Uma modalidade preferida é aonde a composição sinérgica é pré-misturada em uma cera ou sólido de ponto de fusão baixo de peso molecular alto que pode ser misturada facilmente como suporte material, o material de suporte é um material capaz de absorção do óleo essencial e cera
30 ou sólido de ponto de ebulição baixo de peso molecular alto ao nível que a mistura resultante esteja na forma de um pó de fluxo livre; e fornece o mecanismo de controle da liberação da mistura de gárlico e AITC. Sólidos ade-

quados são materiais tais como argilas; sílicas; celitas; zeólitos; sais de metal, incluindo por exemplo, fosfatos; carbonatos, tais como bicarbonato de sódio; boratos, tais como borato de sódio; sulfatos tais como sulfato de sódio; polímeros solúveis em água; bórax; e misturas dos mesmos.

5 A composição pode ser utilizada como qualquer veículo adequado. A escolha de veículo dependerá do método de aplicação. Veículos líquidos tais como água podem ser usados de modo que eles possam ser aplicados como *sprays* e similares. No caso de água, se requerido, um emulsificante/solvente adequado poderia ser empregado. De preferência um
10 material aprovado pela EPA tal como sulfato de lauril sódio é usado. Outros líquidos adequados podem ser selecionados, de preferência aqueles na lista da EPA de inertes, por exemplo óleo de milho, óleo de semente de linho e óleo de soja.

Veículos sólidos podem ser quaisquer materiais inertes tais como
15 mo sabugo de milho moído, celulose, areia, terra, rocha moída, cinza de mosca, e misturas dos mesmos.

A composição pode ser aplicada como parte líquida e parte veículo.

É também considerado que a composição pode ser formulada
20 como outros pesticidas e/ou óleos essenciais para mitigar o odor de gárlico.

A invenção é também descrita como referência aos seguintes exemplos, nos quais todas as partes, porcentagens e relações são em peso.

EXEMPLOS

Exemplo 1

25 As seguintes cápsulas foram preparadas e testadas para liberação:

10% (peso) de gárlico

10% (peso) de AITC (óleo de mostarda)

10% (peso) (90 gárlico:10 AITC (% de peso/peso))

30 Procedimento:

Gárlico, AITC ou uma mistura dos dois na relação em peso de 90:10 foram carregados como ativos em 10% em peso de carga em micro-

cápsulas de gelatina obtidas de Givaudan Corporation, de acordo com o procedimento aqui abaixo descrito.

1. Misturar ativo, álcool e água (fase líquida) nas seguintes proporções (todas as quantidades em % em peso):

	% de Gálico (peso/peso)	% de AITC (peso/peso)	% de 90 gálico/10 AITC (peso/peso)
Cápsulas de gelatina	75	75	75
Ativo	10	10	10
Álcool	10	10	10
Água	5	5	5

5 2. Agitar vigorosamente até que uma emulsão seja formada.

3. Despejar a emulsão de fase líquida sobre as cápsulas em um misturador de cimento e homogenizar a mistura.

4. Deixá-la turbilhonando até que o pó esteja seco e de fluxo livre.

10 Aplicação

50 mgs foram misturados em 1 kg de terra. Estes foram colocados em um jarro de vidro. Uma amostra de topo livre foi tomada cada dia e analisada. Os seguintes resultados foram obtidos:

NANOGRAMAS POR LITRO

	Gálico	Mostarda	90:10 (peso/peso) de Gálico:AITC
15 Dia 1	4692	3590	9283
Dia 7	918	713	7876
Dia 14	248	36	4456
20 Dia 23	105	2,6	1335
Dia 28	102	1,1	1004

Surpreendentemente, a mistura é capaz de sustentar um alto nível de ativos liberados por mais tempo do que os materiais sozinhos.

Exemplo 2

25 As seguintes cápsulas foram preparadas como por exemplo 1 (todas as quantidades em % em peso):

	Gárlico % (peso/peso)	AITC % (peso/peso)	% de 85 Gárl- lico/15 AITC (peso/peso)	% em 50 Gárl- lico/50 AITC (peso/peso)
Cápsulas de gelatina	75	75	75	75
Ativo	10	10	10	10
Álcool	10	10	10	10
Água	5	5	5	5

Aplicação

50 mg foram misturados em 1 kg de terra. Estes foram colocados em um jarro de vidro. Uma amostra de topo livre foi tomada cada dia e analisada. Os seguintes resultados foram obtidos:

5 NANOGRAMAS POR LITRO

	85:15 (peso/peso) de Gárlico:AITC	50:50 (peso/peso) de Gárlico:AITC
Dia 1	9877	4917
Dia 7	8006	3177
10 Dia 14	4683	1863

Isto indica que o efeito da mistura não será como longa duração se a relação de gárlico para AITC se tornar muito alta.

Exemplo 3

15 Este exemplo investiga se as sementes poderiam ser protegidas contra pestes por meio de atividade pesticida prolongada e ser reativadas em plantação por liberação lenta continuada de gárlico e AITC.

As seguintes cápsulas foram feitas:

20 Uma mistura de gárlico e AITC na relação de 90:10 (peso/peso) foi carregada em 10% (peso) em microcápsulas de gelatina obtidas de Givaudan Corporation, de acordo com o procedimento no exemplo 1.

25 Sementes de milho foram tingidas de vermelho usando corante de semente Gustafson Pro-Ized. Uma solução aquosa a 10% foi preparada e as sementes foram misturadas e turbilhonadas com esta solução. As sementes foram deixadas secar a ar antes de adição das cápsulas de gárlico/AITC.

As sementes foram preparadas por fixação de várias concentrações de cápsulas conseqüentemente :

0,50% (5g de cápsulas/Kg de sementes)

1,00% (10g de cápsulas/Kg de sementes)

5 As sementes foram analisadas por coleta de topo livre como segue:

As sementes foram colocadas em jaras de coleta de vidro de 1 litro e deixadas equilibrar durante 30 minutos antes de coleta, isto representa as condições secas. Para as condições úmidas, as sementes foram submetidas a ativação de água a 10% (0,6 gramas para 6 sementes testadas) e deixadas equilibrar durante 3 horas antes de amostragem. O teste foi conduzido durante um período de 12 meses. Resultados são mostrados na seguinte tabela.

Resultados: Topo Livre de Sementes Secas e Úmidas

15 A mistura sinérgica de gárligo/AITC é liberada em uma taxa relativamente constante durante 12 meses.

		1 mês Ng/l	6 meses Ng/l	12 meses Ng/l
0,50%	Seca	1448,2	1062,4	1059,2
	Úmida	7369,2	11079,5	6094,9
1,00%	Seca	1097,2	1517,7	1404,5
	Úmida	8141,8	12022,2	13128

Na ativação de água, há um aumento repentino na concentração de gárligo/AITC claramente indicando liberação dos ativos.

Para explorar se a germinação de semente foi afetada pelo sistema de gárligo/AITC, amostras de algodão de 50,8 x 50,8 milímetros (2 x 2 polegadas) foram colocadas em placas de Petri de vidro. 3 a 4 ml de água foram adicionados ao algodão e 1 semente foi colocada na amostra. A placa de Petri foi colocada em um forno fixado a 27°C (78°F) para observação de germinação. Uma semente de cada nível de concentração foi observada.

25 Depois de 7 dias transcorridos, todas as sementes tratadas mostraram clara evidência de germinação.

As cápsulas de gárligo/AITC são estáveis em armazenagem

emanando mistura de gárligo/AITC durante 12 meses e também fornecem um nível aumentado quando as sementes são irrigadas. Nenhuma atividade deletéria à germinação de semente de milho foi observada.

Exemplo 4

5 Exemplo de uma composição sólida.

Polietileno Glicol 4000 foi colocado em um vaso de mistura e a mistura de óleo gárligo e AITC foi adicionada como agitação. Quando homogeneizada, ela foi despejada sobre uma mistura de zeólito e argila de bentonita em um misturador de cimento e turbilhonada até que a mistura
10 ficasse um pó de fluxo livre seco. Os materiais foram misturados na seguinte proporção:

	<u>% (peso)</u>
Gárligo/AITC (85:15)	20
Polietileno Glicol 4000 (Union Carbide)	1
15 Bentonita H (Whitaker, Clark & Daniels)	10
Zeólito de Aluminosilicato de Valfor® 100 (PQ Corp.)	69

O resultado era um pó de fluxo livre.

Exemplo 5

Exemplos adicionais de pó de fluxo livre (todas as quantidades em % em
20 peso):

		A	B	C	D
Componentes de óleos ativos	Gárligo	8,5	12,75	8,5	17
	AITC	1,5	2,25	1,5	3
Fixador	Cera de parafina*	1	1		
	Cera de abelha**			1	
	PEG 4000				1
Componentes de pó	Sabugo de milho moído	60	55		
	Caulinita***			49	
	Bentonita	29	29	40	19
	Zeólito				60
Total		100	100	100	100
Fluxo Livre? Y/N		Y	Y	Y	Y

** SP 422P (Strahl & Pitsch)

*** (Southern Clay Products)

Exemplo 6

Teste de terra de uma composição encapsulada.

5 Óleo gárlico, uma combinação de 85/15 (peso/peso) de óleo gárlico/AITC e água (controle) foram carregados em cápsulas de gelatina disponíveis comercialmente por Givaudan Flavors Corp. A carga em cada caso foi de 20% (peso)

10 Os três tipos de cápsula foram testados em amostras de terra. A terra foi derivada de um campo de algodão (barro de sedimento, pH 6,2, CEC (capacidade de permuta de cátion) <10meq/100g de terra, matéria orgânica <1,0%). Ela foi naturalmente infestada com nematódeo de protuberância de raiz (*Meloidogyne incognita*), nematódeo espiral (*Heliocotylenhus dihystrera*) e nematódeo de dano (*Pratylenchus brachyurus*). A terra foi mis-
15 turada 50/50 (vol.) e dividida em lotes de 1 Kg, os quais foram colocados em potes de PVC de 10 cm de diâmetro.

20 A cada três séries de potes foram adicionados 100 ml de cada uma das três composições encapsuladas, produzindo uma taxa de 400 mg de formulação por Kg de terra. Os potes foram em seguida cobertos como 1,5 mil (0,038mm) de polietileno claro espesso. Depois de 8 dias, o polietileno foi removido e as terras submetidas à análise nematológica.

25 Cada pote foi em seguida plantado como soja "Hutcheson" (5 mudas por pote) e as plantas foram deixadas crescer durante 7 semanas. Elas foram em seguida removidas do solo e parâmetros de desenvolvimento foram determinados. Além disso, amostras de solo foram analisadas para fornecer uma contagem de nematódeo final e as raízes foram incubadas para determinar níveis de nematódeo nelas. Os resultados foram como segue:

	controle	gárlco	gárlco/AITC
	Contagem de nematódeo final		
<i>M. ingognita</i> , pré-planta, número/100 ml de terra	37	10	-
<i>M. ingognita</i> , final, número/100 ml de terra	53	25	10
<i>M. ingognita</i> , número em sistema de raiz	500	310	200
<i>H. dihystra</i> , número em sistema de raiz	15	39	2
	outros		
Altura de broto média (cm)	25,2	26,5	24,7
Raízes frescas de peso médio (g)	16,8	19,8	18,4

Os resultados mostram que o desenvolvimento total da combinação de gárlco/AITC foi significativamente melhor do que aquele do controle ou do gárlco sozinho.

REIVINDICAÇÕES

1. Preparação de pesticida compreendendo uma composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárlico e isotiocianatos de alila (AITCs) na relação de peso de 95:5 a 60:40, e opcionalmente um veículo.
5
2. Preparação de acordo com a reivindicação 1, em que os AITCs são fornecidos por óleo de mostarda.
3. Preparação de acordo com a reivindicação 1, em que a proporção de óleo gárlico para AITCs é de 90:10 a 70:30.
- 10 4. Preparação de acordo com a reivindicação 1, em que a proporção de óleo gárlico para AITCs é de 85:15 a 80:20.
5. Preparação de acordo com a reivindicação 1, em que a composição está na forma sólida.
6. Preparação de acordo com a reivindicação 5, em que a forma
15 sólida é fornecida pela adsorção da composição em um veículo sólido poroso.
7. Preparação de acordo com a reivindicação 5, em que a forma sólida é fornecida pelo encapsulamento da composição.
8. Preparação de acordo com a reivindicação 7, em que as cápsulas têm cascas de hidrogel e núcleos oleosos.
20
9. Preparação de acordo com a reivindicação 6, em que a composição adsorvida no veículo sólido poroso é pré-misturada em uma cera ou sólido de baixo ponto de fusão, de peso molecular elevado.
10. Método de controle de pragas de planta, compreendendo a
25 aplicação à planta e/ou ao solo no qual ela está desenvolvendo-se de uma preparação pesticida como definida na reivindicação 1.
11. Método de acordo com a reivindicação 10, em que a preparação é aplicada na forma sólida.
12. Método de acordo com a reivindicação 11, em que a forma
30 sólida é fornecida pela absorção da composição em um veículo sólido poroso poeirento.
13. Método de acordo com a reivindicação 12, em que a compo-

sição é pré-misturada em uma cera ou sólido de baixo ponto de fusão, de peso molecular elevado, antes de adsorção no sólido.

14. Método de acordo com a reivindicação 11, em que a forma sólida é fornecida pelo encapsulamento da composição em cápsulas.

5 15. Método de acordo com a reivindicação 14, em que as cápsulas possuem cascas de hidrogel e núcleos oleosos.

16. Composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárlico e isotiocianatos de alila (AITCs) na relação de peso de 95:5 a 60:40.

10 17. Método de controle de pestes de planta, compreendendo a aplicação à planta e/ou ao solo no qual ela está desenvolvendo-se, de uma composição pesticida como definida na reivindicação 16.

PI 0617379-9

RESUMO

Patente de Invenção: "**COMPOSIÇÃO PESTICIDA**".

5. Uma preparação de pesticida compreende uma composição pesticida consistindo essencialmente em uma mistura de óleo gárrico e isotiocianatos de alila (AITCs) na relação de peso de 95:5 para 60:40. Ela é especialmente eficaz como um pesticida, especialmente contra nematódeos comumente encontrados no solo.