

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

(21) **PI0800792-6 A2**

(22) Data de Depósito: 28/02/2008
(43) Data da Publicação: 19/10/2010
(RPI 2076)



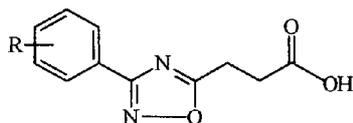
(51) *Int.Cl.:*
A01N 43/836
A01P 7/04

(54) Título: **NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1,2,4-OXIDIAZOL**

(73) Titular(es): UNIVERSIDADE FEDERAL DE PERNAMBUCO

(72) Inventor(es): DANIELA MARIA DO AMARAL FERRAZ NAVARRO

(57) **Resumo:** NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1,2,4-OXIDIAZOL. Processo de preparação de um novo larvicida contra o mosquito transmissor da dengue, dengue hemorrágica e febre amarela, caracterizado pela utilização de seis compostos derivados de oxadiazóis. A utilização como inseticida larval ou larvicida dos destes compostos no combate às larvas do mosquito *Aedes Aegypti* bioqueiam seu ciclo de vida, não deixando que chegue a fase adulta, prevenindo a sua propagação. Os compostos ácidos utilizados na composição do novo larvicida foram testados frente às larvas de estágio L4 e apresentaram mortalidade de 100% em concentrações entre 0,01 ppm e 70 ppm. Outro aspecto importante destacado neste processo, foi a sua utilização em ambiente doméstico e por não apresentar toxicidade ao ser humano.



R= CH₃ (orto, meta e para), p-bromo, p-nitro, p-metóxi, F



“NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1,2,4-OXIDIAZOL”.

5 A presente Patente de Invenção refere-se a um processo de preparação de um novo larvicida contra o mosquito transmissor da dengue, dengue hemorrágica e febre amarela, conforme as normas estabelecidas pela WHO - Organização Mundial de Saúde, e que tem como componentes seis compostos derivados de oxadiazóis.

10 O controle do mosquito *Aedes aegypti*, transmissor da dengue, dengue hemorrágica e da febre amarela, tem sido uma constante preocupação das autoridades brasileiras, por ser o inseto causador destas doenças que são uma das principais questões de saúde pública da atualidade, provocando um desequilíbrio social.

15 Em nosso país, existem em determinadas regiões, ambiente favorável a proliferação do mosquito, tendo em vista o desequilíbrio sócio-econômico existente nelas, acrescida a falta de cuidados no combate à sua proliferação pela própria população existente nesses locais.

20 Estas doenças promovem altos gastos com internação e medicamentos, e, dependendo da gravidade a morte é inevitável. Sendo a melhor maneira de conter as doenças transmissíveis pelo inseto *Aedes aegypti*, seja, a prevenção.

25 A utilização de compostos inseticidas no combate às larvas do mosquito *Aedes aegypti*, transmissor da dengue, dengue hemorrágica e da febre amarela, bloqueando seu ciclo de vida, não deixando que chegue a fase adulta, prevenindo a sua propagação, tem sido, uma das armas mais usadas

pelos órgãos de saúde pública, pelas autoridades responsáveis, na tentativa de conter a disseminação deste inseto.

O maior problema do uso prolongado de um inseticida larval(ou larvicida), tal como o temefós, está no fato dos insetos adquirirem resistências com o passar dos anos. Assim a busca por novas substâncias larvicidas torna-se imperativa.1

A maior parte dos inseticidas larvais (larvicidas) utilizados são importados e tóxicos ao ser humano. A utilização de um inseticida larval (larvicida) nacional que não seja tóxico para o homem e que seja facilmente obtido de forma sintetizada e obtido com tecnologia nacional, traria enormes benefícios ao nosso país.

A presente invenção desenvolveu-se com o objetivo de tornar-se uma alternativa de inseticida larval (larvicida) de produção nacional, para serem utilizados no futuro como substituintes dos inseticidas larvais já existentes no mercado e que vêm apresentando resistência por parte das larvas em campo pelo seu uso prolongado.

Os inseticidas larvais atualmente utilizados têm patente estrangeira reconhecidos pela WHO, utilizam produtos (Bti ou Temefós) e tecnologia de fora do nosso país. Sendo a presente invenção um larvicida nacional fácil de ser sintetizado, não sendo tóxico ao ser humano (não é genotóxico) nas concentrações utilizadas para matar as larvas do mosquito *Aedes aegypti*.

Outra vantagem na utilização desses compostos, está em sua utilização em ambiente doméstico (vasos, ralos e etc.), por não apresentarem toxicidade ao ser humano.

Os compostos ácidos 3-[3- (aril)- 1,2,4 – oxadiazol-5-il] propanóicos, onde o grupo aril = fenil, o - , m- e p – toluil, p-anisil, p-bromofenil, p-nitrofenil foram testados frente à larvas de estágio L4 (machos e fêmeas) de *Aedes aegypti*, segundo a metodologia da WHO e apresentou mortalidade de 100% em concentrações entre 0,01 ppm a 70 ppm para estágio L4 (machos e fêmeas).

Estrutura Química dos larvicidas ácidos derivados do 1,2,4 – oxadiazol

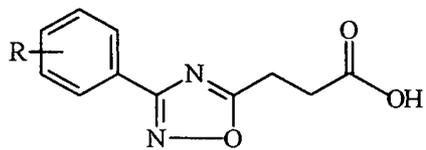
A utilização como inseticida larval ou larvicida dos compostos dos ácidos 3-[3- (aril)- 1,2,4 – oxadiazol-5-il] propanóicos, onde o grupo aril = fenil, o - , m- e p – toluil, p-anisil, p-bromofenil em baixas concentrações (< 110 ppm), em solvente adequado (etanol, acetona, DMSO, tween, etc) ou elaboradas, associadas, adsorvidas ou incorporadas em qualquer tipo de polímero, material nano-estruturado, sol-gel, gel, cerâmica, etc.

REIVINDICAÇÕES

1. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, caracterizado pela utilização como inseticida larval ou larvicida dos compostos dos ácidos 3-[3- (aril)- 1,2,4 – oxadiazol-5-il] propanóicos, onde o grupo aril = fenil, *o* -, *m*- e *p* – toluil, *p*-anisil, *p*-bromofenil, em baixas concentrações (< 110 ppm), em solvente adequado ou elaboradas, associadas, adsorvidas ou incorporadas em qualquer tipo de polímero, material nano-estruturado, sol-gel, gel, cerâmica, etc.
2. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por apresentar atividade larvicida segundo o protocolo da OMS - Organização Mundial da Saúde, cujas moléculas já foram testados quanto a atividade anti-inflamatória e grau de toxicidade em ratos, demonstrando o seu potencial farmacológico;
3. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, processo de acordo com a reivindicação 2, caracterizado pelo fato de que os solventes orgânicos ou inorgânicos (em mistura ou não) utilizados para facilitar a introdução destes compostos em sítios artificiais de ovoposição do mosquito em ambiente doméstico ou não doméstico;
4. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, processo de acordo com a reivindicação 3, a utilização destes compostos como larvicidas em formulações sólidas, líquidas ou em qualquer outro estado da matéria (sol, gel, sol-gel, etc);

5. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, processo de acordo com a reivindicação 2, 3 e 4, caracterizado pela utilização dos referidos compostos nas concentrações mínimas de 0,01 ppm e máxima de 110 ppm, formuladas isoladamente ou de uma mistura entre si, em qualquer concentração anteriormente citadas;
6. “NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1, 2, 4 – OXIDIAZOL”, processo de acordo com a reivindicação 5, caracterizado pela utilização destes compostos formulados isoladamente ou em mistura nas percentagens de 0,0005% - 5% (massa/volume ou massa/massa).

DESENHOS



R= CH₃ (orto, meta e para), p-bromo, p-nitro, p-metóxi, F

RESUMO

“NOVO LARVICIDA PARA AEDES AEGYPTI DERIVADO DE ÁCIDOS DE 1,2,4-OXIDIAZOL”

5

Processo de preparação de um novo larvicida contra o mosquito transmissor da dengue, dengue hemorrágica e febre amarela, caracterizado pela utilização de seis compostos derivados de oxadiazóis. A utilização como inseticida larval ou larvicida dos destes compostos no combate às larvas do mosquito *Aedes Aegypti* bloqueiam seu ciclo de vida, não deixando que chegue a fase adulta, prevenindo a sua propagação. Os compostos ácidos utilizados na composição do novo larvicida foram testados frente às larvas de estágio L4 e apresentaram mortalidade de 100% em concentrações entre 0,01 ppm e 70 ppm. Outro aspecto importante destacado neste processo, foi a sua utilização em ambiente doméstico e por não apresentar toxicidade ao ser humano.

15