

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 546 454**

51 Int. Cl.:

A01N 25/22 (2006.01)
A01N 25/00 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 47/40 (2006.01)
A01N 47/42 (2006.01)
A01N 51/00 (2006.01)
A01N 31/08 (2006.01)
A01N 35/04 (2006.01)
A01N 53/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.07.2005 E 05765708 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **12.08.2015 EP 1767090**

54 Título: **Compuesto de clatrato, método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo agrícola químico y preparación química agrícola**

30 Prioridad:

13.07.2004 JP 2004205905
10.09.2004 JP 2004264479

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
23.09.2015

73 Titular/es:

NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku
Tokyo 100-8165, JP

72 Inventor/es:

AMANOKURA, NATSUKI;
SAHARA, TETSUYA;
SUZUKI, HIROSHI;
MAEKAWA, YUICHI;
KATSUURA, KIYOSHI y
ENOMOTO, ENOMOTO

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 546 454 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

Compuesto de clatrato, método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo agrícola químico y preparación química agrícola

Campo de la invención

- 5 La presente invención se refiere a un compuesto de clatrato que contiene un compuesto hospedador polimolecular como compuesto hospedador y un principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil como compuesto huésped, a un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola, y a una formulación química agrícola que contiene el compuesto de clatrato.

Antecedentes en la técnica

- 10 Generalmente un principio activo químico agrícola se ha usado como formulación química agrícola después de su formulación. Ejemplos de formulaciones químicas agrícolas incluyen polvos, gránulos, polvos humectables, gránulos humectables, agentes solubles en agua, formulaciones líquidas solubles en agua, concentrados emulsionables, y formulaciones en sol.

- 15 El principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil, por ejemplo, acetamiprid, normalmente se usa para compuestos químicos solubles en agua, gránulos, y gránulos humectables.

- Recientemente, se han desarrollado formulaciones y sus métodos de aplicación para así mejorar la seguridad hacia seres humanos y el medio ambiente y promover el ahorro de costes laborales. Por ejemplo, se han requerido formulaciones que se puedan almacenar de forma estable durante un periodo prolongado y que no pierdan su potencia química agrícola durante un periodo prolongado incluso en la tierra, y que también presenten potencia química agrícola durante un periodo prolongado mediante la liberación controlada de los principios activos químicos agrícolas.

- 20 En contraste, en relación con la presente invención, se conocen algunos compuestos de clatrato que contienen un compuesto de tetraquisfenolato como compuesto hospedador y un agente farmacológico como compuesto huésped. Por ejemplo, la bibliografía de patente 1 describe un adhesivo epoxi en el que está incluido un compuesto huésped tal como un agente de curado para resinas epoxi en un compuesto hospedador polimolecular, y la bibliografía de patente 2 describe un agente blanqueante para el control de limos sin polvo en el que se incluye un agente antibacteriano tal como 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona en un compuesto hospedador polimolecular tal como tetraquisfenoles.

Bibliografía de patente 1: solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación N° Hei 5-194711

- 30 Bibliografía de patente 2: solicitud de patente japonesa sin examinar, primera publicación N° Hei 2000-327509

La patente de Estados Unidos 4.672.112 desvela agentes herbicidas y reguladores del crecimiento de plantas que contienen como principio activo un complejo de un derivado de bencenosulfonil urea con beta-ciclodextrina. La solubilidad en agua de la bencenosulfonil urea es bastante baja, lo que complica su procesamiento en agentes para la protección de plantas.

- 35 El documento WO 86/03939 desvela una composición fungicida para la protección de plantas que contiene del 3 al 90 % en peso de principio activo fungicida en mezcla con el 1 al 90 % en peso de ciclodextrina y opcionalmente con agentes adyuvantes habituales. La ciclodextrina incrementa la solubilidad del principio activo fungicida.

- 40 El documento GB 1.453.801 desvela un compuesto de inclusión en el que una ciclodextrina forma una red hospedadora que tiene cavidades en las que queda atrapado el fosfato de O,O-dimetil-dicloro vinilo (DDVP) como compuesto huésped.

El documento de Estados Unidos 5.079.000 desvela una composición para matar organismos perjudiciales que contiene un compuesto de clatrato compuesta de uno o más aceites esenciales naturales y/o sus derivados, tales como benzaldehído, y un compuesto hospedador polimolecular capaz de incluir dichos aceites esenciales naturales y/o sus derivados.

- 45 El documento EP 0 816 349 desvela una composición de revestimiento que contiene un compuesto de clatrato que incluye un compuesto de tetraquisfenol, tal como 1,1,2,2-tetraquis(4-hidroxifenil)etano, como compuesto hospedador y una 2-alquil-3(2H)-isotiazolona como compuesto huésped, para su uso como biocida industrial para el control de limos, antiincrustante y similares.

Divulgación de la invención

- 50 Problemas a resolver por la invención

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto de clatrato que contiene un compuesto

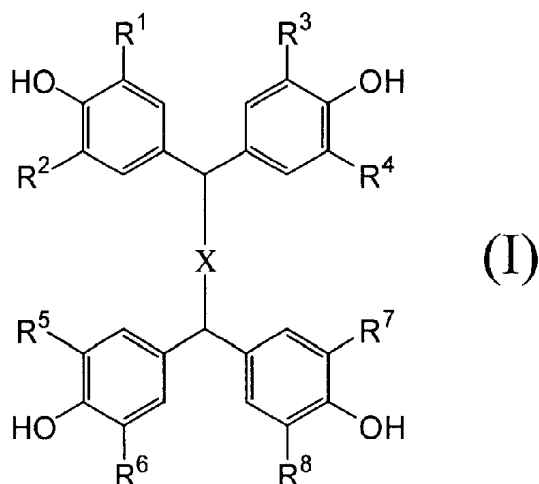
hospedador polimolecular como compuesto hospedador y un principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil como compuesto huésped, un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola, y una formulación química agrícola que sea excelente en cuanto a su capacidad de liberación sostenida, estabilidad de almacenamiento y la estabilidad en tierra.

5 Medios para resolver los problemas

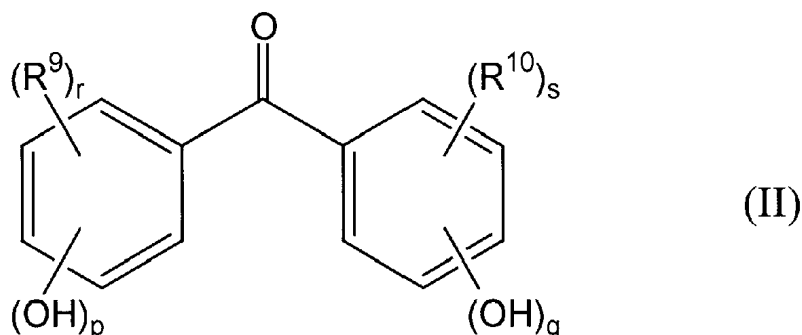
Los presentes inventores han preparado y evaluado un compuesto de clatrato que contiene un compuesto hospedador polimolecular como compuesto hospedador y un principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil, por ejemplo, acetamiprid, como compuesto huésped, y han tenido éxito en la preparación del compuesto de clatrato objetivo. Han comprobado que el uso del compuesto de clatrato resultante posibilita el mantenimiento de la solubilidad de saturación del principio activo químico agrícola en agua en un intervalo de concentraciones predeterminado, y la obtención de una formulación química agrícola de tipo sol (formulación en sol) que es excelente en cuanto a su capacidad de liberación sostenida, estabilidad de almacenamiento y estabilidad en tierra. Así, se ha completado la presente invención.

De acuerdo con un primer aspecto de la presente invención, se proporciona un compuesto de clatrato para una formulación química agrícola caracterizado por que contiene un compuesto hospedador polimolecular como compuesto hospedador, y un principio activo químico agrícola que tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm, con la excepción de benzaldehído, 2-alquil-3(2H)-isotiazolonas, y 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona, como compuesto huésped.

En el compuesto de clatrato de la presente invención, el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de tetraquisfenol representado mediante la fórmula (I):



(en la que X representa $(CH_2)_n$ (n representa un número entero de 0 a 3) o un grupo fenileno que puede tener un sustituyente, y R^1 a R^8 cada uno representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilo que puede tener un sustituyente, un átomo de halógeno o un grupo alcoxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), o un compuesto de hidroxibenzofenona representado mediante la fórmula (II):



(en la que R^9 y R^{10} cada uno representa independientemente un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno o un grupo alcoxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, r y s cada uno representa independientemente un número entero de 0 a 4, y p y q cada uno representa independientemente un número entero de 1 a 4).

En el compuesto de clatrato de la presente invención, el principio activo químico agrícola diferentemente es un compuesto neonicotinoide y el compuesto neonicotinoide es más preferentemente al menos uno seleccionado del grupo que consiste en nitenpyram, imidacloprid, acetamiprid, thiamethoxam, clothianidin, thiacloprid y dinotefuran.

5 De acuerdo con un segundo aspecto de la presente invención, se proporciona un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola, caracterizado por que contiene una etapa de mantenimiento de la concentración del principio activo químico agrícola en agua dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado al incluir el principio activo químico agrícola que tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no superior a 500 ppm, con la excepción de benzaldehído, 2-alkuil-3(2H)-isotiazolonas, y 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona, en un espacio interior formado por un compuesto hospedador polimolecular.

10 En el método para el control de la concentración de la presente invención, el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de tetraquisfenol representado mediante la fórmula (I) o el compuesto de hidroxibenzofenona representado mediante la fórmula (II).

15 En el método para el control de la concentración de la presente invención, el principio activo químico agrícola preferentemente es un compuesto neonicotinoide y el compuesto neonicotinoide es más preferentemente al menos uno seleccionado del grupo que consiste en nitenpyram, imidacloprid, acetamiprid, thiamethoxam, clothianidin, thiacloprid y dinotefuran.

De acuerdo con un tercer aspecto de la presente invención, se proporciona una formulación química agrícola, caracterizada por que contiene el compuesto de clatrato de la presente invención.

20 La formulación química agrícola de la presente invención preferentemente es un agente para el tratamiento de semillas.

La formulación química agrícola de la presente invención preferentemente es una formulación en sol, en la que el compuesto de clatrato está disperso en agua.

De acuerdo con un cuarto aspecto de la presente invención, se proporciona una composición activa agrícola, caracterizada por que contiene el compuesto de clatrato de la presente invención y un piretroide sintético.

25 **Efectos de la invención**

De acuerdo con el compuesto de clatrato de la presente invención, se puede preparar una formulación química agrícola que puede mantener una solubilidad de saturación de un principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado y también es excelente en cuanto a su capacidad de liberación sostenida, estabilidad de almacenamiento y estabilidad en tierra.

30 De acuerdo con el método para el control de la concentración de la presente invención, es posible mantener una solución saturada de un principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado. En consecuencia, se puede controlar la elución del principio activo químico agrícola con humedad en la tierra y así no se reduce la persistencia de su potencia mediante cambios medioambientales tales como lluvias o similares.

35 La formulación química agrícola de la presente invención es excelente en cuanto a su capacidad de liberación sostenida, estabilidad de almacenamiento y estabilidad en tierra y puede presentar eficientemente una eficacia activa, y así también es respetuosa con el medioambiente.

En la formulación química agrícola que contiene el compuesto de clatrato de la presente invención como formulación en sol, esencialmente no se produce crecimiento de partículas ni apelmazamiento.

40 **Breve descripción de los dibujos**

La Fig. 1 es un gráfico que muestra un espectro de RMN ¹H del compuesto de clatrato 1.

La Fig. 2 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de XRD del compuesto de clatrato 1.

La Fig. 3 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de TG-DTA del compuesto de clatrato 1.

La Fig. 4 es un gráfico que muestra un espectro de RMN ¹H del compuesto de clatrato 2.

45 La Fig. 5 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de XRD del compuesto de clatrato 2.

La Fig. 6 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de TG-DTA del compuesto de clatrato 2.

La Fig. 7 es un gráfico que muestra un espectro de RMN ¹H del compuesto de clatrato 3.

La Fig. 8 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de XRD del compuesto de clatrato 3.

La Fig. 9 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de TG-DTA del compuesto de clatrato 3.

La Fig. 10 es un gráfico que muestra un espectro de RMN ^1H del compuesto de clatrato 4.

La Fig. 11 es un gráfico que muestra un espectro de IR del compuesto de clatrato 4.

La Fig. 12 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de XRD del compuesto de clatrato 4.

5 La Fig. 13 es un gráfico que muestra los resultados de las mediciones de TG-DTA del compuesto de clatrato 4.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

Ahora se describirá la presente invención con detalle con respecto a los siguientes artículos: 1) un compuesto de clatrato, 2) un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola, 3) una formulación química agrícola, y 4) una composición agrícola activa.

10 1) Compuesto de clatrato

El compuesto de clatrato de la presente invención se caracteriza por que contiene un compuesto hospedador polimolecular como compuesto hospedador y un principio activo químico agrícola que tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm como compuesto huésped.

15 El compuesto hospedador polimolecular usado en la presente invención es un compuesto en el que varias moléculas se combinan mediante puentes de hidrógeno para formar un cristal con un espacio interior y en cuyo espacio se puede incluir un compuesto huésped.

El compuesto hospedador polimolecular usado en la presente invención es un compuesto de tetraquisfenol representado mediante la fórmula (I) o un compuesto de hidroxibenzofenona representado mediante la fórmula (II). Se puede obtener eficientemente un compuesto de clatrato que contiene un principio activo químico agrícola que 20 tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm como compuesto huésped y también se puede obtener una formulación química agrícola que tiene una capacidad de liberación sostenida, una estabilidad de almacenamiento y una estabilidad en tierra excelentes.

En la fórmula (I), X representa $(\text{CH}_2)_n$, o un grupo fenileno que puede tener un sustituyente.

n representa un número entero de 0 a 3 y preferentemente es 0.

25 El grupo fenileno puede ser un grupo p-fenileno, un grupo m-fenileno o un grupo o-fenileno, pero preferentemente es un grupo p-fenileno.

Ejemplos del sustituyente del grupo fenileno que puede tener un sustituyente incluyen átomos de halógeno tales como flúor, cloro, y bromo; grupos alquilo tales como un grupo metilo, un grupo etilo, y un grupo n-propilo; y grupos alcoxi tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, y un grupo n-propoxi. Entre estos, se prefiere un grupo fenileno 30 que no tenga sustituyentes.

R^1 a R^8 cada uno representa independientemente un átomo de hidrógeno; un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, o un grupo isopropilo; un grupo fenilo que puede tener un sustituyente, tal como un grupo fenilo, un grupo 2-clorofenilo, un grupo 4-metilfenilo, un grupo 2,4-difluorofenilo, un grupo 3,5-dimetoxifenilo, o un grupo 2,4,6-trimetilfenilo; un átomo de halógeno tal como 35 flúor, cloro, o bromo; o un grupo alcoxi que tiene de 1 a 6 átomos de carbono tal como un grupo metoxi, grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, o un grupo t-butoxi.

Ejemplos específicos del compuesto representado mediante la fórmula (I) incluyen 1,1,2,2-tetraquis(4-hidroxifenil)etano (TEP), 1,1,2,2-tetraquis(3-metil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-dimetil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-cloro-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-dicloro-4-hidroxifenil)etano, 40 1,1,2,2-tetraquis(3-bromo-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-dibromo-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-t-butil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-di-t-butil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-fluoro-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-difluoro-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-metoxi-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3,5-dimetoxi-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-cloro-5-metil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-bromo-5-metil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-metoxi-5-metil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-t-butil-5-metil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-cloro-5-bromo-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis(3-cloro-5-fenil-4-hidroxifenil)etano, 1,1,2,2-tetraquis[(4-hidroxi-3-fenil)fenil]etano, 1,1,3,3-tetraquis(4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-metil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-dimetil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-cloro-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-dicloro-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-bromo-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-dibromo-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-fenil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-difenil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-metoxi-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-dimetoxi-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3-t-butil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,3,3-tetraquis(3,5-di-t-butil-4-hidroxifenil)propano, 1,1,4,4-tetraquis(4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3-metil-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4- 50

tetraquis(3,5-dimetil-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3-cloro-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3,5-dicloro-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3-metoxi-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3,5-dimetoxi-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3-bromo-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3,5-dibromo-4-hidroxifenil)butano, 1,1,4,4-tetraquis(3-t-butil-4-hidroxifenil)butano, y 1,1,4,4-tetraquis(3,5-di-t-butil-4-hidroxifenil)butano.

Sus ejemplos específicos incluyen $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-m-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-o-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-metilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-clorofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-etilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-isopropilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-clorofenil)-m-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-metilfenil)-m-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-etilfenil)-m-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-metilfenil)-o-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-clorofenil)-o-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-etilfenil)-o-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-isopropilfenil)-o-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-t-butilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-bromofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-yodofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-metoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-etoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-isopropoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-t-butoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxi-4-clorofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxi-4-bromofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxi-4-yodofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxi-4-metoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(3-hidroxi-4-etoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(2-hidroxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(2-hidroxi-4-clorofenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(2-hidroxi-4-metilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(2-hidroxi-4-metoxifenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3,5-dimetilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxi-3-cloro-5-metilfenil)-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-3-cloro-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-3-metil-p-xileno, $\alpha,\alpha,\alpha',\alpha'$ -tetraquis(4-hidroxifenil)-3-metoxi-p-xileno, α,α -bis(4-hidroxifenil)- α',α' -bis(3-cloro-4-hidroxifenil)-p-xileno, α,α -bis(4-hidroxifenil)- α',α' -bis(3-metil-4-hidroxifenil)-p-xileno, α,α -bis(4-hidroxifenil)- α',α' -bis(3-metoxi-4-hidroxifenil)-p-xileno, α,α,α' -tris(4-hidroxifenil)- α' -3-clorofenil-p-xileno, α,α,α' -tris(4-hidroxifenil)- α' -3-metilfenil-p-xileno, y α,α,α' -tris(4-hidroxifenil)- α' -3-metoxifenil-p-xileno.

En la fórmula (II), R^9 y R^{10} cada uno representa independientemente un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno o un grupo alcóxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono. El grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, el átomo de halógeno y el grupo alcóxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono son idénticos a los descritos como grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, átomo de halógeno y grupo alcóxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono en la fórmula (I).

r y s cada uno representa independientemente un número entero de 0 a 4 y preferentemente es 0. p y q cada uno representa independientemente un número entero de 1 a 4 y preferentemente es 1 o 2.

Ejemplos específicos del compuesto representado mediante la fórmula (II) incluyen 4,4'-dihidroxibenzofenona, 2,4'-dihidroxibenzofenona, 3,4'-dihidroxibenzofenona, 3,3'-dihidroxibenzofenona, 2,3'-dihidroxibenzofenona, 2,2'-dihidroxibenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2-metilbenzofenona, 4,4'-dihidroxi-3-metilbenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2-clorobenzofenona, 4,4'-dihidroxi-3-clorobenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2-metoxibenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2-metoxibenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2,2'-dimetilbenzofenona, 4,4'-dihidroxi-3,3'-dimetilbenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2,2'-diclorobenzofenona, 4,4'-dihidroxi-3,3'-diclorobenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2,2'-dimetoxibenzofenona, 4,4'-dihidroxi-2,2'-dimetoxibenzofenona, 3,3'-dihidroxi-2,2'-dimetilbenzofenona, 3,3'-dihidroxi-4,4'-dimetilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-3,3'-dimetilbenzofenona, 2,2'-dihidroxi-4,4'-dimetilbenzofenona, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2,2',3,3'-tetrahidroxibenzofenona, 3,3',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2,2',3,4'-tetrahidroxibenzofenona, 3,3',2,4'-tetrahidroxibenzofenona, 4,4',3,2'-tetrahidroxibenzofenona, 2,3,4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 3,3'-dimetilbenzofenona, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 3,3'-diclorobenzofenona, y 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona, 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona.

El principio activo químico agrícola a usar no está limitado específicamente siempre que sea un principio activo químico agrícola que tenga una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm (también denominado de aquí en lo sucesivo como "principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil"), con la excepción de benzaldehído, 2-alquil-3(2H)-isotiazolonas, y 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona.

Ejemplos del principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil incluyen compuestos neonicotinoides tales como (E)-N-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-etil-N'-metil-2-nitrovinilidendiamina [nombre común: nitenpyram, solubilidad acuosa: aproximadamente > 590 g/l (pH 7, 20 °C)], (E)-N1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-N2-ciano-N1-metilacetamidina [nombre común: acetamiprid, solubilidad en agua: 4200 ppm (25 °C)], 1-(6-cloro-3-piridilmetil)-N-nitroimidazolidin-2-ilidenamina [nombre común: imidacloprid, solubilidad acuosa: 610 ppm (20 °C)], 3-(2-cloro-1,3-tiazol-5-metil-1,3,5-oxadiazinan-4-ilideno [nombre común: thiamethoxam, solubilidad acuosa: 4100 ppm (25 °C)], (E)-1-(2-cloro-1,3-tiazol-5-ilmetil-3-metil-2-nitroguanidina [nombre común: clothianidin, solubilidad acuosa: 0,327 g/l (20 °C)], 3-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,3-tiazolidin-2-ilidenocianamida (nombre común: thiocloprid), y (RS)-1-metil-2-nitro-3-(tetrahidro-3-furilmetil)guanidina (nombre común: dinotefuran);

compuestos de fósforo tales como tioato de O,S-dimetil-N-acetilfosforoamida [nombre común: acefato, aproximadamente 650.000 ppm], N2-(4-cloro-o-toluil)-N1,N1-dimetilformamida [solubilidad acuosa: 250 ppm (20 °C)], y 2,2-diclorovinildimetil fosfato [nombre común: DDVP, solubilidad acuosa: aproximadamente 1000 ppm]

(temperatura ambiente)]; compuestos de carbamato tales como clorhidrato de 2,2-dimetil-1,3-benzodioxol-4-il-metilcarbamato [nombre común: bendiocarb, solubilidad acuosa: 26.000 ppm (25 °C)], S,S'-2-dimetilaminotrimetilen-bis(tiocarbamato) [nombre común: cartap, solubilidad acuosa: 200.000 ppm (25 °C)], y 2-etiltiometilfenilmetilcarbamato [nombre común: etiofencarb, solubilidad acuosa: 1800 ppm (20 °C)]; y

- 5 otros compuestos insecticidas tales como imidato de S-metil-N,N-dimetil-N-metilcarbamoiloxi-1-tiooxam [nombre común: oxamilo, solubilidad acuosa: 280.000 ppm], S-metil-N-(metilcarbamoiloxi)tioacetimidato [nombre común: metomilo, solubilidad acuosa: 58.000 ppm], y 1,3-dicloropropeno [nombre común: D-D, solubilidad acuosa: 2000 ppm].

- 10 Entre estos compuestos, el principio activo químico agrícola preferentemente es un compuesto neonicotinoide y el compuesto neonicotinoide es más preferentemente al menos uno seleccionado del grupo que consiste en nitenpyram, imidacloprid, acetamiprid, thiamethoxam, clothianidin, thiacloprid y dinotefuran en la presente invención.

Estos principios activos químicos agrícolas se pueden usar solos o en combinación de al menos dos de sus tipos mezclados en una relación arbitraria. Entre estos, el acetamiprid es particularmente preferible debido a que tiene una alta actividad química agrícola y ejerce unos efectos notables a la hora de formar un compuesto de clatrato.

- 15 El método para la preparación del compuesto de clatrato de la presente invención no está limitado específicamente y se pueden emplear métodos conocidos de forma convencional para la preparación de un compuesto de clatrato usando un compuesto hospedador polimolecular.

- 20 Ejemplos específicos del método incluyen (i) un método de adición de un compuesto hospedador polimolecular a un principio activo químico agrícola líquido, seguido de agitación, (ii) un método de adición de un compuesto hospedador polimolecular a una solución disolvente de un principio activo químico agrícola sólido, seguido de agitación, y (iii) un método de mezcla de un principio activo químico agrícola sólido con un compuesto hospedador polimolecular pulverizado.

Cuando se emplean los métodos (i) a (iii), la temperatura de agitación normalmente es entre temperatura ambiente y 100 °C, y el tiempo de agitación normalmente es desde varios minutos a varias decenas de horas.

- 25 La relación de mezcla del compuesto hospedador polimolecular al principio activo químico agrícola como compuesto huésped varía dependiendo del tipo de compuesto a usar, y una relación de compuesto hospedador polimolecular:principio activo químico agrícola en general se encuentra entre 99:1 y 1:99 (partes en peso), una relación de compuesto hospedador polimolecular:principio activo químico agrícola preferentemente se encuentra entre 80:20 y 20:80 (partes en peso), una relación de compuesto hospedador polimolecular:principio activo químico agrícola más preferentemente se encuentra entre 60:40 y 35:65 (partes en peso).

Ejemplos del disolvente a usar incluyen agua; alcoholes tales como metanol y etanol; ésteres tales como acetato de etilo; e hidrocarburos halogenados tales como diclorometano.

La cantidad de disolvente no está limitada específicamente siempre que permita la agitación y mezcla con facilidad así como el postratamiento con comodidad.

- 35 El compuesto de clatrato objetivo se puede aislar según métodos de separación y purificación convencionales a partir de la mezcla obtenida mediante agitación.

La estructura del compuesto de clatrato resultante se puede comprobar mediante métodos analíticos muy conocidos tales como espectrometría RMN, espectrometría IR, y espectrometría de masas.

- 40 El compuesto de clatrato obtenido se puede conformar en una solución en gel que tenga una alta estabilidad de dispersión, como se describe a continuación.

- 45 El punto de fusión del compuesto de clatrato obtenido no está influido por el principio activo químico agrícola o disolvente a usar, sino que está influido por el compuesto hospedador polimolecular a usar. Por ejemplo, cuando se usa acetamiprid que tiene un punto de fusión de 96,25 °C como principio activo químico agrícola, se obtiene un compuesto de clatrato que tiene un punto de fusión de 165 °C aproximadamente usando 1,1,2,2-tetraquis(4-hidroxifenil)etano (TEP) como compuesto hospedador polimolecular, y se obtiene un compuesto de clatrato que tiene un punto de fusión de 135 °C aproximadamente usando 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona.

El compuesto de clatrato de la presente invención se puede mezclar con otros fungicidas o insecticidas para así ampliar su espectro de aplicación biológico. Ejemplos específicos a mezclar incluyen, pero no están limitados a, los siguientes.

- 50 Fungicidas:

Agentes de cobre; cloruro básico de cobre, sulfato básico de cobre, y similares.

Agente sulfurados; tiuram, zineb, maneb, mancozeb, ziram, propineb, policarbamato, y similares.

Agentes de polihaloalquiltio; captan, folpet, diclorofluanide, y similares.

Agentes orgánicos clorados; clorotalonil, ftalida, y similares.

Agentes organofosforados; IBP, EDDP, tolclofos-metilo, pirazofos, fosetil, y similares.

Agentes de bencimidazol; tiofanato-metilo, benomilo, carbendazim, tiabendazol, y similares.

5 Agentes de dicarboxiimida; iprodiona, procimidona, vinclozolina, fluoroimida, y similares.

Agentes de carboxamida; oxicarboxin, mepronil, flutolanilo, tecloftalam, triclamida, pencicurón, y similares.

Agentes de acilalanina; metalaxil, oxadixil, furalaxil, y similares.

Agentes de metoxiacrilato; cresoxim-metilo, azoxistrobina, metominostrobin, y similares.

Agentes de anilino pirimidina; andpurina, mepanipirim, pirimetanilo, ciprodinil, y similares.

10 Agentes SBI; triadimefón, triadimenol, bitertanol, miclobutanil, hexaconazol, propiconazol, triflumizol, procloraz, pefurazoato, fenarimol, pirifenox, triforina, flusilazol, etaconazol, diclobutrazol, fluotrimazol, flutriafe, penconazol, diniconazol, imazalil, tridemorf, fenpropimorf, butiobato, epoxiconazol, metoconazol, y similares.

Antibióticos; polioxina, blastidene S, kasugamicina, validamicina, sulfato de dihidroestreptomicina, y similares.

15 Otros; clorhidrato de propamocarb, quintoceno, hidroxiisoxazol, metasulfocarb, anirazina, isoprotiolano, probenazol, chiometionat, ditianón, dinocap, diclomezina, ferimzona, fluazinam, piroquilon, triciclazol, ácido oxolínico, ditianón, acetato de iminotadina, cimoxanil, pirrolnitrina, metasulfocarb, dietofencarb, binapacril, lecitina, bicarbonato de sodio, fenaminosulf, dodine, dimetomorf, óxido de fenazina, carpropamid, flusulfamida, fludioxonil, famoxadona, y similares.

Insecticidas/Acaricidas:

20 Insecticidas organofosforados y carbamatos; fentión, fenitrotión, diazinón, clorpirifos, ESP, vamidotión, fentoato, dimetoato, formotión, malatión, triclorfón, tiometón, fosmet, diclorvos, acefato, EPBP, paratión metílico, oxidimetón-metilo, etión, salitión, cianofos, isoxatión, piridafentión, fosadona, metidatión, sulprofos, clorfeninfos, tetraclorinfos, dimetilvinfos, propafos, isofenfos, etiltiometón, profenofos, piraclofos, monocrotofos, azinfos-metilo, aldicarb, metomilo, tiodicarb, carbofurano, carbosulfán, benfuracarb, furatiocarb, propoxur, BPMC, MTMC, MIPC, carbaril, pirimicarb, etiofencarb, fenoxicarb, y similares.

25 Insecticidas piretroides; permetrina, cipermetrina, deltametrina, fenvalerato, fenpropatrina, piretrina, aletrina, tetrametrina, resmetrina, dimetrina, propatrina, fenotrina, protrina, fluvalinato, ciflutrina, cihalotrina, fucitricato, etofenprox, cicloprotrina, tralometrina, silafluofeno, brofenprox, acrinatrina, y similares.

30 Benzoinurea y otros insecticidas; diflubenzurón, clorfluazurón, hexaflumurón, triflumurón, tetrabenzurón, flufenoxurón, flucicloxurón, buprofezin, piriproxifeno, metopreno, benzoepina, diafenthiurón, acetamiprid, imidacloprid, nitenpiram, fipronil, cartap, tiociclam, bensultap, sulfato de nicotina, rotenona, metaldehído, aceite de machina, pesticidas de microorganismos tales como BT y virus patógenos de insectos; agentes de feromonas, y similares.

Nematicidas; fenamifos y fostiazato

35 Acaricidas; clorobenzilato, fenisobromolato, dicofol, amitraz, DPAP, benzomato, hexatiazox, óxido de fenbutatin, polinactin, quinometionato, CPCBS, tetradifón, avermectina, milbectina, clofentezina, cihexatina, piridaben, fenpiroximato, tebufenpirad, pirimidifen, fenotiocarb, dienoclor, y similares.

Reguladores del crecimiento de plantas: giberelinas (por ejemplo, giberelina A3, giberelina A4, giberelinas A7), IAA, NAA, y similares.

Herbicidas:

40 Herbicidas de anilida; diflufenicán, propanil, y similares.

Herbicidas de cloroacetanilida; alaclor, pretilaclor, y similares.

Herbicidas del ácido ariloxialcanoico; 2,4-D, 2,4-DB, y similares.

Herbicidas del ácido ariloxifenoxialcanoico; diclofop-metilo, fenoxaprop-etilo, y similares.

Herbicidas del ácido arilcarboxílico; dicamba, piritiobac, y similares.

45 Herbicidas de imidazolina; imazaquin, imazetapir, y similares.

Herbicidas de urea; diurón, isoproturón, y similares.

Herbicidas de carbamato; clorprofam, fenmedifam, y similares.

Herbicidas de tiocarbamato; tiobencarb, EPTC, y similares.

Herbicidas de dinitroanilina; trifluralina, pendimetalina, y similares.

5 Herbicidas de difenil éter; acifluorfen, fomesafen, y similares.

Herbicidas de sulfonilurea; bensulfuron-metilo, nicosulfuron, y similares.

Herbicidas de triazinona; metribuzina, metamitrona, y similares.

Herbicidas de triazina; atrazina, cyanazin, y similares.

Herbicidas de triazopirimidina; flumetsulam, y similares.

10 Herbicidas de nitrilo; bromoxinil, diclobenil, y similares.

Herbicidas del ácido fosfórico; glifosato, glufosinato, y similares.

Herbicidas de sales de amonio cuaternario; paraquat, difenzoquat, y similares.

Herbicidas de imida cíclica; flumiclorac-pentilo, fluthiacet-metilo, y similares.

Herbicidas del ácido benzoilaminopropiónico; benzoilprop-etilo, furanprop-etilo, y similares.

15 Otros herbicidas; isoxaben, etofumesato, oxadiazón, piperofos, daimuron, bentazona, benfuresato, difenzoquat, naproanilida, triazofenamida, quinchlorac, clomazona, sulcotriona, cinmetilina, ditiopir, pirazolato, piridato y flupoxam y herbicidas de ciclohexanodiona tales como setoxidim, tralcoxidim, y similares.

20 Sinérgicos/antídotos; octaclorodipropil éter, butóxido de piperonilo, cyneprin, IBTA, benoxacor, cloquintocet-metilo, ciometranil, diclormid, fenclorazol-etilo, fencloram, flurazol, flaxofenimi, furilazol, mefenpirdietil, MG191, anhídrido naftálico, oxabetrinil, compuestos a base de neonicotinoides, y similares.

25 Agentes antibacterianos/antifúngicos/antialgas; trialquiltriaina, etanol, alcohol isopropílico, alcohol propílico, trisnitrilo, clorobutanol, pronopol, glutaraldehído, formaldehído, α -bromcinnamalaldehído, scane M-8, caisson CG, NS-500W, BIT, n-butyl BIT, isotiocianato de alilo, tiabendazol, 2-bencimidazolil carbamato de metilo, lauricidina, biovan, triclocarbán, halocarbán, glasisicar, ácido benzoico, ácido sórbico, ácido caprílico, ácido propiónico, ácido 10-undecilénico, sorbato de potasio, propionato de potasio, benzoato de potasio, ftalato de monomagnesio, undecilenato de zinc, 8-hidroxiquinolina, cobre quinolina, TMTD, triclosán, diclohelanilida, tolifluanid, proteína de lecha, lisozima de clara de huevo, bentiazol, carbam sodio, triazina, tebuconazol, hinokitiol, tetracloroisoftalonitrilo, tectamer 38, gluconato de clorhexidina, clorhidrato de clorhexidina, polihexametenbiguanida, clorhidrato de polibiguanida, danthoprom, clidant, piriton sodio, piriton zinc, densil, kappa-piriton, timol, isopropil metil fenol, OPP, fenol, butilparabeno, etil parabeno, metilparabenceno, propilparabenceno, metacresol, ortocresol, paracresol, ortofenilfenol sodio, clorfen, paraclorofenol, paracloro metaxilato, paraclorocresol, fluorfolpet, polilisina, BIOPAN P-1487, metilparatolilsulfona Jote, paracloroisocyanil polivinilpirrolidona, peróxido de hidrógeno, dióxido de cloro estabilizado, ácido peracético, naftenato de cobre, novalon AG 300, cloruro de plata, óxido de titanio, plata, fosfato de zinc-calcio, Silver Ace, aluminosilicato de plata-zinc, zeolita de plata-zinc, novalon AGZ330, asesino forona, 35

35 dimmer 136, cloruro de benzalconio, cloruro de didecil dimetil amonio, bardack 2250/80, cloruro de benzotonio, Hyamine 3500J, bromuro de cetilamonio, cetrimida, CTAB, Cetavlon, Dimmer- 38, cloruro de benzalconio, Hyamine 3500J, BARDAC™ 170P, DC-5700, cloruro de cetil piridinio, quitosano, deuron, DCMU, prepentol A6, CMI, 2CI-OIT, BCM, ZPT, BNP, OIT, IPBC, TCMSP, y similares.

40 Los insecticidas piretroides sintéticos se pueden ejemplificar preferentemente debido a que se puede ejercer de forma sinérgica un efecto insecticida cuando se mezclan con el compuesto de clatrato de la presente invención. Los ejemplos específicos del insecticida piretroide sintético incluyen acrinatrina, aletrina, bioaletrina, bartrina, bifentrina, bioetanometrina, cicletrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, dimeflutrina, dimetrina, empenetrina, fenflutrina, fenpiritrina, fenpropatrina, fenvalerato, esfenvalerato, fluvalinato, tau-fluvalinato, furetrina, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, biopermetrina, transpermetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piresmetrina, resmetrina, bioresmetrina, cismetrina, teflutrina, teraletrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, etofenprox (2-(4-etoxifenil)-2-metilpropil 3-fenoxibencil éter), flufenprox, halfenprox, protrifenbute, silafluofeno, y similares.

2) Método para el control de la concentración

50 El método para el control de la concentración de la presente invención se caracteriza por que contiene una etapa de

mantenimiento de la concentración del principio activo químico agrícola en agua dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado al incluir el principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil en un espacio interior formado por un compuesto hospedador polimolecular.

El compuesto hospedador polimolecular se selecciona de forma conveniente y el principio activo químico agrícola se incluye en un espacio interior formado en el compuesto hospedador polimolecular, manteniendo así la concentración del principio activo químico agrícola en agua dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado. Cuando un compuesto de clatrato que incluye un principio activo químico agrícola se permite que exista en agua, la concentración del principio activo químico agrícola en agua no alcanza la concentración saturada del principio y se puede controlar hasta un valor predeterminado que es inferior a la concentración saturada. El valor predeterminado se decide por diversos factores, pero preferentemente se controla por el tipo de compuesto hospedador a usar.

El compuesto hospedador polimolecular y el principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil a usar no están limitados específicamente y sus ejemplos son idénticos a los descritos para el compuesto de clatrato.

3) Formulación química agrícola

La formulación química agrícola de la presente invención preferentemente contiene el compuesto de clatrato de la presente invención. La formulación química agrícola de la presente invención preferentemente es un agente para el tratamiento de semillas.

La forma de la formulación química agrícola de la presente invención no está limitada específicamente y sus ejemplos incluyen polvos humectables, gránulos humectables, compuestos químicos solubles en agua, compuestos químicos granulares solubles en agua, formulaciones líquidas solubles en agua, gránulos, polvos, concentrados emulsionables, compuestos químicos solubles en agua, emulsiones, suspoemulsiones, microcápsulas, y formulaciones en sol (también denominadas agentes o fluidos de CS (concentrado en suspensión)). Entre estos, son preferibles las formulaciones en sol debido a que el compuesto de clatrato de la presente invención se puede mantener en un estado estable.

La formulación en sol es una formulación obtenida mediante la dispersión en agua de un principio activo químico agrícola sólido que es insoluble en agua. En la presente invención, la formulación en sol agrícola se puede obtener mediante la dispersión en agua del compuesto de clatrato de la presente invención con un tensioactivo, un espesante, y si es necesario, otros adyuvantes tales como un agente anticongelante.

La relación en contenido del compuesto de clatrato normalmente es del 10 al 60 % en peso, y preferentemente del 25 al 45 % en peso, en base al peso total de la formulación química agrícola.

El tensioactivo es un agente para la dispersión del principio activo químico agrícola, de forma uniforme y estable, durante un periodo prolongado.

El tensioactivo a usar no está limitado específicamente, y preferentemente es un tensioactivo no iónico o un tensioactivo aniónico.

Ejemplos de tensioactivos no iónicos incluyen alquil éter de polioxietileno tales como lauril éter de polioxietileno, fenilalquil éter de polioxietileno, estirilfenil éter de polioxietileno, oleil éter de polioxietileno, octilfenil éter de polioxietileno, alquil éster de sorbitán, alquil éster de polioxietilensorbitán, y mezclas de al menos dos tipos de los mismos.

El valor de HLB (balance hidrófilo-lipófilo) del tensioactivo no iónico preferentemente es de 10 o inferior, y más preferentemente de 7 o inferior.

La relación de contenido del tensioactivo no iónico preferentemente es del 0,1 al 20 % en peso, y más preferentemente del 0,1 al 10 % en peso, en base al peso total de la formulación química agrícola.

Ejemplos de tensioactivos aniónicos incluyen sulfato de alquilo (sal de Na, sal de NH₄, sal de alcanolamina), sulfosuccinato de dialquilo (sal de Na, sal de Ca, sal de Mg), naftalensulfonato de alquilo, alquilbencenosulfonato, lignosulfonato, condensado de formaldehído de naftaleno sulfonato de alquilo, alquil éter fosfato de polioxietileno (sal de Na, sal de alcanolamina), policarboxilato, y mezclas de al menos dos tipos de los mismos.

La relación de contenido del tensioactivo aniónico preferentemente es del 0,1 al 20 % en peso, y más preferentemente del 0,1 al 10 % en peso, en base al peso total de la formulación química agrícola.

El espesante es un agente para prevenir la sedimentación de partículas dispersas.

Ejemplos de espesantes incluyen polímeros orgánicos solubles en agua tales como goma de xantano, goma de guar, carboximetilcelulosa, polivinilpirrolidona, polímero de carboxivinilo, polímero acrílico, derivado de fécula, y polisacáridos; y vehículos sólidos pulverizados finos tales como bentonita de alta pureza y carbono blanco.

La relación de contenido del espesante preferentemente es del 0,01 al 10 % en peso, y más preferentemente del 0,1

al 3 % en peso, en base al peso total de la formulación química agrícola.

Ejemplos de los demás adyuvantes incluyen agentes anticongelantes, antiespumantes, y antisépticos. La relación de contenido de los demás adyuvantes normalmente es del 0 al 15 % en peso, y preferentemente del 0,1 al 8 % en peso, en base al peso total de la formulación química agrícola. La adición de los demás adyuvantes no afecta perjudicialmente a la solubilidad de saturación del principio activo químico agrícola en agua.

El método para la preparación de una formulación en sol no está limitado específicamente y sus ejemplos incluyen un método de dispersión de un compuesto de clatrato, un tensioactivo, un espesante y, si es necesario, otros adyuvantes en agua usando una mezcladora de alta velocidad, y pulverizando muy fina la suspensión obtenida mediante pulverización mecánica.

El método de pulverización no está limitado específicamente, y preferentemente es un método de pulverización en mojado usando un molino de coloides, un molino dyno, un molino de bolas o un pulverizador de arena.

El tamaño de partícula promedio de las partículas en la formulación en sol obtenida normalmente es de 0,7 a 2,5 μm , y preferentemente es de 1 a 2 μm debido a la alta estabilidad del sol.

Es probable que la formulación en sol forme grandes partículas como consecuencia del crecimiento de las partículas debido a un cambio en la temperatura durante el almacenamiento (crecimiento de las partículas), o que forme una masa como resultado de la agregación de las partículas (apelmazamiento). La formulación en sol de la presente invención tiene una alta estabilidad de dispersión debido al uso del compuesto de clatrato de la presente invención. Puesto que la solubilidad de saturación del principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil se mantiene a un nivel bajo, no se produce ni crecimiento de partículas ni apelmazamiento incluso cuando se almacena durante un periodo prolongado.

La formulación química agrícola de la presente invención presenta una relación residual excelente del principio activo químico agrícola en la formulación química agrícola incluso cuando se almacena durante un periodo prolongado, debido a que el principio activo químico agrícola está contenido como compuesto de clatrato en la formulación.

De acuerdo con la formulación química agrícola de la presente invención, la solubilidad de saturación del principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil se puede ajustar dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado mediante la selección adecuada del compuesto hospedador polimolecular a usar.

De acuerdo con la formulación química agrícola de la presente invención, puesto que la solubilidad de saturación en agua del principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil se puede mantener y controlar a un nivel bajo, es posible impedir que el principio activo químico agrícola se disuelva en agua en un corto periodo de tiempo, y de esta forma que se disocie de la formulación. Es decir, se puede controlar la elución del principio activo químico agrícola en agua y se puede mantener la eficacia activa como químico agrícola durante un periodo prolongado.

La formulación química agrícola de la presente invención se puede usar de la misma forma que en el caso de un método de aplicación de una formulación química agrícola conocida. Por ejemplo, se puede ejemplificar un método de inmersión de semillas de campos de cultivo en una solución preparada diluyendo una cantidad predeterminada de la formulación química agrícola de la presente invención en agua durante un tiempo predeterminado, seguido de la siembra, más específicamente, un método de pulverización muy fina de la formulación química agrícola de la presente invención hasta 100 μm o inferior, dispersando o disolviendo la formulación química agrícola pulverizada en un disolvente, sumergiendo las semillas en la solución obtenida, y revistiendo la superficie de las semillas con la formulación química agrícola, un método de siembra de semillas de campos de cultivo, y la pulverización uniforme de una cantidad predeterminada de una solución preparada diluyendo la formulación química agrícola de la presente invención con agua.

La formulación química agrícola de la presente invención contiene el compuesto de clatrato de la presente invención y por tanto es estable en la tierra y también presenta unos efectos residuales excelentes.

La formulación química agrícola de la presente invención se puede usar para diversos fines distintos de fines agrícolas, por ejemplo, agentes para el control de plagas en la tierra, agentes para el control de termitas, agentes para la ropa, agentes para el control de plagas de insectos, agentes para el control de plagas de insectos de la madera, agentes cebo, agentes para el control de ectoparásitos en animales, agentes sanitarios para el control de plagas de insectos, agentes para el control de enfermedades domésticas transmisibles, pinturas para el casco de los barcos, agentes anti-algas para redes de pesca, agentes antifúngicos para madera, biocidas, y similares.

4) Composición agrícola activa

La composición agrícola activa de la presente invención contiene el compuesto de clatrato de la presente invención y el insecticida piretroide sintético. El insecticida piretroide sintético puede presentar un efecto insecticida mejorado de forma sinérgica cuando se mezcla con el compuesto de clatrato de la presente invención.

La relación de contenido del piretroide sintético no está limitada específicamente, pero normalmente es de 0,05 a 20 partes en peso, preferentemente de 0,1 a 10 partes en peso, y más preferentemente de 0,2 a 5 partes en peso, en base a 1 parte en peso del principio activo químico agrícola que tiene una hidrosolubilidad fácil en el compuesto de clatrato de la presente invención.

- 5 El método de mezcla del compuesto de clatrato de la presente invención con el piretroide sintético no está limitado específicamente, y se puede emplear un método de mezcla del compuesto de clatrato de la presente invención con el piretroide sintético para preparar una formulación, se puede emplear un método de mezcla de una formulación química agrícola que contiene el compuesto de clatrato de la presente invención con el piretroide sintético para preparar una formulación, se puede emplear un método de mezcla del compuesto de clatrato de la presente invención con el piretroide sintético y usar la mezcla obtenida (mezcla en tanque), y se puede emplear un método de tratamiento (sucesivo) casi simultáneo con el tiempo de aplicación.

Ejemplos

La presente invención se describirá ahora con mayor detalle mediante ejemplos. No obstante, la presente invención no está limitada por los siguientes ejemplos.

- 15 El punto de fusión se midió usando un aparato de medición del punto de fusión (DSC220, fabricado por Seiko Instruments Inc.).

Ejemplo 1

- 20 Se disolvieron 24,4 g (110 mmol) de acetamiprid (96,4 °C de punto de fusión) y 19,9 g (50 mmol) de 1,1,2,2-tetraquis (4-hidroxifenil) etano (TEP) en 500 ml de acetato de etilo mientras se agitaba en condiciones de reflujo. Después de completar la disolución, la solución se agitó durante 30 minutos y se dejó reposar a temperatura ambiente durante toda la noche. Los cristales precipitados se recogieron por filtración para obtener el compuesto de clatrato 1.

La relación de inclusión del compuesto de clatrato 1 fue la siguiente: TEP:acetamiprid = 1:2, y el punto de fusión fue de 162,7 °C.

- 25 El espectro de RMN ¹H (CDCl₃, patrón interno: TMS) del compuesto de clatrato 1 se muestra en la Fig. 1. En la Fig. 1, la ordenada indica la intensidad del pico y el eje de abscisas indica el valor del desplazamiento químico (ppm) (el mismo que en las Fig. 4, Fig. 7 y Fig. 10).

Los resultados de las mediciones de XRD del compuesto de clatrato 1 se muestran en la Fig. 2. La ordenada indica la intensidad y la abscisa indica el ángulo de difracción (el mismo que en las Fig. 5, Fig. 8 y Fig. 12).

- 30 Los resultados de las mediciones de TG-DTA del compuesto de clatrato 1 se muestran en la Fig. 3. En la Fig. 3, el eje de ordenadas (a la izquierda) indica el cambio en peso (% en peso), la ordenada (derecha) indica el flujo de calor/μV, y la abscisa indica la temperatura (°C) (la misma que en las Fig. 6, Fig. 9 y Fig. 13).

Ejemplo 2

- 35 Se disolvieron 33,0 g (150 mmol) de acetamiprid (96,4 °C de punto de fusión) y 39,8 g (100 mmol) de 1,1,2,2-tetraquis(4-hidroxifenil)etano (TEP) en 220 ml de metanol mientras se calentaba en condiciones de reflujo. Después de completar la disolución, la solución se agitó durante 30 minutos y se dejó reposar a temperatura ambiente durante toda la noche. Los cristales precipitados se recogieron por filtración para obtener el compuesto de clatrato 2.

La relación de inclusión del compuesto de clatrato 2 fue la siguiente: TEP:acetamiprid:metanol = 1:1:1, y el punto de fusión fue de 167,5 °C.

- 40 El espectro de RMN ¹H (CDCl₃, patrón interno: TMS) del compuesto del clatrato 2 se muestra en la Fig. 4, los resultados de las mediciones de XRD se muestran en la Fig. 5, y los resultados de las mediciones de TG-DTA se muestran en la Fig. 6.

Ejemplo 3

- 45 Se disolvieron 33,0 g (150 mmol) de acetamiprid (96,4 °C de punto de fusión) y 39,8 g (100 mmol) de 1,1,2,2-tetraquis(4-hidroxifenil)etano (TEP) en 220 ml de etanol mientras se calentaba en condiciones de reflujo. Después de completar la disolución, la solución se agitó durante 30 minutos y se dejó reposar a temperatura ambiente durante toda la noche. Los cristales precipitados se recogieron por filtración para obtener el compuesto de clatrato 3.

La relación de inclusión del compuesto de clatrato 3 fue la siguiente: TEP:acetamiprid:etanol = 1:1:1, y el punto de fusión fue de 167,5 °C.

- 50 El espectro de RMN ¹H (CDCl₃, patrón interno: TMS) del compuesto de clatrato 3 se muestra en la Fig. 7, los resultados de las mediciones de XRD se muestran en la Fig. 8, y los resultados de las mediciones de TG-DTA se muestran en la Fig. 9.

Ejemplo 4

Se mezclaron 870 mg de acetamiprid (punto de fusión: 96,4 °C), 1,26 g de 2,2',4,4'-tetrahidroxibenzofenona (THB) y 5,7 ml de etanol y se disolvieron mientras se agitaba y se calentaba en condiciones de reflujo durante 30 minutos. La solución se dejó en reposo durante 168 horas y los cristales precipitados se recogieron por filtración para obtener el compuesto de clatrato 4.

El espectro de RMN ^1H (CDCl_3 , patrón interno: TMS) del compuesto de clatrato 4 se muestra en la Fig. 10, el espectro de IR (KBr) se muestra en Fig. 11, los resultados de las mediciones de XRD se muestran en la Fig. 12, y los resultados de las mediciones de TG-DTA se muestran en la Fig. 13. En la Fig. 11, la ordenada indica el porcentaje de transmitancia y la abscisa indica un número de onda (cm^{-1}).

Medición de la solubilidad de saturación

Después de pesar una cantidad fija de cada uno de los compuestos de clatrato 1 a 4 obtenidos en los Ejemplos 1 a 4 y acetamiprid como control en un matraz aforado, se añadió agua destilada a 25 °C para obtener un volumen igual. Después de tapar y agitar 5 veces de arriba abajo, el matraz aforado se dejó reposar en una incubadora a 25 °C. Después de agitar 5 veces de arriba abajo seguido de la toma de muestras con el paso del tiempo, se añadió agua a 25 °C para volver a obtener un volumen igual, y la toma de muestras se realizó hasta las 192 horas. La concentración de acetamiprid en las soluciones de muestra se midió mediante HPLC y a continuación se calculó la solubilidad de saturación. Los resultados se muestran en la Tabla 1.

Como se muestra en la Tabla 1, la solubilidad de saturación después de reposar a 25 °C durante 192 horas fue la siguiente: compuesto de clatrato 1; 232 ppm, compuesto de clatrato 2; 238 ppm, compuesto de clatrato 3; 230 ppm, compuesto de clatrato 4; 373 ppm, acetamiprid; 3807 ppm.

Tabla 1

Compuestos	Concentración de acetamiprid (ppm)					
	1 hora	3 horas	24 horas	48 horas	72 horas	192 horas
Compuesto de clatrato 1	121 ppm	134 ppm	193 ppm	210 ppm	221 ppm	232 ppm
Compuesto de clatrato 2	72 ppm	79 ppm	161 ppm	200 ppm	217 ppm	238 ppm
Compuesto de clatrato 3	156 ppm	156 ppm	163 ppm	179 ppm	200 ppm	230 ppm
Compuesto de clatrato 4	238 ppm	244 ppm	306 ppm	333 ppm	346 ppm	373 ppm
Acetamiprid	2822 ppm	3273 ppm	3734 ppm	3776 ppm	3752 ppm	3807 ppm

Como resulta evidente de los resultados de la Tabla 1, la solubilidad de saturación del acetamiprid se redujo drásticamente en los compuestos de clatrato 1 a 4. También se comprobó que la solubilidad de saturación después de un periodo de tiempo prolongado (después de 192 horas) variaba dependiendo del compuesto hospedador polimolecular usado y la solubilidad de saturación presentaba esencialmente el mismo valor (compuestos de clatrato 1, 2 y 3) cuando se usa el mismo compuesto hospedador polimolecular, incluso si el método para la preparación del compuesto de clatrato varía.

Ejemplo 5

Se mezclaron el 35,0 % en peso del compuesto de clatrato 1, el 5,0 % en peso de lauril éter de polioxietileno (NEWCOL 2303, fabricado por Nippon Nyukazai Co., Ltd.) como agente tensioactivo, el 2,5 % en peso de dioctilsulfosuccinato de Na (NEWKALGEN EP-70G, fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.), el 0,2 % en peso de un espesante (Roadpole 23, fabricado por Rhodia Nicca, Ltd.) y otros adyuvantes, es decir, el 5,0 % en peso de un agente anticongelante (propilenglicol), el 0,5 % en peso de un antiespumante (Antifoam SE39, fabricado por Asahikasei Wacker Silicone Co., Ltd.) y el 0,1 % en peso de un antiséptico (PROXEL GXL, fabricado por Avecia KK) con el 51,7 % en peso de agua usando un mezclador de alta velocidad. La suspensión obtenida se pulverizó usando un molino de bolas para obtener la Formulación en sol 1.

La Formulación en sol 1 tenía un tamaño promedio de partículas de 1,3 μm .

Ejemplo 6

Se mezcló el 98 % en peso del compuesto de clatrato 1, y el 1 % en peso de lignosulfonato de Na (NEWKALGEN RX-B, fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.) y el 1 % en peso de alquilnaftalenosulfonato de Na (NEWKALGEN BX-C, fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.) como agente tensioactivo y se pulverizaron utilizando un molino

de púas para obtener el polvo humectable 1 que va a estar contenido en una formulación en una cantidad del 50 % en peso.

Ensayo de estabilidad de almacenamiento

Se pusieron de 1 a 2 g de la Formulación en sol 1 en una ampolla y se almacenaron en una incubadora a 54 °C durante 7 días (a), o como alternativa se almacenaron en incubadoras a 50 °C y -10 °C cada uno durante 3 días a 50 °C, 3 días a -10 °C, alternando para un total de 30 días (b). El contenido de acetamiprid se midió por cromatografía líquida de alto rendimiento (HPLC) y se calculó la relación residual de acetamiprid en las formulaciones en sol. Como resultado, la relación residual de acetamiprid en (a) y (b) era sustancialmente del 100 %. Esto demuestra que la estabilidad del acetamiprid contenido en la misma se puede mantener incluso si la Formulación en sol 1 se expone a un ambiente en el que la temperatura cambia drásticamente durante un largo periodo. La Formulación en sol 1 en (a) tenía un tamaño promedio de partículas de 1,6 µm y presentaba una tasa de crecimiento de partículas menor, y tampoco se produjo apelmazamiento.

También se pusieron de 1 a 2 g de polvo humectable 1 en una bolsa de vinilo y la bolsa de vinilo se puso en un laminado de aluminio, y a continuación se realizó el ensayo de estabilidad de almacenamiento (a). Como resultado, la relación residual de acetamiprid fue esencialmente del 100 %, de manera similar a la Formulación en sol 1. Después del ensayo, el estado del polvo era excelente y tampoco se produjo apelmazamiento.

Ensayo de estabilidad en tierra

El polvo humectable 1 obtenido se mezcló uniformemente con tierra a fin de controlar el contenido de acetamiprid a 1 mg en base a 10 g de tierra. Después de almacenar en una incubadora en condiciones de temperatura de 25 °C y una humedad relativa del 90 %, se realizó la toma de muestras en cada periodo predeterminado. El acetamiprid en la tierra se extrajo con un disolvente y se analizó por HPLC, y así se calculó la relación residual de acetamiprid.

Se realizó el mismo ensayo usando un polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid y se midió la estabilidad en tierra (relación residual). Los resultados se muestran en la Tabla 2. En la Tabla 2, la semi-vida media en tierra significa el periodo (días) requerido para reducir la cantidad de acetamiprid añadido bajo estas condiciones de ensayo a la mitad.

Tabla 2

Días transcurridos	Polvo humectable 1	Polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid
0 días	100 %	100 %
7 días	46 %	47 %
13 días	45 %	35 %
21 días	27 %	23 %
28 días	28 %	20 %
Semi-vida en tierra	12,6 días	10,5 días

Como resulta evidente de los resultados de la Tabla 2, la semi-vida en tierra del acetamiprid en el polvo humectable 1 fue superior a la del acetamiprid en el polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid, y el polvo humectable 1 presentaba una mayor estabilidad en tierra.

Ensayo como agente para el tratamiento de semillas

En 3 ml de una solución (solución adhesiva) preparada disolviendo el 5 % en peso de alcohol polivinílico (Gohsenol GL-05S, fabricado por Nippon Synthetic Chemical Industry Co., Ltd.) y el 1 % en peso de lignosulfonato de Na (NEWKALGEN RX -B, fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.) como agente tensioactivo en el 94 % en peso de agua se dispersó el polvo humectable 1 del Ejemplo 6 de manera que contenga 70 mg de acetamiprid y, a continuación 0,3 ml de esta dispersión se pusieron en una bolsa de vinilo con una cremallera que contiene 20 g de semillas de trigo (Norin N° 61). Inmediatamente después de eso, la bolsa de vinilo se cerró, y las semillas se recubrieron con el producto químico agitando vigorosamente durante 30 segundos. Estas semillas se extendieron sobre una bandeja y a continuación se secaron al aire a temperatura ambiente durante toda la noche para obtener semillas de trigo recubiertas con 35 g de acetamiprid por 100 kg de semillas. Las semillas se plantaron en una maceta de flores sin esmaltar N° 2 que contiene tierra Kuroboku, seguido de la inoculación con adultos y larvas de 20 pulgones del trigo por planta 40 días (o 50 días) más tarde. El número de parásitos se contó a los 2, 4, y 7 días después de la inoculación para evaluar la eficacia residual. En el caso del tratamiento con un polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid y sin tratamiento como control, se realizó el mismo ensayo. Los resultados

se muestran en la Tabla 3.

Tabla 3

Formulaciones	Inoculadas 40 días después de la siembra			Inoculadas 50 días después de la siembra		
	después de 2 días	después de 4 días	después de 7 días	después de 2 días	después de 4 días	después de 7 días
Polvo humectable 1	2	0	0	19	29	32
Polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid	7	7	38	40	43	76
Sin tratamiento	49	87	276	43	90	159

5 Como resulta evidente de los resultados mostrados en la Tabla 3, el polvo humectable 1 presentaba una alta persistencia de la potencia de principio químico agrícola activo, en comparación con el polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid.

Ensayo como agente para el tratamiento de semillas usado en combinación con un agente piretroide sintético

10 En 3,2 ml de una solución (solución adhesiva) preparada disolviendo el 5 % en peso de alcohol polivinílico (Gohsenol GL-05S, fabricado por Nippon Synthetic Chemical Industry Co., Ltd.) y el 1 % en peso de lignosulfonato de Na (NEWKALGEN RX-B, fabricado por Takemoto Oil & Fat Co., Ltd.) como agente tensioactivo en el 94 % en peso de agua, se dispersó el polvo humectable 1 del Ejemplo 6 de manera que contenga 800 mg de acetamiprid y, a continuación se pusieron 0,24 g de esta dispersión en una bolsa de vinilo con una cremallera que contiene 8 g de semillas de colza. Inmediatamente después de eso, la bolsa de vinilo se cerró, y las semillas de colza se recubrieron con el producto químico agitando vigorosamente durante 30 segundos. Estas semillas se extendieron sobre una

15 bandeja y a continuación se secaron al aire a temperatura ambiente durante toda la noche para obtener semillas de colza recubiertas con 500 g de acetamiprid por 100 kg de semillas.

20 En 1,1 g de agente de CS bifentrina (principio activo: 7,2 % en peso), se dispersó el polvo humectable 1 del Ejemplo 6 de manera que contenga 80 mg de acetamiprid y a continuación se pusieron 0,64 g de esta dispersión (que contiene 40 mg de bifentrina y 40 mg de acetamiprid) en una bolsa de vinilo con una cremallera que contiene 8 g de semillas de colza. Inmediatamente después de eso, la bolsa de vinilo se cerró, y las semillas de colza se recubrieron con el producto químico agitando vigorosamente durante 30 segundos. Estas semillas se extendieron sobre una bandeja y a continuación se secaron al aire a temperatura ambiente durante toda la noche para obtener semillas de colza recubiertas con 500 g de bifentrina y 500 g de acetamiprid por 100 kg de semillas.

25 Las semillas obtenidas se sembraron en una maceta N° 2 que contiene tierra aluvial y a continuación se cultivaron en un invernadero. 15 días después de la siembra, las plántulas de colza se trasladaron a una jaula en la que se liberaron 100 imagos de escarabajo pulga rayado. 2 días después de asentar, se contó el número de incidencias de daños por insectos debido a los imagos de escarabajo pulga rayado de 3 plantas en cada maceta del experimento. En el caso de un tratamiento con un polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid o únicamente un agente de CS bifentrina a fin de recubrir las semillas con 500 g del principio activo por cada 100 kg de semillas, y

30 sin tratamiento como control, se realizó el mismo ensayo. Los resultados se muestran en la Tabla 4.

Tabla 4

Formulaciones	Cantidad de tratamiento g/100 kg de semillas	Número de incidencias de daños por insectos/4 plantas	% de relación de insecticida
		después de 15 días	después de 15 días
Polvo humectable 1 + bifentrina	500 + 500	40	89,9
	250 + 250	58	85,4
Polvo humectable 1	500	65	83,7
Bifentrina	500	98	75,4
Polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid	500	80	79,9
Sin tratamiento	-	398	

Como resulta evidente de los resultados mostrados en la Tabla 4, el polvo humectable 1 presentaba un efecto insecticida superior contra el escarabajo pulga rayado en comparación con el polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid. También se comprobó que el efecto insecticida contra el escarabajo pulga rayado se mejoró al usar en combinación con bifentrina como agente piretroide sintético, en comparación con un tratamiento solo con polvo humectable 1 o bifentrina, y se reconoció un efecto sinérgico entre el polvo humectable 1 y el agente piretroide sintético.

Ensayo como agente contra termitas

[Ensayo de potencia como agente para el tratamiento de tierra contra termitas]

Se prepara una solución química dispersando 0,5 g de polvo humectable 1 obtenido en el Ejemplo 6 en 1,6 l de agua del grifo. Se añadió 1 ml de la solución química obtenida a 14 g de tierra kuroboku, seguido de mezcla uniforme con agitación. La tierra tratada se puso en una incubadora a 36 °C y se añadió el agua perdida por la evaporación cada 7 días, a fin de volver al peso inicial, seguido de mezcla mientras se agita. 21 días después del tratamiento, con la tierra tratada se rellenó un tubo de cloruro de vinilo (diámetro interior: 11 mm, longitud: 5 cm) y el tubo se conectó a la porción de puente a una altura de 2 cm desde el fondo de dos recipiente de ensayo de resina de PET (diámetro interno: 5 cm, altura: 11 cm). En un recipiente de ensayo, se pusieron 30 g de una tierra no tratada. Después de 2 días, se inocularon 60 hormigas obreras y una hormiga soldado de la especie *Reticulitermes speratus* Kolbe. En otro recipiente de ensayo, se pusieron 5 g de cartón corrugado cortado como cebo y 5 ml de agua del grifo. El recipiente de ensayo se puso en una incubadora a 25 °C y se evaluó la eficacia activa observando el estado de perforación de la tierra tratada, el estado de comportamiento y el estado de salud durante 21 días. Se utilizaron como control una maceta tratada con un polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid (la misma cantidad de principio activo) y una maceta no tratada sin ningún producto químico. El ensayo se repitió dos veces. Los resultados se muestran en la Tabla 5.

Tabla 5

Formulaciones	Repetición	Grado de perforación *						
		1 DAT	3 DAT	5 DAT	7 DAT	10 DAT	14 DAT	21 DAT
Polvo humectable	A	1	1	1	1	1	1	1
	B	0	0	0	0	0	0	0
	Promedio	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid	A	0	0	5	5	5	5	5
	B	1	1	2	2	3	5	5
	Promedio	0,5	0,5	3,5	3,5	4	5	5
Sin tratamiento	A	5	5	5	5	5	5	5
	B	5	5	5	5	5	5	5
	Promedio	5	5	5	5	5	5	5

*: grado de perforación 0: no se observó perforación en la tierra sometida a ensayo

grado de perforación 1: distancia de perforación inferior a 1 cm

grado de perforación 2: distancia de perforación inferior a 2 cm

grado de perforación 3: distancia de perforación inferior a 3 cm

grado de perforación 4: distancia de perforación inferior a 4 cm

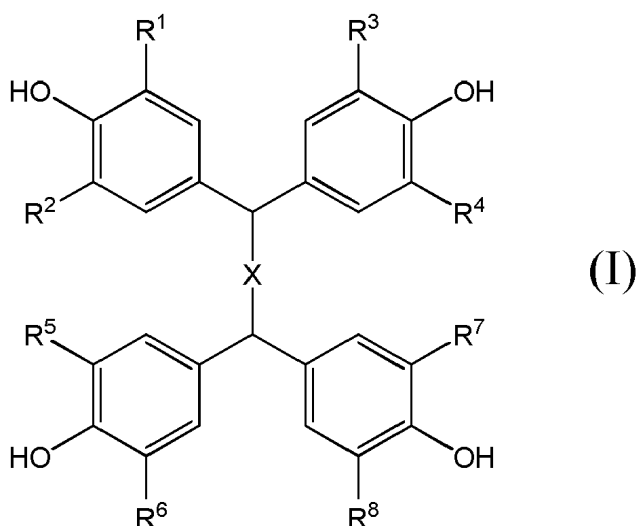
grado de perforación 5: distancia de perforación no inferior a 4 cm

Como resulta evidente de los resultados mostrados en la Tabla 5, el polvo humectable 1 presentaba efectos insecticidas mejorados en la tierra contra *Reticulitermes speratus* Kolbe en comparación con el polvo humectable que contiene el 70 % en peso de acetamiprid.

REIVINDICACIONES

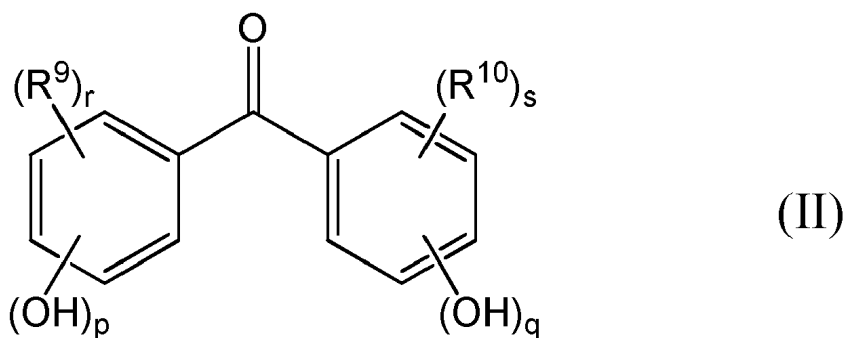
1. Un compuesto de clatrato para una formulación química agrícola caracterizado por que comprende: un compuesto hospedador polimolecular como compuestos hospedador; y un principio activo químico agrícola que tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm, con la excepción de benzaldehído, 2-alkil-3(2H)-isotiazolonas, y 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona, como compuesto huésped,

en el que el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de tetraquisfenol representado mediante la fórmula (I)



(en la que X representa $(CH_2)_n$ (n representa un número entero de 0 a 3) o un grupo fenileno que puede tener un sustituyente, y R^1 a R^8 cada uno representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilo que puede tener un sustituyente, un átomo de halógeno o un grupo alcóxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), o

el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de hidroxibenzofenona representado mediante la fórmula (II):



(en la que R^9 y R^{10} cada uno representa independientemente un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno o un grupo alcóxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, r y s cada uno representa independientemente un número entero de 0 a 4, y p y q cada uno representa independientemente un número entero de 1 a 4).

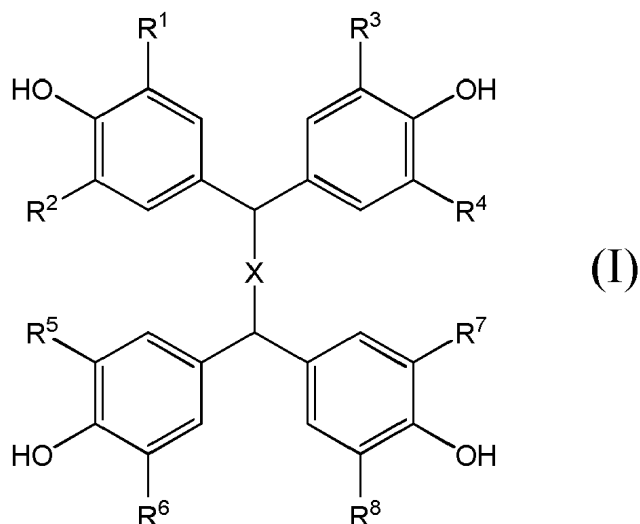
2. Un compuesto de clatrato para una formulación química agrícola de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que el principio activo químico agrícola es un compuesto neonicotinoide.

3. Un compuesto de clatrato para una formulación química agrícola de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado por que el compuesto neonicotinoide es al menos uno seleccionado del grupo que consiste en nitenpyram, imidacloprid, acetamiprid, thiamethoxam y dinotefuran.

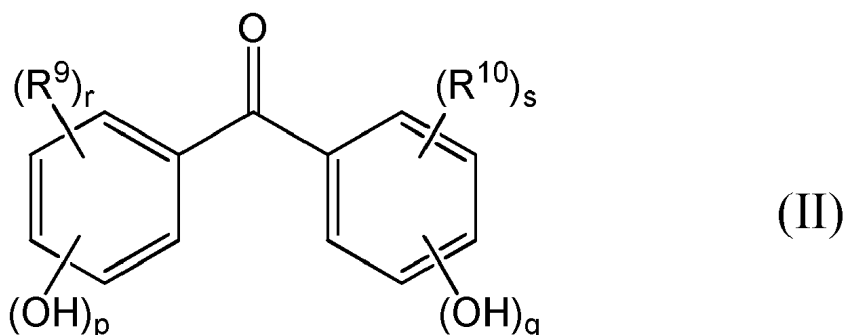
4. Un método para el control de una concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola, caracterizado por que comprende una etapa de mantenimiento de la concentración de un principio activo químico agrícola en agua dentro de un intervalo de concentraciones predeterminado al incluir el principio activo químico agrícola que tiene una solubilidad de saturación en agua a 25 °C no inferior a 500 ppm, con la excepción de

benzaldehído, 2-alkil-3(2H)-isotiazolonas, y 5-cloro-2-metil-4-isotiazolin-3-ona, en un espacio interior formado por un compuesto hospedador polimolecular,

en el que el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de tetraquisfenol representado mediante la fórmula (I)



(en la que X representa $(CH_2)_n$ (n representa un número entero de 0 a 3) o un grupo fenileno que puede tener un sustituyente, y R^1 a R^8 cada uno representa independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, un grupo fenilo que puede tener un sustituyente, un átomo de halógeno o un grupo alcoxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono), o el compuesto hospedador polimolecular es un compuesto de hidroxibenzofenona representado mediante la fórmula (II):



(en la que R^9 y R^{10} cada uno representa independientemente un grupo alquilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, un átomo de halógeno o un grupo alcoxilo que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, r y s cada uno representa independientemente un número entero de 0 a 4, y p y q cada uno representa independientemente un número entero de 1 a 4).

5. Un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola de acuerdo con la reivindicación 4, caracterizado por que el principio activo químico agrícola es un compuesto neonicotinoide.

6. Un método para controlar la concentración de una solución acuosa de principio activo químico agrícola de acuerdo con la reivindicación 5, caracterizado por que el compuesto neonicotinoide es al menos uno seleccionado del grupo que consiste en nitenpyram, imidacloprid, acetamiprid, thiamethoxam y dinotefuran.

7. Una formulación química agrícola caracterizada por que comprende el compuesto de clatrato para una formulación química agrícola de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.

8. Una formulación química agrícola de acuerdo con la reivindicación 7, caracterizada por que es un agente para el tratamiento de semillas.

9. Una formulación química agrícola de acuerdo con la reivindicación 7 u 8, caracterizada por que es una formulación en sol en la que el compuesto de clatrato está disperso en agua.

10. Una composición activa agrícola caracterizada por que comprende: el compuesto de clatrato para una formulación agrícola de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3; y un piretroide sintético.

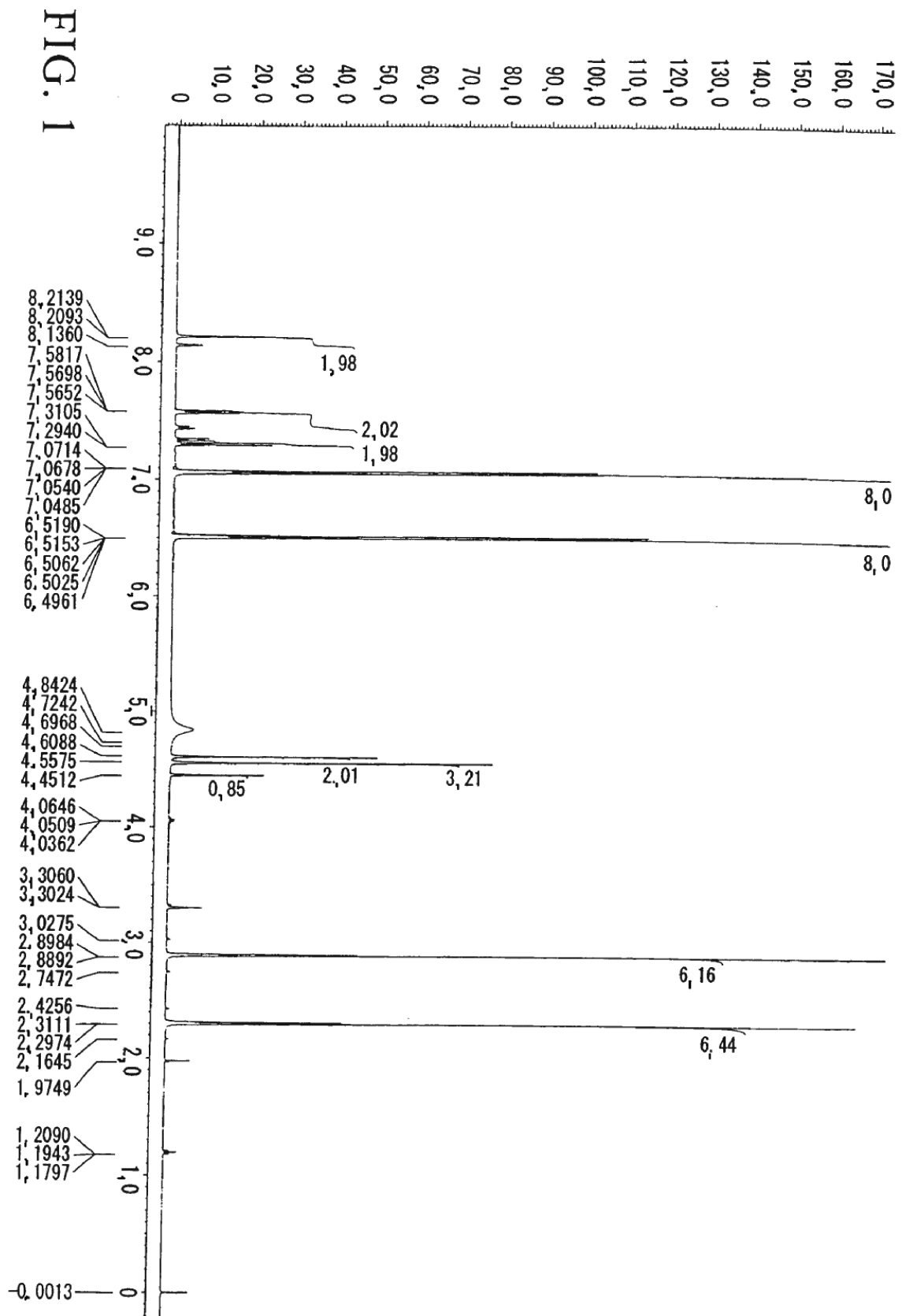
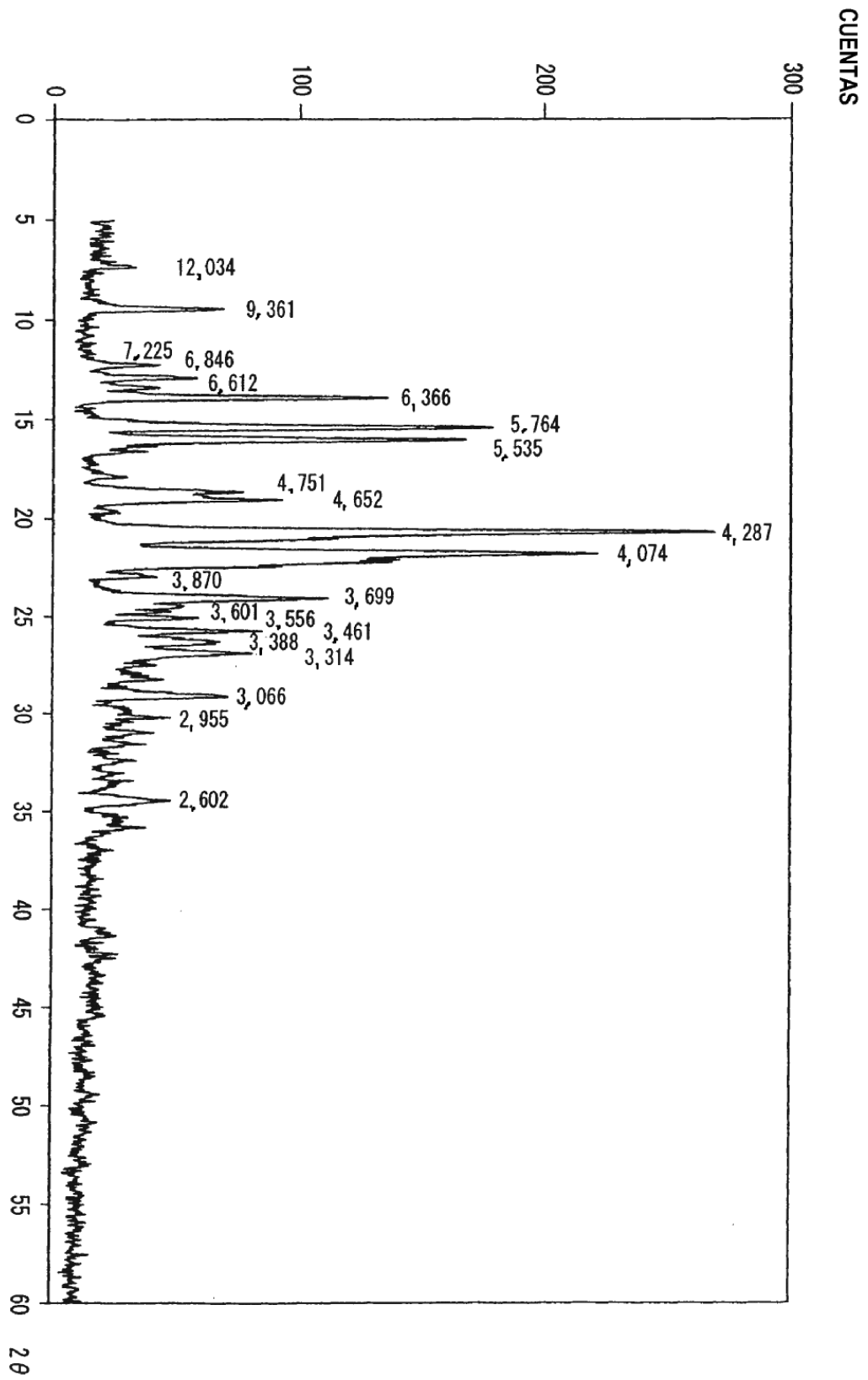


FIG. 2



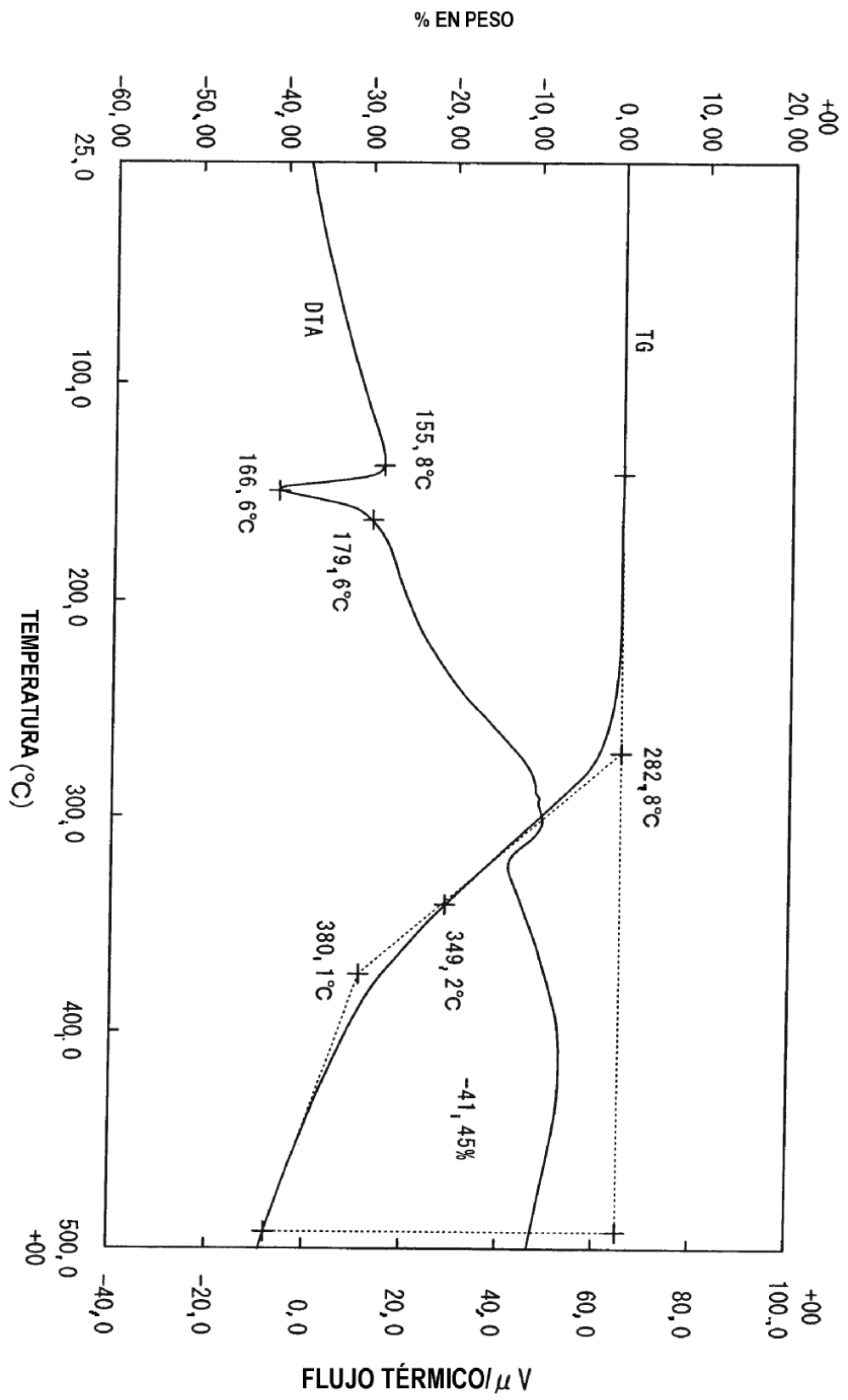


FIG. 3

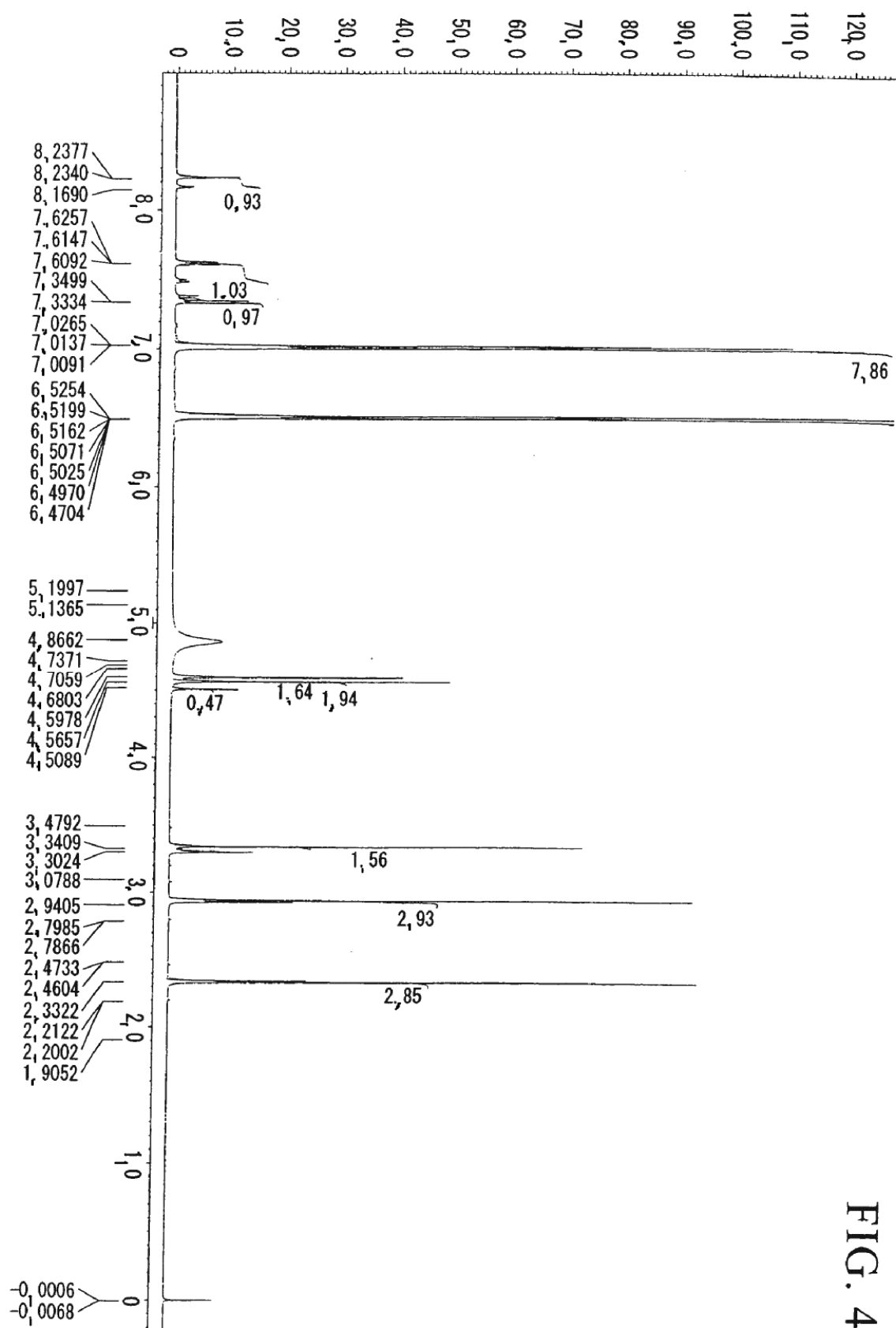


FIG. 4

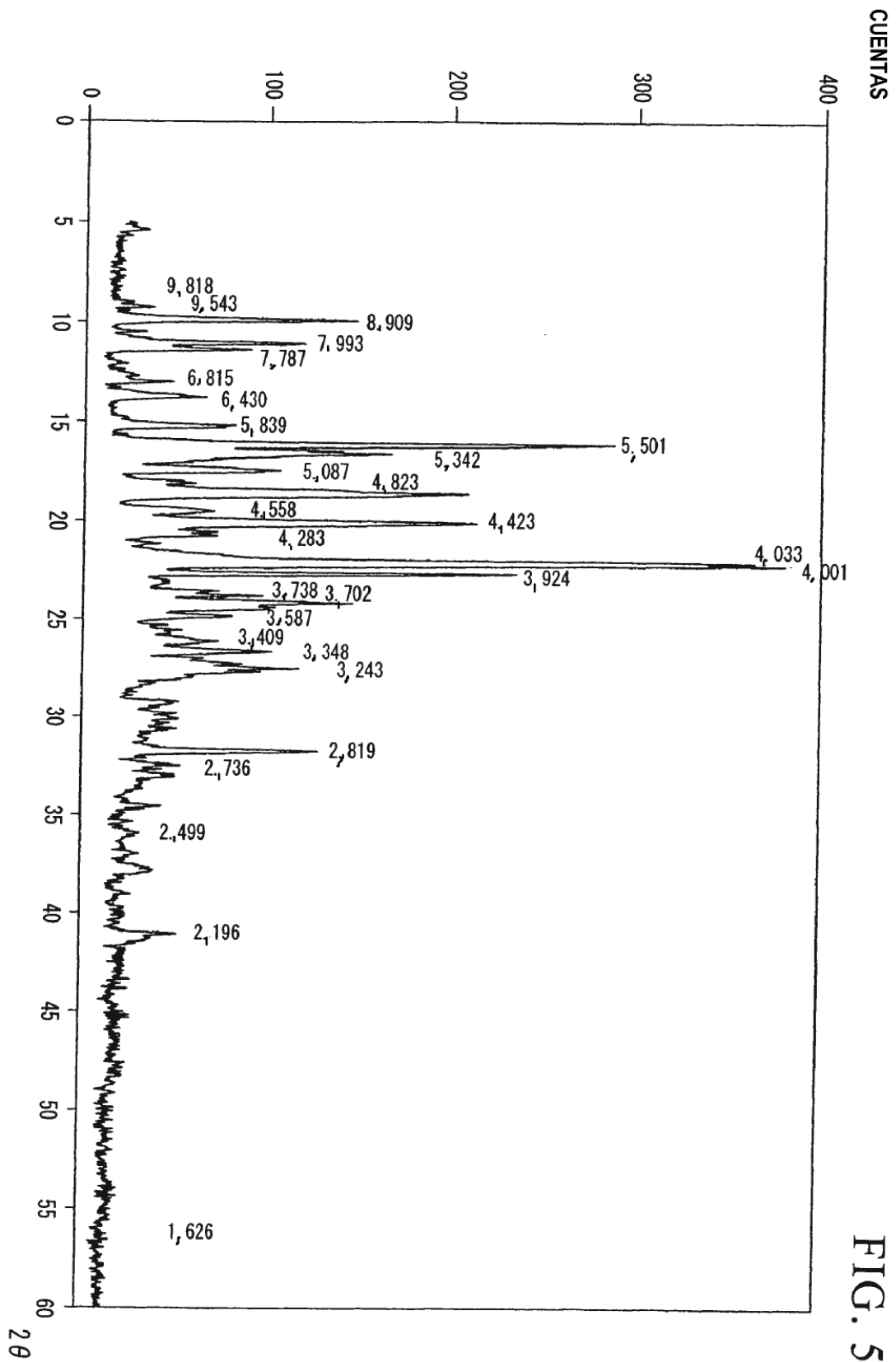


FIG. 5

FIG. 6

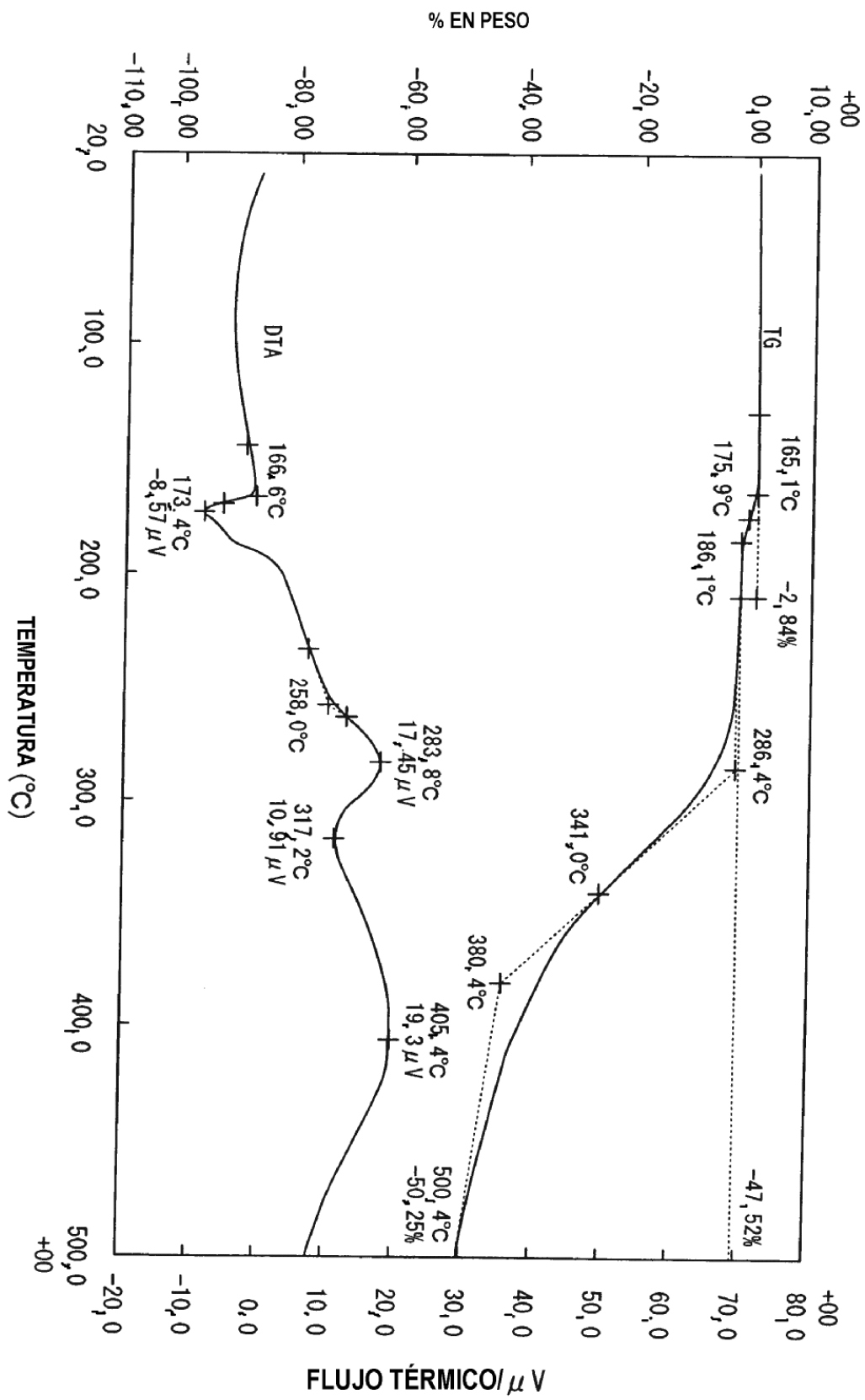
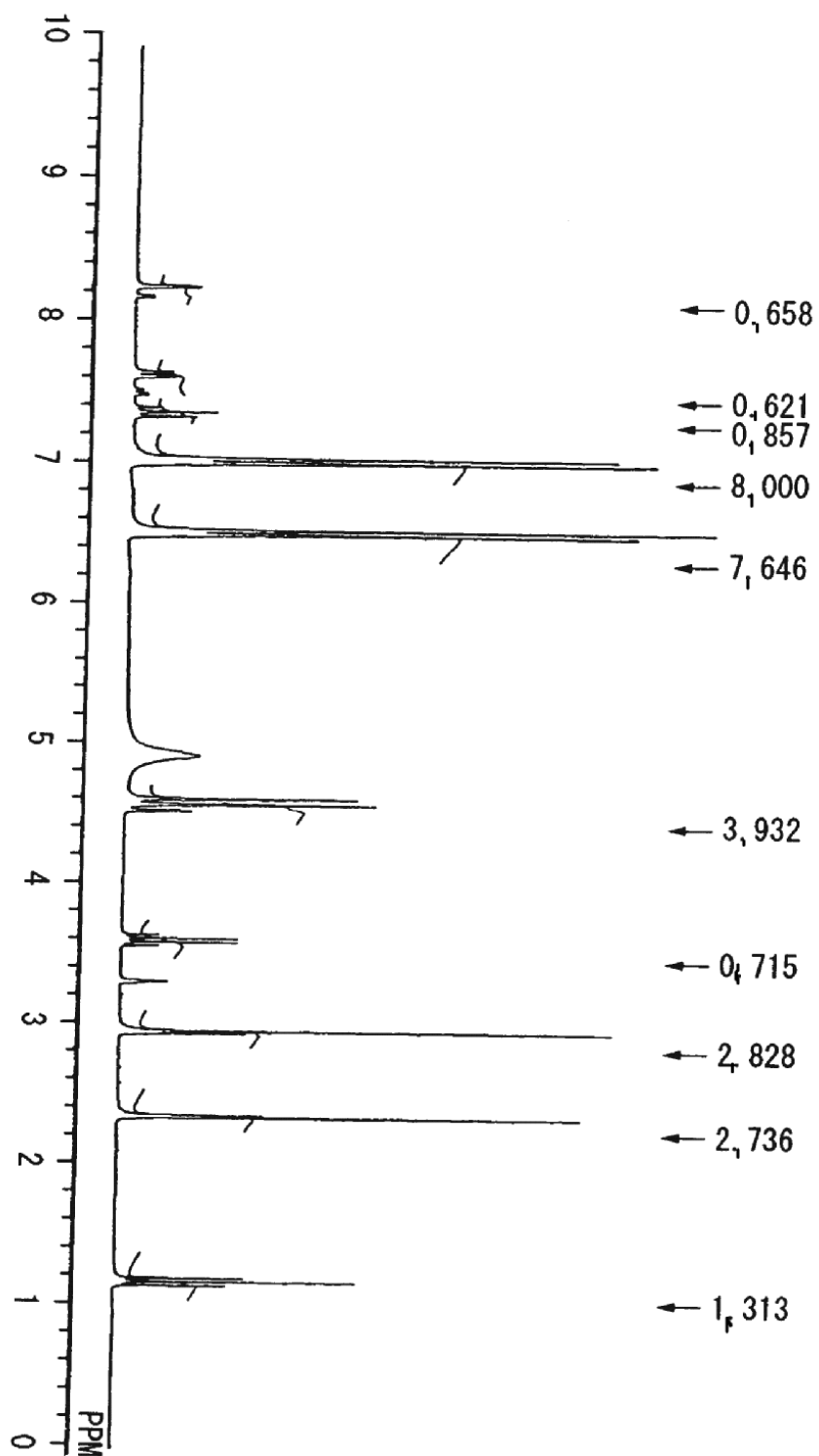


FIG. 7



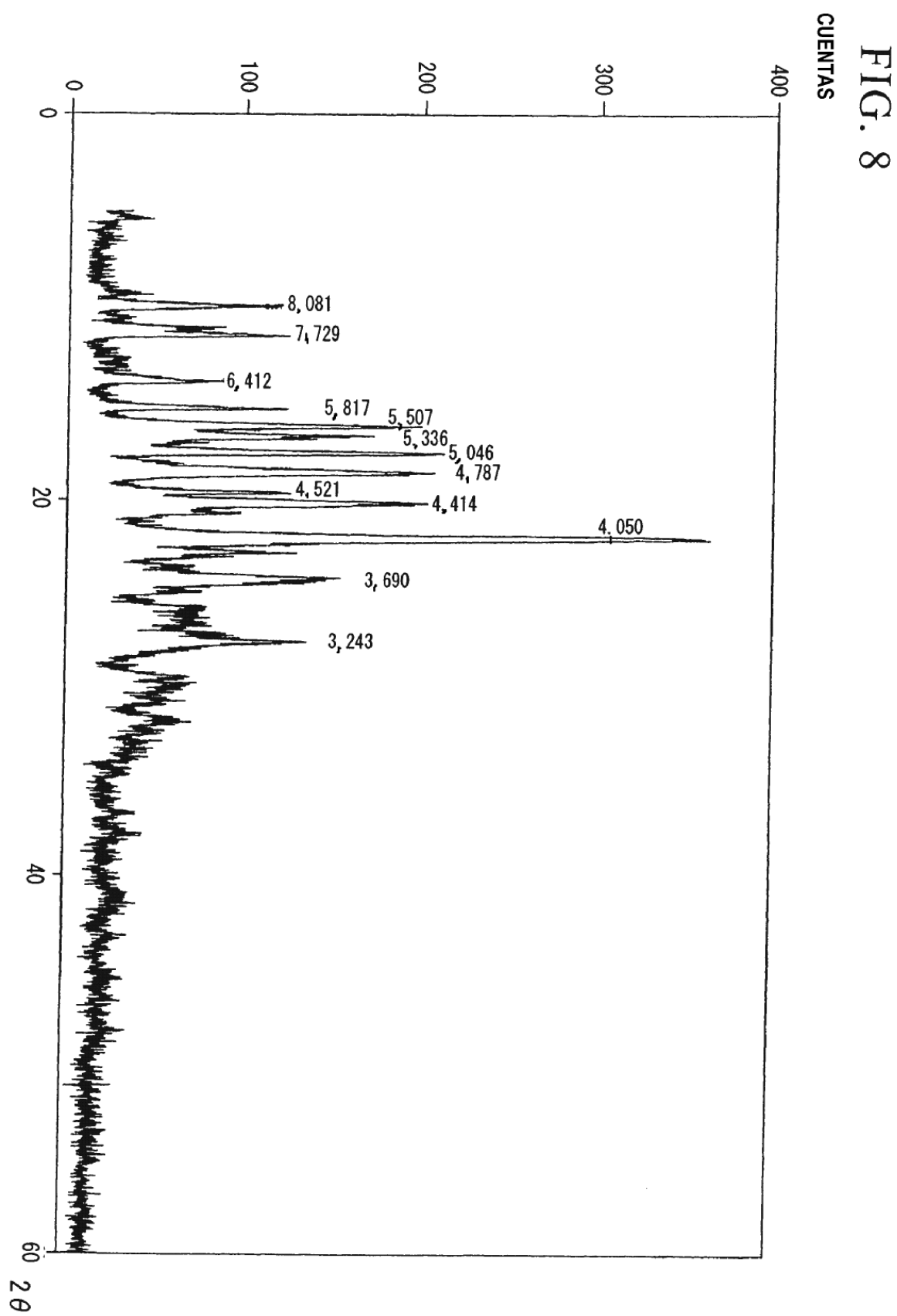


FIG. 9

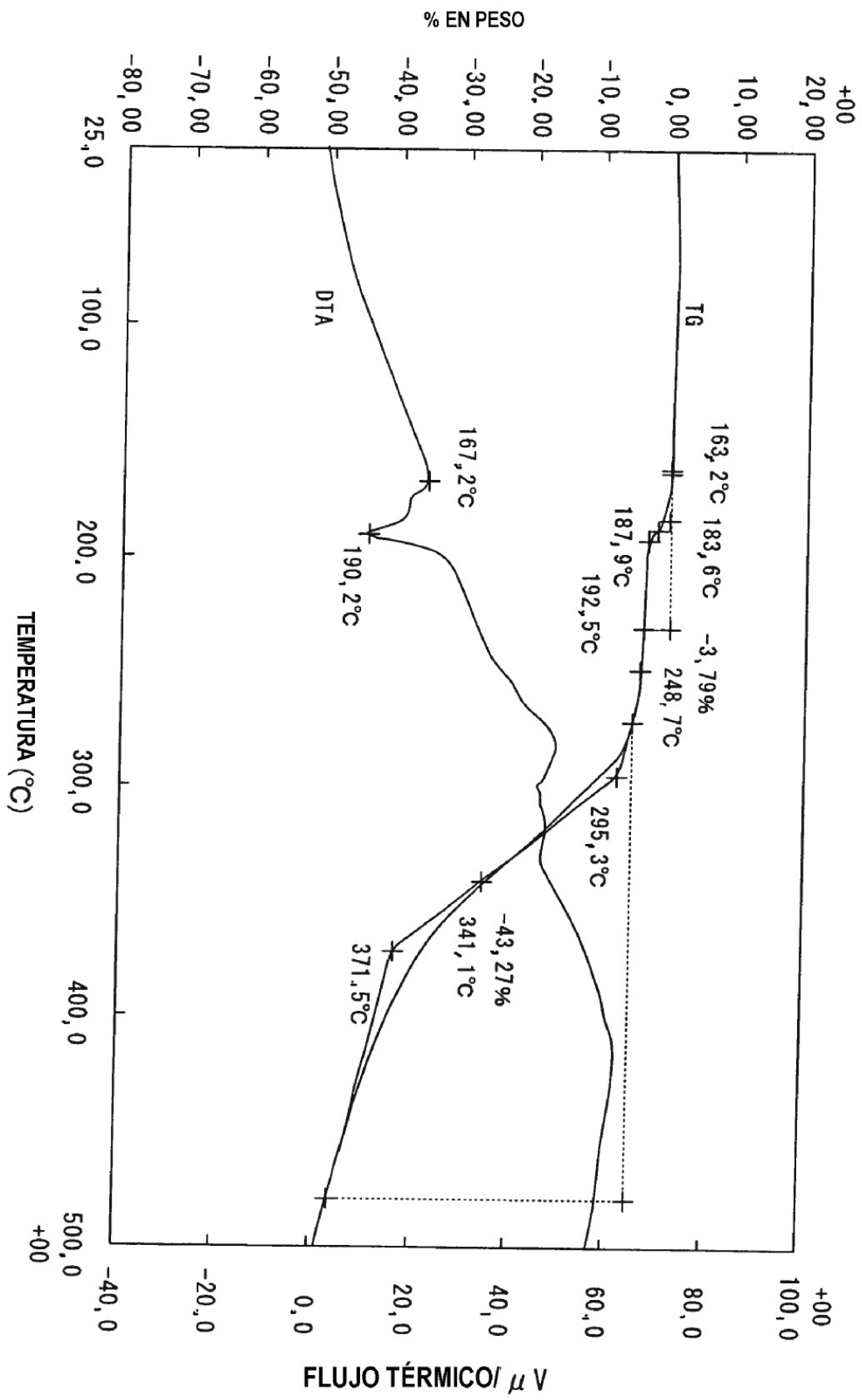
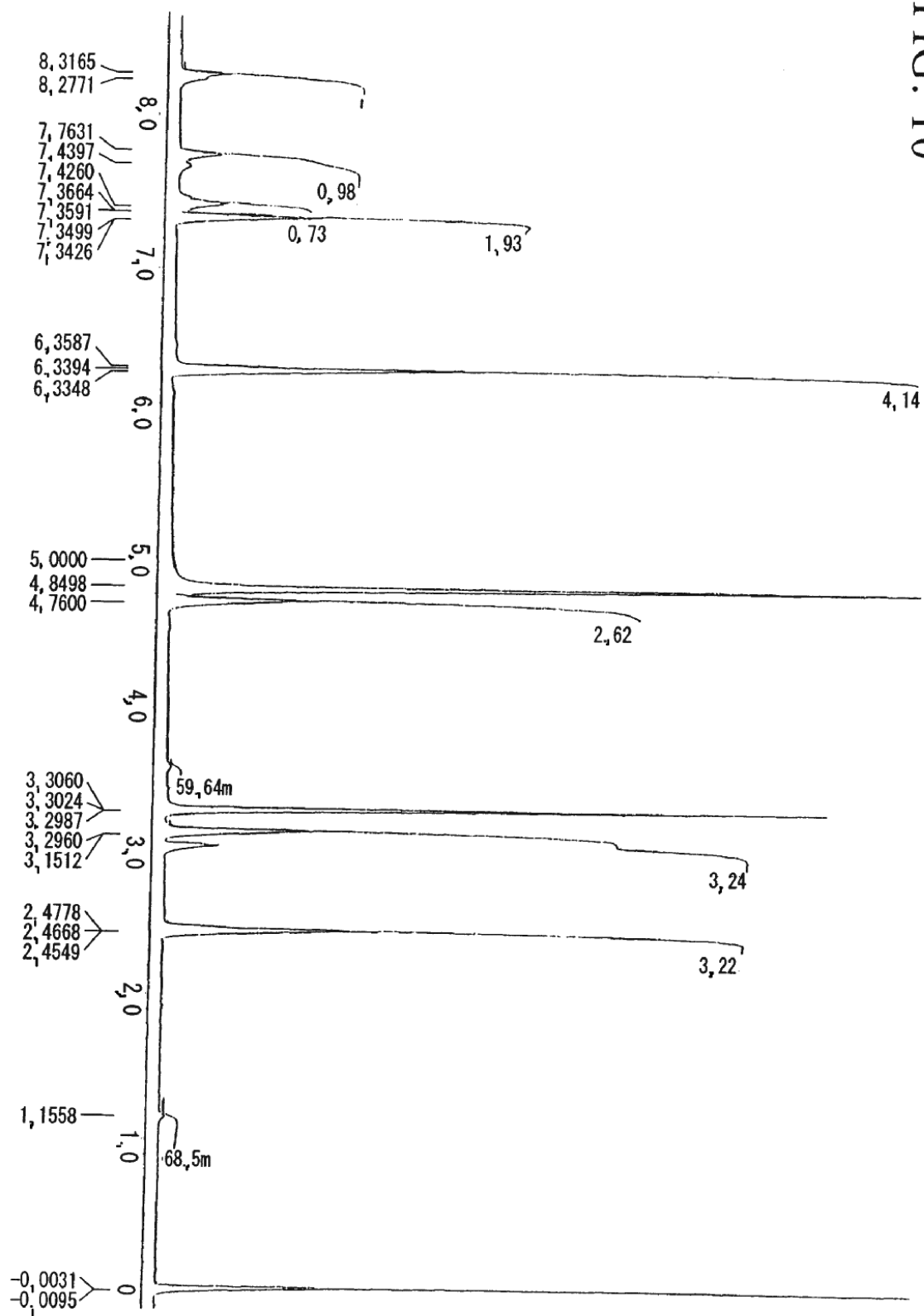


FIG. 10



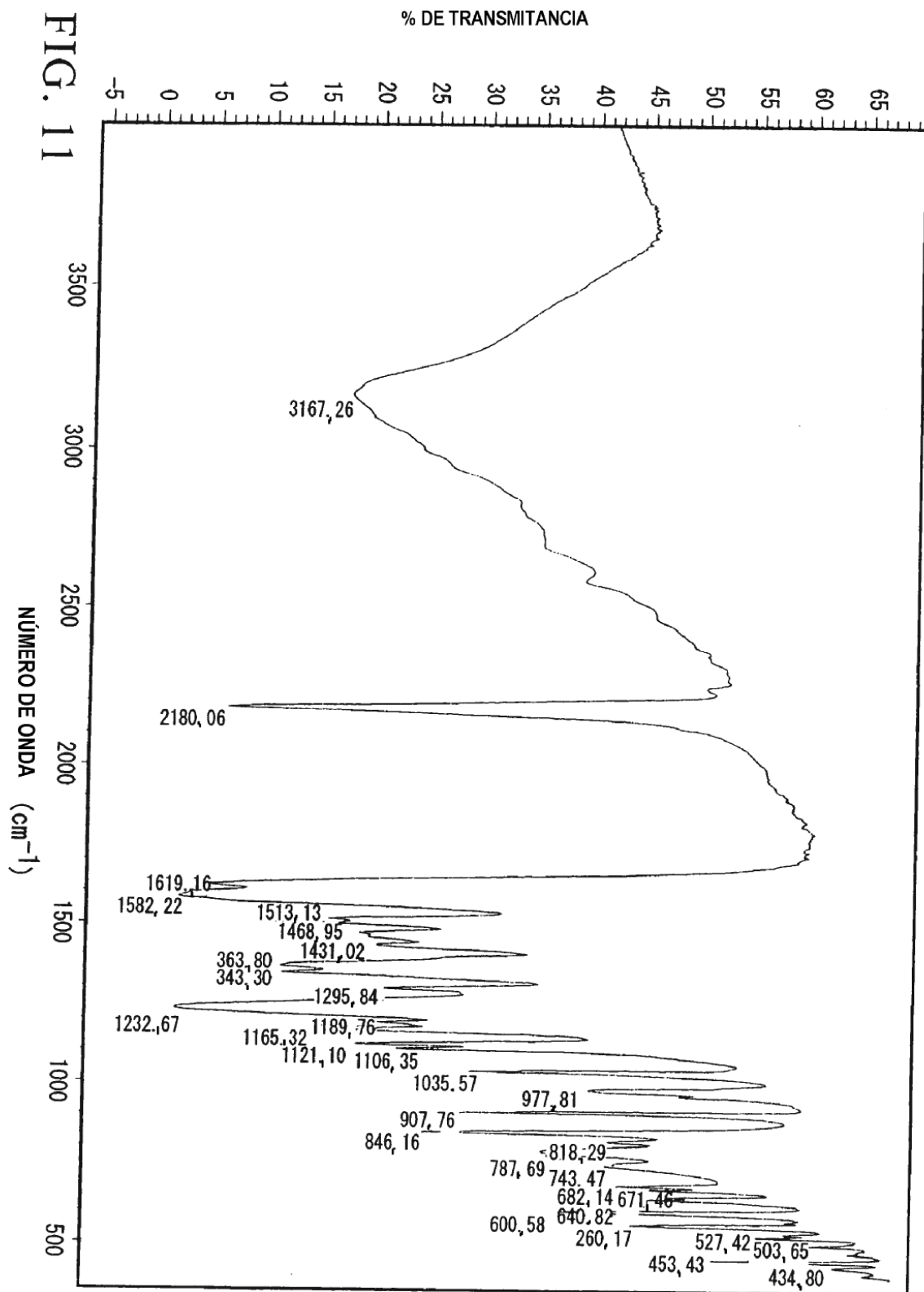


FIG. 12
CIENTAS

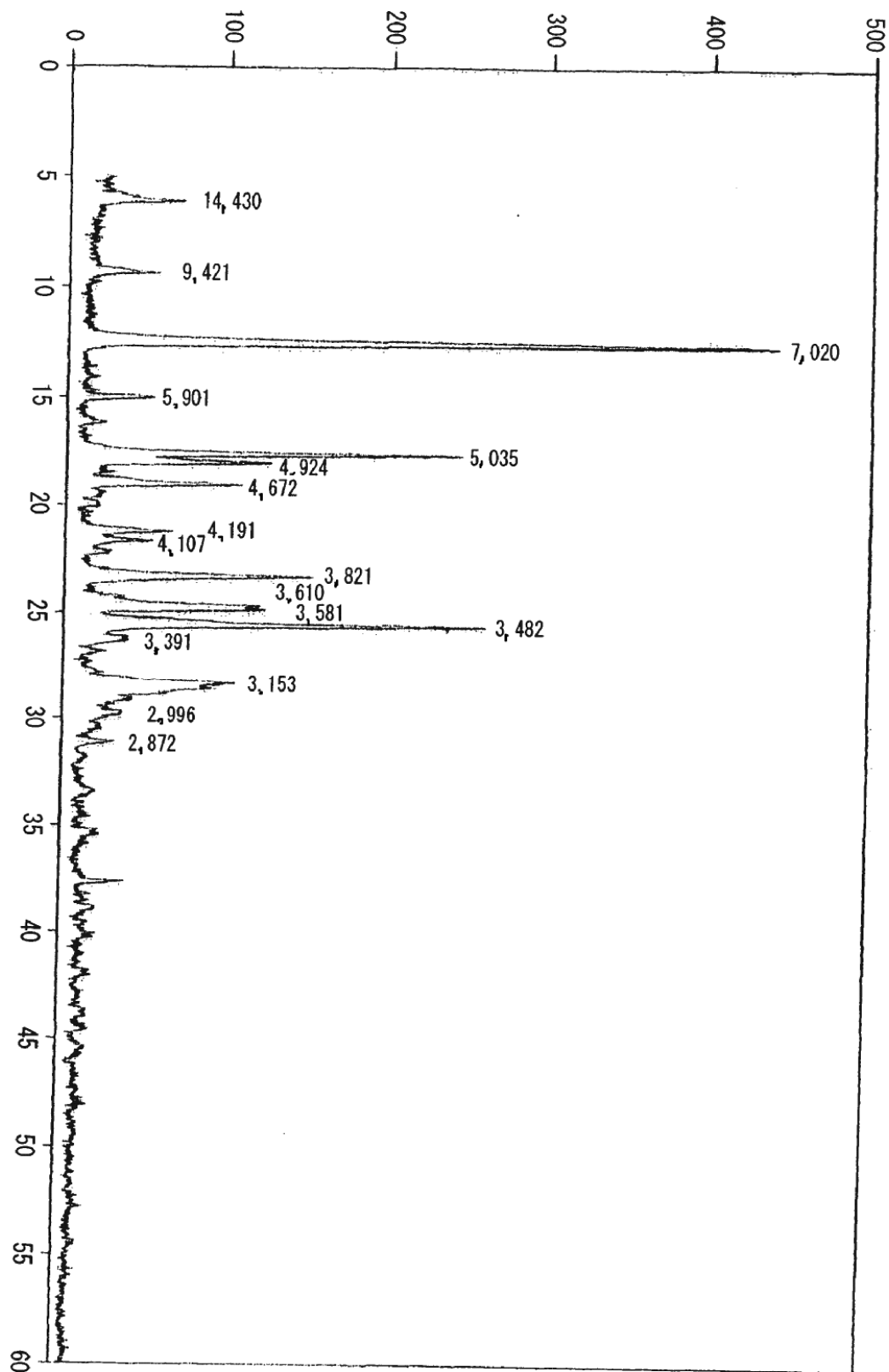


FIG. 13

