



(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ

(11)



1-0026430

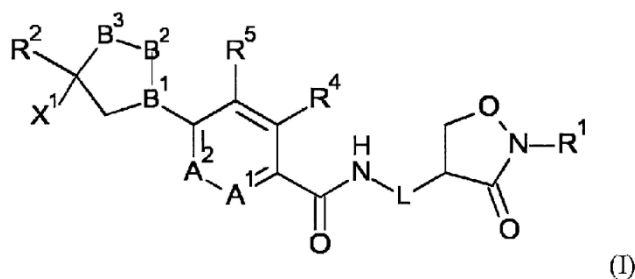
(51)⁷ A01N 43/80; A01P 7/04

(13) B

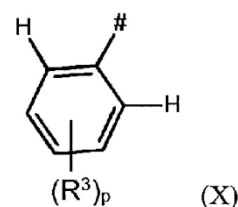
(21) 1-2015-00637 (22) 09/08/2013
(86) PCT/EP2013/066696 09/08/2013 (87) WO 2014/029640 A1 27/02/2014
(30) 12181766.2 24/08/2012 EP; 12195026.5 30/11/2012 EP
(45) 25/11/2020 392 (43) 27/07/2015 328A
(73) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland
(72) EL QACEMI, Myriem (FR); CASSAYRE, Jérôme Yves (FR).
(74) Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)

(54) PHƯƠNG PHÁP PHÒNG TRỪ VÀ/HOẶC NGĂN NGỪA SỰ PHÁ HOẠI CỦA
RẦY HOẶC SÂU ĐỤC THÂN Ở CÂY LÚA

(57) Sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ côn trùng ở cây lúa, phương pháp này bao gồm việc áp dụng cho cây lúa, địa điểm trồng chúng, hoặc vật liệu nhân giống chúng hợp chất có công thức I: trong đó -B¹-B²-B³- là -C=N-O-, -C=N-CH₂-, -C=CH₂-O- hoặc -N-CH₂-CH₂-; L là liên kết trực tiếp hoặc metylen; A¹ và A² là C-H, hoặc một trong số A¹ và A² là C-H và chất còn lại là N; X¹ là nhóm X R¹ là C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl hoặc C₃-C₆cycloalkyl; R² là clodiflometyl hoặc triflometyl; R³ độc lập là bromo, clo, flo hoặc triflometyl; R⁴ là hydro, halogen, metyl, halometyl hoặc xyano; R⁵ là hydro; hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nhau tạo thành nhóm 1,3-butadien có cầu; p là 2 hoặc 3. Tốt hơn, nếu phương pháp theo sáng chế dùng để phòng trừ sâu đục thân, sâu cuốn lá, rầy, sâu năn, giòi đục lá, bộ xít hôi, và/hoặc bộ xít đen.



(I)



(X)

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát rầy hoặc sâu đục thân tàn phá lúa.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

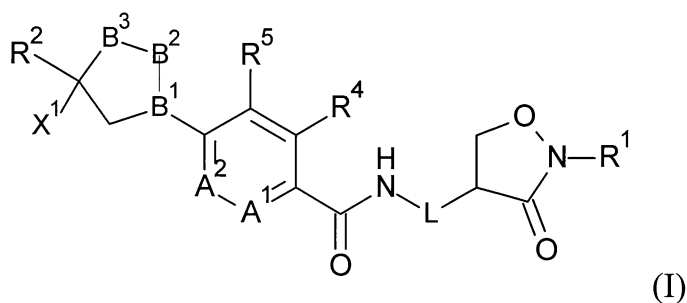
Các hợp chất có hoạt tính diệt côn trùng, diệt ve bét, diệt giun tròn và/hoặc diệt loài gây hại thân mềm nhờ chất đối kháng của kênh clorua mở do gamma-aminobutyric axit (GABA), và bao gồm dị vòng no được thế một phần bởi phần tử thế haloalkyl và một hoặc hai vòng thơm no hoặc dị vòng thơm được thế tùy ý, thể hiện nhóm thuốc diệt loài gây hại mới được mô tả làm ví dụ trong Ozoe et al. Biochemical and Biophysical Research Communications, 391 (2010) 744-749. Các hợp chất từ nhóm này được mô tả rộng rãi trong các tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2005/085216 (EP1731512), WO 2007/123853, WO 2007/075459, WO 2009/002809, WO 2008/019760, WO 2008/122375, WO 2008/128711, WO 2009/097992, WO 2010/072781, WO 2010/072781, WO 2008/126665, WO 2007/125984, WO 2008/130651, các tài liệu đơn sáng chế Nhật Bản số JP 2008110971, JP 2008133273, JP 2009108046, các tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2009/022746, WO 2009/022746, WO 2010/032437, WO 2009/080250, WO 2010/020521, WO 2010/025998, WO 2010/020522, WO 2010/084067, WO 2010/086225, WO 2010/149506, WO 2010/108733 và WO 2012/163960 (được công bố ngày 06/12/2012).

Hiện nay đã phát hiện một cách đáng ngạc nhiên là các chất diệt côn trùng cụ thể từ nhóm mới này của chất đối kháng kênh clorua mở do gamma-aminobutyric axit (GABA) (được bộc lộ ví dụ trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO2011/067272) có hiệu quả cao trong việc phòng trừ một số loài gây hại ở cây lúa.

Do đó các hợp chất này thể hiện giải pháp mới quan trọng để bảo vệ cây lúa, khỏi côn trùng tàn phá cây lúa, cụ thể là khi côn trùng kháng các phương pháp hiện có.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề xuất phương pháp bao gồm việc áp dụng cho cây lúa, địa điểm trồng chúng, hoặc vật liệu nhân giống chúng hợp chất có công thức I



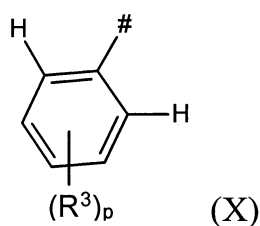
trong đó

$-B^1-B^2-B^3-$ là $-C=N-O-$;

L là liên kết trực tiếp;

A^1 và A^2 là C-H;

X^1 là nhóm X



R^1 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_3 - C_6 xycloalkyl;

R^2 là triflometyl;

mỗi R^3 độc lập là bromo, clo, flo hoặc triflometyl;

R^4 là hydro, halogen, metyl, halometyl hoặc xyano;

R^5 là hydro;

hoặc R^4 và R^5 cùng với nhau tạo thành nhóm 1,3-butadien có cầu;

p là 2 hoặc 3; trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy hoặc sâu đục thân.

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo một phương án, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sâu đục thân ở cây lúa bao gồm việc áp dụng cho cây lúa, địa điểm trồng chúng, hoặc vật liệu nhân giống chúng hợp chất có công thức I. Theo một phương án, sáng chế đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức I để phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sâu đục thân ở lúa. Sâu đục thân có thể kháng các chất diệt côn trùng khác. Các ví dụ về sâu đục thân bao gồm *Chilo* sp, *Chilo suppressalis*, *Chilo polychrysus*, *Chilo auricilius*, *Scirpophaga* spp., *Scirpophaga incertulas*, *Scirpophaga innotata*, *Scirpophaga nivella*, *Sesamia* sp, *Sesamia inferens*.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa rầy ở cây lúa bao gồm việc áp dụng cho cây lúa, địa điểm trồng chúng, hoặc vật liệu nhân giống chúng hợp chất có công thức I. Theo một phương án, sáng chế đề xuất việc sử dụng hợp chất có công thức I để phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa rầy, đặc biệt là ở cây lúa. Rầy có thể kháng các chất diệt côn trùng khác. Các ví dụ về rầy bao gồm *Nephotettix* spp., *Nephotettix virescens*, *Nephotettix nigropictus*, *Nephotettix malayanus*, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*.

Các hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại dưới các dạng đồng phân hình học hoặc quang học hoặc các dạng hỗn biến khác nhau. Sáng chế bao gồm tất cả các chất đồng phân và chất hỗn biến này và hỗn hợp của chúng ở tất cả các tỷ lệ cũng như các dạng đồng vị như các hợp chất đơ-tơ-ri hóa. Sáng chế cũng bao gồm các muối và N-oxit của hợp chất được mô tả trong sáng chế.

Định nghĩa phần tử thể được ưu tiên được mô tả dưới đây và có thể được kết hợp trong dạng kết hợp bất kỳ, bao gồm với định nghĩa gốc.

Tốt hơn là X^1 là 3,5-diclophenyl-, 3-clo-4-flophenyl-, 3-flo-4-clophenyl-, 3,4-diclophenyl-, 3-clo-4-bromophenyl-, 3,5-diclo-4-flophenyl-, 3,4,5-triclophenyl-, 3,4,5-triflophenyl-, 3-clo-5-bromophenyl-, 3-clo-5-flophenyl-, 3-clo-5-(triflometyl)phenyl-, 3,4-diclo-5-(triflometyl)phenyl-, 3,5-bis(triflometyl)phenyl-, 4-clo-3,5-bis(triflometyl)phenyl-, 3-(triflometyl)phenyl-, ưu tiên hơn là 3-clo-5-bromophenyl-, 3-clo-5-(triflometyl)phenyl-, 3,5-diclo-4-flophenyl-, 3,4,5-triclophenyl-, 3,5-bis(triflometyl)phenyl-, 3-(triflometyl)phenyl-, 3,5-diclo-4-bromophenyl-, 3-bromo-5-(triflometyl)phenyl-, 3,5-dibromophenyl-, hoặc 3,4-diclophenyl-, còn ưu tiên hơn nữa là 3,5-diclo-phenyl, 3,5-diclo-4-flophenyl-, 3,4,5-triclophenyl-, 3,5-bis(triflometyl)phenyl, tốt hơn cả là R^4 là 3,5-diclo-phenyl.

R^1 tốt hơn là metyl, etyl, propyl, butyl, xyclopropyl, xyclobutyl, trifloetyl, difloetyl. Etyl và trifloetyl được đặc biệt ưu tiên.

R^2 là triflometyl.

Mỗi R^3 tốt hơn là độc lập là clo hoặc flo, ưu tiên nhất là clo.

R^4 tốt hơn là clo hoặc metyl, ưu tiên nhất là metyl.

R^5 tốt hơn là hydro.

L là liên kết trực tiếp.

$-B^1-B^2-B^3-$ là $-C=N-O-$.

R^5 là hydro.

Theo một phương án, R^4 là halogen hoặc metyl và R^5 là hydro.

Theo phương án được ưu tiên, R^3 là clo hoặc flo và R^4 là halogen hoặc metyl.

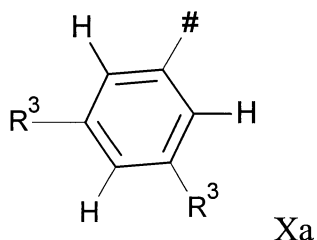
Theo phương án rất được ưu tiên, R^3 là clo hoặc flo, R^4 là halogen hoặc metyl và R^5 là hydro, và

phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy, tốt hơn là rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) hoặc sâu đục thân (cụ thể là *Chilo sp.*) ở lúa, ưu tiên là trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy, tốt hơn là rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) ở lúa.

Theo một phương án, R^4 là metyl, R^5 là hydro, mỗi R^3 là clo, p là 2.

Theo một phương án R^1 là C_1 - C_4 alkyl, ví dụ metyl, etyl hoặc propyl, ví dụ metyl hoặc etyl, ví dụ etyl.

Theo một phương án X^1 là nhóm Xa



Theo một phương án R^1 là C_1 - C_8 alkyl, ví dụ metyl, etyl hoặc propyl, ví dụ metyl hoặc etyl, ví dụ etyl và X^1 là nhóm Xa.

Theo một phương án R^1 là metyl.

Theo một phương án R^1 là etyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2,2-trifloetyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2-difloetyl.

Theo một phương án X^1 là 3,5-diclophenyl.

Theo một phương án X^1 là 3,5-diclo-4-flophenyl.

Theo một phương án X^1 là 3,4,5-triclophenyl.

Theo một phương án R^1 là metyl và X^1 là 3,5-diclophenyl.

Theo một phương án R^1 là metyl và X^1 là 3,5-diclo-4-flophenyl.

Theo một phương án R^1 là metyl và X^1 là 3,4,5-triclophenyl.

Theo một phương án R^1 là etyl và X^1 là 3,5-diclophenyl.

Theo một phương án R^1 là etyl và X^1 là 3,5-diclo-4-flophenyl.

Theo một phương án R^1 là etyl và X^1 là 3,4,5-triclophenyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2,2-trifloetyl và X^1 là 3,5-diclophenyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2,2-trifloetyl và X^1 là 3,5-diclo-4-flophenyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2,2-trifloetyl và X^1 là 3,4,5-triclophenyl.

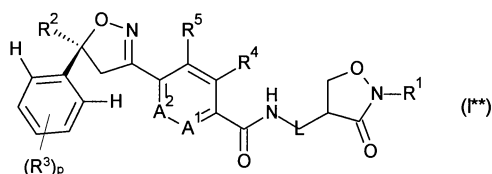
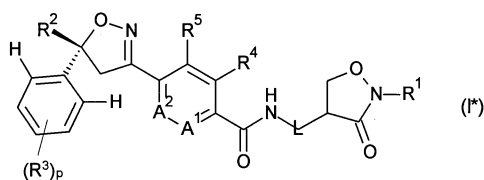
Theo một phương án R^1 là 2,2-difloetyl và X^1 là 3,5-diclophenyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2-difloetyl và X^1 là 3,5-diclo-4-flophenyl.

Theo một phương án R^1 là 2,2-difloetyl và X^1 là 3,4,5-triclophenyl.

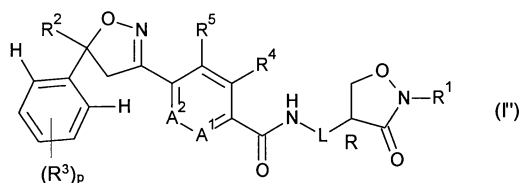
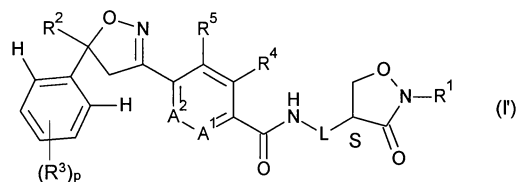
Theo tất cả các phương án của sáng chế, phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy, tốt hơn là rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) hoặc sâu đục thân (cụ thể là *Chilo sp.*) ở lúa. Phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy, rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) ở lúa được ưu tiên nhất.

Hợp chất có công thức I có thể tồn tại như là hợp chất có công thức I* hoặc hợp chất có công thức I**.



Hợp chất có công thức I** có hoạt tính sinh học cao hơn hợp chất có công thức I*. Hợp chất có công thức I có thể là hỗn hợp của hợp chất I* và I** với tỷ lệ bất kỳ, ví dụ với tỷ lệ mol là từ 1:99 đến 99:1, ví dụ từ 10:1 đến 1:10, ví dụ tỷ lệ mol cơ bản bằng 50:50. Tốt hơn là hợp chất có công thức I là hỗn hợp raxemic của hợp chất có công thức I** và I* hoặc là hỗn hợp được làm giàu chất đồng phân đối ảnh của hợp chất có công thức I**. Ví dụ, khi hợp chất có công thức I là hỗn hợp được làm giàu chất đồng phân đối ảnh có công thức I**, tỷ lệ mol của hợp chất I** so với lượng tổng của cả hai chất đồng phân đối ảnh ví dụ lớn hơn 50%, ví dụ ít nhất 55, 60, 65, 70, 75, 80, 85, 90, 95, 96, 97, 98, hoặc ít nhất 99%. Theo một phương án, hợp chất có công thức I là hợp chất có công thức I** ở dạng cơ bản tinh khiết, ví dụ với điều kiện là cơ bản không có mặt các chất đồng phân đối ảnh thay thế.

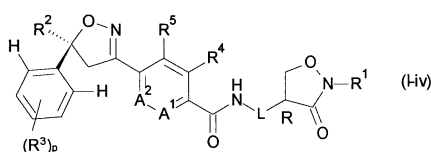
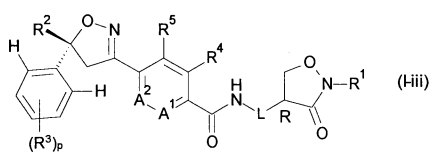
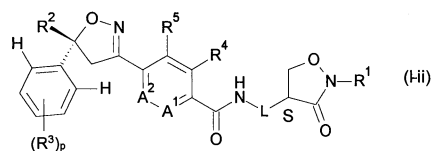
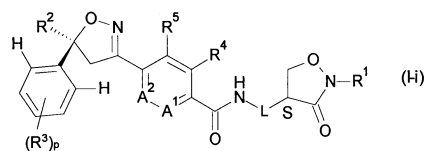
Hợp chất có công thức I có thể tồn tại dưới dạng hợp chất có công thức I' hoặc hợp chất có công thức I''.



(S = hóa học lập thể S, R = hóa học lập thể R)

Hợp chất có công thức I'' thường có hoạt tính sinh học hơn các hợp chất có công thức I'. Hợp chất có công thức I có thể là hỗn hợp của các hợp chất I' và I'' theo tỷ lệ bất kỳ ví dụ với tỷ lệ mol bằng 1:99 đến 99:1, ví dụ 10:1 đến 1:10, ví dụ tỷ lệ mol cơ bản bằng 50:50. Tốt hơn là hợp chất có công thức I là hỗn hợp raxemic của các hợp chất có công thức I'' và I' hoặc là hỗn hợp được làm giàu chất đồng phân đối ảnh cho hợp chất có công thức I''. Ví dụ, khi hợp chất có công thức I là hỗn hợp được làm giàu chất đồng phân đối ảnh có công thức I'', tỷ lệ mol của hợp chất I'' so với lượng tổng của cả hai chất đồng phân đối ảnh ví dụ lớn hơn 50%, ví dụ ít nhất 55, 60, 65, 70, 75, 80, 85, 90, 95, 96, 97, 98, hoặc ít nhất 99%. Theo một phương án được ưu tiên, hợp chất có công thức I là hợp chất có công thức I'' ở dạng cơ bản tinh khiết, ví dụ với điều kiện là cơ bản không có mặt chất đồng phân đối ảnh thay thế.

Các tâm lập thể nêu trên có đến bốn chất đồng phân lập thể:



Theo một phương án, hợp chất có công thức I là hỗn hợp bao gồm các hợp chất I-i, I-ii, I-iii và I-iv, trong đó hỗn hợp được làm giàu hợp chất có công thức I-iv, ví dụ tỷ lệ mol của hợp chất I-iv so với tổng lượng của bốn chất đồng phân ví dụ là lớn hơn 25%, ví dụ ít nhất là 30, 35, 40, 50 55, 60, 65, 70, 75, 80, 85, 90, 95, 96, 97, 98, hoặc ít nhất là 99%.

Theo phương án khác, hợp chất có công thức I là hỗn hợp bao gồm các hợp chất I-i, I-ii, I-iii và I-iv, trong đó lượng mol của hợp chất có công thức I-iv lớn hơn lượng mol của hợp chất có công thức I-i, và lượng mol của hợp chất I-ii, và lượng mol của hợp chất có công thức I-iii, nói cách khác, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất trong hỗn hợp. Ví dụ lượng mol của hợp chất có công thức I-iv ít nhất là 1, 2, 5, 10, 15, 20, 25, 30, 35, 40, 45, 50, 55, 60, 56, 70, 75, 80, 85, 90, hoặc thậm chí ít nhất là 95% lớn hơn lượng kết hợp của hợp chất có công thức I-iv và I-i, lượng kết hợp của hợp chất có công thức I-iv và I-ii, và lượng kết hợp của hợp chất có công thức I-iv và I-iii.

Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là C_1 - C_4 alkyl, ví dụ methyl, ethyl hoặc propyl, ví dụ methyl hoặc ethyl, ví dụ ethyl.

Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là C_1 - C_4 alkyl, ví dụ methyl, ethyl hoặc propyl, ví dụ methyl hoặc ethyl, ví dụ ethyl và X^1 là nhóm Xa.

Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là methyl.

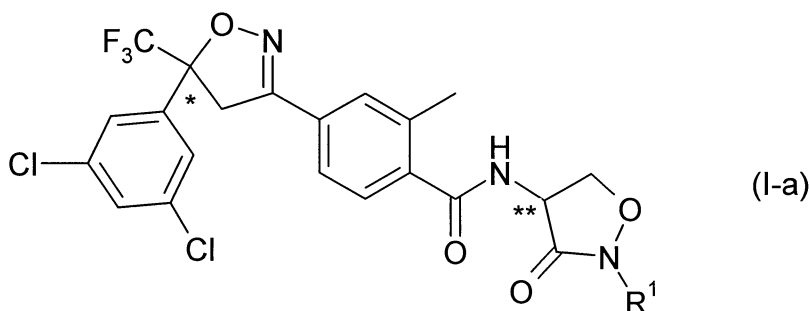
Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là ethyl.

Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là 2,2,2-trifluoethyl.

Theo một phương án, hợp chất có công thức I-iv là chất đồng phân nhiều nhất và R^1 là 2,2-difluoethyl.

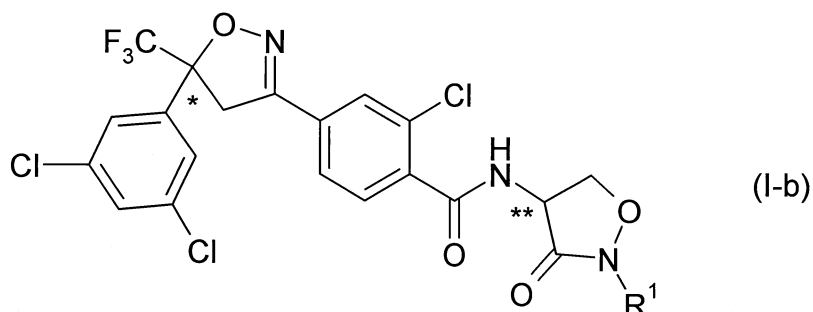
Hợp chất có công thức I được ưu tiên được thể hiện trong bảng dưới đây.

Bảng A: Hợp chất có công thức (I-a)



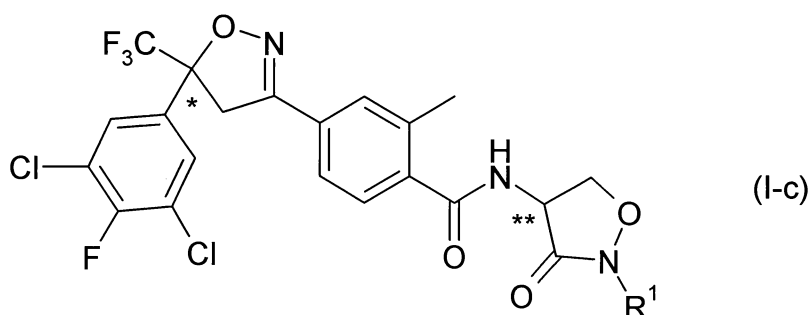
Bảng A đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-a) trong đó R^1 có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng B: Hợp chất có công thức (I-b)



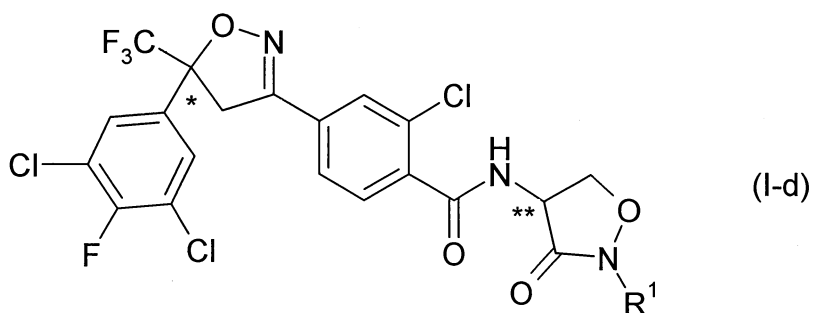
Bảng B đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-b) trong đó R^1 có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng C: Hợp chất có công thức (I-c)



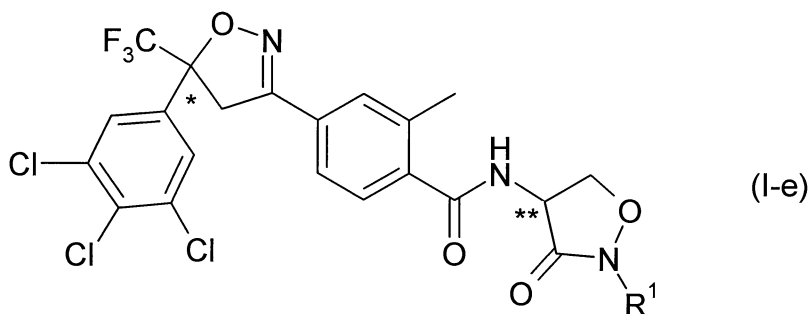
Bảng C đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-c) trong đó R^1 có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng D: Hợp chất có công thức (I-d)



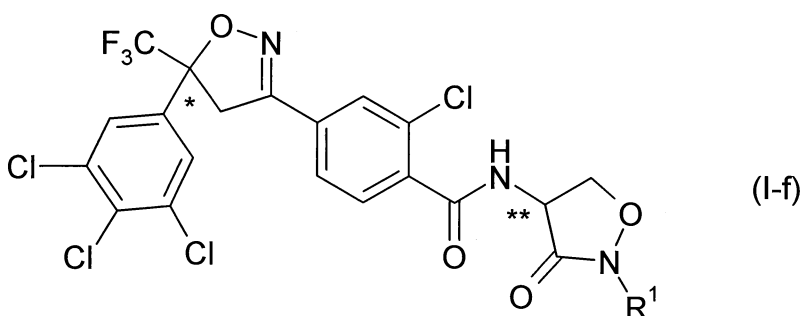
Bảng D đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-d) trong đó R^1 có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng E: Hợp chất có công thức (I-e)



Bảng E đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-e) trong đó R¹ có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng F: Hợp chất có công thức (I-f)



Bảng F đề xuất 78 hợp chất và hỗn hợp có công thức (I-f) trong đó R¹ có giá trị được liệt kê trong bảng X dưới đây. Biểu tượng * và ** chỉ vị trí của tâm không đối xứng.

Bảng X thể hiện bảng A khi X là A, bảng B khi X là B, bảng C khi X là C, bảng D khi X là D, bảng E khi X là E, bảng F khi X là F.

Số thứ tự hợp chất	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **	R ¹
X.1	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	ethyl-
X.2	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	butyl-
X.3	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	but-2-yl-
X.4	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	3-brom-propyl-
X.5	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	2,2,2-triflo-ethyl-
X.6	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	3,3,3-triflo-propyl-
X.7	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	xyclobutyl-

Số thứ tự hợp chất	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **	R ¹
X.8	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	metyl
X.9	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	propyl
X.10	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	2,2-diflo-etyl-
X.11	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	2-flo-etyl-
X.12	S	Hỗn hợp raxemic	etyl-
X.13	S	Hỗn hợp raxemic	butyl-
X.14	S	Hỗn hợp raxemic	but-2-yl-
X.15	S	Hỗn hợp raxemic	3-brom-propyl-
X.16	S	Hỗn hợp raxemic	2,2,2-triflo-etyl-
X.17	S	Hỗn hợp raxemic	3,3,3-triflo-propyl-
X.18	S	Hỗn hợp raxemic	xyclobutyl-
X.19	S	Hỗn hợp raxemic	metyl
X.20	S	Hỗn hợp raxemic	propyl
X.21	S	Hỗn hợp raxemic	2,2-diflo-etyl-
X.22	S	Hỗn hợp raxemic	2-flo-etyl-
X.23	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	isopropyl
X.24	Hỗn hợp raxemic	Hỗn hợp raxemic	xyclopropyl
X.25	S	Hỗn hợp raxemic	isopropyl
X.26	S	Hỗn hợp raxemic	xyclopropyl
X.27	Hỗn hợp raxemic	S	etyl-
X.28	Hỗn hợp raxemic	S	butyl-
X.29	Hỗn hợp raxemic	S	but-2-yl-

Số thứ tự hợp chất	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **	R ¹
X.30	Hỗn hợp raxemic	S	3-brom-propyl-
X.31	Hỗn hợp raxemic	S	2,2,2-triflo-etyl-
X.32	Hỗn hợp raxemic	S	3,3,3-triflo-propyl-
X.33	Hỗn hợp raxemic	S	xyclobutyl-
X.34	Hỗn hợp raxemic	S	metyl
X.35	Hỗn hợp raxemic	S	propyl
X.36	Hỗn hợp raxemic	S	2,2-diflo-etyl-
X.37	Hỗn hợp raxemic	S	2-flo-etyl-
X.38	S	S	etyl-
X.39	S	S	butyl-
X.40	S	S	but-2-yl-
X.41	S	S	3-brom-propyl-
X.42	S	S	2,2,2-triflo-etyl-
X.43	S	S	3,3,3-triflo-propyl-
X.44	S	S	xyclobutyl-
X.45	S	S	metyl
X.46	S	S	propyl
X.47	S	S	2,2-diflo-etyl-
X.48	S	S	2-flo-etyl-
X.49	Hỗn hợp raxemic	S	isopropyl
X.50	Hỗn hợp raxemic	S	xyclopropyl
X.51	S	S	isopropyl
X.52	S	S	xyclopropyl
X.53	Hỗn hợp raxemic	R	etyl-
X.54	Hỗn hợp raxemic	R	butyl-
X.55	Hỗn hợp raxemic	R	but-2-yl-
X.56	Hỗn hợp raxemic	R	3-brom-propyl-
X.57	Hỗn hợp raxemic	R	2,2,2-triflo-etyl-

Số thứ tự hợp chất	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **	R ^I
X.58	Hỗn hợp raxemic	R	3,3,3-triflo-propyl-
X.59	Hỗn hợp raxemic	R	xyclobutyl-
X.60	Hỗn hợp raxemic	R	metyl
X.61	Hỗn hợp raxemic	R	propyl
X.62	Hỗn hợp raxemic	R	2,2-diflo-etyl-
X.63	Hỗn hợp raxemic	R	2-flo-etyl-
X.64	S	R	etyl-
X.65	S	R	butyl-
X.66	S	R	but-2-yl-
X.67	S	R	3-brom-propyl-
X.68	S	R	2,2,2-triflo-etyl-
X.69	S	R	3,3,3-triflo-propyl-
X.70	S	R	xyclobutyl-
X.71	S	R	metyl
X.72	S	R	propyl
X.73	S	R	2,2-diflo-etyl-
X.74	S	R	2-flo-etyl-
X.75	Hỗn hợp raxemic	R	isopropyl
X.76	Hỗn hợp raxemic	R	xyclopropyl
X.77	S	R	isopropyl
X.78	S	R	xyclopropyl

Hợp chất được mô tả theo sáng chế có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp như được thể hiện trong sơ đồ từ 1 đến 3.

Sơ đồ 1

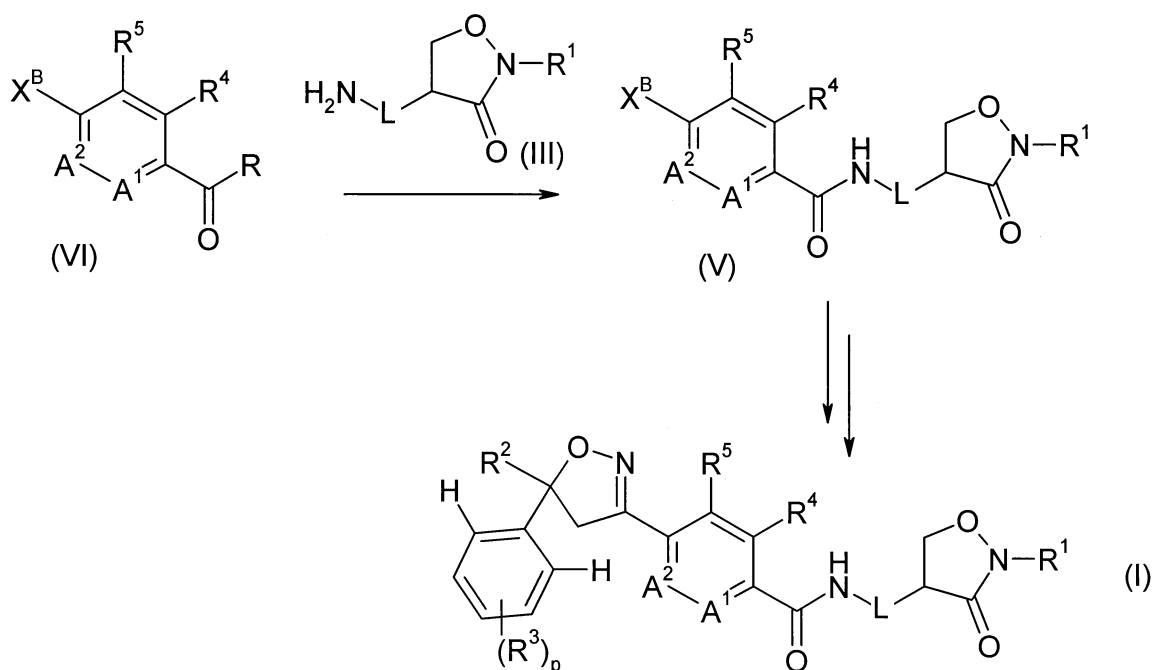
2) Axit halogenua có công thức (II), trong đó R là Cl, F hoặc Br, có thể được điều chế từ axit carboxylic có công thức (II), trong đó R là OH, dưới các điều kiện tiêu chuẩn, như được mô tả ví dụ trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO2009/080250.

3) Axit carboxylic có công thức (II), trong đó R là OH, có thể được điều chế từ este có công thức (II), trong đó R là C₁-C₆alkoxy như được mô tả ví dụ trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2009/080250.

4) Hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng cách cho hợp chất có công thức (IV) trong đó X^B là nhóm rời chuyển, ví dụ halogen, như bromo, phản ứng với carbon monoxit và amin có công thức (III), với sự có mặt của chất xúc tác, như paladi(II) axetat hoặc bis(triphenylphosphin)paladi(II) diclorua, tùy ý với sự có mặt của phối tử, như triphenylphosphin, và bazơ, như natri cacbonat, pyridin, trietylamin, 4-(dimethylamino)-pyridin (“DMAP”) hoặc diisopropyletylamin (Bazơ Hunig), trong dung môi, như nước, *N,N*-dimetylformamit hoặc tetrahydrofuran. Phản ứng được thực hiện ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 50°C đến 200°C, tốt hơn là từ 100°C đến 150°C. Phản ứng được thực hiện ở áp suất từ 50 đến 200 bar, tốt hơn là từ 100 đến 150 bar.

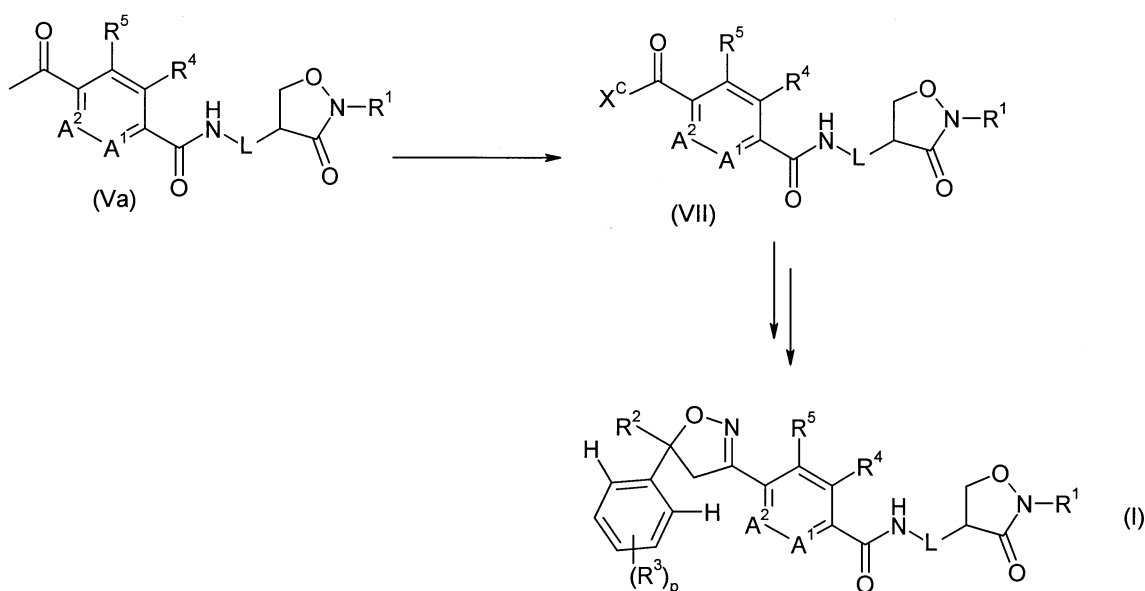
5) Hợp chất có công thức (IV) trong đó X^B là nhóm rời chuyển, ví dụ halogen, như bromo, có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp, ví dụ như được mô tả trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2009/080250.

Sơ đồ 2

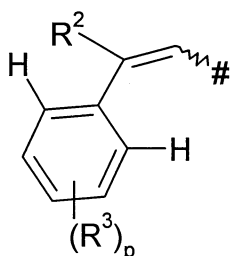
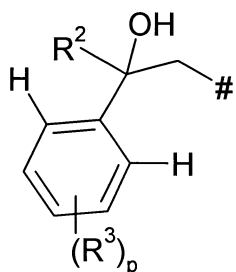


6) Thay vào đó, hợp chất có công thức (I), có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp từ hợp chất trung gian có công thức (V) như được thể hiện trong sơ đồ 2 trong đó X^B là nhóm rời chuyển, ví dụ halogen, như bromo, hoặc X^B là xyano, formyl hoặc axetyl theo phương pháp tương tự với phương pháp được mô tả trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO09/080250. Chất trung gian có công thức (V) có thể được điều chế ví dụ như từ chất trung gian có công thức (VI) như được mô tả trong cùng tài liệu tham khảo.

Sơ đồ 3



7) Thay vào đó, hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế bằng nhiều phương pháp từ hợp chất trung gian có công thức (VII) như được thể hiện trong sơ đồ 3 trong đó X^C là X^C-1 hoặc X^C-2



theo phương pháp tương tự với phương pháp được mô tả trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2009/080250.

8) Hợp chất có công thức (VII) trong đó X^C là X^C-1 hoặc X^C-2 có thể được điều chế từ hợp chất có công thức (Va) từ hợp chất có công thức (VII) trong đó

X^C là CH_2 -halogen sử dụng phương pháp tương tự với phương pháp được mô tả trong tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2009/080250.

9) Hợp chất có công thức (VII) trong đó X^C là CH_2 -halogen, như brom hoặc clo, có thể được điều chế bằng cách cho metyl keton có công thức (Va) phản ứng với chất halogen hóa, như brom hoặc clo, trong dung môi, như axit axetic, ở nhiệt độ từ $0^\circ C$ đến $50^\circ C$, ưu tiên là từ nhiệt độ môi trường đến $40^\circ C$.

Phương pháp khác để điều chế hợp chất có công thức I được mô tả trong tài liệu đơn sáng chế số PCT/EP2010/068605, mà được kết hợp ở đây như tài liệu tham khảo.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất hợp chất được chọn từ bảng A đến F dùng để chống loài gây hại lúa.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất hợp chất được chọn từ bảng A đến F dùng để chống sâu đục thân ở cây lúa.

Ví dụ về sâu đục thân bao gồm *Chilo* sp, *Chilo suppressalis*, *Chilo polychrysus*, *Chilo auricilius*, *Scirpophaga* spp., *Scirpophaga incertulas*, *Scirpophaga innotata*, *Scirpophaga nivella*, *Sesamia* sp, *Sesamia inferens*.

Theo một phương án, sáng chế đề xuất hợp chất được chọn từ bảng A đến F dùng để chống rầy ở cây lúa.

Ví dụ về rầy bao gồm *Nephotettix* spp., *Nephotettix virescens*, *Nephotettix nigropictus*, *Nephotettix malayanus*, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*.

Việc sử dụng hợp chất được mô tả trong sáng chế chống rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) và/hoặc sâu đục thân (cụ thể là *Chilo* sp.) được ưu tiên đặc biệt. Việc sử dụng hợp chất theo sáng chế chống rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) được ưu tiên nhất.

Thuật ngữ “địa điểm trồng” của cây trồng có ích như được sử dụng ở đây để bao hàm nơi ở đó cây trồng có ích phát triển, nơi vật liệu nhân giống thực vật của cây trồng có ích được gieo hoặc nơi vật liệu nhân giống thực vật của cây trồng có ích được trồng vào trong đất. Ví dụ về địa điểm trồng này là cánh đồng, trên đó cây trồng phát triển.

Thuật ngữ “vật liệu nhân giống thực vật” được hiểu là bao hàm phần sinh sản của cây, như hạt, có thể được sử dụng để nhân giống cây trồng, và vật liệu sinh dưỡng, như cành giâm hoặc thân củ, ví dụ khoai tây. Ví dụ có thể đề cập là hạt (theo nghĩa hẹp), rễ, quả, thân củ, củ, thân rễ và các phần của cây. Cây nảy mầm và cây non được

cây sau khi nảy mầm hoặc nhô lên mặt đất, cũng có thể được đề cập. Cây non này có thể được bảo vệ trước khi cây bằng xử lý toàn bộ hoặc một phần bằng cách ngâm. Tốt hơn là “vật liệu nhân giống thực vật” được hiểu là bao hàm hạt.

Áp dụng có thể trước sự tàn phá hoặc khi loài gây hại có mặt. Áp dụng hợp chất theo sáng chế có thể được thực hiện theo cách bất kỳ trong số các cách áp dụng thông thường, ví dụ lá, tưới ẩm, đất, theo luống v.v. Tuy nhiên, việc phòng trừ *Anthonomus grandis* thường thu được bằng cách áp dụng trên lá, là cách áp dụng được ưu tiên theo sáng chế.

Hợp chất theo sáng chế có thể được áp dụng cho các bộ phận của cây. Các bộ phận của cây được hiểu có nghĩa là các bộ phận và cơ quan của cây nằm trên và dưới mặt đất, như cành, lá, hoa và rễ, các ví dụ có thể kể đến là lá, lá kim, thân, cành, hoa, thể quả, quả, hạt, rễ, thân củ và thân rễ. Các bộ phận của cây cũng bao gồm vật liệu thu hoạch, cũng như vật liệu nhân giống sinh dưỡng và sinh sản, ví dụ như cành giâm, củ, thân rễ, chồi bên và hạt. Việc xử lý theo sáng chế cây và các bộ phận của cây bằng các hoạt chất có thể thực hiện trực tiếp hoặc bằng cách cho hợp chất hoạt động xung quanh chúng, nơi ở hoặc không gian lưu trữ của chúng bằng các phương pháp xử lý thông thường, ví dụ bằng cách ngâm, phun, bay hơi, phun sương, rắc, sơn, tiêm và, trong trường hợp vật liệu nhân giống, với hạt, còn bằng cách áp dụng một hoặc nhiều lớp bao.

Hợp chất được mô tả trong sáng chế để dùng trên cây lúa, bao gồm các cây được biến đổi gen để kháng thành phần hoạt tính như chất diệt cỏ, hoặc tạo ra hợp chất hoạt tính sinh học phòng trừ sự tàn phá của loài gây hại thực vật.

Thuật ngữ "cây trồng" như được sử dụng trong sáng chế có nghĩa là cây lúa, cây lúa giống. Cây lúa được hiểu là cũng bao gồm cây trồng đã được tạo khả năng chịu thuốc diệt cỏ hoặc nhóm thuốc diệt cỏ (như các chất ức chế ALS-, GS-, EPSPS-, PPO- và HPPD) nhờ các phương pháp gây giống thông thường hoặc công nghệ gen.

Hợp chất có công thức I có thể được sử dụng trên các cây chuyển gen (bao gồm cây trồng) thu được bằng các phương pháp công nghệ gen và/hoặc bằng các phương pháp thông thường. Điều này được hiểu có nghĩa là cây có các đặc tính mới (“đặc điểm”) thu được bằng gây giống thông thường, bằng quá trình đột biến hoặc bằng kỹ thuật tái tổ hợp ADN. Tùy thuộc vào loài cây hoặc cây trồng, nơi mọc và các điều

kiện sinh trưởng của chúng (đất, khí hậu, thời gian sinh dưỡng, chế độ dinh dưỡng), việc xử lý theo sáng chế có thể cũng dẫn đến tác động “hiệp trợ” siêu cộng.

Do đó, ví dụ, tỷ lệ áp dụng giảm và/hoặc mở rộng phổ hoạt tính và/hoặc tăng hoạt tính của hợp chất và chế phẩm có thể được sử dụng theo sáng chế, sinh trưởng của cây trồng tốt hơn, tăng khả năng chống chịu với nhiệt độ thấp hoặc cao, tăng khả năng chịu hạn hoặc với úng hoặc nồng độ muối trong đất, tăng năng suất ra hoa, dễ thu hoạch, thúc đẩy sự trưởng thành, sản lượng thu hoạch cao hơn, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, độ ổn định khi bảo quản tốt hơn và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm sau thu hoạch tốt hơn, các tác dụng này vượt quá các tác dụng mà thực tế được mong đợi.

Cây chuyển gen hoặc các giống cây được ưu tiên được xử lý theo sáng chế bao gồm tất cả các cây, do các biến đổi di truyền, nhận được vật liệu di truyền mà đạt được các đặc điểm hữu ích, thuận lợi đặc biệt cho các cây này. Ví dụ về đặc điểm như vậy là tăng trưởng của cây tốt hơn, tăng khả năng chịu nhiệt độ cao hoặc thấp, tăng khả năng chịu hạn hoặc úng hoặc nồng độ muối trong đất, tăng năng suất ra hoa, dễ thu hoạch, thúc đẩy sự trưởng thành, sản lượng thu hoạch cao hơn, chất lượng và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch cao hơn, độ ổn định khi bảo quản tốt hơn và/hoặc khả năng chế biến sản phẩm thu hoạch tốt hơn.

Ví dụ khác và được đặc biệt nhấn mạnh về các đặc điểm này là sự kháng của cây trồng đối với động vật và vi sinh vật gây hại tốt hơn, như chống lại côn trùng, nấm, nấm, vi khuẩn và/hoặc virus gây bệnh cho thực vật, và tăng sức chống chịu của cây trồng đối với một số hợp chất có hoạt tính diệt cỏ.

Cây trồng chuyển gen là lúa.

Hợp chất có công thức I có thể được dùng trên cây chuyển gen mà chúng có khả năng tạo ra một hoặc nhiều protein diệt loài gây hại, các protein này trao cho cây chuyển gen khả năng chịu hoặc chống các loài gây hại, ví dụ như loài gây hại là côn trùng, giun tròn và tương tự. Protein diệt côn trùng này bao gồm, mà không giới hạn ở, protein Cry của *Bacillus thuringiensis* Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry2Ae, Cry3A, Cry3Bb, hoặc Cry9C; protein được thiết kế như Cry3A (Tài liệu bằng sáng chế Hoa Kỳ số US 7,030,295) hoặc Cry1A.105 được cải biến; hoặc các protein diệt côn trùng thực vật như Vip1, Vip2 hoặc Vip3. Danh sách đầy đủ các protein Cry Bt và VIP hữu dụng theo sáng chế có thể được tìm thấy trên trang web toàn cầu trong

Bacillus thuringiensis Toxin Nomenclature Database được duy trì bởi trường Đại học Sussex (tham khảo cùng, Crickmore *et al.* (1998) *Microbiol. Mol. Biol. Rev.* 62:807-813). Protein diệt côn trùng khác hữu dụng theo sáng chế bao gồm protein của vi khuẩn sống trong giun tròn, ví dụ *Photorhabdus* spp. hoặc *Xenorhabdus* spp.; độc tố này được tạo ra bởi động vật, như độc tố bọ cạp, độc tố nhện, độc tố ong bắp cày, hoặc độc tố thân kinh đặc hiệu côn trùng khác; độc tố do nấm sinh ra, như độc tố của *Streptomyces*, lectin thực vật, chẳng hạn như lectin đậu Hà lan hoặc lúa mạch; agglutinin; chất ức chế proteinaza, chẳng hạn như chất ức chế trypsin, chất ức chế serin proteaza, chất ức chế patatin, xystatin hoặc papain; protein bất hoạt ribosom (RIP), chẳng hạn như rixin, RIP ở ngô, abrin, luffin, saporin hoặc bryodin; enzym chuyển hóa steroid, như 3-hydroxysteroid oxidaza, ecdysteroid-IDP-glycosyl-transferaza, cholesterol oxidaza, các chất ức chế ecdyson hoặc HMG-CoA-reductaza; chất càngh hóa kênh ion, như chất càngh hóa kênh natri hoặc canxi; hoocmon esteraza nguyên sinh; thụ thể của hormon lợi tiểu (thụ thể helicokinin); stilben synthaza, bibenzyl syntaza, chitinaza hoặc glucanaza. Ví dụ khác về protein diệt côn trùng này hoặc cây trồng chuyển gen có khả năng tổng hợp các protein này được bộc lộ, ví dụ, trong EP-A 374753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427529, EP-A 451878, WO 03/18810 và WO 03/52073. Phương pháp để tạo ra cây trồng chuyển gen này là hiểu biết thông thường đối với người hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này.

Ví dụ khác về cây chuyển gen, và đáng quan tâm, là cây mang tính trạng kháng 2,4D (ví dụ Enlist®) (ví dụ WO 2011066384), glyphosat (ví dụ Roundup Ready® (P24), Roundup Ready 2 Yield® (P25)), sulfonylure (ví dụ STS®) (P26), glufosinat (ví dụ Liberty Link® (P27), Ignite® (P28)), Dicamba (P29) (Monsanto), chống chịu HPPD (P30) (ví dụ chất diệt cỏ isoxaflutol) (Bayer CropScience, Syngenta). Gộp hai hoặc ba của bất kỳ các tính trạng nào được mô tả theo sáng chế cũng được quan tâm, bao gồm chống chịu glyphosat và sulfonyl-ure (ví dụ như Optimum GAT®) (P31), cây gộp STS® và Roundup Ready® (P32) hoặc cây gộp STS® và Roundup Ready 2 Yield® (P33)), chống chịu dicamba và glyphosat (P34) (Monsanto).

Hợp chất được mô tả theo sáng chế có thể được sử dụng trong hỗn hợp với phân bón (ví dụ phân bón bao gồm nitơ, kali hoặc photpho). Dạng bào chế thích hợp bao gồm hạt phân bón. Hỗn hợp tốt hơn là bao gồm đến 25% hợp chất được mô tả theo sáng chế theo khối lượng.

Chế phẩm được mô tả theo sáng chế có thể bao gồm hợp chất khác có hoạt tính sinh học, ví dụ như chất dinh dưỡng vi lượng hoặc hợp chất có hoạt tính diệt nấm hoặc có hoạt tính điều hòa sinh trưởng cây trồng, diệt cỏ, diệt côn trùng, diệt giun tròn hoặc diệt rệp.

Hợp chất có công thức (I) có thể là hoạt chất duy nhất của chế phẩm hoặc có thể được trộn lẫn với một hoặc nhiều hoạt chất bổ sung như thuốc diệt loài gây hại, ví dụ như diệt côn trùng, diệt nấm hoặc diệt cỏ, hoặc chất hỗ trợ hoặc chất điều hòa sinh trưởng cây trồng thích hợp. Hoạt chất bổ sung có thể tạo ra chế phẩm có phổ hoạt tính rộng hoặc độ bền cao ở địa điểm ứng dụng; hỗ trợ hoạt tính hoặc bổ sung hoạt tính (ví dụ như bằng cách tăng tốc độ tác dụng hoặc khắc phục hiện tượng không thấm) của hợp chất có công thức (I); hoặc giúp khắc phục hoặc phòng ngừa phát triển tính kháng đối với hợp phần cụ thể. Hoạt chất thêm vào cụ thể phụ thuộc vào lợi ích mong muốn của chế phẩm. Ví dụ về thuốc trừ sâu thích hợp bao gồm như sau:

a) Pyrethroid, như permethrin, xpermethrin, fenvalerat, esfenvalerat, deltamethrin, xyhalothrin (cụ thể là lambda-xyhalothrin và gamma xyhalothrin), bifenthrin, fenpropathrin, xyfluthrin, tefluthrin, pyrethroid an toàn cho cá (ví dụ ethofenprox), pyrethrin tự nhiên, tetramethrin, S-bioallethrin, fenfluthrin, prallethrin, acrinathrin, etofenprox hoặc 5-benzyl-3-furylmetyl-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemetyl)xyclopropan carboxylat;

b) Photphat hữu cơ, như, profenofos, sulprofos, axephat, metyl parathion, azinphos metyl, demeton-s-metyl, heptenophos, thiometon, fenamiphos, monocrotophos, profenofos, triazophos, metamitophos, dimetoat, phosphamiton, malathion, clopyrifos, phosalon, terbufos, fensulfothion, fonofos, phorat, phoxim, pirimiphos-metyl, pirimiphos-etyl, fenitrothion, fosthiazat hoặc diazinon;

c) Cacbamat (bao gồm các aryl cacbamat), như pirimicarb, triazamat, cloethocarb, cacbofuran, furathiocarb, ethiofencarb, aldicarb, thiofurox, cacbosulfan, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomyl hoặc oxamyl;

d) Ure benzoyl, như diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron, diafenthiuron, lufeneron, novaluron, noviflumuron hoặc clofluazuron;

e) Hợp chất thiếc hữu cơ, như xyhexatin, fenbutatin oxit hoặc azoxyclotin;

f) Pyrazol, như tebufenpyrad, tolfenpyrad, ethiprol, pyriprol, fipronil, và fenpyroximat;

- g) Macrolit, như avermectin hoặc milbemycin, ví dụ abamectin, emamectin benzoat, ivermectin, milbemycin, spinosad, azadirachtin, milbemectin, lepimectin hoặc spinetoram;
- h) Hoocmon hoặc pheromon;
- i) Hợp chất clo hữu cơ, như endosulfan (cụ thể là alpha-endosulfan), benzen hexaclorua, DDT, clodan hoặc dieldrin;
- j) Amidin, như clodimeform hoặc amitraz;
- k) Chất hun, như clopicrin, diclopropan, metyl bromua hoặc metam;
- l) Hợp chất Neonicotinoid, như imidacloprid, thiacloprid, axetamiprid, nitenpyram, dinotefuran, thiamethoxam, clothianidin, hoặc nithiazin;
- m) Diaxylyhydrazin, như tebufenozit, cromafenozit hoặc metoxyfenozit;
- n) Diphenyl ete, như diofenolan hoặc pyriproxifen;
- o) Ure như Indoxacarb hoặc metaflumizon;
- p) Ketoenol, như Spirotetramat, spiroadiclofen hoặc spiromesifen;
- q) Diamit, như flubendiamit, cloantraniliprol (Rynaxypyr®) hoặc xyantraniliprol;
- r) Tinh dầu như Bugoil® - (PlantImpact); hoặc
- s) hợp chất được chọn từ buprofezin, flonicamid, axequinoxyl, bifenazat, xyenopyrafen, xyflumetofen, etoxazol, flometoquin, fluacrypyrim, fluensulfon, flufenerim, flupyradifuron, harpin, iodometan, dodecadienol, pyridaben, pyridalyl, pyrimidifen, flupyradifuron, 4-[(6-Clo-pyridin-3-ylmetyl)-(2,2-diflo-etyl)-amino]-5H-furan-2-on (DE 102006015467), CAS: 915972-17-7 (tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2006129714; WO2011/147953; WO2011/147952), CAS: 26914-55-8 (tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2007020986), clofenapyr, pymetrozin, sulfoxaflor và pyrifluquinazon.

Ngoài các nhóm hóa chất chính của thuốc trừ sâu đã được liệt kê ở trên, các thuốc trừ sâu khác có đích cụ thể có thể được đưa vào chế phẩm, nếu thích hợp với lợi ích mong muốn của chế phẩm. Ví dụ, thuốc diệt côn trùng chọn lọc cho vụ cây trồng cụ thể, ví dụ như thuốc diệt côn trùng đặc hiệu cho sâu đục thân (như cartap) hoặc thuốc diệt côn trùng đặc hiệu cho rầy (như buprofezin) để dùng trên lúa có thể được dùng. Thay vào đó, chất diệt côn trùng hoặc bọ ve đặc hiệu cho loài/giai đoạn côn trùng cụ thể cũng có thể được bao gồm trong chế phẩm (ví dụ như thuốc diệt ấu trùng bọ ve, như clofentezin, flubenzimin, hexythiazox hoặc tetradifon; các motilicid diệt bọ

ve, như dicofol hoặc propargit; các chất diệt bọ ve, như bromopropylat hoặc clobenzilat; hoặc chất điều hòa sinh trưởng, như hydrametylnon, xyromazin, methopren, clofluazuron hoặc diflubenzuron).

Ví dụ về các hợp chất diệt nấm có thể được bao gồm trong chế phẩm được mô tả trong sáng chế là (E)-*N*-metyl-2-[2-(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl]-2-metoxyminoaxetamit (SSF-129), 4-bromo-2-xyano-*N,N*-dimetyl-6-triflometylbenzimidazol-1-sulfonamit, α -[*N*-(3-clo-2,6-xylyl)-2-metoxyaaxetamido]- γ -butyrolacton, 4-clo-2-xyano-*N,N*-dimetyl-5-*p*-tolylimidazol-1-sulfonamit (IKF-916, xyamidazosulfamid), 3-5-diclo-*N*-(3-clo-1-etyl-1-metyl-2-oxopropyl)-4-metylbenzamid (RH-7281, zoxamit), *N*-allyl-4,5,-dimetyl-2-trimetylsilylthiophen-3-carboxamid (MON65500), *N*-(1-xyano-1,2-dimetylpropyl)-2-(2,4-diclophenoxy)propionamid (AC382042), *N*-(2-metoxi-5-pyridyl)-xyclopropan carboxamid, axibenzolar (CGA245704) (ví dụ axibenzolar-*S*-metyl), alanycarb, aldimorph, anilazin, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl, benomyl, benthiavalicarb, biloxazol, bitertanol, bixafen, blasticidin S, boscalid, bromuconazol, bupirimat, captafol, captan, carbendazim, carbendazim clohydrat, carboxin, carpropamid, carvon, CGA41396, CGA41397, chinomethionat, clothalonil, clozolinat, clozylacon, hợp chất bao gồm đồng như đồng oxyclorea, đồng oxyquinolat, đồng sulfat, đồng talat và hỗn hợp Bordeaux, xyclufenamid, xymoxanil, xyproconazol, xyprodinil, debacarb, di-2-pyridyl disulfide 1,1'-dioxit, diclofluamid, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumentorim, *O,O*-di-*iso*-propyl-*S*-benzyl thiophosphat, dimefluazol, dimetconazol, dimethomorph, dimethirimol, diniconazol, dinocap, dithianon, dodexyl dimetyl amoni clorua, dodemorph, dodin, doguadin, edifenphos, epoxiconazol, ethirimol, etyl-(Z)-*N*-benzyl-*N*-([metyl(metylthioetylidenaminooxycarbonyl)amino]thio)- β -alaninat, etridiazol, famoxadon, fenamidon (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid (KBR2738), fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferimzon, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopyram, fluoxastrobin, floimit, fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fuberidazol, furalaxyl, furametpyr, guazatin, hexaconazol, hydroxyisoxazol, hymexazol, imazalil, imibenconazol, iminoctadin, iminoctadin triaxetat, ipconazol, iprobenfos, iprodion, iprovalicarb (SZX0722), isopropanyl butyl carbamae, isoprothiolan, isopyrazam, kasugamycin, kresoxim-metyl, LY186054, LY211795,

LY248908, mancozeb, mandipropamid, maneb, mefenoxam, metalaxyl, mepanipirim, mepronil, metalaxyl, metconazol, metiram, metiram-kẽm, metominostrobin, myclobutanil, neoasozin, nickel dimetyldithiocarbamat, nitrothal-*is*opropyl, nuarimol, ofurace, hợp chất hữu cơ-thủy ngân, oxadixyl, oxasulfuron, oxolinic axit, oxpoconazol, oxycarboxin, pefurazoat, penconazol, penxycuron, penflufen, penthiopyrad, phenazin oxit, phosetyl-Al, axit của phospho, phthalit, picoxystrobin (ZA1963), polyoxinD, polyram, probenazol, procloaz, proxymidon, propamocarb, propiconazol, propineb, propionic axit, prothioconazol, pyrazophos, pyrifenox, pyrimethanil, pyraclostrobin, pyroquilon, pyroxyfur, pyrrolnitrin, hợp chất amoni bậc bốn, quinomethionat, quinoxifen, quintozen, sedaxan, sipconazol (F-155), natri pentaclophenat, spiroxamin, streptomycin, lưu huỳnh, tebuconazol, tecloftalam, tecnazen, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamid, 2-(thioxyanometylthio)benzothiazol, thiophanat-metyl, thiram, timibenconazol, tolclofos-metyl, tolylfluanid, triadimefon, triadimenol, triazbutil, triazoxit, trixyclozol, tridemorph, trifloxystrobin (CGA279202), triforin, triflumizol, triticonazol, validamycin A, vapam, vinclozolin, zineb và ziram, N-[9-(diclometylene)-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-methanonaphthalen-5-yl]-3-(diflometyl)-1-metyl-1H-pyrazol-4-carboxamid [1072957-71-1], 1-metyl-3-diflometyl-1H-pyrazol-4-carboxylic acid (2-diclometylen-3-etyl-1-metyl-indan-4-yl)-amid, và 1-metyl-3-diflometyl-4H-pyrazol-4-carboxylic axit [2-(2,4-diclo-phenyl)-2-metoxi-1-metyl-etyl]-amid.

Ngoài ra, tác nhân sinh học có thể được bao gồm trong chế phẩm được mô tả theo sáng chế ví dụ loài thuộc chi *Bacillus* như *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis*, và loài thuộc chi *Pasteuria* như *Pasteuria penetrans* và *Pasteuria nishizawae*. Chủng *Bacillus firmus* thích hợp là chủng CNCM I-1582 có sẵn trên thị trường dưới nhãn hiệu BioNemTM. Chủng *Bacillus cereus* thích hợp là chủng CNCM I-1562. Chi tiết hơn về cả hai chủng *Bacillus* có thể tìm thấy trong tài liệu đơn sáng chế Hoa Kỳ số US 6,406,690. Các tổ chức sinh học khác có thể được bao gồm trong chế phẩm theo sáng chế là vi khuẩn như *Streptomyces* spp. như *S. avermitilis*, và nấm như *Pochonia* spp. như *P. chlamydosporia*. Cũng được quan tâm là *Metarhizium* spp. như *M. anisopliae*; *Pochonia* spp. như *P. chlamydosporia*.

Hợp chất được mô tả theo sáng chế có thể được trộn với đất, than bùn hoặc môi trường ra rễ khác để bảo vệ cây trồng chống lại mầm bệnh ở hạt, đất hoặc bệnh do nấm rễ.

Ví dụ về các chất hiệp đồng thích hợp để sử dụng trong chế phẩm bao gồm piperonyl butoxit, sesamex, safroxan và dodexyl imidazol.

Thuốc diệt cỏ và chất điều hòa sinh trưởng thực vật thích hợp để đưa vào các chế phẩm sẽ phụ thuộc vào đích mong muốn và tác dụng đòi hỏi.

Ví dụ về thuốc diệt cỏ chọn lọc cho lúa có thể được bao gồm là propanil.

Một số hỗn hợp có thể bao gồm hoạt chất có các tính chất vật lý, hóa học hoặc sinh học khác nhau đáng kể đến mức tự chúng không dễ dàng thêm được vào cùng dạng chế phẩm thông thường. Trong tình huống này, dạng chế phẩm khác có thể được điều chế. Ví dụ như, khi một hoạt chất là chất rắn không tan trong nước và hoạt chất kia là chất lỏng không tan trong nước, tuy nhiên, có thể có khả năng phân tán mỗi hoạt chất vào cùng một pha nước liên tục bằng cách phân tán hoạt chất rắn dưới dạng huyền phù (sử dụng cách điều chế tương tự với điều chế SC) nhưng phân tán hoạt chất lỏng dưới dạng nhũ tương (sử dụng cách điều chế tương tự với điều chế EW). Chế phẩm thu được là chế phẩm huyền phù nhũ (SE).

Trừ khi có chỉ dẫn khác, tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức I so với thành phần hoạt tính bổ sung thường có thể nằm trong khoảng từ 1000:1 đến 1:1000. Theo các phương án khác, tỷ lệ khối lượng của hợp chất có công thức I so với thành phần hoạt tính bổ sung này có thể nằm trong khoảng từ 500:1 đến 1:500, ví dụ từ 100:1 đến 1:100, ví dụ từ 1:50 đến 50:1, ví dụ 1:20 đến 20:1, ví dụ 1:10 đến 10:1, ví dụ 1:5 đến 5:1, ví dụ 1:1, 1:2, 1:3, 1:4, 1:5, 2:1, 3:1, 4:1, hoặc 5:1.

Hỗn hợp với pyrethroid, cụ thể là pymetrozin, là đặc biệt có lợi cho sáng chế.

Chế phẩm được mô tả theo sáng chế bao gồm chế phẩm được điều chế bằng cách trộn sơ bộ trước khi áp dụng, ví dụ dưới dạng trộn sẵn hoặc hỗn hợp trộn trong bể, hoặc bằng cách áp dụng đồng thời hoặc áp dụng tuần tự lên cây.

Để áp dụng các chế phẩm được mô tả theo sáng chế như là chất diệt côn trùng, chất diệt ve bét, chất diệt giun tròn hoặc chất diệt loài gây hại thân mềm lên loài gây hại, địa điểm của loài gây hại, hoặc cây trồng dễ bị tấn công bởi loài gây hại, chế phẩm được mô tả trong sáng chế thường được bào chế thành chế phẩm bao gồm, ngoài chế phẩm theo sáng chế, chất pha loãng hoặc chất mang trợ thích hợp và, tùy ý, chất hoạt

động bề mặt (SFA). SFA là hóa chất có khả năng làm thay đổi tính chất bề mặt phân cách (ví dụ như, bề mặt phân cách lỏng/rắn, lỏng/khí hoặc lỏng/lỏng) bằng cách làm giảm sức căng bề mặt phân cách và nhờ đó dẫn đến thay đổi các tính chất khác (ví dụ như phân tán, nhũ hóa và thấm ướt). Ưu tiên là tất cả chế phẩm (cả chế phẩm rắn và lỏng) bao gồm, theo khối lượng, 0,0001 đến 95%, ưu tiên hơn là 1 đến 85%, ví dụ 5 đến 60%, hợp chất được mô tả trong sáng chế. Chế phẩm được sử dụng để phòng trừ rầy và sâu đục thân sao cho hợp chất được mô tả trong sáng chế được áp dụng với tỷ lệ nằm trong khoảng từ 0,1g đến 10kg trên mỗi hecta, tốt hơn là từ 1g đến 6kg trên mỗi hecta, tốt hơn nữa là từ 1g đến 1kg trên mỗi hecta.

Khi được sử dụng trong việc bọc hạt giống, hợp chất được mô tả trong sáng chế được sử dụng với tỷ lệ từ 0,0001g đến 10g (ví dụ 0,001g hoặc 0,05g), tốt hơn là 0,005g đến 10g, tốt hơn nữa là 0,005g đến 4g, trên mỗi kilogram hạt giống.

Chế phẩm bao gồm hợp chất được mô tả trong sáng chế có thể được chọn từ nhiều dạng chế phẩm, bao gồm bột có thể tạo bụi (DP), bột tan được (SP), hạt tan được trong nước (SG), hạt phân tán được trong nước (WG), bột thấm ướt được (WP), hạt (GR) (giải phóng chậm hoặc nhanh), dịch đặc tan được (SL), chất lỏng có thể trộn lẫn với dầu (OL), chất lỏng thể tích siêu nhỏ (UL), dịch đặc nhũ hóa được (EC), dịch đặc phân tán được (DC), nhũ tương (cả dầu trong nước (EW) và nước trong dầu (EO)), vi nhũ tương (ME), huyền phù đặc (SC), sol khí, chế phẩm sương mù/khói, huyền phù bao nang (CS) và dạng bào chế xử lý hạt. Kiểu chế phẩm được chọn trong bất kỳ trường hợp nào sẽ phụ thuộc vào mục đích cụ thể được dự định và các tính chất vật lý, hóa học và sinh học của hợp chất theo sáng chế.

Bột có thể tạo bụi (DP) có thể được điều chế bằng cách trộn lẫn hợp chất được mô tả trong sáng chế với một hoặc nhiều chất pha loãng rắn (ví dụ như sét tự nhiên, cao lanh, pyrophyllit, bentonit, alumin, montmorillonit, kizengua, thạch cao, diatomit, canxi phosphat, canxi và magie carbonat, lưu huỳnh, vôi, bột mỳ, bột tan và các chất mang rắn hữu cơ và vô cơ khác) và nghiền cơ học hỗn hợp thành bột mịn.

Bột tan được (SP) có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất được mô tả trong sáng chế với một hoặc nhiều muối vô cơ tan trong nước (như natri bicarbonat, natri carbonat hoặc magiê sulfat) hoặc một hoặc nhiều chất rắn hữu cơ tan trong nước (như a polysacarit) và, tùy ý, một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất phân tán hoặc hỗn hợp của các chất này để cải thiện khả năng phân tán/hòa tan trong nước.

Hỗn hợp sau đó được nghiền thành bột mịn. Chế phẩm tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo thành hạt tan được trong nước (SG).

Bột thấm ướt được (WP) có thể được điều chế bằng cách trộn lẫn hợp chất được mô tả trong sáng chế với một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn, một hoặc nhiều chất thấm ướt và, tốt hơn là, một hoặc nhiều chất phân tán và tùy chọn, một hoặc nhiều tác nhân tạo huyền phù để dễ phân tán trong chất lỏng. Hỗn hợp sau đó được nghiền thành bột mịn. Chế phẩm tương tự cũng có thể được tạo hạt để tạo thành hạt phân tán được trong nước (WG).

Hạt (GR) có thể được tạo thành hoặc bằng cách tạo hạt hỗn hợp của hợp chất được mô tả trong sáng chế và một hoặc nhiều chất pha loãng hoặc chất mang rắn được nghiền bột, hoặc từ hạt phôi tạo trước bằng cách hấp thụ hợp chất theo sáng chế (hoặc dung dịch của nó, trong chất thích hợp) trong vật liệu hạt xốp (như đá bọt, đất sét atapulgit, đất tẩy màu, kizengua, diatomit hoặc lõi ngô xay) hoặc bằng cách hấp thụ hợp chất được mô tả trong sáng chế (hoặc dung dịch của nó, trong chất thích hợp) lên vật liệu lõi cứng (như cát, silicat, cacbonat, sulfat hoặc phosphat khoáng) và làm khô nếu cần. Chất thường được sử dụng để hỗ trợ cho sự hấp thụ hoặc hấp phụ bao gồm dung môi (như các dung môi dầu mỡ béo và thơm, rượu, ete, keton và este) và chất bám dính (như polyvinyl axetat, rượu polyvinyl, dextrin, đường và dầu thực vật). Một hoặc nhiều chất phụ gia khác cũng có thể được bao gồm trong hạt (ví dụ như chất nhũ hóa, chất thấm ướt hoặc chất phân tán).

Dịch đặc phân tán được (DC) có thể được điều chế bằng cách hòa tan hợp chất được mô tả trong sáng chế trong nước hoặc dung môi hữu cơ, như keton, rượu hoặc glycol ete. Các dung dịch này có thể bao gồm chất có hoạt tính bề mặt (ví dụ như để cải thiện khả năng pha loãng trong nước hoặc chống kết tinh trong bể phun).

Dịch đặc nhũ hóa được (EC) hoặc nhũ tương dầu trong nước (EW) có thể được điều chế bằng cách hòa tan hợp chất được mô tả trong sáng chế trong dung môi hữu cơ (tùy chọn bao gồm một hoặc nhiều chất thấm ướt, một hoặc nhiều chất nhũ hóa hoặc hỗn hợp các chất này). Dung môi hữu cơ thích hợp để sử dụng trong EC bao gồm hydrocarbon thơm (như alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen, ví dụ như SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 và SOLVESSO 200; SOLVESSO là nhãn hiệu đã đăng ký), keton (như xyclohexanon hoặc metylxyclohexanon) và rượu (như benzyl alcohol, furfuryl alcohol hoặc butanol), *N*-alkylpyrrolidon (như *N*-metylpyrrolidon hoặc *N*-

octylpyrolidon), dimetyl amit của axit béo (như dimetylamit của axit béo C_8-C_{10}) và hydrocacbon được clo hóa. Sản phẩm EC khi thêm nước có thể tự nhũ hóa thành nhũ tương với độ ổn định đủ để cho phép ứng dụng phun sương thông qua thiết bị thích hợp. Điều chế EW bao gồm thu được hợp chất được mô tả trong sáng chế hoặc là dưới dạng chất lỏng (nếu nó không lỏng ở nhiệt độ phòng, có thể được làm nóng chảy ở nhiệt độ vừa phải, điển hình là dưới 70°C) hoặc trong dung dịch (bằng cách hòa tan trong dung môi thích hợp) và sau đó nhũ hóa chất lỏng hoặc dung dịch thu được trong nước bao gồm một hoặc nhiều SFA, dưới lực ép cao, để tạo ra nhũ tương. Dung môi thích hợp để dùng trong EW bao gồm dầu thực vật, hydrocacbon được clo hóa (như clobenzen), dung môi thơm (như alkylbenzen hoặc alkylnaphtalen) và dung môi hữu cơ thích hợp khác có độ tan thấp trong nước.

Vi nhũ tương (ME) có thể được điều chế bằng cách trộn nước với hỗn hợp một hoặc nhiều dung môi với một hoặc nhiều SFA, để tự sinh ra một chế phẩm lỏng đẳng hướng ổn định nhiệt động học. Hợp chất được mô tả trong sáng chế có mặt ban đầu dưới dạng hoặc là trong nước, hoặc là trong hỗn hợp dung môi/SFA. Dung môi thích hợp để dùng trong ME bao gồm dung môi đã được mô tả trên để dùng trong EC hoặc trong EW. ME có thể hoặc là hệ dầu trong nước, hoặc là hệ nước trong dầu (có thể xác định hệ nào hiện diện bằng cách đo độ dẫn điện) và có thể thích hợp để trộn lẫn thuốc trừ loài gây hại tan trong nước và tan trong dầu trong cùng một chế phẩm. ME thích hợp để pha loãng trong nước, hoặc là vẫn duy trì như một vi nhũ, hoặc là tạo thành nhũ tương dầu trong nước thông thường.

Huyền phù đặc (SC) có thể bao gồm huyền phù có nước hoặc không có nước của hạt rắn không tan được phân nhỏ mịn của hợp chất được mô tả trong sáng chế. SC có thể được điều chế bằng nghiền bi hoặc nghiền hợp chất rắn được mô tả theo sáng chế trong môi trường thích hợp tùy chọn với một hoặc nhiều chất phân tán, để tạo thành huyền phù hạt mịn của hợp chất. Một hoặc nhiều chất thấm ướt có thể được bao gồm trong chế phẩm và chất tạo huyền phù có thể được bao gồm để giảm tỷ lệ lắng đọng hạt. Thay vào đó, hợp chất được mô tả trong sáng chế có thể được nghiền khô rồi thêm vào nước, có bao gồm chất được mô tả ở trên, để tạo ra sản phẩm cuối mong muốn.

Chế phẩm sol khí bao gồm hợp chất được mô tả trong sáng chế và chất nổ đẩy thích hợp (ví dụ *n*-butan). Hợp chất theo sáng chế cũng có thể được hòa tan hoặc được

phân tán trong môi trường thích hợp (ví dụ nước hoặc chất lỏng có thể trộn với nước, như *n*-propanol) để tạo ra chế phẩm để dùng trong bơm phun hoạt động bằng tay, không điều áp.

Hợp chất được mô tả trong sáng chế có thể được trộn lẫn ở trạng thái khô với hỗn hợp làm pháo hoa để tạo thành chế phẩm thích hợp cho việc phát ra, trong một không gian đóng, khói có bao gồm hợp chất.

Huyền phù bao nang (CS) có thể được điều chế theo cách tương tự với điều chế chế phẩm EW nhưng có thêm giai đoạn polyme hóa nhằm thu được sự phân tán trong nước của các giọt dầu, trong đó mỗi giọt dầu được bọc bằng vỏ polyme và có bao gồm hợp chất được mô tả trong sáng chế và tùy chọn, chất mang hoặc chất pha loãng cho nó. Vỏ polyme có thể được tạo ra hoặc là bằng phản ứng đa ngưng tụ bề mặt phân cách, hoặc là bằng quá trình giọt tụ. Chế phẩm này có thể tạo sự giải phóng có kiểm soát của hợp chất được mô tả trong sáng chế và chúng có thể được dùng để xử lý hạt. Hợp chất được mô tả trong sáng chế cũng có thể được pha chế trong chất nền polyme để phân hủy sinh học để tạo ra sự giải phóng chậm có kiểm soát của hợp chất.

Chế phẩm có thể bao gồm một hoặc nhiều chất bổ trợ để cải thiện các tính năng sinh học của chế phẩm (ví dụ như bằng việc cải thiện tính thấm ướt, sức căng hoặc phân bố bề mặt; chịu mưa trên các bề mặt được xử lý; hoặc hấp thu hoặc biến đổi hợp chất theo sáng chế). Chất bổ trợ này bao gồm các tác nhân hoạt động bề mặt, các chất bổ trợ phun sương nền dầu, ví dụ như một số dầu khoáng hoặc dầu thực vật tự nhiên (như dầu đậu tương và dầu hạt cải), và hỗn hợp của các chất này với tá dược tăng tính năng sinh học khác (thành phần mà có thể hỗ trợ hoặc làm thay đổi tác động của hợp chất được mô tả trong sáng chế).

Hợp chất được mô tả trong sáng chế cũng có thể được bào chế để sử dụng làm chất xử lý hạt, ví dụ như chế phẩm bột, bao gồm bột để xử lý hạt khô (DS), bột tan trong nước (SS) hoặc bột phân tán được trong nước để xử lý dạng vữa (WS), hoặc như là chế phẩm lỏng, bao gồm dịch đặc chảy được (FS), dung dịch (LS) hoặc huyền phù bao nang (CS). Điều chế các chế phẩm DS, SS, WS, FS và LS rất giống với điều chế chế phẩm DP, SP, WP, SC và DC tương ứng đã được mô tả ở trên. Chế phẩm để xử lý hạt có thể bao gồm chất trợ giúp sự bám dính của chế phẩm vào hạt (ví dụ như dầu khoáng hoặc rào tạo màng).

Chất làm ướt, chất phân tán, chất nhũ hóa có thể là SFA bề mặt của dạng cation, anion, lưỡng tính hoặc không ion.

SFA thích hợp kiểu cation bao gồm hợp chất amoni bậc bốn (ví dụ như xetyltrimetyl amoni bromua), imidazolin và muối amin.

SFA loại anion phù hợp bao gồm muối kim loại kiềm của axit béo, muối của monoeste béo của axit sunfuric (ví dụ như natri lauryl sulfat), muối của hợp chất thơm sulfonat hóa (ví dụ natri dodecylbenzensulfonat, canxi dodecylbenzensulfonat, butylnaphtalen sulfonat và hỗn hợp natri di- *isopropyl*- và tri-*isopropyl*-naphtalen sulfonat), este sunfat, este hydroxy sulfat (ví dụ natri laureth-3-sulfat), este cacboxylat (ví dụ natri laureth-3-carboxylat), este phosphat (sản phẩm từ phản ứng giữa một hoặc nhiều rượu béo và axit phosphoric (chủ yếu là mono-este) hoặc phospho pentoxit (chủ yếu là di-este), ví dụ phản ứng giữa rượu lauryl và axit tetraphosphoric; ngoài ra các sản phẩm này có thể được etoxylat hóa), sulfosuxinamat, parafin hoặc olefin sulfonat, các taurat và lignosulfonat.

SFA thích hợp kiểu lưỡng tính bao gồm betain, propionat và glyxinat.

SFA loại không ion phù hợp bao gồm sản phẩm ngưng tụ của oxit alkylen, như etylen oxit, propylen oxit, butylen oxit hoặc hỗn hợp của chúng, với rượu béo (như rượu oleyl hoặc rượu xetyl) hoặc với alkylphenol (như octylphenol, nonylphenol hoặc octylcresol); este một phần dẫn xuất từ các axit béo mạch dài hoặc anhydrit hexitol; sản phẩm ngưng tụ của este một phần nói trên với etylen oxit; polyme khối (bao gồm etylen oxit và propylen oxit); alkanolamit; este đơn giản (ví dụ các axit béo polyetylen glycol este); amin oxit (ví dụ lauryl dimetyl amin oxit) và lexitin.

Chất huyền phù hóa thích hợp bao gồm keo ưa nước (như polysacarit, polyvinylpyrrolidon hoặc natri cacboxymetylxenluloza) và sét trương (như bentonit hoặc atapungit).

Hợp chất được mô tả theo sáng chế có thể được áp dụng bằng bất kỳ cách áp dụng các chất diệt loài gây hại đã biết. Ví dụ như, nó có thể được áp dụng, được bào chế hoặc không bào chế, cho loài gây hại hoặc cho địa điểm của loài gây hại (như môi trường sống của các loài gây hại, hoặc cây trồng có khả năng bị tàn phá bởi loài gây hại) hoặc cho bộ phận bất kỳ của cây, bao gồm bộ lá, thân, cành hoặc rễ, cho hạt giống trước khi được trồng hoặc cho các môi trường khác mà trong đó cây đang phát triển hoặc sẽ được trồng (như đất quanh rễ, đất nói chung, nước trong ruộng hoặc các hệ

thống thủy canh), trực tiếp hoặc có thể bằng cách phun lên, phủ bụi lên, áp dụng bằng cách ngâm, áp dụng dưới dạng bào chế dạng kem hoặc bột nhão, áp dụng dưới dạng hơi hoặc áp dụng thông qua việc phân bố hoặc kết hợp chế phẩm (như chế phẩm dạng hạt hoặc chế phẩm được đóng vào túi tan trong nước) vào môi trường đất hoặc nước.

Hợp chất được mô tả theo sáng chế cũng có thể được tiêm vào cây hoặc phun lên thực vật sử dụng kỹ thuật phun sương điện động hoặc phương pháp thể tích nhỏ khác, hoặc áp dụng bằng các hệ thống tưới dưới đất hoặc trên không.

Chế phẩm để sử dụng làm chất pha chế có nước (dung dịch hoặc hệ phân tán trong nước) thường được cung cấp dưới dạng dịch đặc có tỷ lệ thành phần hoạt động cao, dịch đặc này được thêm nước trước khi dùng. Dịch đặc này, mà chúng có thể bao gồm DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG và CS, thường cần phải lưu trữ trong thời gian dài và sau thời gian lưu trữ như vậy, có khả năng thêm nước để tạo thành các chất pha chế trong nước mà vẫn duy trì được tính đồng nhất trong thời gian đủ để chúng có khả năng được áp dụng bởi các thiết bị phun sương thông thường. Chất pha chế trong nước này có thể bao gồm lượng khác nhau của hợp chất được mô tả trong sáng chế (ví dụ 0,0001 đến 10%, theo khối lượng) tùy thuộc vào mục đích mà chúng được sử dụng.

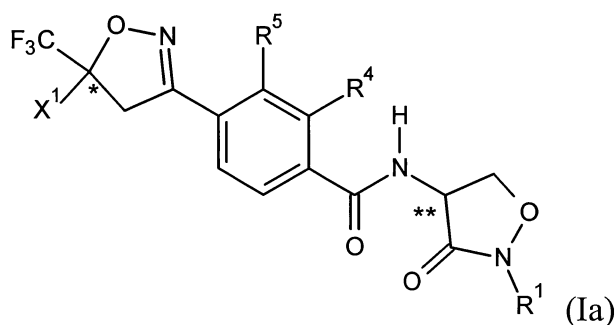
Sáng chế sẽ được minh họa bằng ví dụ nhưng không là giới hạn sau đây.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ sinh học

Bảng A

Bảng A đề xuất hợp chất có công thức (Ia) trong đó X^1 và R^1 có định nghĩa được thể hiện dưới đây.

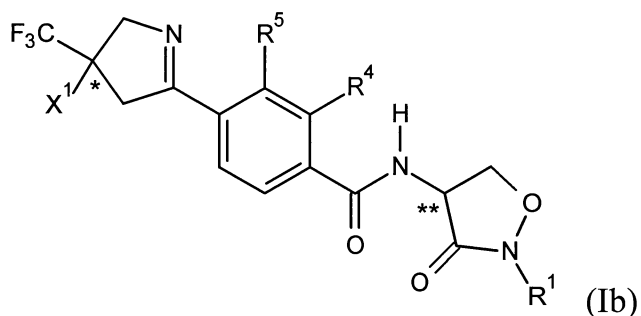


	X^1	R^1	R^4	R^5	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **
--	-------	-------	-------	-------	-----------------	------------------

A1	3,5-diclophenyl	metyl	CH3	H	R/S	R
A2	3,5-diclophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	R/S	R
A3	3,5-diclophenyl	etyl	CH3	H	S	R
A4	3,5-diclo-phenyl	etyl	CH3	H	R/S	S
A5	3,5-diclo-phenyl	metyl	CH3	H	R/S	S
A6	3,4,5-triclophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
A7	3,5-diclo-4-bromophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
A8	3,5-diclo-4-flophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
A9	3,5-diclophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R
A10	3,5-triflometyl-4-clophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
A11	3-clo-5-flophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
A12	3,5-diclophenyl	2,2-difloetyl	CH3	H	S	R
A13	3,4,5-triclophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R
A14	3,5-diclo-4-flophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R
A15	3-clo-5-triflometylphenyl	etyl	CH3	H	S	R
A16	3-clo-5-bromophenyl	etyl	CH3	H	S	R
A17	3-clo-5-bromophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R
A18	3,5-diclophenyl	etyl	CH3	H	S	R/S
A19	3,5-diclophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R/S
A20	3,5-diclophenyl	2,2-difloetyl	CH3	H	S	R/S
A21	3,5-diclo-4-flophenyl	Etyl	CH3	H	S	R/S
A22	3,5-diclophenyl	metyl	CH3	H	S	R/S
A23	3,4,5-triclophenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	S	R/S
A24	3,5-diclo-4-flophenyl	etyl	CH3	H	S	R
A25	3,5-diclo-4-flophenyl	etyl	Cl	H	S	R
A26	3-clo,5-triflometylphenyl	etyl	CH=CH- CH=CH		S	R
A27	3,5-diclophenyl	etyl	Br	H	S	R
A28	3,5-diclophenyl	etyl	CF3	H	S	R
A29	3,4,5-triclophenyl	etyl	CF3	H	S	R
A30	3-triflometylphenyl	etyl	CH3	H	S	R
A31	3,4,5-triclophenyl	etyl	CF3	H	S	R
A32	3,5-diclophenyl	etyl	CF3	H	S	R
A33	3,4,5-triclophenyl	etyl	Br	H	S	R
A34	3,5-diclophenyl	etyl	Br	H	S	R
A35	3,4,5-triclophenyl	etyl	CH3	H	S	R

Bảng B

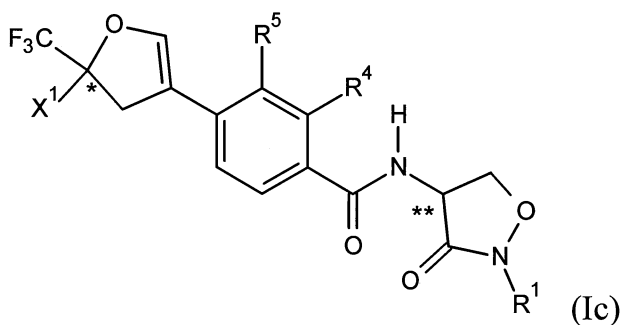
Bảng B đề xuất hợp chất có công thức (Ib) trong đó X^1 và R^1 có định nghĩa được thể hiện dưới đây.



	X1	R1	R4	R5	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **
B1	3,5-diclophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R
B2	3,5-diclo-phenyl	etyl	CH3	H	R	R
B3	3,5-diclo-phenyl	2,2,2-trifloetyl	CH3	H	R	R

Bảng C

Bảng C đề xuất hợp chất có công thức (Ic) trong đó X^1 và R^1 có định nghĩa được thể hiện dưới đây.



	X1	R1	R4	R5	Hóa lập thể ở *	Hóa lập thể ở **
C1	3,5-diclophenyl	etyl	CH3	H	R/S	R

R/S để chỉ hỗn hợp triệt quang.

Nephotettix virescens (Rầy xanh đuôi đen)

Cây lúa non được xử lý bằng các dung dịch thử pha loãng trong buồng phun. Sau khi làm khô, cây bị cho tàn phá bởi 10 N₅ nhộng (3 lần lặp lại). 5 ngày sau khi xử lý, mẫu được kiểm tra tỷ lệ chết.

Hợp chất	Phép thử	Tỷ lệ áp dụng	Phòng trừ
----------	----------	---------------	-----------

		/ ppm	/ %
A9	<i>Nephotettix virescens</i> (Rầy xanh đuôi đen)	200	100
		50	100
		12	100
		3	100
A3	<i>Nephotettix virescens</i> (Rầy xanh đuôi đen)	200	100
		50	100
		12	100
		3	90

Nilaparvata lugens (Rầy nâu)

Cây lúa non được xử lý bằng dung dịch thử pha loãng trong buồng phun. Sau khi làm khô, cây bị cho tàn phá bởi 20 N₃ nhộng (2 lần lặp lại). 6-12 ngày sau khi xử lý, các mẫu được kiểm tra tỷ lệ chết

Hợp chất	Rate / ppm	Phòng trừ / %
A1	50	98
	25	93
	12,5	93
A2	50	99
	25	98
	12,5	80
A3	50	100
	25	100
	12,5	100
A4	50	100
	25	93
	12,5	88
A5	50	98
	25	65
	12,5	0
A6	50	100
	25	100
	12,5	100
A7	50	100
	25	100
	12,5	100
A8	50	100
	25	100
	12,5	100

A9	50	100
	25	100
	12,5	98
A10	50	100
	25	100
	12,5	100
A11	50	100
	25	55
	12,5	80
A12	50	100
	25	100
	12,5	100
A13	50	98
	25	100
	12,5	75
A14	50	100
	25	100
	12,5	100
A15	50	100
	25	99
	12,5	99
A16	50	98
	25	97
	12,5	95
A17	50	100
	25	100
	12,5	100
A18	50	100
	25	100
	12,5	100
A19	50	100
	25	100
	12,5	100
A20	50	100
	25	100
	12,5	100
A21	50	100
	25	100
	12,5	100
A22	50	100
	25	100
	12,5	98
A23	50	100
	25	98
	12,5	90
A24	50	98
	25	85

	12,5	75
A25	50	100
	25	100
	12,5	100
A26	50	100
	25	100
	12,5	83
A27	50	100
	25	100
	12,5	98
A28	50	95
	25	50
	12,5	0
A29	50	100
	25	88
	12,5	55
A30	50	98
	25	100
	12,5	93
A31	50	100
	25	88
	12,5	55
A32	50	95
	25	50
	12,5	0
A33	50	98
	25	98
	12,5	80
A34	50	100
	25	100
	12,5	98
A35	50	98
	25	100
	12,5	93
B1	50	90
	25	78
	12,5	0
B2	50	88
	25	70
	12,5	15
B3	50	100
	25	100
	12,5	100
C1	50	95
	25	15
	12,5	0

Chilo suppressalis (Sâu đục thân lúa)

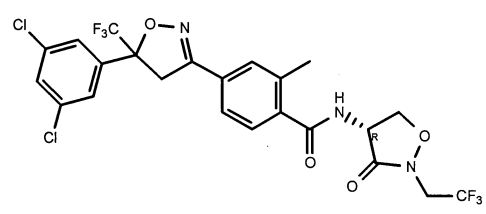
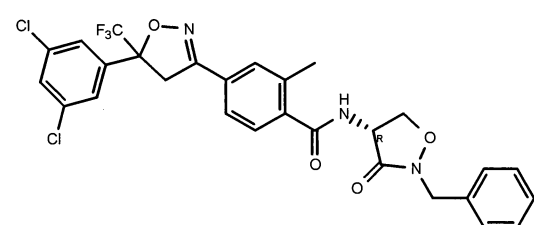
Cây lúa non được xử lý và sau khi làm khô cắt các lá và chuyển vào đĩa petri phủ bằng giấy lọc ướt. Thêm vào 10 ấu trùng (L2) và bọc đĩa bằng vải lọc và nắp nhựa. 5 ngày sau xử lý, tỷ lệ chết được đánh giá (3 lần lặp lại cho mỗi nồng độ).

Hợp chất	Phép thử	Tỷ lệ áp dụng / ppm	Phòng trừ / %
A9	<i>Chilo suppressalis</i> (Sâu đục thân lúa)	0,8	100
		0,2	100
		0,05	43
A3	<i>Chilo suppressalis</i> (Sâu đục thân lúa)	0,8	100
		0,2	100
		0,05	97

Ví dụ so sánh

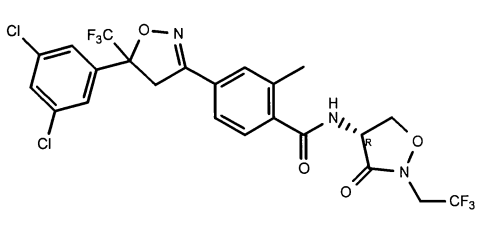
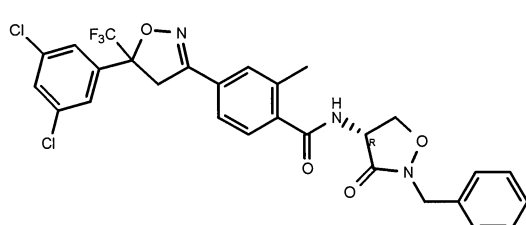
Hợp chất được thử theo các phương pháp trên. Kết quả thể hiện rằng hợp chất theo sáng chế có hoạt tính nhiều hơn đáng kể chống loài gây hại cây lúa được chỉ ra so với các hợp chất cùng cấu trúc, đặc biệt là ở tỷ lệ áp dụng thấp.

Bảng so sánh 1

Hợp chất theo sáng chế		Hợp chất tham khảo	
			
Hợp chất	Phép thử	Tỷ lệ áp dụng / ppm	Phòng trừ / %
Hợp chất theo sáng chế	<i>Chilo suppressalis</i> (Sâu đục thân lúa)	0,8	100
		0,2	53
Hợp chất tham khảo	<i>Chilo suppressalis</i> (Sâu	0,8	43

	độc thân lúa)	0,2	23
--	---------------	-----	----

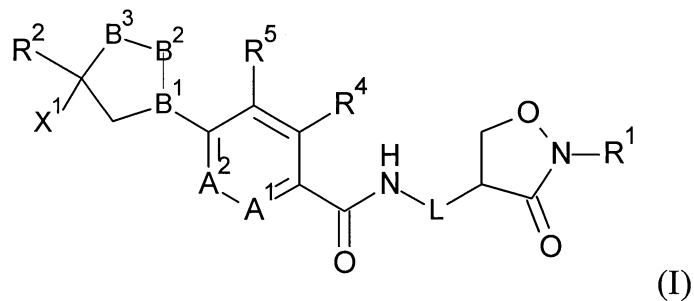
Bảng so sánh 2

Hợp chất theo sáng chế		Hợp chất tham khảo	
			
Hợp chất	Phép thử	Tỷ lệ áp dụng / ppm	Phòng trừ / %
Hợp chất theo sáng chế	<i>Nilaparvata lugens</i> (Rầy nâu)	50	99
		25	98
		12,5	80
Hợp chất tham khảo	<i>Nilaparvata lugens</i> (Rầy nâu)	50	45
		25	0
		12,5	0

Hợp chất theo sáng chế và hợp chất tham khảo là các hợp chất B5 và B4 tương ứng từ tài liệu công bố đơn quốc tế số WO 2011/067272.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Phương pháp bao gồm việc áp dụng cho cây lúa, địa điểm trồng chúng, hoặc vật liệu nhân giống chúng hợp chất có công thức I



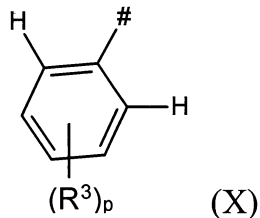
trong đó:

-B¹-B²-B³- là -C=N-O-;

L là liên kết trực tiếp;

A¹ và A² là C-H;

X¹ là nhóm X



R¹ là C₁-C₄alkyl, C₁-C₄haloalkyl hoặc C₃-C₆xycloalkyl;

R² là triflometyl;

mỗi R³ độc lập là bromo, clo, flo hoặc triflometyl;

R⁴ là hydro, halogen, metyl, halometyl hoặc xyano;

R⁵ là hydro;

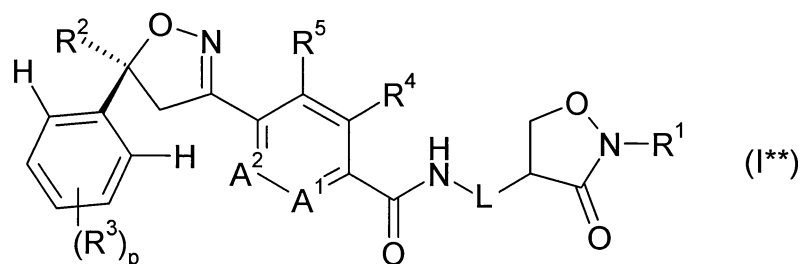
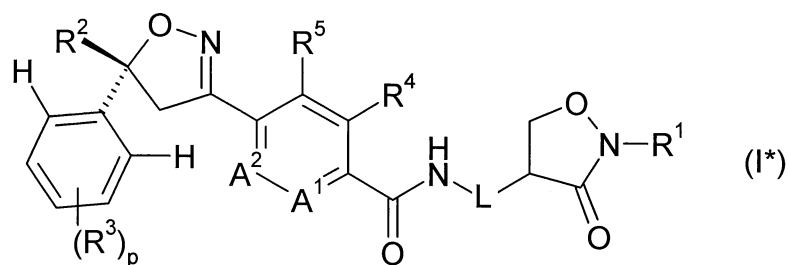
hoặc R⁴ và R⁵ cùng với nhau tạo thành nhóm 1,3-butadien có cầu;

p là 2 hoặc 3;

trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự phá hoại của rầy hoặc sâu đục thân.

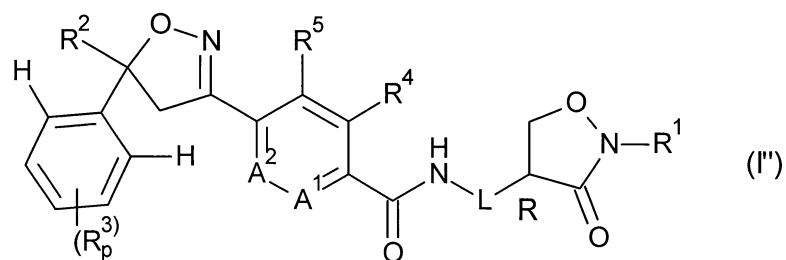
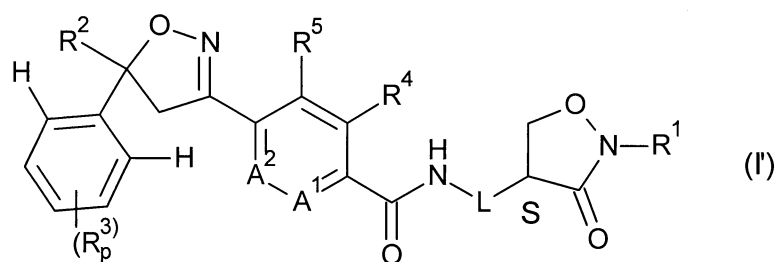
2. Phương pháp theo điểm 1, trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của sâu đục thân.

3. Phương pháp theo điểm 2, trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của *Chilo* sp.
4. Phương pháp theo điểm 1, trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy.
5. Phương pháp theo điểm 4, trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của *Nilaparvata lugens*.
6. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó R^4 là methyl, R^5 là hydro, mỗi R^3 là clo, p là 2.
7. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó R^1 là methyl, ethyl, propyl, butyl, xyclopropyl, xyclobutyl, trifloetyl, difloetyl.
8. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó R^1 là ethyl hoặc trifloetyl.
9. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 4, trong đó X^1 là 3,5-diclo-phenyl, 3,5-diclo-4-flophenyl-, 3,4,5-triclophenyl-, hoặc 3,5-bis(triflometyl)phenyl.
10. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8, trong đó hợp chất có công thức I là hỗn hợp của các hợp chất I^* và I^{**}



trong đó tỷ lệ mol của hợp chất I** so với tổng lượng của cả hai chất đồng phân đối ảnh là lớn hơn 50%.

11. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 8, trong đó hợp chất có công thức I là hỗn hợp của các hợp chất I' và I''



(S = hóa học lập thể S, R = hóa học lập thể R)

trong đó tỷ lệ mol của hợp chất I'' so với tổng lượng của cả hai chất đồng phân đối ảnh là lớn hơn 50%, trong đó phương pháp này là phương pháp phòng trừ và/hoặc ngăn ngừa sự tàn phá của rầy hoặc sâu đục thân, ở cây có ích, ưu tiên là lúa.