



(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)



1-0033063

(51)⁷ A01N 25/34; A01N 47/40; A01P 7/04; (13) B
A01N 43/56

(21) 1-2016-01655

(22) 31/10/2014

(86) PCT/JP2014/079081 31/10/2014

(87) WO 2015/072355 21/05/2015

(30) 2013-235073 13/11/2013 JP

(45) 25/08/2022 413

(43) 25/08/2016 341A

(73) Nippon Soda Co., Ltd. (JP)

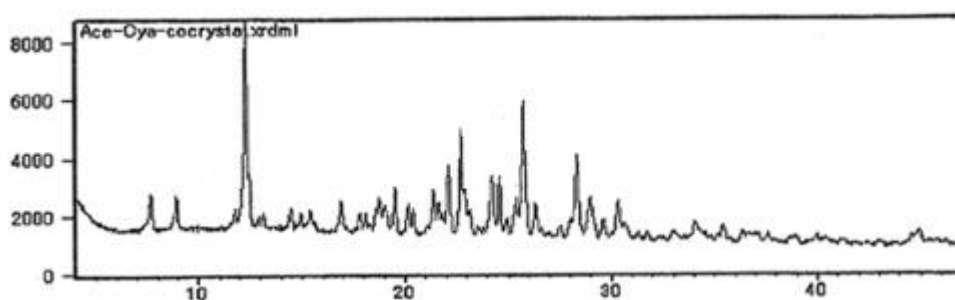
2-1, Ohtemachi 2-chome, Chiyoda-ku, Tokyo 100-8165, Japan

(72) ITO Akihiko (JP); AMANO Tomohiro (JP); MASAKI Rieko (JP).

(74) Công ty TNHH Tầm nhìn và Liên danh (VISION & ASSOCIATES CO.LTD.)

(54) ĐỒNG TINH THỂ VÀ PHƯƠNG PHÁP TẠO RA ĐỒNG TINH THỂ NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến đồng tinh thể gồm thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit làm đồng tinh thể thể hiện tác dụng diệt côn trùng rất tốt trong khoảng thời gian dài đồng thời làm giảm sự xuất hiện của các tổn thương hóa học trên các loài thực vật hữu ích. Sáng chế còn đề cập đến phương pháp tạo ra đồng tinh thể bao gồm bước gia nhiệt và khuấy huyền phù thu được bằng cách tạo huyền phù thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit trong dung môi như nước.



Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến đồng tinh thể gồm thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, phương pháp tạo ra chúng, và chế phẩm hóa nông chứa chúng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Hoạt chất chứa trong sản phẩm hóa nông chẳng hạn như thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt nấm, hoặc thuốc diệt cỏ, hoặc trong chất để kiểm soát sinh vật phá hủy gỗ như mối cần là cần thiết để kiểm soát một cách thích hợp sự rửa trôi nhằm duy trì tác dụng của chúng hoặc làm giảm độc tính thực vật ở thực vật hoặc độc tính ở người và động vật.

Đã có nhiều nỗ lực để tạo chế phẩm cho các hoạt chất có độ tan trong nước thấp để làm tăng sự rửa trôi của chúng. Ngược lại, đã có những nỗ lực để tạo chế phẩm cho các hoạt chất có độ tan trong nước cao để giảm tỷ lệ rửa trôi của chúng.

Hợp chất gốc neonicotinoit thuộc nhóm hợp chất thể hiện tác dụng diệt côn trùng dưới dạng chất chủ vận hoặc chất đối kháng thụ thể axetylcholin nicotin. Nhiều hợp chất trong nhóm này có độ tan trong nước cao. Do đó, việc làm giảm độc tính thực vật gây ra bởi việc sử dụng nồng độ cao và duy trì tác dụng trong khoảng thời gian dài bằng cách làm giảm tỷ lệ rửa trôi hoặc lượng tích trữ đã được xem xét. Hợp chất trong đó hợp chất gốc neonicotinoit được chứa trong hợp chất chủ đa phân tử đã được đề xuất làm phương pháp điều chỉnh tỷ lệ rửa trôi (Tài liệu patent 2). Ngoài ra, có trường hợp trong đó sự thay đổi các tính chất rửa trôi được đem lại bởi việc tạo thành đồng tinh thể. Ví dụ, Tài liệu patent 1 bộc lộ đồng tinh thể gồm imidacloprid, là thuốc diệt côn trùng, và axit oxalic.

Tài liệu đối chứng

Tài liệu patent

Tài liệu patent 1: WO 2010/118833

Tài liệu patent 2: WO 2006/006596

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

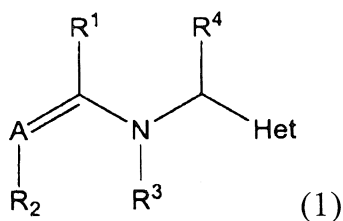
Mục đích của sáng chế là đề xuất chế phẩm diệt côn trùng hoặc chế phẩm tương tự thể hiện tác dụng diệt côn trùng rất tốt trong khoảng thời gian dài bằng cách kiểm soát thích đáng độ tan trong nước của hoạt chất diệt côn trùng, và trong đó không có lo ngại về độc tính thực vật trên cây hữu ích hoặc loài tương tự.

Các tác giả sáng chế đã thực hiện các nghiên cứu chuyên sâu để giải quyết vấn đề nêu trên, và kết quả là đã phát hiện ra rằng thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, axetamiprid, và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit, được chọn từ xyantraniliprol, clorantraniliprol và xyclaniliprol, tạo ra đồng tinh thể, và việc sử dụng đồng tinh thể này là hữu hiệu để giảm sự rửa trôi của thành phần diệt côn trùng gốc neonicotinoit có độ tan trong nước cao, và nhờ đó hoàn thành sáng chế.

Sáng chế đề cập đến đối tượng sau.

- (1) Đồng tinh thể chứa thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit.
- (2) Đồng tinh thể theo mục (1), trong đó tỷ lệ mol của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit so với thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit nằm trong khoảng từ 0,3 đến 3.
- (3) Đồng tinh thể theo mục (1) hoặc (2), trong đó thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit là hợp chất có công thức (1).

Công thức hóa học 1



Trong công thức này,

R^1 là $\text{CHR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, hoặc SR^{12} ,

mỗi R^{11} và R^{12} độc lập là nguyên tử hydro, hoặc nhóm C_{1-2} alkyl,

R^2 là nguyên tử halogen, nhóm xyno, nhóm nitro, hoặc nhóm C_{1-6} axyl được thế hoặc không được thế,

R^3 là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, hoặc nhóm C_{3-6} xycloalkyl,

R^4 là nguyên tử hydro hoặc nhóm methyl;

Het là nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh được thế hoặc không được thế;

A là N hoặc CR^{13} , trong đó R^{13} là nguyên tử hydro hoặc nhóm C_{1-2} alkyl, và

bất kỳ một trong số R^2 và R^{13} cùng với R^1 , và, R^{12} cùng với R^3 , mỗi trong số chúng có thể độc lập tạo ra nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh.

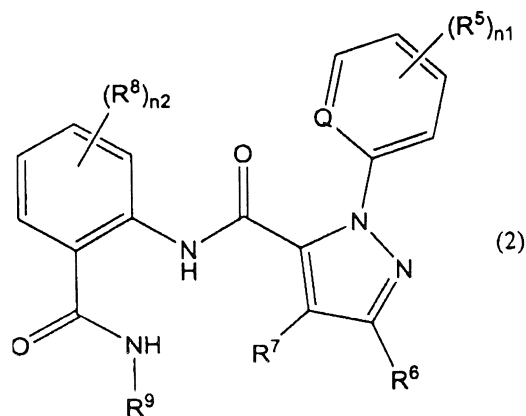
(4) Đồng tinh thể theo mục (1) hoặc (2), trong đó thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit là thành phần được chọn từ nhóm bao gồm imidacloprid, axetamiprid, thiametoxam, clothianidin, thiacloprid, nitenpyram,

N-[3-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(3H)-thiazolyliden]-2,2,2-trifloaxetamit, và

N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinliden]-2,2,2-trifloaxetamit.

(5) Đồng tinh thể theo mục (1) hoặc (2), trong đó thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit là hợp chất có công thức (2).

Công thức hóa học 2



Trong công thức này,

Q là CR^{14} hoặc nguyên tử nitơ,

R^{14} là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế hoặc nhóm C_{2-6} alkenyl được thế hoặc không được thế,

mỗi R^5 và R^8 độc lập là nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm nitro, nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl được thế hoặc không được thế,

hoặc nhóm C₂₋₆ alkynyl được thể hoặc không được thể,

n₁ là 0 hoặc số nguyên từ 1 đến 3;

n₂ là 0 hoặc số nguyên từ 1 đến 4;

R⁶ là nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm nitro, hoặc nhóm C₁₋₆ axyl được thể hoặc không được thể,

R⁷ là nguyên tử hydro, nhóm C₁₋₆ alkylthio được thể hoặc không được thể, hoặc nhóm C₁₋₆ alkylsulfinyl được thể hoặc không được thể,

R⁹ là nhóm C₁₋₆ alkyl được thể hoặc không được thể, nhóm C₂₋₆ alkenyl được thể hoặc không được thể, hoặc nhóm C₂₋₆ alkynyl được thể hoặc không được thể.

(6) Đồng tinh thể theo mục (1) hoặc (2), trong đó thành phần hoạt tính gốc diamit là xyantraniliprol, clorantraniliprol, hoặc xyclaniliprol.

(7) Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo mục bất kỳ trong số các mục từ (1) đến (6), phương pháp này bao gồm bước: tạo huyền phù cho thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit trong dung môi để thu được huyền phù, và gia nhiệt và khuấy huyền phù này.

(8) Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo mục (7), trong đó nhiệt độ gia nhiệt là cao hơn hoặc bằng 40°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi.

(9) Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo mục (8), trong đó nhiệt độ gia nhiệt là cao hơn hoặc bằng 60°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi.

(10) Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo mục bất kỳ trong số các mục từ (7) đến (9), trong đó dung môi là nước.

(11) Chế phẩm hóa nông chứa đồng tinh thể theo mục bất kỳ trong các mục từ (1) đến (6).

(12) Chế phẩm hóa nông theo mục (11), trong đó chế phẩm hóa nông là thuốc diệt côn trùng.

(13) Chất xử lý hạt chứa đồng tinh thể theo mục bất kỳ trong số các mục từ (1) đến (6).

(14) Chất xử lý hạt theo mục (13), trong đó chất xử lý hạt là chế phẩm cô đặc được tạo huyền phù trong nước.

(15) Phương pháp xử lý hạt, phương pháp này bao gồm bước: phủ hạt bằng chế phẩm hóa nông chứa đồng tinh thể theo mục bất kỳ trong số các mục từ (1) đến (6).

Hiệu quả của sáng chế

Độ tan trong nước của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit trong đồng tinh thể theo sáng chế là thấp hơn độ tan trong nước của chính thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit này. Chế phẩm hóa nông như chế phẩm diệt côn trùng chứa đồng tinh thể theo sáng chế thực hiện việc rửa trôi thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit trong nước ở tỷ lệ thỏa đáng, và nhờ đó tác dụng diệt côn trùng rất tốt được duy trì trong khoảng thời gian dài và không có lo ngại về độc tính thực vật trên cây hữu ích hoặc loài tương tự.

Mô tả vắn tắt các hình vẽ

FIG. 1 là hình thể hiện kết quả thu được bằng cách thực hiện phân tích nhiệt lượng quét vi sai (đo DSC) đồng tinh thể gồm axetamiprid và xyantraniliprol.

FIG. 2 là hình thể hiện kết quả thu được bằng cách thực hiện đo DSC hỗn hợp gồm axetamiprid và xyantraniliprol.

FIG. 3 là hình thể hiện nhiễu xạ tia X của đồng tinh thể gồm axetamiprid và xyantraniliprol.

FIG. 4 là hình thể hiện nhiễu xạ tia X của axetamiprid.

FIG. 5 là hình thể hiện nhiễu xạ tia X của xyantraniliprol.

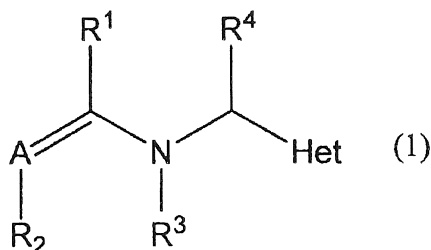
Mô tả chi tiết sáng chế

Các phương án thực hiện sáng chế

Đồng tinh thể theo sáng chế gồm thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit.

Không có giới hạn cụ thể về thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, miễn là thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit thuộc nhóm hợp chất thể hiện tác dụng diệt côn trùng dưới dạng chất chủ vận hoặc chất đối kháng thụ thể axetylcholin nicotinic. Ví dụ cụ thể của chúng bao gồm hợp chất có công thức (1).

Công thức hóa học 1



Trong công thức này, R^1 là $\text{CHR}^{11}\text{R}^{12}$, $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, hoặc SR^{12} , và tốt hơn nếu là $\text{CHR}^{11}\text{R}^{12}$.

Mỗi R^{11} và R^{12} độc lập là nguyên tử hydro, hoặc nhóm C_{1-2} alkyl. Ví dụ cụ thể về nhóm C_{1-2} alkyl bao gồm nhóm metyl, và nhóm etyl.

R^2 là nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm nitro, hoặc nhóm C_{1-6} axyl không được thế hoặc được thế. Ví dụ cụ thể về nguyên tử halogen bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom và nguyên tử iot. Ví dụ về nhóm C_{1-6} axyl bao gồm nhóm formyl, nhóm axetyl, và nhóm propionyl. Trong số chúng, R^2 tốt hơn nếu là nhóm xyano.

R^3 là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{1-6} haloalkyl, hoặc nhóm C_{3-6} xycloalkyl. Ví dụ cụ thể về nhóm C_{1-6} alkyl bao gồm nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, và nhóm n-hexyl. Ví dụ về nhóm C_{1-6} haloalkyl bao gồm nhóm monoflometyl, nhóm diflometyl, nhóm triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl, nhóm perfloetyl, nhóm 2,2,2-tricloetyl, nhóm 1,1,1,3,3,3-hexaflo-2-propyl, nhóm perflo-propyl, và nhóm 4,4,4-triflo-n-butyl. Ví dụ về nhóm C_{3-6} xycloalkyl bao gồm nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, và nhóm xyclohexyl. Trong số chúng, R^3 tốt hơn nếu là nhóm C_{1-6} alkyl.

R^4 là nguyên tử hydro hoặc nhóm metyl, và tốt hơn nếu là nguyên tử hydro.

Het là nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh được thế hoặc không được thế. Nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh tốt hơn nếu có ít nhất một nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm bao gồm nguyên tử oxy, nguyên tử lưu huỳnh, và nguyên tử nitơ, và ví dụ cụ thể của

chúng bao gồm nhóm pyrolyl, nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm imidazolyl, nhóm pyrazolyl, nhóm oxazolyl, nhóm isooxazolyl, nhóm thiazolyl, nhóm isothiazolyl, nhóm triazolyl, nhóm oxadiazolyl, nhóm thiadiazolyl, nhóm tetrazolyl; nhóm pyridyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm pyridazinyl, và nhóm triazinyl. Nhóm dị vòng này có thể có phần tử thế nêu ở trên. Trong số chúng, nhóm pyridyl được thế hoặc không được thế được ưu tiên, và nhóm pyridyl có nguyên tử halogen là phần tử thế được ưu tiên hơn.

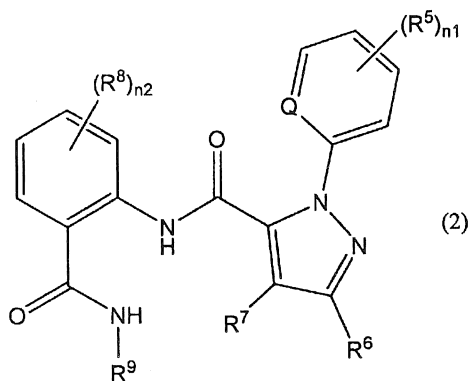
A là N hoặc CR¹³, trong đó R¹³ là nguyên tử hydro hoặc nhóm C₁₋₂ alkyl. Ví dụ cụ thể về nhóm C₁₋₂ alkyl bao gồm nhóm metyl và nhóm etyl. Trong số chúng, A tốt hơn nếu là N.

Nhóm bất kỳ trong số R² và R¹³ và R¹, và, R¹² và R³, mỗi trong số chúng có thể độc lập tạo thành nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh, và ví dụ về nhóm dị vòng 5 đến 6 cạnh bao gồm pyrol, thiophen, imidazol, pyrazol, oxazol, isoxazol, thiazol, isothiazol, triazol, oxadiazol, thiadiazol, tetrazol, pyridin, pyrazin, pyrimidin, pyridazin, và triazin. Nhóm dị vòng này có thể có phần tử thế nêu ở trên.

Trong các thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, imidacloprid, axetamiprid, thiametoxam, thiacloprid, clothianidin, dinotefuran, nitenpyram, nithiazin, flonicamid, sulfoxaflor, flupyradifuron, paichongding, imidaclothiz, N-[3-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(3H)-thiazolyliden]-2,2,2-trifloaxetamit, và N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinliden]-2,2,2-trifloaxetamit là được ưu tiên, imidacloprid, axetamiprid, thiametoxam, clothianidin, thiacloprid, nitenpyram, N-[3-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(3H)-thiazolyliden]-2,2,2-trifloaxetamit, và N-[1-[(6-clo-3-pyridinyl)metyl]-2(1H)-pyridinliden]-2,2,2-trifloaxetamit, mà độ tan trong nước của chúng là tương đối cao, được ưu tiên hơn, và axetamiprid còn được ưu tiên hơn nữa.

Thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit thuộc nhóm hợp chất có cấu trúc bazơ trong đó nhóm aminocacbonyl hoặc cacbonylamino được liên kết với vòng benzen, và nhóm aryl như nhóm phenyl hoặc nhóm pyrazol được liên kết với ít nhất một vị trí của chúng, và không bị giới hạn cụ thể, miễn là thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit thể hiện hoạt tính là chất chủ vận thụ thể ryanodin. Ví dụ cụ thể của chúng bao gồm hợp chất có công thức (2).

Công thức hóa học 2



Trong công thức (2), Q là CR^{14} hoặc nguyên tử nitơ, trong đó R^{14} là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl được thế hoặc không được thế, hoặc nhóm C_{2-6} alkynyl được thế hoặc không được thế. Ví dụ cụ thể về nhóm C_{1-6} alkyl bao gồm nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, và nhóm n-hexyl. Ví dụ về nhóm C_{2-6} alkenyl bao gồm nhóm vinyl, nhóm 1-propenyl, nhóm 2-propenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 3-butenyl, nhóm 1-metyl-2-propenyl, nhóm 2-metyl-2-propenyl, nhóm 1-pentenyl, nhóm 2-pentenyl, nhóm 3-pentenyl, nhóm 4-pentenyl, nhóm 1-metyl-2-butenyl, nhóm 2-metyl-2-butenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 2-hexenyl, nhóm 3-hexenyl, nhóm 4-hexenyl, và nhóm 5-hexenyl. Ví dụ về nhóm C_{2-6} alkynyl bao gồm nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butylnyl, nhóm 2-butylnyl, nhóm 3-butylnyl, nhóm 1-metyl-2-propynyl, nhóm 2-metyl-3-butylnyl, nhóm 1-pentylnyl, nhóm 2-pentylnyl, nhóm 3-pentylnyl, nhóm 4-pentylnyl, nhóm 1-metyl-2-butylnyl, nhóm 2-metyl-3-pentylnyl, nhóm 1-hexynyl, và nhóm 1,1-dimetyl-2-butylnyl. Trong số chúng, Q tốt hơn nếu là nguyên tử nitơ.

Mỗi R^5 và R^8 độc lập là nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm nitro, nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl được thế hoặc không được thế, hoặc nhóm C_{2-6} alkynyl được thế hoặc không được thế. Ví dụ cụ thể về nguyên tử halogen bao gồm nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, và nguyên tử iot. Ví dụ về nhóm C_{1-6} alkyl, nhóm C_{2-6} alkenyl, và nhóm C_{2-6} alkynyl bao gồm các nhóm giống như vậy được nêu cho R^{14} . Trong số chúng, được ưu tiên là mỗi R^5 và R^8 độc lập là nguyên tử halogen, nhóm xyano, hoặc nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế.

n_1 là 0 hoặc là số nguyên từ 1 đến 3, và tốt hơn nếu là 1.

n_2 là 0 hoặc là số nguyên từ 1 đến 4, và tốt hơn nếu là 1 hoặc 2.

R^6 là nguyên tử halogen, nhóm xyano, nhóm nitro, hoặc nhóm C_{1-6} axyl được thế hoặc không được thế. Ví dụ cụ thể về nhóm C_{1-6} axyl bao gồm nhóm formyl, nhóm axetyl, và nhóm propionyl. Trong số chúng, R^6 tốt hơn nếu là nguyên tử halogen.

R^7 là nguyên tử hydro, nhóm C_{1-6} alkylthio được thế hoặc không được thế, hoặc nhóm C_{1-6} alkylsulfinyl được thế hoặc không được thế. Ví dụ cụ thể về nhóm C_{1-6} alkylthio bao gồm nhóm metylthio, nhóm etylthio, nhóm n-propylthio, nhóm i-propylthio, nhóm n-butylthio, nhóm i-butylthio, nhóm s-butylthio, và nhóm t-butylthio. Ví dụ về nhóm C_{1-6} alkylsulfinyl bao gồm nhóm metylsulfinyl, nhóm etylsulfinyl, và nhóm t-butylsulfinyl. Trong số chúng, R^7 tốt hơn nếu là nguyên tử hydro.

R^9 là nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế, nhóm C_{2-6} alkenyl được thế hoặc không được thế, hoặc nhóm C_{2-6} alkynyl được thế hoặc không được thế. Ví dụ cụ thể của chúng bao gồm các nhóm giống như vậy được nêu cho R^{14} . Trong số chúng, R^9 tốt hơn nếu là nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế.

Trong số các thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit, xyantraniliprol, clorantraniliprol, xyclaniliprol, flubendiamit, và SYP-9080 được ưu tiên, xyantraniliprol, clorantraniliprol, và xyclaniliprol được ưu tiên hơn, và xyantraniliprol còn được ưu tiên hơn nữa.

Thuật ngữ "được thế" trong công thức (1) và (2) nghĩa là nguyên tử hydro bất kỳ của nhóm trở thành hạt nhân mẹ được thế bằng nhóm có cấu trúc giống cấu trúc của hạt nhân mẹ hoặc khác cấu trúc của hạt nhân mẹ. Số phần tử thế có thể là một hoặc hai hoặc nhiều hơn hai. Hai hoặc nhiều hơn hai phần tử thế có thể là giống hoặc khác nhau.

Thuật ngữ " C_{1-6} " hoặc tương tự biểu thị số nguyên tử cacbon của nhóm trở thành hạt nhân mẹ là một đến sáu. Số nguyên tử cacbon không bao gồm số nguyên tử cacbon tồn tại trong phần tử thế. Ví dụ, nhóm butyl có nhóm etoxy là phần tử thế được phân loại là nhóm C_4 alkyl được thế.

"Phần tử thế" không bị giới hạn cụ thể miễn là nó chấp nhận được về mặt hóa

học và thể hiện hiệu quả của sáng chế.

Ví dụ cụ thể về nhóm mà có thể là "phần tử thể" bao gồm: nguyên tử halogen, như nguyên tử flo, nguyên tử clo, nguyên tử brom, và nguyên tử iot; nhóm C₁₋₆ alkyl, như nhóm metyl, nhóm etyl, nhóm n-propyl, nhóm i-propyl, nhóm n-butyl, nhóm s-butyl, nhóm i-butyl, nhóm t-butyl, nhóm n-pentyl, và nhóm n-hexyl; nhóm C₃₋₆ xycloalkyl, như nhóm xyclopropyl, nhóm xyclobutyl, nhóm xyclopentyl, và nhóm xyclohexyl; nhóm C₂₋₆ alkenyl, như nhóm vinyl, nhóm 1-propenyl, nhóm 2-propenyl, nhóm 1-butenyl, nhóm 2-butenyl, nhóm 3-butenyl, nhóm 1-metyl-2-propenyl, nhóm 2-metyl-2-propenyl, nhóm 1-pentenyl, nhóm 2-pentenyl, nhóm 3-pentenyl, nhóm 4-pentenyl, nhóm 1-metyl-2-butenyl, nhóm 2-metyl-2-butenyl, nhóm 1-hexenyl, nhóm 2-hexenyl, nhóm 3-hexenyl, nhóm 4-hexenyl, và nhóm 5-hexenyl; nhóm C₃₋₆ xyclo alkenyl, như nhóm 2-xyclopropenyl, nhóm 2-xyclopentenyl, và nhóm 3-xyclohexenyl; nhóm C₂₋₆ alkynyl, như nhóm etynyl, nhóm 1-propynyl, nhóm 2-propynyl, nhóm 1-butynyl, nhóm 2-butynyl, nhóm 3-butynyl, nhóm 1-metyl-2-propynyl, nhóm 2-metyl-3-butynyl, nhóm 1-pentynyl, nhóm 2-pentynyl, nhóm 3-pentynyl, nhóm 4-pentynyl, nhóm 1-metyl-2-butynyl, nhóm 2-metyl-3-pentynyl, nhóm 1-hexynyl, và nhóm 1,1-dimetyl-2-butynyl;

Nhóm C₁₋₆ alkoxy như nhóm metoxy, nhóm etoxy, nhóm n-propoxy, nhóm i-propoxy, nhóm n-butoxy, nhóm s-butoxy, nhóm i-butoxy, và nhóm t-butoxy; nhóm C₂₋₆ alkenyloxy như nhóm vinyloxy, nhóm alyloxy, nhóm propenyloxy, và nhóm butenyloxy; nhóm C₂₋₆ alkynyloxy như nhóm etynyloxy, và nhóm propargyloxy; nhóm C₃₋₆ xycloalkoxy như nhóm xyclopropyloxy, nhóm xyclobutyloxy, nhóm xyclopentyloxy, và nhóm xyclohexyloxy; nhóm C₆₋₁₀ aryl như nhóm phenyl và nhóm naphtyl; nhóm C₆₋₁₀ aryloxy như nhóm phenoxy, nhóm naphtoxy, nhóm azulenyl, nhóm indenyl, nhóm indanyloxy, và nhóm tetralinyloxy; nhóm C₇₋₁₄ aralkyl như nhóm benzyl và nhóm phenetyl; nhóm C₇₋₁₄ aralkyloxy như nhóm benzyloxy và nhóm phenetyloxy; nhóm C₁₋₁₁ axyl như nhóm formyl, nhóm axetyl, nhóm propionyl, nhóm benzoyl, và nhóm xyclohexylcacbonyl; nhóm C₁₋₇ axyloxy như nhóm formyloxy, nhóm axetyloxy, nhóm propionyloxy, nhóm benzoyloxy, và nhóm xyclohexyl cacbonyloxy; nhóm C₁₋₆ alkoxycacbonyl như nhóm metoxycacbonyl, nhóm etoxycacbonyl, nhóm n-propoxycacbonyl, nhóm i-propoxycacbonyl, nhóm n-butoxycacbonyl, và nhóm t-butoxycacbonyl; nhóm carboxyl;

nhóm hydroxyl; nhóm C₁₋₆ haloalkyl như nhóm flometyl, nhóm clometyl, nhóm bromometyl, nhóm diflometyl, nhóm diclometyl, nhóm dibromometyl, nhóm triflometyl, nhóm triclometyl, nhóm tribromometyl, nhóm 2,2,2-trifloetyl, nhóm 2,2,2-tricloetyl, nhóm pentaflloetyl, nhóm 4-flobutyl, nhóm 4-clobutyl, nhóm 3,3,3-triflopropyl, nhóm 2,2,2-triflo-1-triflometyletyl, nhóm perflohexyl, nhóm perclohexyl, và nhóm 2,4,6-triclohexyl; nhóm C₂₋₆ haloalkenyl như nhóm 2-clo-1-propenyl và nhóm 2-flo-1-butenyl; nhóm C₂₋₆ haloalkynyl như nhóm 4,4-diclo-1-butynyl, nhóm 4-flo-1-pentynyl, và nhóm 5-bromo-2-pentynyl; nhóm C₁₋₆ haloalkoxy như nhóm clometoxy, nhóm diclometoxy, nhóm triclometoxy, nhóm triflometoxy, nhóm 1-floetoxy, nhóm 1,1-difloetoxy, nhóm 2,2,2-trifloetoxy, nhóm pentaflloetoxy, nhóm 2-clo-n-propoxy, và nhóm 2,3-diclobutoxy; nhóm C₂₋₆ haloalkenyloxy như nhóm 2-clopropenyloxy, và nhóm 3-bromobutenyloxy; nhóm C₆₋₁₀ haloaryl như nhóm 4-clophenyl, nhóm 4-flophenyl, và nhóm 2,4-diclophenyl; nhóm C₆₋₁₀ haloaryloxy như nhóm 4-flophenoxy và nhóm 4-clo-1-naphtoxy; nhóm C₁₋₇ haloaxyl như nhóm monofloaxetyl, nhóm monocloaxetyl, nhóm monobromoaxetyl, nhóm difloaxetyl, nhóm dicloaxetyl, nhóm dibromaxetyl, nhóm trifloaxetyl, nhóm tricloaxetyl, nhóm tribromaxetyl, nhóm 3,3,3-triflopropionyl, nhóm 3,3,3-triclopropionyl, nhóm 2,2,3,3,3-pentafllopropionyl, và nhóm 4-clobenzoyl;

nhóm xyano; nhóm isoxyano; nhóm nitro; nhóm isoxyanato; nhóm xyanato; nhóm azido; nhóm amino; nhóm C₁₋₆(di)alkylamino như nhóm metylamino, nhóm dimetylamino, và nhóm dietylamino; nhóm C₆₋₁₀ arylamino như nhóm anilino, và nhóm naphtylamino; nhóm C₇₋₁₁ aralkylamino như nhóm benzylamino và nhóm phenyletyl amino; nhóm C₁₋₇ axylamino như nhóm formylamino, nhóm axetylamino, nhóm propanoylamino, nhóm butyrylamino, nhóm i-propylcacbonylamino, và nhóm benzoylamino; nhóm C₁₋₆ alkoxycacbonylamino như nhóm metoxycacbonylamino, nhóm etoxycacbonylamino, nhóm n-propoxycacbonylamino, và nhóm i-propoxycacbonylamino;

nhóm mercapto; nhóm isothioxyanato; nhóm thioxyanato; nhóm C₁₋₆ alkylthio như nhóm metylthio, nhóm etylthio, nhóm n-propylthio, nhóm i-propylthio, nhóm n-butylthio, nhóm i-butylthio, nhóm s-butylthio, và nhóm t-butylthio; nhóm C₂₋₆ alkenylthio như nhóm vinylthio và nhóm alylthio; nhóm C₂₋₆ alkynylthio như nhóm etynylthio và nhóm propargylthio; nhóm C₆₋₁₀ arylthio như nhóm phenylthio và nhóm

naphtylthio; nhóm heteroarylthio như nhóm thiazolylthio và nhóm pyridylthio; nhóm C₇₋₁₄ aralkylthio nhóm benzylthio và nhóm phenetylthio; nhóm axylthio (tốt hơn nếu nhóm C₁₋₆axylthio) như nhóm axetylthio, và nhóm benzoylthio; nhóm (C₁₋₆ alkylthio) cacbonyl như nhóm (metylthio)cacbonyl, nhóm (etylthio)cacbonyl, nhóm (n-propylthio)cacbonyl, nhóm (i-propylthio)cacbonyl, nhóm (n-butylthio)cacbonyl, nhóm (i-butylthio)cacbonyl, nhóm (s-butylthio)cacbonyl, và nhóm (t-butylthio)cacbonyl;

nhóm C₁₋₆ alkylsulfinyl như nhóm metylsulfinyl, nhóm etylsulfinyl, và nhóm t-butyl sulfinyl; nhóm C₂₋₆ alkenyl sulfinyl như nhóm alyl sulfinyl; nhóm C₂₋₆ alkynylsulfinyl như nhóm propargylsulfinyl; nhóm C₆₋₁₀ arylsulfinyl như nhóm phenylsulfinyl; nhóm heteroarylsulfinyl như nhóm thiazoylsulfinyl và nhóm pyridylsulfinyl; nhóm C₇₋₁₁ aralkylsulfinyl như nhóm benzyl sulfinyl và nhóm phenetylsulfinyl; nhóm C₁₋₆ alkylsulfonyl như nhóm metyl sulfonyl, nhóm etyl sulfonyl, và nhóm t-butyl sulfonyl; nhóm C₂₋₆ alkenylsulfonyl như nhóm alyl sulfonyl; nhóm C₂₋₆ alkynylsulfonyl như nhóm propargylsulfonyl; nhóm C₆₋₁₀ arylsulfonyl như nhóm phenylsulfonyl; nhóm heteroarylsulfonyl như nhóm thiazolylsulfonyl và nhóm pyridylsulfonyl; nhóm C₇₋₁₄ aralkylsulfonyl như nhóm benzylsulfonyl và nhóm phenetylsulfonyl; nhóm haloalkylsulfonyl (tốt hơn nếu là nhóm C₁₋₆ haloalkylsulfonyl) như nhóm triflometylsulfonyl; nhóm sulfo; nhóm alkoxysulfonyl (tốt hơn nếu là nhóm C₁₋₆ alkoxysulfonyl) như nhóm metoxysulfonyl, và nhóm etoxysulfonyl; nhóm sulfamoyl; nhóm sulfamoyl (tốt hơn nếu là nhóm mono C₁₋₆ alkylsulfamoyl hoặc nhóm di C₁₋₆ alkylsulfamoyl) như nhóm N-metylsulfamoyl, nhóm N-etylsulfamoyl, nhóm N,N-dimetylsulfamoyl, và nhóm N,N-dietylsulfamoyl; nhóm monoarylsulfamoyl (tốt hơn nếu là nhóm C₆₋₁₀ arylsulfamoyl) như nhóm phenylsulfamoyl, và nhóm 4-metylphenylsulfamoyl;

nhóm heteroaryl 5 cạnh như nhóm pyrolyl, nhóm furyl, nhóm thienyl, nhóm imidazolyl, nhóm pyrazolyl, nhóm oxazolyl, nhóm isoxazolyl, nhóm thiazolyl, nhóm isothiazolyl, nhóm triazolyl, nhóm oxadiazolyl, nhóm athiadiazolyl, và nhóm tetrazolyl; nhóm heteroaryl 6 cạnh như nhóm pyridyl, nhóm pyrazinyl, nhóm pyrimidinyl, nhóm pyridazinyl, và nhóm triazinyl; nhóm dị vòng no như nhóm aziridinyl, nhóm epoxy, nhóm pyrrolidinyl, nhóm tetrahydrofuranyl, nhóm piperidyl, nhóm piperazinyl, và nhóm morpholinyl; -Si(R²⁰)(R²¹)(R²²) (trong đó mỗi R²¹, R²², và

R^{23} độc lập là nhóm C_{1-6} alkyl hoặc nhóm phenyl, và ví dụ về nhóm C_{1-6} alkyl bao gồm các nhóm giống như được nêu ở trên), như nhóm trimethylsilyl, nhóm triethylsilyl, nhóm t-butyl dimethylsilyl, nhóm trixyclopropyl, và nhóm triphenylsilyl.

Ngoài ra, "phần tử thế" này có thể có một "phần tử thế" khác trong đó, và ví dụ cụ thể của chúng bao gồm: "nhóm C_{1-6} alkyl" được thế bằng "nhóm C_{3-6} xycloalkyl được thế hoặc không được thế" như nhóm xyclopropylmetyl, nhóm 2-xyclopropyletyl, nhóm xyclopentylmetyl, và nhóm 2-xyclohexyletyl; "nhóm C_{1-6} alkyl" được thế bằng "nhóm C_{3-6} xycloalkenyl được thế hoặc không được thế", như nhóm xyclopentenylmetyl, nhóm 3-xyclopentatenylmetyl, nhóm 3-xyclohexenylmetyl, nhóm 2-(3-xyclohexenyl)etyl; "nhóm C_{1-6} alkyl" được thế bằng "nhóm dị vòng được thế hoặc không được thế", như nhóm 2-pyridylmetyl, nhóm 3-pyridylmetyl, nhóm 4-pyridylmetyl, nhóm 2-(2-pyridyl)etyl, nhóm 2-(3-pyridyl)etyl, nhóm 2-(4-pyridyl)etyl, nhóm 3-(2-pyridyl)propyl, nhóm 3-(3-pyridyl)propyl, nhóm 3-(4-pyridyl)propyl, nhóm 2-pyrazinylmetyl, nhóm 3-pyrazinylmetyl, nhóm 2-(2-pyrazinyl)etyl, nhóm 2-(3-pyrazinyl)etyl, nhóm 3-(2-pyrazinyl)propyl, nhóm 3-(3-pyrazinyl)propyl, nhóm 2-pyrimidinylmetyl, nhóm 4-pyrimidinylmetyl, nhóm 2-(2-pyrimidinyl)etyl, nhóm 2-(4-pyrimidinyl)etyl, nhóm 3-(2-pyrimidinyl)propyl, nhóm 3-(4-pyrimidinyl)propyl, nhóm 2-furylmetyl, nhóm 3-furylmetyl, nhóm 2-(2-furyl)etyl, nhóm 2-(3-furyl)etyl, nhóm 3-(2-furyl)propyl, và nhóm 3-(3-furyl)propyl; "nhóm C_{1-6} alkyl" được thế bằng "nhóm hydroxyl", như nhóm hydroxymetyl, nhóm hydroxyetyl, và nhóm hydroxypropyl; "nhóm hydroxyl C_{1-20} alkyl" được thế bằng "nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm metoxymetyl, nhóm etoxymetyl, nhóm metoxyetyl, nhóm etoxyetyl, nhóm metoxy n-propyl, nhóm etoxymetyl, nhóm etoxyetyl, nhóm n-propoxymetyl, nhóm i-propoxyetyl, nhóm s-butoxymetyl, nhóm t-butoxyetyl, và nhóm 2,2-dimetoxyletyl; "nhóm hydroxy C_{1-6} alkyl" được thế bằng "nhóm C_{1-20} axyl được thế hoặc không được thế", như nhóm formyloxymetyl, nhóm axetoxymetyl, nhóm 2-axetoxyletyl, nhóm propionyloxymetyl, và nhóm propionyloxyetyl; "nhóm C_{3-6} xycloalkyl" được thế bằng "nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm 2,3,3-trimetyl xyclobutyl, nhóm 4,4,6,6-tetrametyl xyclohexyl, và nhóm 1,3-dibutyl xyclohexyl; "nhóm C_{4-6} xycloalkenyl" được thế bằng "nhóm C_{1-6} alkyl được thế hoặc không được thế" như nhóm 2-metyl-3-xyclohexenyl, và nhóm 3,4-dimetyl-3-xyclohexenyl; "nhóm C_{2-6} alkenyl" được thế bằng "nguyên tử halogen", như nhóm 3-

clo-2-propenyl, nhóm 4-clo-2-butenyl, nhóm 4,4-diclo-3-butenyl, nhóm 4,4-diflo-3-butenyl, nhóm 3,3-diclo-2-propenyl, nhóm 2,3-diclo-2-propenyl, nhóm 3,3-diflo-2-propenyl, và nhóm 2,4,6-triclo-2-hexenyl; "nhóm C₂₋₆ alkynyl" được thế bằng "nguyên tử halogen", như nhóm 3-clo-1-propynyl, nhóm 3-clo-1-butylnyl, nhóm 3-bromo-1-butylnyl, nhóm 3-bromo-2-propynyl, nhóm 3-iodo-2-propynyl, nhóm 3-bromo-1-hexynyl, nhóm 4,4,6,6-tetraflo-1-dodecynyl, nhóm S,S-diclo-2-metyl-3-pentynyl, và nhóm 4-clo-1, 1-dimetyl-2-butylnyl; "nhóm alkoxy" được thế bằng "nhóm C₃₋₆ xycloalkyl được thế hoặc không được thế" hoặc "nhóm C₆₋₁₀ aryl được thế hoặc không được thế", như nhóm xyclopropylmetyloxy, nhóm 2-xyclopentyletyloxy, nhóm benzyloxy; nhóm xycloalkoxy được thế bằng "nhóm C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm 2-metylxcyclopropyloxy, nhóm 2-etylxcyclopropyloxy, nhóm 2,3,3-trimetylxcyclobutyloxy, nhóm 2-metylxcyclopentyloxy, nhóm 2-etylxcyclohexyloxy, nhóm 4,4,6,6-tetrametylxcyclohexyloxy, và nhóm 1,3-dibetylxcyclohexyloxy; "nhóm C₁₋₆ axyl" được thế bằng "nhóm C₂₋₆ alkenyl được thế hoặc không được thế", "nhóm C₂₋₆ alkynyl được thế hoặc không được thế", "nhóm C₆₋₁₀ aryl được thế hoặc không được thế" hoặc "nhóm dị vòng được thế hoặc không được thế", như nhóm 3-aryl-phenylcacbonyl, nhóm 3-etylnyl-phenylcacbonyl, nhóm benzylcacbonyl, nhóm phenetylccabonyl, hoặc nhóm 2-pyridylmetylccabonyl; "nhóm alkoxyccabonyl" được thế bằng "nhóm C₃₋₆ xycloalkyl được thế hoặc không được thế" hoặc "nhóm C₆₋₁₀ aryl được thế hoặc không được thế", như nhóm xyclopropylmetyloxyccabonyl, nhóm 2-xyclopentyletyloxyccabonyl, và nhóm benzyloxyccabonyl; "nhóm 1-(hydroximino)C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm hydroximinometyl, nhóm 1-(hydroximino)etyl, nhóm 1-(hydroximino)propyl, và nhóm 1-(hydroximino)butyl; "nhóm 1-(hydroximino)C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế" trong đó nguyên tử hydro trên nhóm hydroxyl được thế bằng "nhóm C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm metoximinometyl, nhóm etoximinometyl, và nhóm 1-(etoximino)etyl; "nhóm" có nhóm amino trên hai nguyên tử hydro được thế bằng cùng một nguyên tử cacbon của "nhóm C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm metylidenamino, và nhóm etylidenamino; nhóm diarylamino (tốt hơn nếu là nhóm di C₆₋₁₀ arylamino) như nhóm di 1-naphtylamino; "nhóm carbamoyl" được thế bằng "nhóm C₁₋₆ alkyl được thế hoặc không được thế", như nhóm metylcarbamoyl, nhóm etylcarbamoyl, nhóm dimetylcarbamoyl, và nhóm

diethylcarbamoyl; nhóm monoarylcarbamoyl (tốt hơn nếu là nhóm mono C₆₋₁₀ arylcarbamoyl) như nhóm phenylcarbamoyl, và nhóm 4-methylphenylcarbamoyl; nhóm axylcarbamoyl (tốt hơn nếu là nhóm C₁₋₆ axylcarbamoyl) như nhóm axetylcarbamoyl, và nhóm benzoylcarbamoyl; "nhóm imino" được thể bằng "nhóm C₆₋₁₀ alkyl được thể hoặc không được thể", như nhóm metylimino, và nhóm benzylimino; và "nhóm imino" được thể bằng "nhóm hydroxyl được thể hoặc không được thể", như nhóm hydroximino và nhóm etoximino.

Được cho là đồng tinh thể theo sáng chế được tạo ra bằng cách làm ổn định thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit thông qua tương tác phân tử, như liên kết hydro, sự xếp chồng obitan π , hoặc lực Van der Waals.

Trong đồng tinh thể theo sáng chế, tỷ lệ mol của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit so với thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit (thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit/thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit) tốt hơn nếu nằm trong khoảng từ 0,3 đến 3,0, tốt hơn nữa là từ 0,5 đến 2,0, còn tốt hơn nữa nếu từ 0,8 đến 1,25, và đặc biệt tốt hơn nếu từ 0,9 đến 1,1.

Việc tạo ra đồng tinh thể theo sáng chế có thể được xác nhận bằng phân tích nhiệt (TG/DTA), phân tích nhiệt lượng quét vi sai (differential scanning calorimetry, DSC), phổ hấp thụ hồng ngoại (infrared absorption spectrum, IR), mẫu hình nhiễu xạ tia X, phổ ¹³C-CP/MAS-NMR rắn, hoặc tương tự. Ngoài ra, các thành phần đồng tinh thể có thể được xác nhận thông qua phân tích nhiệt, nhiệt lượng quét vi sai (DSC), phổ ¹H-NMR, phổ ¹³C-NMR, phổ ²⁹Si-NMR, sắc ký lọc gel (gel filtration chromatography, GPC), sắc ký lỏng hiệu năng cao (high performance liquid chromatography, HPLC), phân tích nguyên tố, hoặc các phương pháp tương tự.

Ví dụ về phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo sáng chế bao gồm:

- (i) phương pháp bao gồm bước: trộn thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, và thành phần phụ trợ khi cần; và đưa hỗn hợp qua phản ứng pha rắn hóa cơ;
- (ii) phương pháp bao gồm bước: tạo huyền phù thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, và thành phần

phụ trợ khi cần, trong dung môi để thu được huyền phù; và gia nhiệt và khuấy huyền phù này;

(iii) phương pháp bao gồm bước: hòa tan thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, và thành phần phụ trợ khi cần, trong dung môi, và sau đó, lắng đồng tinh thể; và

(iv) phương pháp bao gồm bước: trộn thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, và thành phần phụ trợ khi cần; và gia nhiệt làm nóng chảy hỗn hợp.

Trong số các phương pháp này, phương pháp (ii) hoặc (iii) được ưu tiên.

Ví dụ về thành phần phụ trợ được sử dụng khi cần trong phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo sáng chế bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất mở rộng, chất hỗ trợ củng cố tác dụng, chất chống oxy hóa, chất hấp thụ tia cực tím, và chất làm ổn định.

Phản ứng pha rắn hóa cơ trong phương pháp (i) tốt hơn nếu được thực hiện bằng cách phun khô.

Mặc dù dung môi có trong phương pháp (ii) không bị giới hạn cụ thể, dung môi được ưu tiên là môi trường lỏng trong đó ít nhất một trong các thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit có thể được hòa tan ở độ tan lớn hơn hoặc bằng 100 ppm. Ví dụ về dung môi bao gồm: nước; rượu monohydric như metanol, etanol, propanol, isopropanol, và butanol; glycol như etylen glycol, dietylen glycol, propylen glycol, và glyxerin; và keton như axeton, metyletyl keton, và metylisobutyl keton. Dung môi có thể được sử dụng một mình hoặc kết hợp với hai hoặc nhiều trong số chúng. Trong số các dung môi này, tốt hơn nếu nước được sử dụng làm dung môi.

Sau khi thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit được tạo huyền phù trong dung môi, sản phẩm thu được có thể được khuấy trong một thời gian hoặc có thể được để yên không khuấy. Sau khi sản phẩm thu được được tạo huyền phù, gia nhiệt và khuấy sản phẩm này trong một thời gian nhất định. Thời gian khuấy hoặc gia nhiệt sản phẩm thu được không bị giới hạn cụ thể, nhưng tốt hơn nếu dài hơn hoặc bằng 30 phút nhưng ngắn hơn hoặc bằng 1 ngày. Thời gian phụ thuộc vào mục đích sử dụng đồng tinh thể, và

thời gian bất kỳ có thể được thiết lập miễn là ít nhất một phần của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, tốt hơn nếu từ 10% khối lượng đến 100% khối lượng của chúng, tốt hơn nữa nếu từ 50% khối lượng đến 100% khối lượng của chúng, và đặc biệt tốt hơn nếu từ 90% khối lượng đến 100% khối lượng của chúng, tạo ra đồng tinh thể. Thời gian có thể được xác định bằng phương pháp được mô tả ở trên để xác nhận việc tạo ra đồng tinh thể, hoặc đo sự thay đổi kích thước hạt rắn trong huyền phù theo thời gian. Nhiệt độ gia nhiệt tốt hơn nếu cao hơn hoặc bằng 40°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi, và tốt hơn nữa nếu cao hơn hoặc bằng 60°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi.

Tốt hơn nếu bước gia nhiệt và khuấy huyền phù nêu trên được thực hiện khi có mặt chất hoạt động bề mặt. Mặc dù các chất sau có thể được sử dụng làm chất hoạt động bề mặt, tốt hơn nếu ít nhất một chất được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt không ion như polyoxyetylen glycol tristyrylphenyl ete, lignin sulfonat, và dialkylsulfo suxinat được sử dụng.

Dung môi có trong phương pháp (iii) không bị giới hạn cụ thể, miễn là thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit có thể được hòa tan hoàn toàn trong đó. Ví dụ cụ thể về dung môi bao gồm axeton, axetonitril, metanol, etanol, etyl axetat, diclometan, cloform, tetrahydrofuran, n-hexan, xyclohexan, benzen, toluen, và xylen. Dung môi có thể được sử dụng một mình hoặc ở dạng kết hợp của hai hoặc nhiều dung môi. Trong số chúng, axeton được ưu tiên.

Bước lắng đồng tinh thể có thể được thực hiện bằng cách trộn sản phẩm thu được với dung môi nghèo, hoặc làm lạnh sản phẩm thu được. Mặc dù quy trình sau khác hoàn toàn quy trình tái kết tinh, đồng tinh thể có thể thu được bằng cách chưng cất một mình dung môi.

Trong phương pháp (iv), nhiệt độ gia nhiệt có thể được thiết lập, với điều kiện là nhiệt độ gia nhiệt là nhiệt độ hoặc cao hơn nhiệt độ mà tại đó ít nhất hỗn hợp của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit được làm nóng chảy, và nhiệt độ tại đó cả thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc

neonicotinoit đều không bị phân hủy. Nhiệt độ này không nhất thiết phải thấp hơn nhiệt độ nóng chảy được thể hiện độc lập bởi mỗi trong số các thành phần được mô tả ở trên, và nhiệt độ này có thể thấp hơn nhiệt độ nóng chảy phụ thuộc vào các tính chất của hỗn hợp được mô tả ở trên. Nhiệt độ gia nhiệt tốt hơn nếu cao hơn hoặc bằng 85°C, tốt hơn nữa nếu cao hơn hoặc bằng 90°C, và thậm chí tốt hơn nữa nếu cao hơn hoặc bằng 100°C.

Đồng tinh thể được tạo ra theo cách trên có thể được sử dụng để tạo chế phẩm hóa nông theo sáng chế, như chế phẩm diệt côn trùng, ở dạng như khi nó được sản xuất ra hoặc tinh sạch thêm đồng tinh thể, phụ thuộc vào sử dụng đích.

Chế phẩm hóa nông theo sáng chế, cụ thể là chế phẩm diệt côn trùng, chứa đồng tinh thể làm thành phần hoạt tính của chúng. Đồng tinh thể, làm thành phần hoạt tính, có thể chứa một mình hoặc kết hợp với hai hoặc nhiều của chúng. Chế phẩm hóa nông theo sáng chế có thể chứa các thành phần hoạt tính hóa nông khác ngoài đồng tinh thể, và có thể chứa thành phần phụ trợ, phụ thuộc vào sử dụng đích và dạng liều.

Ví dụ về các thành phần hoạt tính hóa nông khác có thể có trong chế phẩm hóa nông theo sáng chế bao gồm thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt giun, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, chất điều hòa tăng trưởng thực vật, chất cảm ứng tính kháng, chất xua đuổi côn trùng, và chất kháng virus, và ví dụ cụ thể hơn của chúng bao gồm các hợp chất sau.

Thuốc diệt côn trùng:

(1) Bazơ (thio)phosphat hữu cơ: axephat, azamethipho, azinpho-metyl, azinpho-etyl, buromopho-etyl, bromfenvinphos, BRP, clorpyrifos, clorpyrifos-metyl, clorfenvinphos, cadusafos, carbophenothion, cloetoxifos, clormephos, coumaphos, xyanofenphos, xyanophos, diclorvos, dicrotophos, dimethoat, disulfoton, demeton-S-metyl, dimetylvinphos, demeton-S-metylsulfon, dialifos, diazinon, dichlofenthion, dioxabenzophos, disulfoton, ethion, ethoprophos, etrimfos, EPN, fenamiphos, fenitrothion, fenthion, fensulfothion, fonofos, formothion, phosmetylan, heptenophos, isazophos, iodofenphos, isofenphos, isoxathion, malathion, mevinphos, methamidophos, methidathion, monocrotophos, mecarbam, methacrifos, omethoat, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl, phenthoat, phosalon, phosmet, phosphamidon, phorat, phoxim, pirimiphos-metyl, pirimiphos-etyl, profenofos,

prothiofos, fosthiazat, phosphocarb, propaphos, propethamphos, prothoat, pyridaphenthion, pyraclofos, quinalphos, sulprophos, sulfotepp, tetrachlorvinphos, terbufos, triazophos, trichlorfon, tebupirimfos, temephos, thiometon, vamidothion, và imicyafos;

(2) Bazo cacbamat: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, phenothiocarb, methiocarb, methomyl, oxamyl, pirimicarb, propoxur, thiodicarb, ethiofencarb, fenobucarb, MIPC, MPMC, MTMC, furathiocarb, XMC, aldoxicarb, allyxycarb, aminocarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxycarboxim, cloethocarb, dimetilan, formetanat, metam-natri, metolcarb, promecarb, thiophanox, trimethacarb, và xylylcarb;

(3) Bazo pyrethroid: allethrin, bifenthrin, cytluthrin, beta-cytluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cyphenothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, deltamethrin, esfenvalerat, ethofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, imiprothrin, permethrin, prallethrin, pyrethrin, pyrethrin I, pyrethrin II, resmethrin, silatluofen, fluvalinate, tetluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, profluthrin, dimetluthrin, acrinathrin, xycloprothrin, halfenprox, flucythrinat, bioallethrin, bioethanomethrin, biopermethrin, bioresmethrin, transpermethrin, empenthrin, fenfluthrin, fenpirithrin, tlubrocyrthrinat, flufenprox, flumethrin, metofluthrin, phenothrin, protrifenbute, pyresmethrin, terallethrin, meperthluthrin, và tetrametyltluthrin;

(4) Chất điều hòa tăng trưởng:

(a) chất ức chế tổng hợp chitin: clortluazuron, ditlubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron, bistriluron, noviflumuron, buprofezin, fluazuron, và penfluron;

(b) chất chủ vận ecdyson: halofenozit, metoxyfenozit, tebufenozit, chromafenozit, và azadirachtin;

(c) Chất tương tự hormon non: pyriproxyfen, methopren, epofenonan, hydroplan, kinopren, tripren, diofenolan, và fenoxycarb; và

(d) Chất ức chế sinh tổng hợp lipid: spiroadiclofen, spiromesifen, và spirotetramat;

- (5) Hợp chất chủ vận/đối kháng thụ thể nicotin: nicotin, bensultap, cartap, thioxyclam, thiosultap, và nereistoxin;
- (6) Hợp chất đối kháng GABA: axetoprol, ethiprol, fipronil, vaniliprol, pyratluprol, và pyriprol;
- (7) Thuốc diệt côn trùng lacton vòng lớn: abamectin, emamectin benzoat, milbemectin, lepimectin, spinosad, ivermectin, selamectin, doramectin, eprinomectin, moxidectin, milbemycin oxim, và spinetoram;
- (8) Hợp chất METI I: fenazaquin, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad, flufenimer, fenpyroximat, và pyrimidifen;
- (9) Hợp chất METI II và III: axequinocyl, fluacrypyrim, hydrametylnon, và cyenopyrafen;
- (10) Hợp chất không ghép cặp: clorfenapyr, binapacryl, dinobuton, dinocap, và DNOC;
- (11) Hợp chất ức chế phosphoryl hóa oxy hóa: cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin-oxit, propargit, azoxyclofen, và tetradifon;
- (12) Hợp chất làm gián đoạn quá trình lột xác: cyromazin;
- (13) Hợp chất ức chế oxidaza chức năng hỗn hợp: piperonyl butoxit;
- (14) Hợp chất chặn kênh natri: indoxacarb và metatlumizon;
- (15) Sản phẩm hóa nông vi sinh: tác nhân BT, tác nhân virus gây bệnh côn trùng, tác nhân nấm gây bệnh côn trùng, và tác nhân nấm gây bệnh giun tròn; các chi và loài *Bacillus*, nấm tầm, nấm giun đen, chi và loài *Paecilomyces*, thuringiensin, và chi và loài *Verticillium*;
- (16) Chất chủ vận thụ thể latrophilin: emodepsit;
- (17) Chất chủ vận liên quan đến octopamin; amitraz
- (20) Chất ức chế nuôi dưỡng: pymetrozin, flonicamid và clordimeform;
- (21) Chất ức chế tăng trưởng của ve bét: clofentezin, etoxazol và hexythiazox;
- (22) Hợp chất khác: benclorfen, bifenthrin, pyridalyl, lru huỳnh, cyflumetofen, amidotlumet, 1,3-diclopropen, DCIP, metaldehyt, pyridaliquinazone, benzoximat,

bromopropylat, chinomethionat, clopicrin, dixyclanil, fenoxacrim, fentrifanil, flubenzimin, gossyplure, japonilure, metoxadiazon, dầu, kali oleat, sulfluramid, tetrasul, triarathen; afidopyropen, pytlubumit, flometoquin, fluensulfon, tralopyril, ditlovidazin, metylneodecanamit, và triazamat;

(23) Thuốc trừ giun

(a) Bazơ benzimidazol: fenbendazol, albendazol, triclabendazol, và oxybendazol;

(b) Bazơ salixylanilit: closantel và oxyclozanit

(c) Bazơ phenol được thế: nitroxinil;

(d) Bazơ pyrimidin: pyrantel;

(e) Bazơ imidazothiazol: levamisol;

(f) Tetrahydropyrimidin: praziquantel; và

(g) Thuốc trừ giun khác: xyclodien, ryania, clorsulon, metronidazol, và demiditraz.

Thuốc diệt nấm:

(1) Bazơ benzimidazol: benomyl, carbendazim, fuberidazol, thiabendazol, thiophanat-metyl, clofenazol, và debacarb;

(2) Bazơ dicarboximit: clozolinat, iprodion, procymidon, và vinclozolin;

(3) Bazơ diệt nấm DMI: imazalil, oxpoconazol, pefurazoat, procloraz, triflumizol, triformin, pyrifenox, fenarimol, nuarimol, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, cyproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazoic, ipconazol, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, etaconazol, và fluconazol-cis; diclobutrazol, diniconazol-M, dodemorph axetat, fluconazol, imazalil-sulfat, naftifin, uniconazol P, viniconazol, và voriconazol;

(4) Bazơ phenyl amit: benalaxyl, benalaxyl-M, clozylacon, furalaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M, oxadixyl, và ofurac;

(5) Bazơ amin: aldimorph, dodemorph, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, piperalin, và spiroxamin;

- (6) Bazo phosphorothiorat: EDDP, iprobenfos, và pyrazophos;
- (7) Bazo dithiolan: isoprothiolan;
- (8) Carboxamit: benodanil, boscalid, carboxin, fenfuran, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad, thifluzamit, bixafen, isopyrazam, penflufen, fluxapyroxad, sedaxan, và fluopyram;
- (9) Bazo hydroxy-(2-amino)pyrimidin: bupirimat, dimethirimol, và ethirimol;
- (10) Bazo diệt nấm AP (anilinopyrimidin): cyprodinil, mepanipyrim, pyrimethanil, và andoprim;
- (11) Bazo N-phenyl cacbamat: diethofencarb;
- (12) Bazo diệt nấm QoI (chất ức chế Qo): azoxystrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, kresoxim-metyl, trifluoxystrobin, dimoxystrobin, metominostrobin, orysastrobin, famoxadon, fluoxastrobin, fenamidon, và metominofen; ametocradin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyribencarb; coumetoxystrobin, coumoxystrobin, enestroburin, phenoxystrobin, và triclopyricarb;
- (13) Bazo diệt nấm PP (phenylpyrol): fenpiclonil và fludioxonil;
- (14) Bazo quinolin: quinoxyfen;
- (15) Bazo diệt nấm AH (hydrocacbon thơm): biphenyl, cloneb, dicloran, quintozen, tecnazen, và clothalonil;
- (16) Bazo MBI-R: ftalit, pyroquilon, và trixyclozole;
- (17) Bazo MBI-D: carpropamid, diclocymet, và fenoxanil;
- (18) Chất SBI: fenhexamid;
- (19) Phenyl ure: pencycuron;
- (20) Thuốc diệt nấm QiI (chất ức chế Qi): cyazofamid, amisulbrom, và frumexycloz;
- (21) Bazo benzamit: zoxamit và zarilamit;
- (22) Bazo enopyranuron: blastidiclin và mildiomyxin;
- (23) Bazo hexopyranosyl: kasugamycin và kasugamycin hydrochlorua;
- (24) Bazo glucopyranosyl: streptomycin và validamycin;

- (25) Xyanoaxetamit: xymoxanil;
- (26) Cacbammat: iodocarb, propamocarb, prothiocarb, và polycacbammat;
- (27) Chất không ghép cặp: binapacryl, dinocap, ferimzon, fluazinam, và meptyldinocap;
- (28) Hợp chất thiếc hữu cơ: triphenyl thiếc axetat, triphenyl thiếc clorua, và triphenyl thiếc hydroxit;
- (29) Phosphat este: axit phosphorous, tolclofos metyl, fosetyl, và adifenphos;
- (30) Phtalamic axit bazơ: techlofthalam;
- (31) Bazơ benzotriazin: triazoxit;
- (32) Bazơ benzen sulfonamit: flusulfamit;
- (33) Pyridazinon: diclomezin;
- (34) Bazơ diệt nấm CAA (amit của axit carboxylic): dimethomorph, flumorph, benthiavalicarb-isopropyl, iprovalicarb, mandipropamid, và valifenalat;
- (35) Tetraxyclin: oxytetraxyclin;
- (36) Bazơ thiocacbammat: methasulfocarb;
- (37) Chất cảm ứng tính kháng: acibenzolar-S-metyl, probenazol, thiazinyl, và isotianil;
- (38) Các hợp chất khác: etridiazol, polyoxin, polyoxorim, axit oxolinic, hydroxy isoxazol, oethilidon, silthiofam, diflumetrim, ethaboxam, cyflufenamid, proquinazid, metrafenon, fluopicolit, hỗn hợp Bordeaux, đồng naphtalat, đồng oxit, oxy đồng clorua, đồng sulfat, mancopper, đồng (II) bis(8-quinolinolato), đồng (II) hydroxit, đồng hữu cơ, lưu huỳnh, canxi polysulfua, ferbam, manzeb, manebu, metiram, propineb, thiuram, zineb, ziram, captan, captafol, folpet, diclofluanid, tolylfluanid, dodin, guazatin, iminoctadin, iminoctadin axetat, iminoctadin alkylbenzensulfonat, anilazin, dithianon, dazomet, chinomethionat, cyprofuram, và floimit; isofetamido, tolprocarb, fenpyrazamin, pyriofenon, và tebufloqlin; flo folpet, propamidin; benthiazol, bethoxazin, capsaicin, cufraneb, mancozeb, diclophen, diphenylamin, flumetover, floimit, flutianil, fosetyl-nhôm, fosetyl-canxi, fosetyl-natri, irumamycin, metyl isothioxyanat (MITC), natamycin, nitrothal-isopropyl, propamocarb-fosetyl, pyrimorph, pyrolnitrin, tolnifanit, và trichlamit;

Chất điều hòa tăng trưởng thực vật

Axit abscisic, axit indolebutyric, uniconazol, ethechlozat, ethephon, cloxyfonac, clormequat, phần chiết tảo chlorella, canxi peroxit, xyanamit, diclorprop, gibberellin, daminozit, rượu dexyl, trinexapac-etyl, mepiquat clorua, paclobutrazol, sáp parafin, pyraflufen etyl, flurprimidol, prohydrojasmon, muối prohexadion canxi, benzylaminopurin, pendimethalin, forclorfenuron, maleic hydrazit kali, 1-naphtylaxetamit, 4-CPA, MCPB, cholin, butralin, 1-metylxcyclopropen, aviglyxin hydroclorua, và cyprosulfamit.

Dạng liều của chế phẩm hóa nông theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể, và ví dụ của chúng bao gồm bột, bột thấm ướt được, hạt phân tán trong nước, huyền phù, và viên nén, và dịch cô đặc huyền phù là đặc biệt thích hợp để làm chất phủ hạt.

Ví dụ về thành phần phụ trợ có trong chế phẩm hóa nông theo sáng chế bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất mở rộng, chất hỗ trợ củng cố tác dụng, chất chống oxy hóa, chất hấp thụ tia cực tím, và chất làm ổn định.

Chất hoạt động bề mặt có trong sáng chế có thể được chọn phụ thuộc vào dạng liều và sử dụng đích, và ví dụ cụ thể của chúng bao gồm: chất hoạt động bề mặt không ion như alkyl phenyl ete mà polyoxyetylen được bổ sung vào đó, alkyl ete mà polyoxyetylen được bổ sung vào đó, este axit béo bậc cao mà polyoxyetylen được bổ sung vào đó, axit este béo sorbitan bậc cao mà polyoxyetylen được bổ sung vào đó, và polyoxyetylen glycol tristyryl phenyl ete; chất ngưng formaldehyt như muối este của sulfuric của alkyl phenyl ete mà polyoxyetylen được bổ sung vào đó, alkyl benzen sulfonat, muối este của axit sulfuric của rượu bậc cao, alkyl naphtalen sulfonat, polycarboxylat, lignin sulfonat, và alkyl naphtalen sulfonat; và copolyme isobutylen maleic anhydrit.

Chất mở rộng có trong sáng chế có thể được chọn phụ thuộc vào dạng liều và sử dụng đích, và ví dụ của chúng bao gồm: dung môi, như, nước, glyxerin, etylen glycol, propylen glycol, dimetyl sulfoxit, dimetylaxetamit, N-metylpyrrolidon, γ -butyrolacton, rượu, hydrocacbon béo, và hydrocacbon thơm; chất làm đặc, chất ổn định, và chất gắn kết, như, polyvinyl pyrrolidon, rượu polyvinyl, polyvinyl axetat, polyetylen glycol, carboxymetyl xenluloza, hydroxypropyl xenluloza, gôm arabic, gôm xanthan, gelatin, casein, pectin, và natri alginat; chất mang rắn, như, đá tan, đất

sét, bentonit, sét kaolinit, montmorillonit, pyrophyllit, đất sét axit, diatomit, vermiculit, apatit, thạch cao, mica, cát silic đioxit, canxi cacbonat, và bột khoáng như bột đá bột; cacbon trắng (silica vô định hình), và sản phẩm tổng hợp như titan đioxit; xenluloza tinh thể, tinh bột, bột có nguồn gốc thực vật như bột gỗ, gỗ xộp, và hạt cà phê; hợp chất polyme như polyvinyl clorua và nhựa dầu mỏ; và nước các thành phần hòa tan, như, amoni sulfat, amoni nitrat, amoni clorua, kali phosphat, kali clorua, ure, và đường.

Phương pháp tạo ra chế phẩm hóa nông theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể. Ví dụ của chúng bao gồm phương pháp trong đó đồng tinh thể theo sáng chế được tạo ra ở dạng như ban đầu, hoặc sau khi trộn với thành phần phụ trợ khi cần; phương pháp trong đó đồng tinh thể theo sáng chế được tạo chế phẩm sau khi được tách và sau đó trộn với thành phần phụ trợ; và phương pháp trong đó thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit tạo ra đồng tinh thể được trộn với thành phần phụ trợ, hỗn hợp được gia nhiệt để tạo thành đồng tinh thể, thành phần phụ trợ được bổ sung thêm vào đồng tinh thể, khi cần, và sau đó hỗn hợp được tạo thành chế phẩm.

Ví dụ về việc sử dụng theo mục đích của chế phẩm hóa nông theo sáng chế bao gồm sử dụng cho nông nghiệp và làm vườn, và sử dụng cho việc làm vườn nhà. Tốt hơn nếu việc sử dụng hóa nông là sử dụng để diệt côn trùng, và ví dụ cụ thể về sử dụng để diệt côn trùng bao gồm sử dụng trong nông nghiệp và sử dụng trong làm vườn, sử dụng trong việc làm vườn nhà và sử dụng trong việc kiểm soát côn trùng gây hại vệ sinh, côn trùng gây hại gỗ, mối, và các vật ký sinh ngoài hoặc ký sinh trong ở động vật.

Phương pháp ứng dụng chế phẩm hóa nông theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể, miễn là dạng liều được sử dụng có thể được áp dụng cho phương pháp sử dụng. Ví dụ cụ thể của chúng bao gồm ứng dụng lên lá; xử lý vật liệu nhân giống như hạt, khoai tây giống, và củ, bằng cách thực hiện phun, phủ bụi, phân tán, nhúng, hoặc phương pháp tương tự; tiêm thân cây; xử lý đất hoặc vật mang nuôi trồng bằng cách thực hiện phân tán bề mặt, trộn, tưới nước, xử lý hố trồng hoặc phương pháp tương tự; và ứng dụng lên bề mặt nước của ruộng lúa.

Chế phẩm hóa nông theo sáng chế tốt hơn nếu được sử dụng làm chất xử lý hạt.

Chất xử lý hạt tốt hơn nếu là chế phẩm cô đặc lơ lửng trong nước. Chế phẩm cô đặc lơ lửng trong nước tốt hơn nếu có thể thu được theo phương pháp (ii) bằng cách tạo huyền phù thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, và thành phần phụ trợ, khi cần, trong nước để thu được huyền phù, và sau đó gia nhiệt và khuấy huyền phù này.

Ví dụ về phương pháp xử lý hạt bao gồm phương pháp trong đó hạt được phủ bằng chế phẩm hóa nông (chất xử lý hạt) theo sáng chế. Ví dụ cụ thể của chúng bao gồm phương pháp trong đó chế phẩm hóa nông theo sáng chế được hòa tan hoặc phân tán trong dung dịch dính (dung dịch thu được bằng cách hòa tan polyme tan trong nước như PYA (polyvinyl alcohol) hoặc CMC (carboxymetyl xenluloza) vào nước để cải thiện tính dính khi hạt được xử lý, với thuốc nhuộm hoặc một chất khác dùng làm chất đánh dấu xử lý chất), dung dịch hoặc huyền phù thu được được trộn với hạt của cây trồng, và sau đó làm khô hỗn hợp để thu được hạt trên đó chất bám dính đồng đều. Trong trường hợp hạt thu được được gieo vào đất, chất được hấp thụ qua hạt hoặc qua rễ mọc ra từ hạt sẽ lan rộng hoàn toàn trên toàn bộ cây và cây trồng được bảo vệ khỏi côn trùng gây hại.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ở đây, sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn nhờ tham khảo các ví dụ. Tuy nhiên, sáng chế không bị giới hạn ở đó.

Ví dụ 1

4,7 phần khối lượng của axetamiprid (được sản xuất bởi Nippon Soda Co., Ltd), 10 phần khối lượng của xyantraniliprol (được sản xuất bởi Du Pont Kabushiki Kaisha) (tỷ lệ mol của xyantraniliprol với axetamiprid = xấp xỉ 1), và 7,91 phần khối lượng axeton được cho vào bình hình quả cà tím, và sau đó khuấy. Hỗn hợp được để trong 1 ngày ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó, chưng cất axeton bằng thiết bị bay hơi ở 50°C để thu được sản phẩm rắn.

Đo DSC sản phẩm rắn (dụng cụ đo: DSC 220 được sản xuất bởi Seiko Instruments Inc., dụng cụ đo giống như vậy được sử dụng trong phần dưới đây). Kết quả được thể hiện trên FIG. 1. Nhiệt độ nóng chảy (xấp xỉ 178°C) được phát hiện khác với nhiệt độ nóng chảy của axetamiprid và xyantraniliprol (FIG. 1). Nhiệt độ nóng

chảy của axetamiprid xấp xỉ 98°C và nhiệt độ nóng chảy của xyantraniliprol là 217°C . Trục dọc (bên trái) của đường cong DSC là nhiệt lượng và trục ngang là nhiệt độ.

Nhiều xạ bột tia X (XRD) của sản phẩm rắn, axetamiprid, và xyantraniliprol được đo, và các kết quả của chúng được thể hiện trên các FIG. 3 đến 5. Trục dọc là cường độ và trục ngang là góc nhiễu xạ. Có thể thấy rằng sản phẩm rắn có cấu trúc tinh thể khác với cấu trúc của axetamiprid và xyantraniliprol.

Do đó, được cho rằng sản phẩm rắn được tạo ra trong ví dụ 1 là đồng tinh thể trong đó axetamiprid và xyantraniliprol có mặt ở tỷ lệ mol xấp xỉ 1:1.

Ví dụ so sánh 1

4,7 phần khối lượng của axetamiprid và 10 phần khối lượng của xyantraniliprol được trộn khô để thu được hỗn hợp. Hỗn hợp được đo DSC và kết quả của chúng được thể hiện trên FIG. 2. Hỗn hợp gồm axetamiprid và xyantraniliprol bắt đầu nóng chảy ở xấp xỉ 94°C và thể hiện đặc tính khác với đặc tính của đồng tinh thể.

Ví dụ 2

10 phần khối lượng axetamiprid, 21 phần khối lượng xyantraniliprol, 1,0 phần khối lượng natri dialkylsulfosuxinat, 4 phần khối lượng polyoxyetylen glycol tristyryl phenyl ete, 0,8 phần khối lượng natri lignin sulfonat, 0,55 phần khối lượng chất bảo quản và chất chống tạo bọt, và 62,7 phần khối lượng nước được trộn lẫn, hỗn hợp được gia nhiệt ở 60°C trong 30 phút trong khi khuấy hỗn hợp, và sau đó sản phẩm thu được được làm mát đến nhiệt độ trong phòng. Sau đó, sản phẩm thu được được phun ướt để thu được chế phẩm huyền phù cô đặc A (chế phẩm cô đặc lơ lửng trong nước). Chế phẩm huyền phù cô đặc A thu được được lọc một phần, và rửa bằng nước để thu được tinh thể. Tinh thể thu được được đo DSC và XRD để xác nhận rằng phổ của tinh thể thu được là giống với phổ của đồng tinh thể thu được trong Ví dụ 1.

Ví dụ 3

Chế phẩm huyền phù cô đặc A thu được trong Ví dụ 2 được pha loãng 4000 lần bằng nước để thu được chất xử lý (lượng thành phần hoạt tính của axetamiprid: 25ppm, lượng thành phần hoạt tính của xyantraniliprol: 50 ppm).

Cắt các lá phía trên của dưa chuột trong khi vẫn giữ lại những chiếc lá thật đầu tiên của chúng, và lượng đủ của chất xử lý được phun trên lá đó bằng bình phun đeo

vai. Rabiden 3S pha loãng 5000 lần được sử dụng làm chất lan rộng. Sau khi số ngày định trước đã trôi qua, ba con rệp hại bông trưởng thành được thả vào mỗi bình. Số ấu trùng rệp hại bông được đếm năm ngày sau khi thả rệp hại bông trưởng thành. Phun mỗi chất lên 6 bình, chia các bình thành hai nhóm mỗi nhóm gồm 3 bình, và trao đổi các nhóm ở mỗi lần thả côn trùng để thực hiện việc thả côn trùng có chu kỳ ngắn. Các kết quả được nêu trong Bảng 1.

Ví dụ so sánh 2 - Ví dụ so sánh 4

Mỗi thí nghiệm được thực hiện theo cách giống Ví dụ 3, ngoại trừ chất SP MOSPILAN (nhãn hiệu đã đăng ký) được pha loãng với nước (lượng thành phần hoạt tính acetamiprid: 25 ppm), chất SC VERIMARK (nhãn hiệu đã đăng ký) được pha loãng với nước (lượng thành phần hoạt tính xyantraniliprol: 50 ppm), hoặc chất hỗn hợp trong bình gồm MOSPILAN (nhãn hiệu đã đăng ký) và VERIMARK (nhãn hiệu đã đăng ký) (lượng thành phần hoạt tính axetamiprid: 25 ppm, lượng thành phần hoạt tính xyantraniliprol: 50 ppm) được sử dụng làm chất xử lý. Các kết quả được nêu trong bảng 1.

Bảng 1

	Chất xử lý	% tỷ lệ kiểm soát 5 ngày sau khi thả côn trùng					
		Thả côn trùng 3 ngày sau khi phun	Thả côn trùng 6 ngày sau khi phun	Thả côn trùng 11 ngày sau khi phun	Thả côn trùng 14 ngày sau khi phun	Thả côn trùng 19 ngày sau khi phun	Thả côn trùng 24 ngày sau khi phun
Ví dụ 3	Chế phẩm huyền phù cô đặc A	100	100	100	100	97,3	90,1
Ví dụ so sánh 2	MOSPILAN SP	65,9	26,5	22,5	0	0	0
Ví dụ so sánh 3	VERIMARK SC	100	98,3	92,1	93,3	88,4	38,9
Ví dụ so sánh 4	Hỗn hợp trong bình chứa gồm MOSPILAN SP và VERIMARK SC (vô định hình)	100	100	90,1	89,5	66,2	56,2

Tỷ lệ kiểm soát (%) = 100 – (Số côn trùng trưởng thành trên khu vực được xử lý / Số côn trùng trưởng thành trên khu vực không được xử lý) x 100

Như rõ ràng từ bảng 1, hiệu quả còn lại của chế phẩm huyền phù cô đặc A chứa đồng tinh thể gồm axetamiprid và xyantraniliprol trội hơn hiệu quả của các chất đơn lẻ MOSPILAN và VERIMARK, và chất hỗn hợp trong bình trong đó không tạo thành tinh thể, nồng độ thành phần hoạt tính của chúng là giống với của chế phẩm huyền phù cô đặc A, và tính vượt trội về hiệu quả thể hiện bởi việc tạo ra đồng tinh thể được xác nhận.

Ví dụ 4

1kg hạt cải dầu và 40g chế phẩm huyền phù cô đặc A được chuẩn bị trong Ví dụ 2 được cho vào túi nhựa (túi trong suốt được làm từ màng polyetylen), được trộn để làm cho chế phẩm huyền phù cô đặc A bám dính đồng đều vào bề mặt hạt, và sau đó sấy khô sản phẩm thu được để thu được hạt trong đó 3,9 ga.i axetamiprid/kg hạt và 8,2 ga.i xyantraniliprol/kg hạt bám dính đồng đều vào bề mặt hạt. Cho đất sét đỏ đã rây lên bình poly 9cm (bình làm bằng polyvinyl clorua) và 4 hạt cải dầu được gieo vào đó. Sau khi tất cả các hạt nảy mầm, chỉ giữ lại 3 cây giống. Sau khi số ngày định trước đã trôi qua, ba con rệp ở cây đào xanh trưởng thành được thả vào mỗi bình. Trong trường hợp khi lá của cây con tăng lên, khoảng 1,5 lá từ đỉnh của cây con vẫn còn và các lá thấp hơn được cắt để dễ kiểm tra và quản lý, và các bình trong đó côn trùng được thả được phủ lưới thoát nước để ngăn sự trốn thoát của côn trùng và sự tấn công của kẻ thù tự nhiên. Số ấu trùng rệp ở cây đào xanh được đếm 5 đến 6 ngày sau khi thả côn trùng. Các kết quả được nêu trong bảng 2.

Ví dụ so sánh 5 - Ví dụ so sánh 7

Mỗi thí nghiệm được thực hiện theo cách giống Ví dụ 4, ngoại trừ MOSPILAN (nhãn hiệu đã đăng ký) SP, VERIMARK (nhãn hiệu đã đăng ký) SC, hoặc bình hỗn hợp của MOSPILAN (nhãn hiệu đã đăng ký) và VERIMARK (nhãn hiệu đã đăng ký) được sử dụng thay cho chế phẩm huyền phù cô đặc A, và hạt cải dầu trong đó lượng bám dính của axetamiprid là 4,0 ga.i/Kg hạt, lượng bám dính của xyantraniliprol là 8,0 ga.i/Kg hạt, hoặc lượng bám dính tương ứng của axetamiprid và xyantraniliprol độc lập là 3,9 ga.i/Kg hạt và 8,0 ga.i/Kg hạt, được sử dụng. Các kết quả được nêu trong bảng 2.

Bảng 2

	Chất xử lý	% Tỷ lệ kiểm soát 5-6 ngày sau khi thả côn trùng			
		Thả côn trùng 8 ngày sau khi gieo hạt	Thả côn trùng 13 ngày sau khi gieo hạt	Thả côn trùng 22 ngày sau khi gieo hạt	Thả côn trùng 35 ngày sau khi gieo hạt
Ví dụ 4	Chế phẩm huyền phù cô đặc A	100	90,3	95,9	86,4
Ví dụ so sánh 5	MOSPILAN SP	100	95,7	71,4	57,8
Ví dụ so sánh 6	VERIMARK SC	54,4	22,6	44,9	68,7
Ví dụ so sánh 7	Hỗn hợp trong bình chứa gồm MOSPILAN SP và VERIMARK SC (vô định hình)	100	89,2	67,3	57,1

Tỷ lệ kiểm soát (%) = 100 – (Số côn trùng trưởng thành trên khu vực được xử lý / Số côn trùng trưởng thành trên khu vực không được xử lý) x 100

Như thấy rõ trong bảng 2, trong trường hợp hạt được xử lý bằng chế phẩm huyền phù cô đặc A chứa đồng tinh thể được sử dụng, hiệu quả cao đối với rệp ở cây đào xanh được xác nhận ngay cả khi côn trùng được thả 35 ngày sau khi gieo hạt, hiệu quả này là vượt trội so với MOSPILAN SP, VERIMARK SC, hoặc hỗn hợp trong bình gồm MOSPILAN SP và VERIMARK SC (vô định hình).

Ví dụ 5

1kg hạt ngô và 7g chế phẩm huyền phù cô đặc A được chuẩn bị trong Ví dụ 2 được cho vào túi nhựa, được trộn lẫn để tạo chế phẩm huyền phù cô đặc A bám dính đồng đều vào bề mặt hạt, và sau đó sản phẩm thu được sấy khô để thu được hạt trong đó 0,6 ga.i axetamiprid/kg hạt và 1,4 ga.i xyantraniliprol/kg hạt bám dính đồng đều vào bề mặt hạt.

Theo cách tương tự, 1kg hạt ngô và 21g chế phẩm huyền phù cô đặc A được chuẩn bị trong Ví dụ 2 được cho vào túi nhựa, được trộn lẫn để làm cho chế phẩm huyền phù cô đặc A bám dính đồng đều vào bề mặt hạt và sau đó sấy khô sản phẩm thu được để thu được hạt trong đó 1,9 ga.i axetamiprid/kg hạt và 4,0 ga.i xyantraniliprol/kg hạt bám dính đồng đều vào bề mặt hạt.

Đặt miếng len bông và giấy lọc vào cốc anh đào (cốc làm bằng nhựa trong suốt) có miệng rộng 90mm, và rót 20ml nước máy vào trong đó. 5 hạt ngô được gieo vào trong đó, đặt nắp đậy lên cốc, và sau đó để yên cốc trong phòng có kiểm soát nhiệt độ (ở 25°C). Sau khi số ngày định trước đã trôi qua, đếm số hạt nảy mầm, và tỷ lệ nảy mầm trung bình (%) được tính toán. Độ dài của mầm và rễ của hạt đã nảy mầm 5 ngày sau khi gieo được đo, và tính toán giá trị trung bình của chúng. Các kết quả được nêu trong bảng 3.

Ví dụ so sánh 8

Thí nghiệm được thực hiện theo cách tương tự với cách ở Ví dụ 5, ngoại trừ 1kg hạt ngô được xử lý bằng MOSPILAN (nhãn hiệu đã đăng ký) SP ở lượng 0,7 ga.i/kg hạt hoặc 2,1 ga.i/kg hạt thay cho chế phẩm huyền phù cô đặc A và hạt có lượng bám dính là 0,6 ga.i/kg hạt hoặc 1,9 ga.i/kg hạt được sử dụng. Các kết quả được nêu trong bảng 3.

Bảng 3

	Chất xử lý	Lượng bám dính ga.i/kg hạt	Tỷ lệ nảy mầm trung bình (%)			Độ dài mầm (mm)	Độ dài rễ (mm)
			Sau 2 ngày	Sau 3 ngày	Sau 4 ngày		
Ví dụ 4	Chế phẩm huyền phù cô đặc A	0,6 + 1,4 (axetamiprid + xyantraniliprol)	73,3	100	100	23,5	69,9
		1,9 + 4,0 (axetamiprid + xyantraniliprol)	73,3	93,3	93,3	20,8	55,5
Ví dụ so sánh 8	MOSPILAN SP	0,6	40,0	93,3	93,3	17,4	43,9
		1,9	0,0	46,7	60,0	4,0	15,9
Đối chứng	Không xử lý		60,0	93,3	93,3	19,3	63,0

Như rõ ràng từ bảng 3, không có tác dụng nào được xác nhận đối với sự nảy mầm và phát triển sớm của hạt trên đó đồng tinh thể được bám dính (hạt được xử lý bằng chế phẩm huyền phù cô đặc A), và được xác nhận rằng tỷ lệ nảy mầm, độ dài của mầm và độ dài của rễ của chúng là giống với hạt không được xử lý. Ngược lại, việc giảm tỷ lệ nảy mầm và phát triển kém của hạt được xử lý bằng MOSPILAN SP được xác nhận. Do đó, rõ ràng là các tổn thương hóa học có thể được giảm nhờ tạo ra đồng tinh thể.

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Đồng tinh thể với điều kiện là thể hiện tác dụng diệt côn trùng tuyệt vời trong khoảng thời gian dài trong khi giảm thương tổn hóa học trên các loài thực vật hữu ích. Phương pháp để sản xuất công nghiệp đồng tinh thể cũng được đề xuất.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Đồng tinh thể gồm thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit, trong đó:
thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit là xyantranilinprol, clorantraniliprol, hoặc xyclaniliprol, và
thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit là axetamiprid.
2. Đồng tinh thể theo điểm 1, trong đó tỷ lệ mol của thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit với thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit nằm trong khoảng từ 0,3 đến 3.
3. Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo điểm 1 hoặc 2, phương pháp này bao gồm bước: tạo huyền phù thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc diamit và thành phần có hoạt tính diệt côn trùng gốc neonicotinoit trong dung môi để thu được huyền phù; và gia nhiệt và khuấy huyền phù này.
4. Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo điểm 3, trong đó nhiệt độ gia nhiệt là cao hơn hoặc bằng 40°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi.
5. Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo điểm 4, trong đó nhiệt độ gia nhiệt là cao hơn hoặc bằng 60°C nhưng thấp hơn hoặc bằng nhiệt độ sôi của dung môi.
6. Phương pháp tạo ra đồng tinh thể theo điểm bất kỳ trong các điểm từ 3 đến 5, trong đó dung môi là nước.
7. Chế phẩm hóa nông chứa đồng tinh thể theo điểm 1 hoặc 2.
8. Chế phẩm hóa nông theo điểm 7, trong đó chế phẩm hóa nông là thuốc diệt côn trùng.
9. Chất xử lý hạt chứa đồng tinh thể theo điểm 1 hoặc 2.
10. Chất xử lý hạt theo điểm 9, trong đó chất xử lý hạt là chế phẩm cô đặc lơ lửng trong nước.
11. Phương pháp xử lý hạt, phương pháp này bao gồm bước: phủ hạt bằng chế phẩm hóa nông chứa đồng tinh thể theo điểm 1 hoặc 2.

Fig. 1

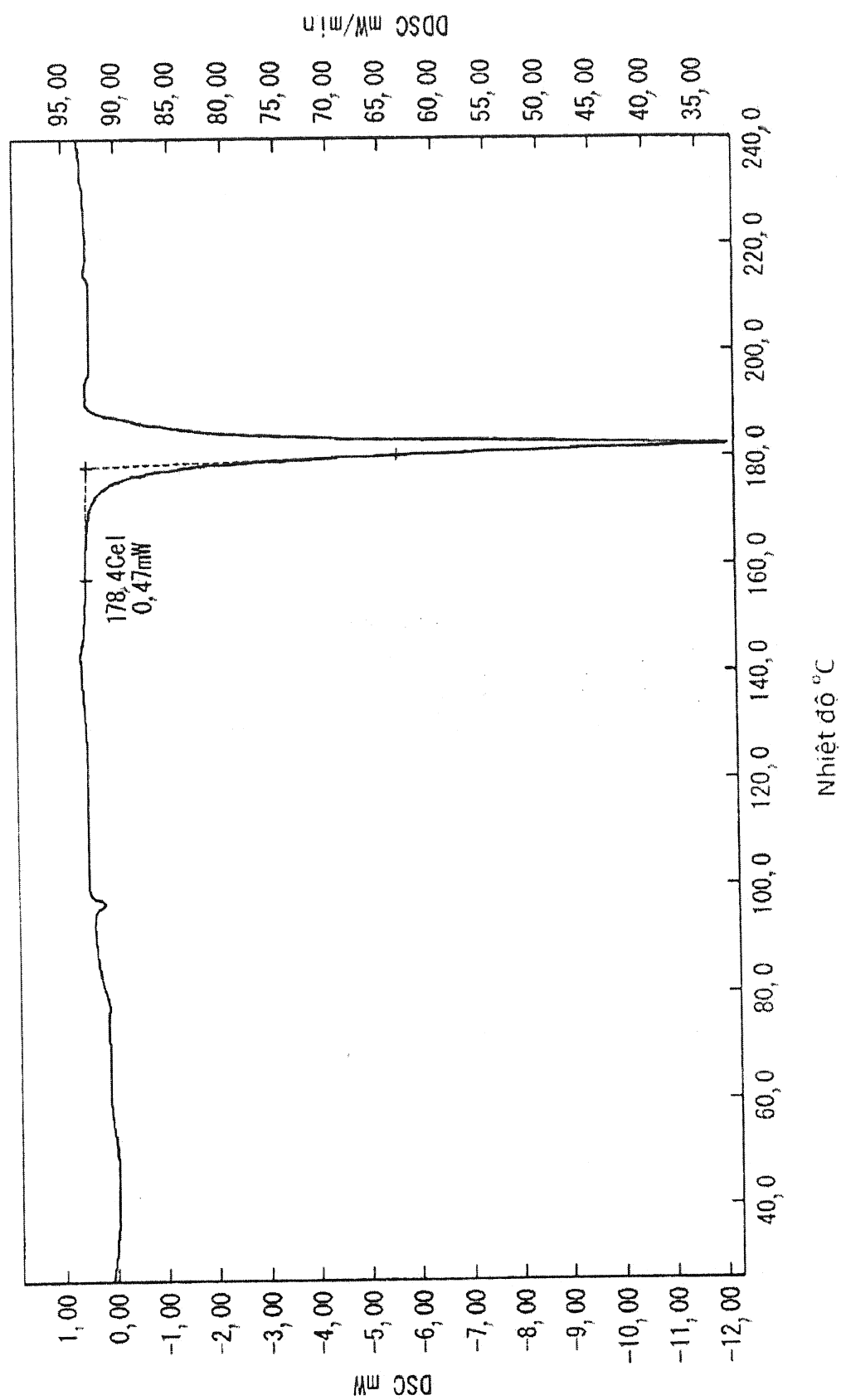


Fig. 2

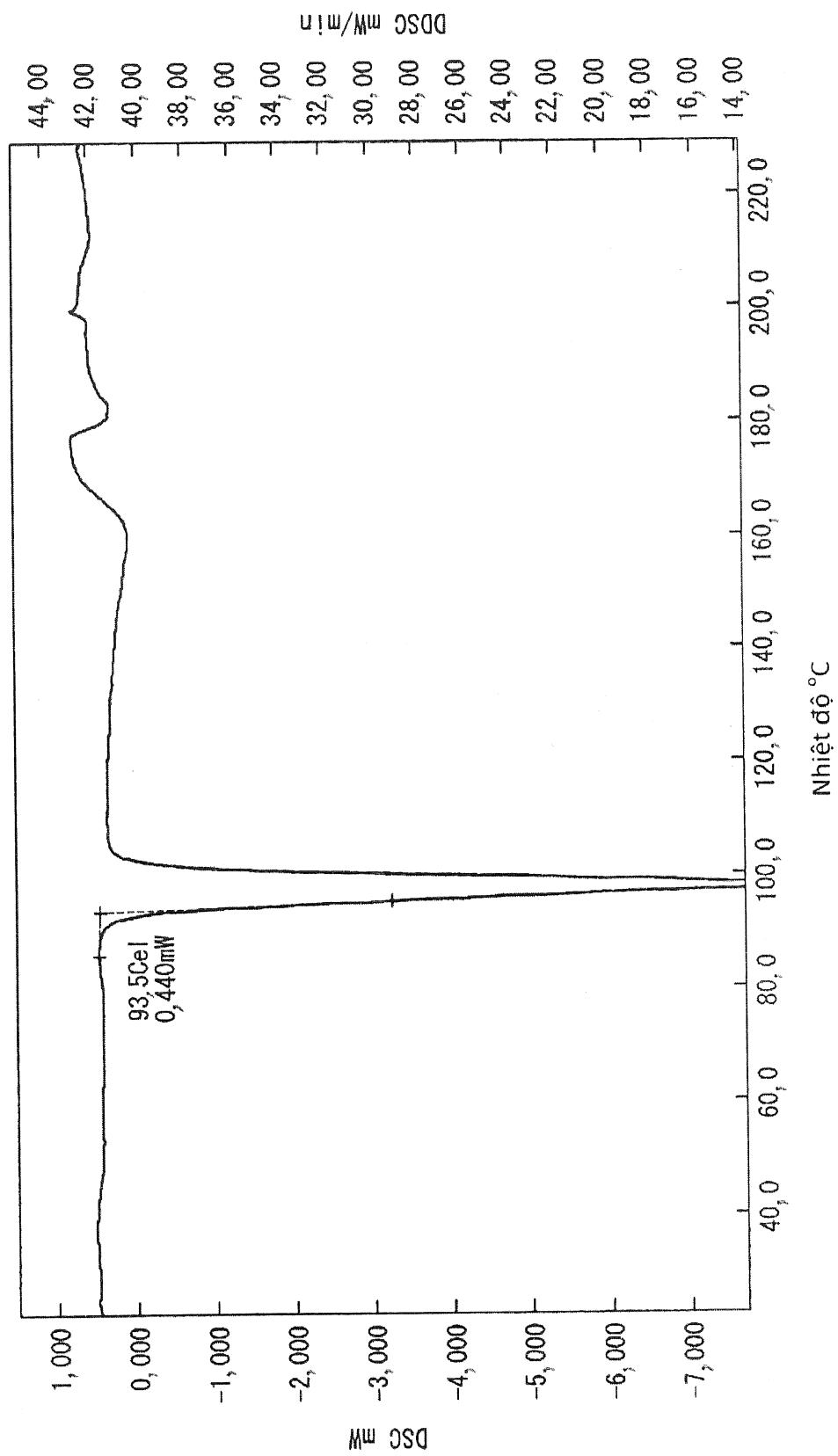


Fig. 3

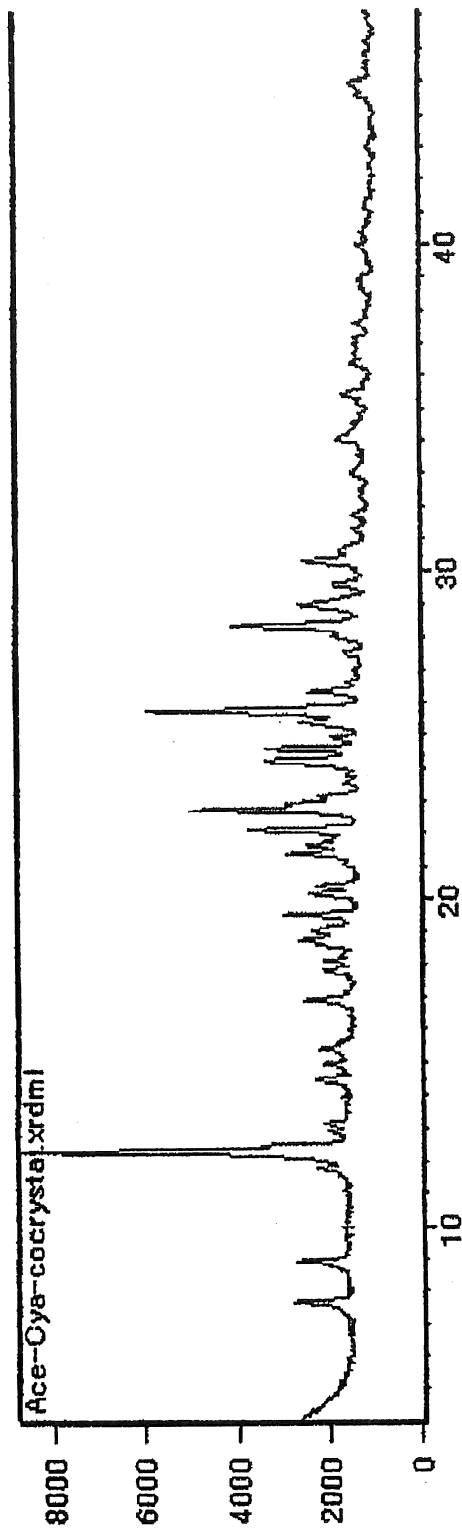


Fig. 4

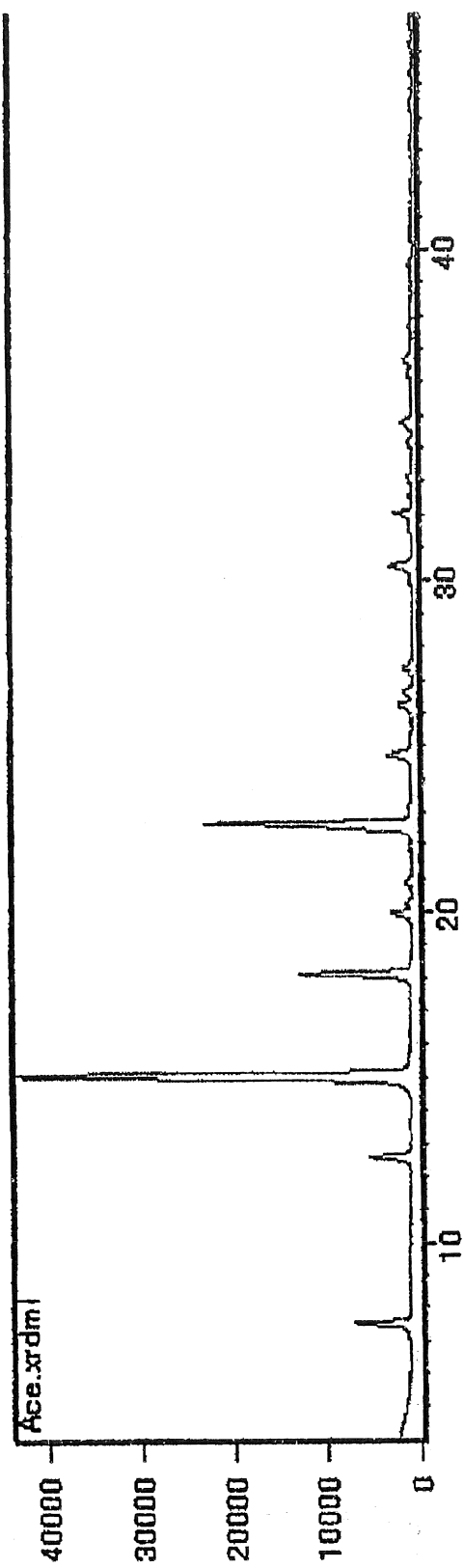


Fig. 5

