



(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)



1-0041819

(51)⁸ C07D 413/04; A01N 47/02; A01P 7/02; (13) B
A01P 7/04; A01N 43/76; A01P 17/00

(21) 1-2018-02989

(22) 12/12/2016

(86) PCT/JP2016/086849 12/12/2016

(87) WO 2017/104592 A1 22/06/2017

(30) 2015-244909 16/12/2015 JP

(45) 25/11/2024 440

(43) 25/09/2018 366A

(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)

27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 Japan

(72) MIYAMOTO, Takashi (JP); TAKEBAYASHI, Kosuke (JP).

(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

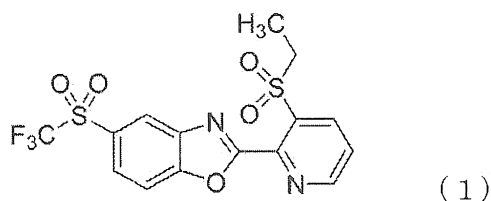
(54) 2-(3-ETANSULFONYLPYRIDIN-2-YL)-5

(TRIFLOMETANSULFONYL)BENZOXAZOL Ở DẠNG TINH THỂ VÀ
PHƯƠNG PHÁP ĐIỀU CHẾ HỢP CHẤT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến 2-(3-etansulfonylpyridin-2-yl)-5-(triflometansulfonyl)benzoxazol ở dạng tinh thể loại 2 có các đỉnh nhiễu xạ tại $2\theta = 14,0 \pm 0,2^\circ$, $14,3 \pm 0,2^\circ$, $16,5 \pm 0,2^\circ$, $16,9 \pm 0,2^\circ$, $17,6 \pm 0,2^\circ$, $18,8 \pm 0,2^\circ$, $19,9 \pm 0,2^\circ$, và $22,3 \pm 0,2^\circ$ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α là tinh thể ổn định. Sáng chế cũng đề cập đến phương pháp điều chế hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến 2-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl)-5-(trifluoromethylsulfonyl)benzoxazol ở dạng tinh thể (sau đây được gọi là "Hợp chất (1)") có công thức (1) dưới đây



có tác dụng phòng ngừa chống lại loài gây hại.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

WO 2014/104407 mô tả rằng hợp chất (1) có tác dụng phòng ngừa chống lại loài gây hại.

Tinh thể của hợp chất (1) được bào chế trong ví dụ bào chế 3 và ví dụ bào chế 17(5) trong WO 2014/104407 là tinh thể có các đỉnh nhiễu xạ tại $2\theta = 13,7 \pm 0,2^\circ$, $16,2 \pm 0,2^\circ$, $16,6 \pm 0,2^\circ$, $17,1 \pm 0,2^\circ$, $18,8 \pm 0,2^\circ$, $20,2 \pm 0,2^\circ$, $21,4 \pm 0,2^\circ$, và $27,6 \pm 0,2^\circ$ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α (sau đây được gọi là "tinh thể loại 1"), và có các đỉnh nhiễu xạ như được thể hiện trong bảng 1.

[Bảng 1]

Giá trị 2θ ($^\circ$)	Giá trị d (Å)	Cường độ tương đối (%)
13,7	6,4586	25,6
16,1	5,5075	22,8
16,6	5,3235	35,1
17,1	5,1872	22,3
18,8	4,7111	16,6
20,2	4,3968	56,4
21,4	4,1448	100
27,6	3,2338	44,6

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề xuất hợp chất (1) ở dạng tinh thể ổn định hơn.

Hợp chất (1) có nhiều dạng tinh thể khác nhau, và một vài tinh thể mà khác biệt so với số còn lại khi xét về dạng tinh thể có thể được bào chế bằng cách chọn dung

môi được sử dụng trong sự tái kết tinh hoặc nhiệt độ trong sự kết tinh một cách phù hợp (ví dụ, các ví dụ đối chứng 1 đến 3). Theo sáng chế, tinh thể có các đỉnh nhiễu xạ tại $2\theta = 14,0 \pm 0,2^\circ$, $14,3 \pm 0,2^\circ$, $16,5 \pm 0,2^\circ$, $16,9 \pm 0,2^\circ$, $17,6 \pm 0,2^\circ$, $18,8 \pm 0,2^\circ$, $19,9 \pm 0,2^\circ$, và $22,3 \pm 0,2^\circ$ (sau đây được gọi là "tinh thể loại 2") là tinh thể ổn định của hợp chất (1).

Sử dụng tinh thể ổn định có thể ngăn chặn sự giảm tác dụng phòng ngừa chống lại loài gây hại.

Tinh thể loại 2 có thể được bào chế bằng cách hòa tan tinh thể loại 1 vào trong 2-propanol, sau đó làm kết tủa tinh thể tại nhiệt độ là 65 đến 67°C.

Theo cách khác, tinh thể loại 2 còn có thể được bào chế bằng cách tái kết tinh từ dung môi khác ngoài 2-propanol (ví dụ, dung môi hỗn hợp của xylen và n-heptan) khi có mặt mầm tinh thể của tinh thể loại 2.

Mô tả vắn tắt các hình vẽ

Fig.1 thể hiện sự nhiễu xạ bột tia X của tinh thể loại 1 của hợp chất (1). Fig.2 thể hiện sự nhiễu xạ bột tia X của tinh thể loại 2 của hợp chất (1). Fig.3 thể hiện sự nhiễu xạ bột tia X của tinh thể loại 3 của hợp chất (1). Fig.4 thể hiện sự nhiễu xạ bột tia X của tinh thể loại 4 của hợp chất (1). Fig.5 thể hiện sự nhiễu xạ bột tia X của tinh thể loại 5 của hợp chất (1).

Mô tả chi tiết sáng chế

Trong bản mô tả sáng chế, các điều kiện cho sự nhiễu xạ bột tia X là như sau.

(Các điều kiện đo)

Thiết bị nhiễu xạ bột tia X: SmartLab (do Rigaku Corporation sản xuất)

Đầu ra tia X: $\text{CuK}\alpha$, 45 kV, 200 mA

Khoảng lấy mẫu: $0,02^\circ$

Phạm vi quét: 5° đến 50°

Tinh thể loại 1 có thể được bào chế bằng cách cô đặc dung dịch của hợp chất (1) trong etyl axetat hoặc clobenzen dưới áp suất giảm, sau đó sấy khô phần dư thu được.

Theo cách khác, tinh thể loại 1 còn có thể được bào chế bằng cách bổ sung dung môi yếu như n-heptan vào dung dịch của hợp chất (1) trong xylen, sau đó làm mát hỗn hợp thu được.

Sáng chế đề cập đến hợp chất (1) ở dạng tinh thể loại 2 mà là tinh thể ổn định hơn. Phương pháp điển hình bào chế tinh thể loại 2 được mô tả dưới đây qua các ví dụ.

- 1) Các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) được hòa tan hoàn toàn vào trong 2-propanol (6 đến 7 phần trọng lượng) ở 70°C đến 82°C.
- 2) Dung dịch trên ở 70°C đến 82°C được làm mát từ từ (ví dụ, với tốc độ là 3°C/giờ) để làm kết tủa các tinh thể ở 65°C đến 67°C. Nếu tinh thể không được làm kết tủa, một phần 2-propanol có thể được làm bay hơi để giảm lượng 2-propanol, và sau đó dung dịch có thể lại được làm mát từ từ.
- 3) Các tinh thể đã kết tủa được lọc và sấy khô để bào chế các tinh thể loại 2.

Tinh thể loại 2 còn có thể được bào chế bằng cách bổ sung mầm tinh thể của tinh thể loại 2 vào dung dịch siêu bão hòa của hợp chất (1), sau đó duy trì nhiệt độ tương tự hoặc làm mát từ từ dung dịch (ví dụ, với tốc độ là 3°C/giờ). Các ví dụ của dung môi được sử dụng trong sự kết tinh bao gồm 2-propanol, dung môi hỗn hợp của xylen và n-heptan với tỷ lệ trọng lượng là 1:1, và dung môi hỗn hợp của xylen và n-heptan với tỷ lệ trọng lượng là 7:3. Nhiệt độ để làm kết tủa tinh thể là từ 55°C đến 82°C.

Ngoài ra, lượng dung môi để làm kết tủa tinh thể loại 2 thường nằm trong khoảng từ 3 đến 20 phần trọng lượng đối với 1 phần trọng lượng của hợp chất (1).

Lượng mầm tinh thể sử dụng để bào chế tinh thể loại 2 thường là từ 0,001 đến 10% trọng lượng, ưu tiên là từ 0,005 đến 1% trọng lượng đối với 1 phần trọng lượng của hợp chất (1).

Chế phẩm thuốc trừ sâu chứa tinh thể loại 2 (sau đây được gọi là "chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế") là ổn định hơn so với chế phẩm thuốc trừ sâu chứa tinh thể có dạng tinh thể khác của hợp chất (1).

Chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế chứa tinh thể loại 2 và chất mang trợ. Các

ví dụ của chất mang trợ bao gồm các chất mang rắn và các chất mang lỏng.

Các ví dụ của các chất mang rắn bao gồm các bột mịn hoặc các hạt đất sét (ví dụ, đất sét cao lanh, đất tảo cát, bentonit, đất sét Fubasami, đất sét pyrophyllit, hoặc đất sét axit trắng), silic oxit tổng hợp được hydrat hóa, bột talc, gôm, các khoáng chất vô cơ khác (ví dụ, sericit, thạch anh, lưu huỳnh, cacbon hoạt tính, canxi cacbonat, hoặc silic oxit được hydrat hóa), các chất rắn cho phân bón (ví dụ, amoni sulfat, amoni phosphat, amoni nitrat, urê, hoặc amoni clorua), và các chất khác. Các ví dụ của các chất mang lỏng bao gồm nước và các hydrocacbon béo (ví dụ, dầu hỏa hoặc dầu nhẹ).

Các ví dụ của loài gây hại mà có thể được phòng ngừa bởi chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế bao gồm các động vật chân đốt gây hại (ví dụ, các côn trùng gây hại hoặc bọ ve bét gây hại), các động vật thân mềm gây hại (ví dụ, động vật thân nhuyễn Gastropoda gây hại), và giun tròn Nematoda gây hại (giun tròn), và các ví dụ điển hình của chúng bao gồm như sau.

Bộ Cánh nửa (Hemiptera): rầy xám (*Laodelphax striatellus*), rầy nâu (*Nilaparvata lugens*), rầy lưng trắng (*Sogatella furcifera*), rầy xanh (*Nephotettix cincticeps*), rầy xanh hại lúa (*Nephotettix virescens*), rầy xanh hại chè (*Empoasca onukii*), rầy mềm (*Aphis gossypii*), rệp vùng đào xanh (*Myzus persicae*), rệp bắp cải (*Brevicoryne brassicae*), rệp muội xanh (*Aphis spiraecola*), rệp khoai tây (*Macrosiphum euphorbiae*), rệp cây mao (*Aulacorthum solani*), rệp muội hại ngô (*Rhopalosiphum padi*), rệp muội đen (*Toxoptera citricidus*), rệp mận (*Hyalopterus pruni*), bọ xít xanh (*Nezara antennata*), bọ xít nâu (*Eysarcoris parvus*), bọ xít đen (*Halyomorpha mista*), rệp đậu (*Riptortus clavatus*), rệp lúa (*Leptocorisa chinensis*), rệp lá lúa (*Trigonotylus caelestialium*), bọ xít hại lúa (*Stenotus rubrovittatus*), bọ phấn bắp cải (*Trialeurodes vaporariorum*), bọ phấn (*Bemisia tabaci*), bọ phấn trắng (*Dialeurodes citri*), bọ phấn đen viền trắng (*Aleurocanthus spiniferus*), rệp sáp (*Aonidiella aurantii*), rệp sáp vảy (*Comstockaspis perniciosus*), rệp dính (*Unaspis citri*), rệp sáp đỏ (*Ceroplastes rubens*), rệp sáp bông (*Icerya purchasi*), rệp phấn trắng (*Planococcus kraunhiae*), bọ cánh cứng đuôi dài (*Pseudococcus longispinis*), rệp đào (*Pseudaulacaspis pentagona*), rầy chổng

cánh (*Diaphorina citri*), rầy lá lê (*Psylla pyrisuga*), rầy khoai tây cà chua (*Bactelricerca cockerelli*), rệp cây (*Stephanitis nasi*), rệp giường (*Cimex lectularius*), và các loài khác.

Bộ Cánh vẩy: sâu bướm đục thân lúa (*Chilo suppressalis*), sâu bướm đục thân vàng (*Tryporyza incertulas*), sâu bướm đục lá lúa (*Cnaphalocrocis medinalis*), sâu bướm cuốn lá (*Notarcha derogata*), ngài Ấn Độ (*Plodia interpunctella*), sâu bướm đục thân ngô châu Á (*Ostrinia furnacalis*), sâu bướm kéo màng bắp cải (*Hellula undalis*), sâu bướm kéo màng lá xanh (*Pediasia teterrellus*), sâu bướm đục lá bông (*Spodoptera litura*), sâu bướm cắn gié củ cải đường (*Spodoptera exigua*), sâu bướm cắt tai (*Pseudaletia separata*), sâu bướm xanh đục bắp (*Mamestra brassicae*), sâu bướm đen (*Agrotis ipsilon*), sâu đo châu Á (*Plusia nigrisigna*), sâu bướm trắng nhỏ (*Pieris rapae*), sâu bướm hại quả phượng đông (*Grapholita molesta*), sâu bướm đục vỏ đậu tương (*Leguminivora glycinivorella*), sâu bướm hại đậu đỗ (*Matsumuraeses azukivora*), sâu bướm cuốn lá trái cây mùa hè (*Adoxophyes orana fasciata*), sâu bướm cuốn lá chè nhỏ (*Adoxophyes honmai*), sâu bướm cuốn lá chè phượng đông (*Homona magnanima*), sâu bướm cuốn lá (*Archips fuscocupreanus*), sâu bướm hại táo (*Cydia pomonella*), sâu bướm cuốn lá chè (*Caloptilia theivora*), sâu bướm ăn lá táo (*Phyllonorycter ringoneella*), sâu bướm hại đào (*Carposina niponensis*), sâu bướm đuôi chuông (*Plutella xylostella*), sâu hồng hại bông (*Pectinophora gossypiella*), sâu bướm ống hại khoai tây (*Phthorimaea operculella*), sâu kéo màng mùa thu (*Hyphantria cunea*), và các loài khác.

Bộ Cánh vẩy: bọ trĩ (*Frankliniella occidentalis*), bọ lạch (*Thrips parvi*), bọ trĩ hại sen (*Scirtothrips dorsalis*), bọ trĩ hành (*Thrips tabaci*), bọ trĩ hại rau (*Frankliniella intonsa*), và các loài khác.

Bộ Hai cánh: ruồi mằm đậu (*Delia platura*), ruồi hại củ (*Delia antiqua*), ruồi hại lúa (*Agromyza oryzae*), ruồi đục lá (*Hydrellia griseola*), ruồi đục lá rau (*Liriomyza sativae*), ruồi hại cà chua (*Liriomyza trifolii*), ruồi đục lá lớn (*Chromatomyia horticola*), ruồi nâu hại lúa (*Clops oryzae*), ruồi đục quả phượng Đông (*Dacus*

cucurbitae), ruồi vàng đục quả (*Ceratitis capitata*), ruồi lưng gù (*Megaselia spiracularis*), ruồi cống (*Clogmia albipunctata*), và các loài khác.

Bộ Cánh cứng: bọ bắp phương Tây (*Diabrotica virgifera virgifera*), bọ hại ngô (*Diabrotica undecimpunctata howardi*), bọ ăn lá lúa (*Oulema oryzae*), bọ ăn lá bí (*Aulacophora femoralis*), bọ hại rau (*Phyllotreta striolata*), bọ khoai tây (*Leptinotarsa decemlineata*), bọ cánh cam (*Anomala cuprea*), bọ đậu tương (*Anomala rufocuprea*), bọ cánh cứng Nhật Bản (*Popillia japonica*), mọt hại ngô (*Sitophilus zeamais*), mọt đầu dài hại lúa (*Echinocnemus squameus*), mọt nước hại lúa (*Lissorhoptrus oryzophilus*), mọt vòi voi (*Sphenophorus venatus*), bọ đục quả bông (*Anthonomus grandis*), bọ rùa (*Epilachna vigintioctopunctata*), mọt gỗ (*Lyctus brunneus*), bọ thông (*Tomicus piniperda*), bọ râu dài Nhật Bản (*Anoplophora malasiaca*), bọ vằn (*Agriotes ogurae fuscicollis*), họ Bỏ củi (*Agriotes* spp.), kiến ba khoang (*Paederus fuscipes*), và các loài khác.

Bộ Cánh thẳng: châu chấu di cư (*Locusta migratoria*), dế chũi (*Gryllotalpa africana*), cào cào lúa (*Oxya yezoensis*), cào cào lúa Nhật Bản (*Oxya japonica*), và các loài khác.

Bộ Cánh màng: ong ăn lá (*Athalia rosae*), ong ăn lá Nhật Bản (*Athalia japonica*), và các loài khác.

Mối: *Reticulitermes speratus*, mối đất Đài Loan (*Coptotermes formosanus*), mối gỗ ướt phương Tây (*Incisitermes minor*), mối gỗ khô (*Cryptotermes domesticus*), mối cánh đen (*Odontotermes formosanus*), mối gỗ ướt (*Neotermes koshunensis*), (*Glyptotermes satsumensis*), mối Nhật Bản (*Glyptotermes nakajimai*), mối ăn lá (*Glyptotermes fuscus*), mối gỗ (*Glyptotermes kodamai*), mối Nhật Bản (*Glyptotermes kushimensis*), mối ăn gỗ (*Hodotermopsis japonica*), mối đất Quảng Châu (*Coptotermes guangzhouensis*), mối cánh (*Reticulitermes miyatakei*), mối trắng (*Reticulitermes flaviceps amamianus*), Họ mối đất phương Tây (*Reticulitermes* sp.), mối bậc cao ăn gỗ (*Nasutitermes takasagoensis*), mối đất (*Pericapritermes nitobei*), mối đất Nhật Bản (*Sinocapritermes mushae*), và các loài khác.

Ve bét: ve hai đốm (*Tetranychus urticae*), ve đỏ hại trà (*Tetranychus kanzawai*), ve đỏ

hại cam quýt (*Panonychus citri*), ve đỏ hại quả (*Panonychus ulmi*), nhện sét hại cam hồng (*Aculops pelekassi*), ve sét hại cam quýt (*Phyllocoptruta citri*), ve nâu hại cà chua (*Aculops lycopersici*), ve trà tím (*Calacarus carinatus*), ve sét hại trà (*Acaphylla theavagrans*), ve sét hại đào (*Eriophyes chibaensis*), ve sét hại táo (*Aculus schlechtendali*), ve thân lớn (*Polyphagotarsonemus latus*), ve béo đỏ đen (*Brevipalpus phoenicis*), ve phó mát (*Tyrophagus putrescentiae*), ve trắng (*Tyrophagus similis*), ve bụi (*Dermatophagoides farinae*), ve bụi nhà (*Dermatophagoides pteronyssinus*), và các loài khác.

Rết: rết nhà Nhật Bản (*Thereuonema hilgendorfi*), rết Việt Nam (*Scolopendra subspinipes*), và các loài khác.

Cuốn chiếu: cuốn chiếu nhà xanh (*Oxidus gracilis*), cuốn chiếu thân đốt (*Nedyopus tambanus*), và các loài khác.

Bộ Chân đều: bộ cuốn (*Armadillidium vulgare*) và các loài khác.

Động vật thân nhuyễn: sên cây (*Limax marginatus*), sên vàng (*Limax flavus*), và các loài khác.

Giun tròn: giun tròn hại lá (*Aphelenchoides besseyi*), giun tròn hại rễ (*Nothotylenchus acris*), giun tròn sưng rễ phương Nam (*Meloidogyne incognita*), giun tròn sưng rễ phương Bắc (*Meloidogyne hapla*), giun tròn hại cà chua (*Meloidogyne javanica*), giun tròn hại đậu nành (*Heterodera glycines*), giun tròn bào nang ánh vàng khoai tây (*Globodera rostochiensis*), giun tròn hại chuối (*Pratylenchus coffeae*), giun tròn hại gốc (*Pratylenchus neglectus*), và các loài khác.

Các ví dụ của chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế bao gồm các dạng bào chế được phân loại như dung dịch cô đặc huyền phù trong nước, các bột ướt, các hạt phân tán được trong nước, hoặc các hạt.

Các ví dụ của phương pháp phòng ngừa loài gây hại sử dụng chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế bao gồm phương pháp bao gồm bước áp dụng lượng hữu hiệu của chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế cho tán lá của thực vật hoặc đất mà là nơi trồng thực vật, và các ví dụ điển hình của chúng bao gồm xử lý tán lá của thực vật như áp

dụng cho tán lá, xử lý đất, và xử lý quy trình trồng thực vật như phương pháp xử lý thủy canh. Chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được áp dụng một hoặc hai hoặc nhiều lần.

Các ví dụ điển hình của quy trình xử lý tán lá của thực vật bao gồm phương pháp xử lý bao gồm bước áp dụng chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế cho bề mặt của thực vật như áp dụng cho tán lá và áp dụng cho gốc. Các ví dụ của quy trình xử lý đất bao gồm phun vào đất, kết hợp đất, và tưới đất bằng các hóa chất lỏng. Các ví dụ của chỗ được xử lý bao gồm các lỗ trồng, các hàng trồng, vùng lân cận của các lỗ trồng, vùng lân cận của các hàng trồng, toàn bộ diện tích của khu đất trồng, các phần cơ bản của thực vật, các không gian giữa các hàng, các không gian bên dưới gốc, các gân giữa các gốc chính, đất trồng, các hộp mầm, các khay mầm, và cây mầm. Các ví dụ của thời gian xử lý trong suốt giai đoạn gieo mầm sơ bộ, giai đoạn gieo mầm, các giai đoạn ngay sau khi gieo mầm, và trong suốt thời gian sinh trưởng bao gồm các giai đoạn nảy mầm, các giai đoạn trồng sơ bộ, giai đoạn trồng, và giai đoạn sau khi trồng. Các ví dụ của phương pháp xử lý thủy canh bao gồm bơm vào trong các phương tiện tưới nước (ống chống tưới nước, ống dẫn tưới nước, bình tưới nước, và tương tự), sự kết hợp thành chất lỏng để tưới không gian giữa các hàng, và sự kết hợp thành phương pháp thủy canh.

Khi chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được sử dụng để ngăn ngừa loài gây hại, liều áp dụng của tinh thể loại 2 thường là từ 1 đến 10000g trên 10000m². Dung dịch cô đặc huyền phù trong nước hoặc tương tự thường được áp dụng bằng cách pha loãng với nước theo cách mà nồng độ của tinh thể loại 2 nằm trong khoảng từ 0,01 đến 10000ppm.

Khi chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được áp dụng cho lúa nước, liều áp dụng của tinh thể loại 2 thường là từ 0,1 đến 10g trên hộp mầm (kích thước bên trong: 28cm × 58cm). Tinh thể loại 2 được áp dụng bằng cách pha loãng nó với nước theo cách mà nồng độ của nó nằm trong khoảng từ 0,01 đến 10000ppm, hoặc chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được áp dụng trực tiếp cho hộp mầm.

Chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế có thể được sử dụng trong đất nông nghiệp mà ở đó nhiều thực vật khác nhau được trồng. Ví dụ, chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế hoặc sự pha loãng của nó với nước có thể được sử dụng trong đất nông nghiệp mà ở đó thực vật sau đây được trồng.

Cây trồng: ngô, lúa, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, lúa miến, bông, đậu tương, đậu phụng, kiều mạch, củ cải đường, hạt cải dầu, hướng dương, mía đường, thuốc lá, và các cây khác;

Rau củ: Họ Cà (ví dụ, cà tím, cà chua, ớt anh đào, hạt tiêu, hoặc khoai tây), Họ Bầu bí (ví dụ, dưa chuột, bí ngô, bí, dưa hấu, hoặc dưa gang), Họ Củ cải (ví dụ, củ cải Nhật Bản, củ cải trắng, cải ngựa, su hào, bắp cải Trung Quốc, bắp cải, lá mù tạc, bông cải xanh, hoặc súp lơ), Họ Cúc (ví dụ, nguru bâng, cải cúc, atisô, hoặc rau diếp), Họ Huệ tây (ví dụ, hành tây, củ hành, tỏi, hoặc măng tây), Họ Hành tỏi (ví dụ, cà rốt, mùi tây, cần tây, hoặc củ cải vàng), Họ Rau muối (ví dụ, rau bina hoặc cải cầu vồng (Swiss chard)), Họ Hoa môi (ví dụ, tía tô, bạc hà, hoặc húng quế), dâu, khoai lang, khoai lang nếp, củ từ, và các rau khác;

Quả: Họ Bưởi (ví dụ, táo, lê, lê Nhật Bản, mận qua Trung Quốc, hoặc mận qua), Họ Quả có hạt (ví dụ, đào, mận, xuân đào, mơ Nhật Bản (*Prunus mume*), quả anh đào, mơ, hoặc mận khô), Họ Cam chanh (ví dụ, cam Nhật Bản (*Citrus unshiu*), cam, chanh, chanh đào, hoặc bưởi chùm), Họ Quả có vỏ cứng (ví dụ, hạt dẻ, quả óc chó, hạt phỉ, hạnh đào, hồ trăn, đào lộn hột, hoặc mắc ca), Họ Quả mọng (ví dụ, việt quất xanh, mận việt quất, quả mâm xôi đen, hoặc quả mâm xôi đỏ), nho, hồng Nhật Bản, ôliu, mận Nhật Bản, chuối, cà phê, chà là, dừa, cọ dầu, và các loại quả khác;

Cây khác ngoài cây ăn quả: trà, cây dâu tằm, thực vật có hoa (ví dụ, đỗ quyên Nhật Bản (*Rhododendron indicum*), cây trà, cây tú cầu, cây trà mai, cây cửu lý hương, cây dâu, cây hoa tuy-líp, cây bằng lăng nước, hoặc cây hoa quế), các cây ven đường (ví dụ, cây tầm bì, cây phong vàng, cây gỗ chó, cây bạch đàn, cây bạch quả (*ginkgo biloba*), cây hoa cà, cây phong, cây sồi (*quercus*), cây gỗ dương, cây họ đỗ, cây bạch dương (*Liquidambar formosana*), cây tiêu huyền, cây họ Du (*zelkova*), cây nhai bách Nhật

Bản (*Thuja standishii*), cây gỗ thông, cây sâm độc, cây bách xù, cây thông trắng phương Tây, cây vân sam Na Uy, cây thủy tùng (*Taxus cuspidate*), cây du, hoặc cây dẻ ngựa), cây tuyết cầu, cây thông Nhật Bản (*Podocarpus macrophyllus*), cây liễu sam Nhật Bản, cây trúc xoắn Nhật Bản, cây cô tông lá đốm, cây tuyết tùng Nhật Bản (*Euonymus japonicus*), cây bụi Nhật Bản (*Photinia glabra*), và các cây khác;

Cỏ: cỏ nhung (ví dụ, cỏ lá gừng (*Zoysia japonica*) hoặc cỏ Hàn Quốc (*Zoysia tenuifolia*)), *Cynodon* (ví dụ, cỏ gà), *Agrostis* (cỏ còng còng) (ví dụ, cỏ uôn (*Agrostis alba*), cỏ uôn cong (*Agrostis stolonifera*), hoặc cỏ ống (*Agrostis capillaris*)), *Poa* (cỏ xanh) (ví dụ, cỏ xanh Kentucky hoặc cỏ xanh xù xì), *Festuca* (ví dụ, cỏ lá tre (*Festuca arundinacea*), cỏ lá gừng (*Festuca rubra* var. *commutata*), hoặc cỏ nhung (*Festuca rubra* var.)), *Lolium* (cỏ lúa mạch đen) (ví dụ, cỏ lúa mạch đen Ý hoặc cỏ lúa mạch đen lưu niên), cỏ nón, cỏ ba lá, và các loại cỏ khác;

Thực vật khác: hoa (ví dụ, hoa hồng, hoa cẩm chướng, hoa cúc vàng, hoa phi yến, hoa hồng chấm bi, hoa đồng tiền, hoa xô thơm, hoa dạ yên thảo, hoa vân anh, hoa tu-líp, hoa thạch thảo, hoa long đóm, hoa ly, hoa păng-xê, hoa anh thảo, hoa lan, hoa linh lan, hoa oải hương, hoa hoàng anh, hoa bắp cải, hoa báo xuân, hoa trạng nguyên, hoa lay ơn, hoa lan *Cattleya*, hoa cúc trắng, hoa hoàng lan, hoặc hoa thu hải đường), các thực vật nguyên liệu sinh học (ví dụ, dầu mè, hoa rum, dầu *Camelina*, cỏ kê, cây chè vè, cây sậy hoa vàng, cóc mía, cây gai, sắn, cây liễu, hoặc tảo), các thực vật lấy lá, và các loại thực vật khác.

Các thực vật trên cũng bao gồm thực vật biến đổi gen.

Chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế có thể được trộn với hoặc được sử dụng trong hỗn hợp với thuốc trừ sâu khác, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt giun, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, chất hỗ trợ, chất bảo vệ thực vật, hoặc các chất điều chỉnh tăng trưởng thực vật. Ví dụ, chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế có thể được trộn với hoặc được sử dụng trong hỗn hợp với các thành phần hoạt tính của thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt giun, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, chất hỗ trợ, chất bảo vệ thực vật, hoặc chất điều chỉnh tăng trưởng thực vật dưới đây.

Các thành phần hoạt tính của thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt ve bét, hoặc thuốc diệt giun

(1) Các hợp chất organophosphorus

axephat, azamethiphos, azinphos-etyl, azinphos-metyl, cadusafos, cloetoxýfos, clofenvinphos, clomephos, clopyrifos, clopyrifos-metyl, coumaphos, xyanophos (CYAP), demeton-S-metyl, diazinon, diclofos (DDVP), dicrotophos, dimethoat, dimetylvinphos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrothion (MEP), fenthion (MPP), heptenophos, isofenphos, isopropyl-O-(metoxyaminothiophosphoryl)salixylat hoặc isocarbophos, isoxathion, malathion, mecarbam, methamitophos, methidathion (DMTP), mevinphos, monocrotophos, naled (BRP), omethoat, oxydemeton-metyl, parathion, parathion-metyl hoặc metyl parathion, phenthoat (PAP), phorat, phosalone, phosmet (PMP), phosphamiton, phoxim, pirimiphos-metyl, profenofos, propetamphos, prothiofos, pyraclofos, pyridaphenthion, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetraclovinphos, thiometon, triazophos, triclofon (DEP), và vamitothion;

(2) Các hợp chất carbamat

alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl (NAC), carbofuran, carbosulfan, ethiofencarb, fenobucarb (BPMC), formetanat, furathiocarb, isoprocarb (MIPC), methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, propoxur (PHC), thiodicarb, thiofanox, triazamat, trimethacarb, XMC, và xylylcarb;

(3) Các hợp chất pyrethroid tổng hợp

acrinathrin, allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioresmethrin, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyphenothrin, deltamethrin, empenethrin, esfenvalerat, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerat, flucythrinate, flumethrin, fluvalinate, tau-fluvalinate, halfenprox, heptafluthrin, imiprothrin, kadethrin, meperfluthrin, momfloethrin, permethrin,

phenothrin, prallethrin, pyrethrins, resmethrin, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, tetramethylfluthrin, tralomethrin, và transfluthrin;

(4) Các hợp chất nereistoxin

bensultap, cartap, cartap hydroclorua, thiocyclam, thiosultap-dinatri hoặc bisultap, và thiosultap-mononatri hoặc monosultap;

(5) Các hợp chất neonicotinoit

axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, flupyradifurone, imidacloprid, nitenpyram, sulfoxaflor, thiacloprid, và thiamethoxam;

(6) Các hợp chất Benzoylurê

bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluxycloxafluron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, và triflumuron;

(7) Các hợp chất phenylpyrazol

ethiprol, fipronil, và flufiprol;

(8) Các hợp chất hydrazin

chromafenozit, halofenozit, metoxyfenozit, và tebufenozit;

(9) Các hợp chất organoclo

clodan, endosulfan, và alpha-endosulfan;

(10) Các hợp chất diamit

cloantraniliprol, xyantraniliprol, xycloniliprol, flubendiamit, và tetraniliprol;

(11) Thuốc trừ sâu tự nhiên

dầu máy, nicotin-sulfat, và rotenon;

(12) Các nguyên liệu vi sinh

các bào tử thô có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*, var. *aizawai*, var. *kurstaki*, var. *israelensis*, hoặc var. *tenebriosis*, tạo ra chất độc tinh thể của nó, và các hỗn hợp của chúng, *Bacillus sphaericus*, *Beauveria bassiana* (ví dụ, chủng vi khuẩn GHA), *Beauveria brongniartii*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *Paecilomyces lilacinus*, *Paecilomyces tenuipes*, *Trichoderma harzianum*, và *Verticillium lecani*;

(13) Các hợp chất hoạt tính diệt giun

dazomet, fluensulfon, fosthiazat, imicyafos, metam, potassium antimonyl tartrat trihydrat, tioazafen, *Arthrobotrys dactyloides*, *Bacillus firmus* (ví dụ, chủng vi khuẩn I-1582), *Bacillus megaterium*, *Hirsutella rhossiliensis*, *Hirsutella minnesotensis*, *Monacrosporium phymatopagus*, *Pasteuria nishizawae*, *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria usgae*, *Verticillium chlamydosporium*, và *Harpin protein*;

(14) Các hợp chất hoạt tính diệt ve bét khác

acequinocyl, amitraz, benzoximat, bifenazat, bromopropylat, chinomethionat, clofentezin, cyenopyrafen, cyflumetofen, cyhexatin hoặc trixyclohexyltin hydroxit, dicofol, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpyroximat, fluacrypyrim, fluazuron, flufenoxystrobin, hexythiazox, propargite (BPPS), pyflubumit, pyridaben, pyrimidifen, pyriminostrobin, spiroadiclofen, spiromesifen, tebufenpyrad, và tetradifon;

(15) Thuốc trừ sâu khác

abamectin, emamectin-benzoat, lepimectin, milbemectin, spinetoram, spinosad, afidopyropen, nhôm phosphit, canxi phosphit, phosphine, kẽm phosphit, azadirachtin, buprofezin, clofenapyr, clopicrin, cyromazin, diafenthiuron, DNOC, fenoxycarb, flometoquin, flonicamit, hydrametylnon, hydropren, indoxacarb, kinopren, metaflumizon, methopren, metoxyclo, methyl bromua, metoxadiazon, pymetrozine, pyrazophos, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriproxyfen, natri nhôm florua hoặc chiolit, spirotetramat, sulfluramit, sulfuryl florua, tolfenpyrad, và triflumezopyrim.

Các thành phần hoạt tính của thuốc diệt nấm

(1) DMI thuốc diệt nấm (chất ức chế sự khử methyl)

azaconazol, bitertanol, bromuconazol, cyproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxyconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, nuarimol, oxpoconazol, oxpoconazol fumarat, pefurazoat, penconazol, procloaz, propiconazol, prothioconazol, pyrifenox, pyrisoxazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triforin, và triticonazol;

(2) Thuốc diệt nấm amin

aldimorph, dodemorph, fenpropidin, fenpropimorph, piperalin, spiroxamin, và tridemorph;

(3) Thuốc diệt nấm benzimidazol

benomyl, carbendazim, fuberidazol, thiabendazol, thiophanat, và thiophanat-metyl;

(4) Thuốc diệt nấm dicarboximit

clozolinat, iprodion, procymidon, và vinclozolin;

(5) Thuốc diệt nấm anilinopyrimidin

cyprodinil, mepanipirim, và pyrimethanil;

(6) Thuốc diệt nấm phenylpyrol

fenpiclonil và fludioxonil;

(7) Chất ức chế QoI

azoxystrobin, coumoxystrobin, dimoxystrobin, enoxastrobin, famoxadon, fenamiton, fenaminstrobin, flufenoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metyl, mandestrobin, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyribencarb, triclopyricarb, trifloxystrobin, và N-metyl-2-[2-(2,5-dimetylphenoxy)metyl]phenyl-2-metoxaxetamit (bao gồm chất triệt quang hoặc đồng phân, và hỗn hợp của tỷ lệ tùy ý là đồng phân R và đồng phân S);

(8) Thuốc diệt nấm PA (thuốc diệt nấm phenyl amit)

benalaxyl, benalaxyl-M hoặc kiralaxyl, furalaxyl, metalaxyl, metalaxyl-M hoặc mefenoxam, oxadixyl, và ofurace;

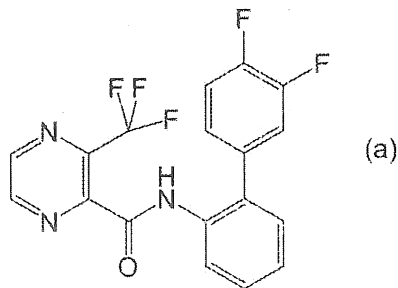
(9) Thuốc diệt nấm axit carboxylic amit

dimethomorph, flumorph, pyrimorph, benthiavalicarb, benthivalicarb-isopropyl, iprovalicarb, mandipropamit, và valifenalat;

(10) Thuốc diệt nấm SDHI

benodanil, benzovindiflupyr, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fluopyram, flutolanil, fluxapyroxad, furametpyr, isofetamit, isopyrazam, mepronil, oxycarboxin,

penthiopyrad, penflufen, sedaxan, thifluzamit, và hợp chất có công thức (a);



(11) Thuốc diệt nấm dithiocarbamat

ferbam, mancozeb hoặc manzeb, maneb, metiram, propineb, thiram, zineb, và ziram;

(12) Tác nhân MBI-R

phthalit hoặc fthalit, pyroquilon, và tricyclazol;

(13) Tác nhân MBI-D

carpropamit, diclocymet, và fenoxanil;

(14) Các nguyên liệu vi sinh

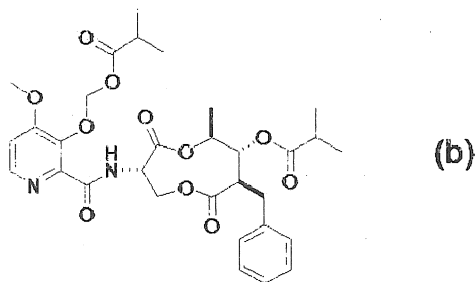
Agrobacterium radiobactor (ví dụ, chủng vi khuẩn 84), *Bacillus amyloliquefaciens*, *Bacillus pumulus*, *Bacillus simplex* (ví dụ, chủng vi khuẩn CGF2856), *Bacillus subtilis* (đồng nghĩa với *Bacillus amyloliquefaciens*) (ví dụ, chủng vi khuẩn QST713, chủng vi khuẩn FZB24, chủng vi khuẩn MBI600, chủng vi khuẩn D747, chủng vi khuẩn HAI0404, hoặc chủng vi khuẩn Y1336), *Variovorax paradoxus* (ví dụ, chủng vi khuẩn CGF4526), *Erwinia carotovora* (ví dụ, chủng vi khuẩn CGE234M403), *Pseudomonas fluorescens* (ví dụ, chủng vi khuẩn G7090), *Talaromyces flavus* (ví dụ, chủng vi khuẩn SAY-Y-94-01), và *Trichoderma atroviride* (ví dụ, chủng vi khuẩn SKT-1);

(15) Thuốc diệt nấm khác

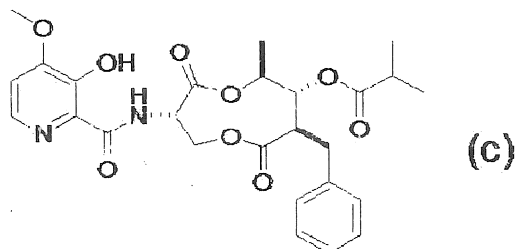
acibenzolar-S-metyl, ametoctradin, amisulbrom, anilazin, biphenyl, blasticidin-S, bupirimat, captafol, captan, chinomethionat hoặc quinomethionat, cloneb, clothalonil, cyazofamit, cyflufenamit, cymoxanil, dichlofluanid, diclomezin, dicloran, diethofencarb, diflumetorim, dimethirimol, dinocap, dithianon, dodine, echlomezol

hoặc etridiazol, edifenphos, ethaboxam, ethirimol, fenhexamit, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin clorua, fentin hydroxit, ferimzone, fluazinam, fluopicolit, floimit, flusulfamit, flutianil, folpet, fosetyl, guazatin, hymexazol, iminoctadin, iminoctadin triaxetat, iodocarb, iprobenfos, isoprothiolan, isotianil, kasugamycin, laminarin, meptyldinocap, methasulfocarb, metrafenon, octhilinon, oxathiapiprolin, axit oxolinic, oxytetraxyclin, penxycuron, polyoxins, probenazol, propamocarb, proquinazid, prothiocarb, pyrazophos, pyributicarb, pyriofenon, quinoxifen, quintozen, streptomycin, tebufloquin, tecloftalam, tecnazen, tiadinil, toiclofos-metyl, tolfenpyrad, tolylfluanid, toprocarb, triazoxit, validamycin A, zoxamit, gốc đồng clorua, đồng(II) hydroxit, gốc đồng sulfat, đồng hữu cơ, lưu huỳnh, 3-clo-5-phenyl-6-metyl-4-(2,6-diflophenyl)pyridazin, 3-xyano-5-phenyl-6-metyl-4-(2,6-diflophenyl)pyridazin, axit N-(1,1,3-trimetyllindan-4-yl)-1-metyl-3-diflometylpyrazol-4-carboxylic amit (bao gồm chất triệt quang hoặc đồng phân, và hỗn hợp của tỷ lệ tùy ý của đồng phân R và đồng phân S);

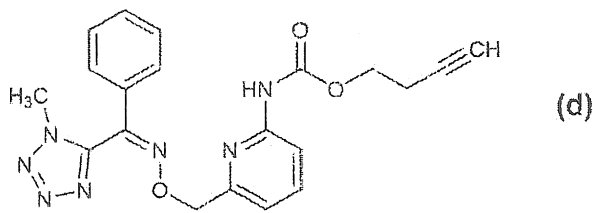
hợp chất có công thức (b);



hợp chất có công thức (c);



và hợp chất có công thức (d);



Các thành phần hoạt tính của thuốc diệt cỏ

(1) Các hợp chất diệt cỏ axit béo phenoxy:

2,4-PA, MCP, MCPB, phenothiol, mecoprop, fluroxypyr, triclopyr, clomeprop, và naproanilit.

(2) Các hợp chất diệt cỏ axit benzoic:

2,3,6-TBA, dicamba, clopyralid, picloram, aminopyralid, quinclorac, và quinmerac.

(3) Các hợp chất diệt cỏ urê:

diuron, linuron, clotoluron, isoproturon, fluometuron, isouron, tebuthiuron, methabenzthiazuron, cumyluron, daimuron, và metyl-daimuron.

(4) Các hợp chất diệt cỏ triazin:

atrazin, ametryn, cyanazin, simazin, propazin, simetryn, dimethametryn, prometryn, metribuzin, triaziflam, và indaziflam.

(5) Các hợp chất diệt cỏ bipyridinium:

paraquat và diquat.

(6) Các hợp chất diệt cỏ hydroxybenzonitril:

bromoxynil và ioxynil.

(7) Các hợp chất diệt cỏ dinitroanilin:

pendimethalin, prodiamin, và trifluralin.

(8) Các hợp chất diệt cỏ organophosphorus:

amiprofos-metyl, butamifos, bensulit, piperophos, anilofos, glyphosat, glufosinat, glufosinat-P, và bialaphos.

(9) Các hợp chất diệt cỏ carbamat:

di-allat, tri-allat, EPTC, butylat, benthocarb, esprocarb, molinat, dimepiperat,

swep, clopropham, phenmedipham, phenisopham, pyributicarb, và asulam.

(10) Các hợp chất diệt cỏ axit amit:

propanil, propyzamit, bromobutit, và etobenzanid.

(11) Các hợp chất diệt cỏ cloaxetanilit:

axetoclo, alaclo, butaclo, dimethenamit, propaclo, metazaclo, metolaclo, pretilaclo, thenylclo, và pethoxamit.

(12) Các hợp chất diệt cỏ diphenylete:

acifluorfen-natri, bifenox, oxyfluorfen, lactofen, fomesafen, chlometoxynil, và aclonifen.

(13) Các hợp chất diệt cỏ xyclic imit:

oxadiazon, cinidon-etyl, carfentrazon-etyl, surfentrazon, flumiclorac-pentyl, flumioxazin, pyraflufen-etyl, oxadiargyl, pentoxazon, fluthiacet-metyl, butafenacil, benzfendizon, bencarbazon, và saflufenacil.

(14) Các hợp chất diệt cỏ pyrazol:

benzofenap, pyrazolat, pyrazoxyfen, topramezon, và pyrasulfotol.

(15) Các hợp chất diệt cỏ triketon:

isoxaflutol, benzobixyclon, sulcotrion, mesotrion, tembotrion, và tefuryltrion.

(16) Các hợp chất diệt cỏ axit aryloxy phenoxypropionic:

clodinafop-propargyl, cyhalofop-butyl, diclofop-metyl, fenoxaprop-etyl, fluazifop-butyl, haloxyfop-metyl, và quizalofop-etyl, metamifop.

(17) Các hợp chất diệt cỏ trion oxim:

alloxydim-natri, setoxydim, butroxydim, clethodim, cloproxydim, xycloxydim, tepraloxydim, tralkoxydim, và profoxydim.

(18) Các hợp chất diệt cỏ sulfonylurê:

closulfuron, sulfometuron-metyl, metsulfuron-metyl, cloimuron-etyl, tribenuron-metyl, triasulfuron, bensulfuron-metyl, thifensulfuron-metyl, pyrazosulfuron-etyl, primisulfuron-metyl, nicosulfuron, amitosulfuron, cinosulfuron, imazosulfuron, rimsulfuron, halosulfuron-metyl, prosulfuron, ethametsulfuron-metyl,

triflusulfuron-metyl, flazasulfuron, xyclosulfamuron, flupyr-sulfuron, sulfosulfuron, azimsulfuron, etoxysulfuron, oxasulfuron, iodosulfuron-metyl-natri, foramsulfuron, mesosulfuron-metyl, trifloxysulfuron, tritosulfuron, orthosulfamuron, flucetosulfuron, và propyrisulfuron.

(19) Các hợp chất diệt cỏ imidazolinon:

imazamethabenz-metyl, imazamethapyr, imazamox, imazapyr, imazaquin, và imazethapyr.

(20) Các hợp chất diệt cỏ sulfonamit:

flumetsulam, metosulam, diclosulam, florasulam, cloransulam-metyl, penoxsulam, và pyroxsulam.

(21) Các hợp chất diệt cỏ axit pyrimidinyl oxybenzoic:

pyrithiobac-natri, bispyribac-natri, pyriminobac-metyl, pyribenzoxim, pyriftalid, và pyrimisulfan.

(22) Các hợp chất diệt cỏ khác:

bentazon, bromacil, terbacil, clothiamit, isoxaben, dinoseb, amitrol, cinmetylin, tridiphan, dalapon, diflufenzopyr-natri, dithiopyr, thiazopyr, flucarbazon-natri, propoxycarbazon-natri, mefenacet, flufenacet, fentrazamit, cafenstrol, indanofan, oxaziclomefone, benfuresate, ACN, pyridat, cloidazon, norflurazon, flurtamone, diflufenican, picolinafen, beflubutamit, clomazon, amicarbazon, pinoxaden, pyraclonil, pyroxasulfone, thiencarbazon-metyl, aminoxyclopyraclo, ipfencarbazon, và methiozolin.

Các thành phần hoạt tính của chất hỗ trợ

piperonyl butoxit, sesamex, sulfoxit, N-(2-etylhexyl)-8,9,10-trinorborn-5-ene-2,3-dicarboximit (MGK 264), N-decylimidazol, WARF-antiresistant, TBPT, TPP, IBP, PSCP, metyl iodua (CH_3I), t-phenylbutenon, dietylmaleat, DMC, FDMC, ETP, và ETN.

Các thành phần hoạt tính của chất bảo vệ thực vật

benoxacor, cloquintocet, cloquintocet-mexyl, cyometrinil, cyprosulfamit,

diclomid, dixyclonon, dietholat, fencloazol, fencloazol-etyl, fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen, isoxadifen-etyl, mefenpyr, mefenpyr-dietyl, mephenat, naphthalic anhydrit, và oxabetrinil.

Các thành phần hoạt tính của các chất điều chỉnh sinh trưởng thực vật

clomequat-clorua, ethephon, gibberellins (ví dụ, Gibberellin A3), hymexazol, inabenfit, mepiquat-clorua, 1-metylxcyclopropen, paclobutrazol, prohexadion, prohexadione-canxi, trinexapac, trinexapac-etyl, uniconazol, uniconazol-P, axit 4-oxo-4-(2-phenyletyl)aminobutyric, và metyl 5-(triflometyl)benzo[b]thiophen-2-carboxylat.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Các ví dụ dưới đây để minh họa sáng chế một cách chi tiết hơn, mà không nhằm giới hạn sáng chế.

Ví dụ 1

2-propanol (6,3 phần trọng lượng) được bổ sung vào bình tách, và được đun nóng đến 73°C. Các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) được bổ sung vào bình tách ở 73°C, và hỗn hợp thu được được khuấy để hòa tan hoàn toàn các tinh thể. Nhiệt độ của dung dịch thu được được giảm với tốc độ là 3°C/giờ bằng cách khuấy, và sau đó các tinh thể bắt đầu kết tủa ở 67°C, và nhiệt độ còn được giảm đến nhiệt độ trong phòng, và các chất rắn được thu hồi từ hỗn hợp thu được bằng cách lọc để bảo chế ra các tinh thể loại 2.

Các tinh thể loại 2 thu được được thể hiện các đỉnh nhiễu xạ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α như được thể hiện trong bảng 2.

[Bảng 2]

Giá trị 2 θ (°)	Giá trị d (Å)	Cường độ tương đối (%)
14,0	6,3197	51,4
14,3	6,2057	100
16,5	5,368	25,1
16,9	5,2423	38,5
17,6	5,0404	21,2
18,8	4,721	39
19,9	4,4667	82,7
22,3	3,9796	22,3

Ví dụ 2

Hỗn hợp của xylene (16,0 phần trọng lượng) và n-heptan (16,0 phần trọng lượng) được bổ sung vào bình tách, và được đun nóng đến 75°C. Các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) được bổ sung vào bình tách ở 75°C, và hỗn hợp thu được được khuấy để hòa tan hoàn toàn các tinh thể. Nhiệt độ của hỗn hợp thu được được giảm với tốc độ là 5°C/giờ bằng cách khuấy, và mẫu tinh thể của tinh thể loại 2 được bổ sung vào đó khi nhiệt độ của dung dịch là 55°C. Sau đó, các tinh thể bắt đầu kết tủa từ dung dịch, và nhiệt độ của hỗn hợp được giảm với tốc độ là 5°C/giờ bằng cách khuấy đến nhiệt độ trong phòng. Các chất rắn được thu hồi từ hỗn hợp thu được bằng cách lọc để bào chế ra các tinh thể loại 2.

Để đối chứng, các ví dụ bào chế của các tinh thể của hợp chất (1) mà khác so với tinh thể loại 1 và tinh thể loại 2 được mô tả như các ví dụ đối chứng. Các tinh thể này đều kém ổn định hơn tinh thể loại 2.

Ví dụ đối chứng 1

Các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) được bổ sung metanol (25 phần trọng lượng) ở nhiệt độ trong phòng để hòa tan các tinh thể. Dung dịch thu được được để ở nhiệt độ trong phòng trong khoảng 1 ngày để cho phép metanol bay hơi từ từ, và các chất rắn thu được được lọc để bào chế ra các tinh thể (sau đây được gọi là "các tinh thể loại 3").

Các tinh thể loại 3 thu được được thể hiện các đỉnh nhiễu xạ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α như được thể hiện trong bảng 3.

[Bảng 3]

Giá trị 2θ (°)	Giá trị d (Å)	Cường độ tương đối (%)
14,5	6,0952	45,3
15,8	5,6117	33,6
16,2	5,4735	27,6
16,8	5,2603	26,6
18,2	4,8597	67,5
19,1	4,6381	37,8
19,9	4,4668	100
22,2	3,9974	45,7
23,9	3,7261	27,8

25,9	3,4372	33,9
27,5	3,2361	80,2
29,9	2,9839	43,6

Ví dụ đối chứng 2

Các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) được bổ sung methyl t-butyl ete (60 phần trọng lượng) ở nhiệt độ trong phòng để hòa tan các tinh thể. Dung dịch thu được được để ở nhiệt độ trong phòng trong khoảng 1 ngày để cho phép methyl t-butyl ete bay hơi từ từ, và các chất rắn thu được được lọc để bảo chế các tinh thể (sau đây được gọi là "các tinh thể loại 4").

Các tinh thể loại 4 thu được thể hiện các đỉnh nhiễu xạ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α như được thể hiện trong bảng 4.

[Bảng 4]

Giá trị 2 θ (°)	Giá trị d (Å)	Cường độ tương đối (%)
10,9	8,1257	24,4
12,8	6,9316	60,5
14,7	6,0371	33,1
16,4	5,4137	64,9
16,8	5,2671	63,3
19,7	4,4984	100
21,4	4,1527	99,2
22,6	3,9379	35,5
24,0	3,6989	24,3
26,2	3,3961	45,2
31,4	2,85	33,9

Ví dụ đối chứng 3

Xylen (5,0 phần trọng lượng) được bổ sung các tinh thể loại 1 (1 phần trọng lượng) ở 65°C để hòa tan các tinh thể. Dung dịch thu được được bổ sung nhỏ giọt vào n-heptan (5,0 phần trọng lượng) ở 25°C để làm kết tủa các chất rắn. Sau khi toàn bộ lượng dung dịch được bổ sung nhỏ giọt, hỗn hợp thu được được làm mát đến nhiệt độ trong phòng bằng cách khuấy, và các chất rắn đã kết tủa được lọc để bảo chế các tinh thể (sau đây được gọi là "các tinh thể loại 5").

Các tinh thể loại 5 thu được thể hiện các đỉnh nhiễu xạ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α như được thể hiện trong bảng 5.

[Bảng 5]

Giá trị 2θ (°)	Giá trị d (Å)	Cường độ tương đối (%)
8,0	11,0092	28,8
13,8	6,4018	26,0
14,4	6,1623	82,2
14,9	5,9219	29,7
15,1	5,8709	63,0
16,7	5,3167	77,9
17,8	4,9781	59,2
18,0	4,9203	30,3
18,5	4,7950	29,8
19,5	4,5381	63,3
20,0	4,4399	100,0
22,7	3,9148	56,2
25,2	3,5255	56,5
30,6	2,9203	40,4

Tiếp theo, các ví dụ bào chế của chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được thể hiện dưới đây.

Ví dụ bào chế 1

Các tinh thể loại 2 (20 phần trọng lượng), natri lauryl sulfat (4 phần trọng lượng), canxi lignin sulfonat (2 phần trọng lượng), bột mịn silic oxit (20 phần trọng lượng), và đất tảo cát (54 phần trọng lượng) được trộn để thu được bột ướt 20%.

Ví dụ bào chế 2

Các tinh thể loại 2 (2 phần trọng lượng), bột mịn silic oxit (1 phần trọng lượng), canxi lignin sulfonat (2 phần trọng lượng), bentonit (30 phần trọng lượng), và cao lanh (65 phần trọng lượng) được trộn. Để hỗn hợp thu được được bổ sung lượng nước phù hợp, và hỗn hợp thu được được nhào. Sản phẩm nhào thu được được đưa đi ép đùn tạo hạt bằng máy tạo hạt và sấy khô bằng cách thổi không khí để thu được hạt 2%.

Ví dụ bào chế 3

Các tinh thể loại 2 (2 phần trọng lượng), chất kết dính (5 phần trọng lượng), chất hoạt động bề mặt không ion (1 phần trọng lượng), và đất sét pyrophyllit (92 phần trọng lượng) được trộn. Để hỗn hợp thu được được bổ sung lượng nước phù hợp, và hỗn hợp thu được được nhào. Sản phẩm nhào thu được được đưa đi ép đùn tạo hạt với

máy tạo hạt loại có rỗ và sấy khô bằng cách thổi không khí để thu được hạt 2% có ϕ 1,2mm.

Ví dụ bào chế 4

Hỗn hợp của muối amoni sulfat của polyoxyetylen alkyl ete và cacbon trắng (tỷ lệ trọng lượng là 1 : 1) (35 phần trọng lượng), các tinh thể loại 2 (10 phần trọng lượng), và nước (55 phần trọng lượng) được trộn hoàn toàn để thu được chế phẩm chảy 10%.

Tiếp theo, tác dụng phòng ngừa chống lại loài gây hại của chế phẩm thuốc trừ sâu của sáng chế được thể hiện dưới đây.

Ví dụ thử nghiệm 1

Hạt 2% chứa các tinh thể loại 2 thu được trong ví dụ bào chế 3 (sau đây được gọi là "hạt của sáng chế 1") và hạt 2% thu được theo ví dụ bào chế 3 bằng cách sử dụng các tinh thể loại 1 thay thế cho các tinh thể loại 2 (sau đây được gọi là "hạt để so sánh 1") được bào chế.

Đất quanh rễ cây của một gốc mầm lúa (*Oryza sativa*, giống cây: Hinohikari) ở giai đoạn 2,5 lá được trồng trong khay di động có 200 lỗ được áp dụng hạt của sáng chế 1 hoặc hạt để so sánh 1 (50mg), và sau đó nước trao đổi ion (0,5 ml) được bổ sung nhỏ giọt vào đó. Sau khi để yên trong phòng trong 1,5 giờ, mầm lúa và đất trong khay di động được cấp ghép vào trong bình Wagner (diện tích: 1/5000a) chứa đất ngập nước, và được trồng trong nhà kính (25°C). Sau 50 ngày từ khi cấp ghép, toàn bộ lúa được bao phủ bởi miếng gạc ni lông, và rầy nâu (*Nilaparvata lugens*) (6 đầu của ấu trùng cái giai đoạn tuổi thứ 5 ngay trước khi nở và 3 đầu của con cái trưởng thành ngay trước khi nở trên một bình) được đưa vào đó. Sau 24 ngày từ lúc đưa rầy nâu vào, số lượng ấu trùng sống trên lúa được điều tra (sau đây được gọi là "nhóm thử nghiệm").

Mầm lúa được trồng theo cách tương tự với nhóm thử nghiệm ngoại trừ là xử lý với hạt chứa hợp chất (1) không được thực hiện. Sau 50 ngày từ khi cấp ghép, rầy nâu được đưa vào nhóm mầm lúa thử nghiệm, và số lượng ấu trùng sống trên lúa được kiểm tra (sau đây được gọi là "nhóm phòng ngừa").

Tác dụng phòng ngừa được tính toán theo phương trình sau trên cơ sở quan sát

trong nhóm thử nghiệm và nhóm phòng ngừa (mỗi thử nghiệm được thực hiện 3 lần lặp, và giá trị trung bình được tính toán).

Tác dụng phòng ngừa (%) = $100 - (\text{số lượng côn trùng trong nhóm thử nghiệm} / \text{số lượng côn trùng trong nhóm phòng ngừa}) \times 100$

[Bảng 6]

Hạt	Tác dụng phòng ngừa (%)
Hạt của sáng chế 1	100
Hạt để so sánh 1	85

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Tinh thể loại 2 là tinh thể ổn định của 2-(3-etansulfonylpyridin-2-yl)-5-(triflometansulfonyl)benzoxazol, và có thể được sử dụng để phòng ngừa loài gây hại.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. 2-(3-etansulfonylpyridin-2-yl)-5-(triflometansulfonyl)benzoxazol ở dạng tinh thể loại 2, trong đó tinh thể có các đỉnh nhiễu xạ tại $2\theta = 14,0 \pm 0,2^\circ$, $14,3 \pm 0,2^\circ$, $16,5 \pm 0,2^\circ$, $16,9 \pm 0,2^\circ$, $17,6 \pm 0,2^\circ$, $18,8 \pm 0,2^\circ$, $19,9 \pm 0,2^\circ$, và $22,3 \pm 0,2^\circ$ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α .
2. Chế phẩm thuốc trừ sâu chứa hợp chất theo điểm 1 làm thành phần hoạt tính.
3. Phương pháp điều chế hợp chất theo điểm 1 khác biệt ở chỗ phương pháp này bao gồm bước hòa tan tinh thể loại 1 của 2-(3-etansulfonylpyridin-2-yl)-5-(triflometansulfonyl)benzoxazol có các đỉnh nhiễu xạ tại $2\theta = 13,7 \pm 0,2^\circ$, $16,2 \pm 0,2^\circ$, $16,6 \pm 0,2^\circ$, $17,1 \pm 0,2^\circ$, $18,8 \pm 0,2^\circ$, $20,2 \pm 0,2^\circ$, $21,4 \pm 0,2^\circ$, và $27,6 \pm 0,2^\circ$ trong sự nhiễu xạ bột tia X sử dụng bức xạ Cu-K α vào trong 2-propanol, và bước làm kết tủa tinh thể ở nhiệt độ là từ 65 đến 67°C.

HÌNH VẼ

Fig.1

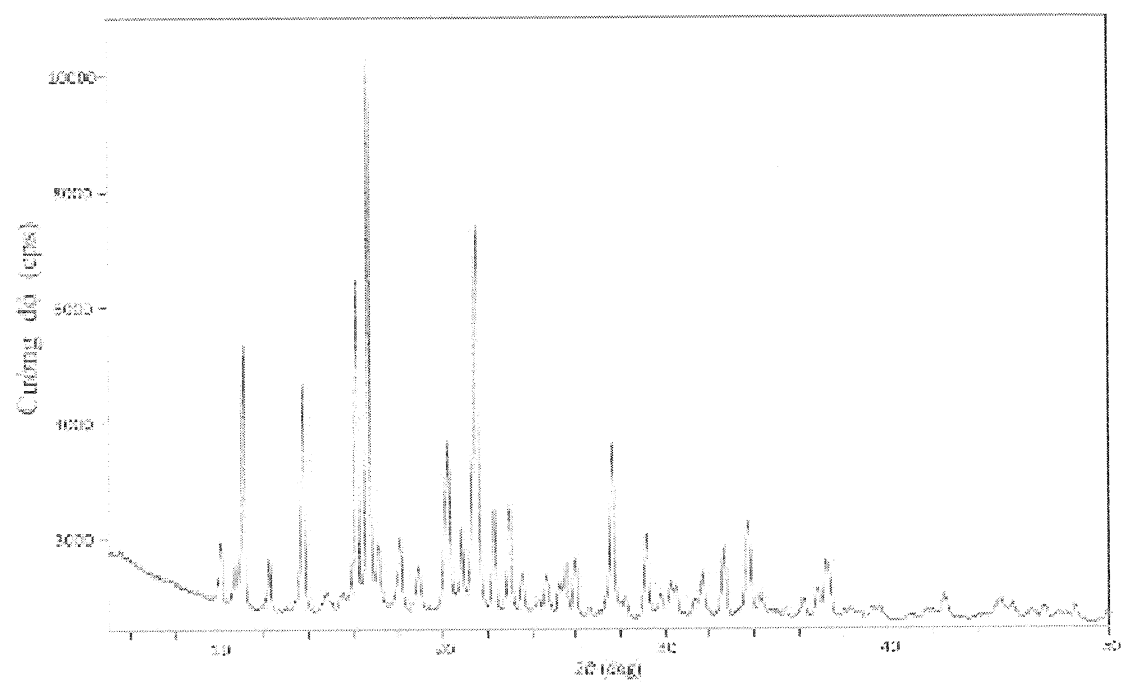


Fig.2

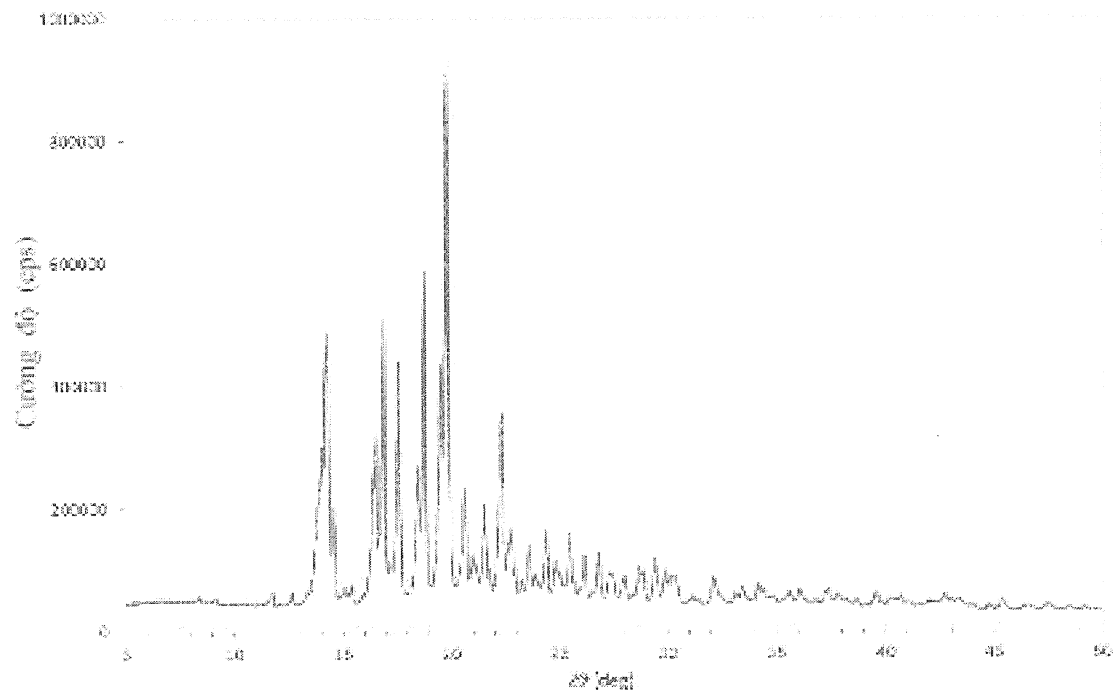


Fig.3

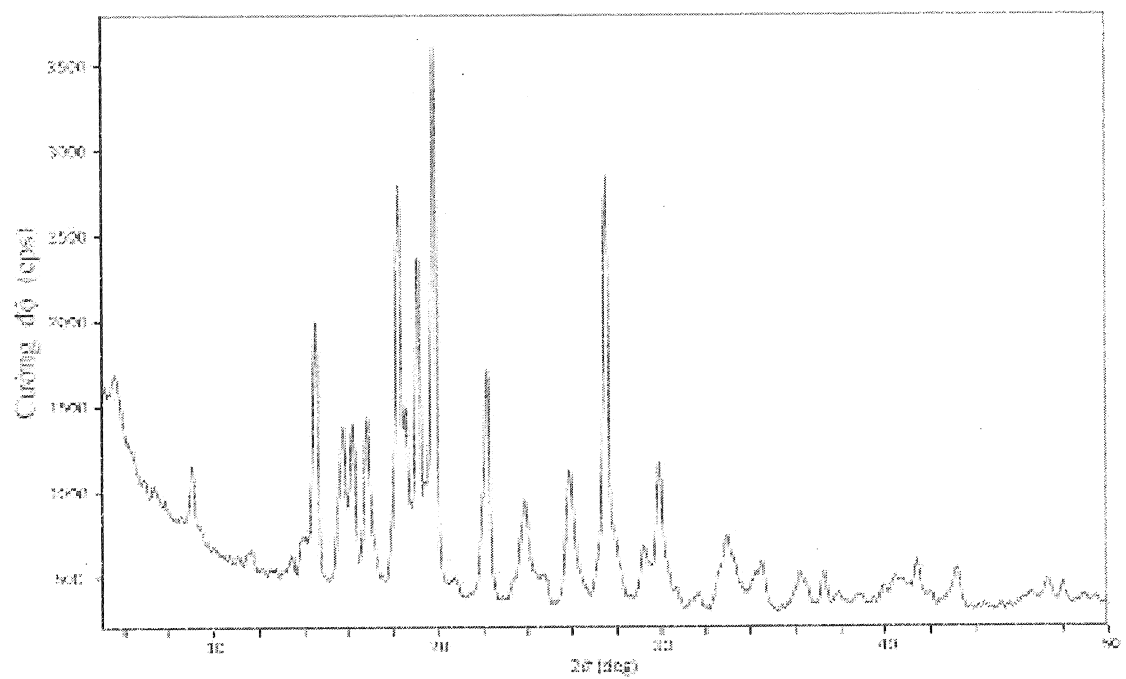


Fig.4

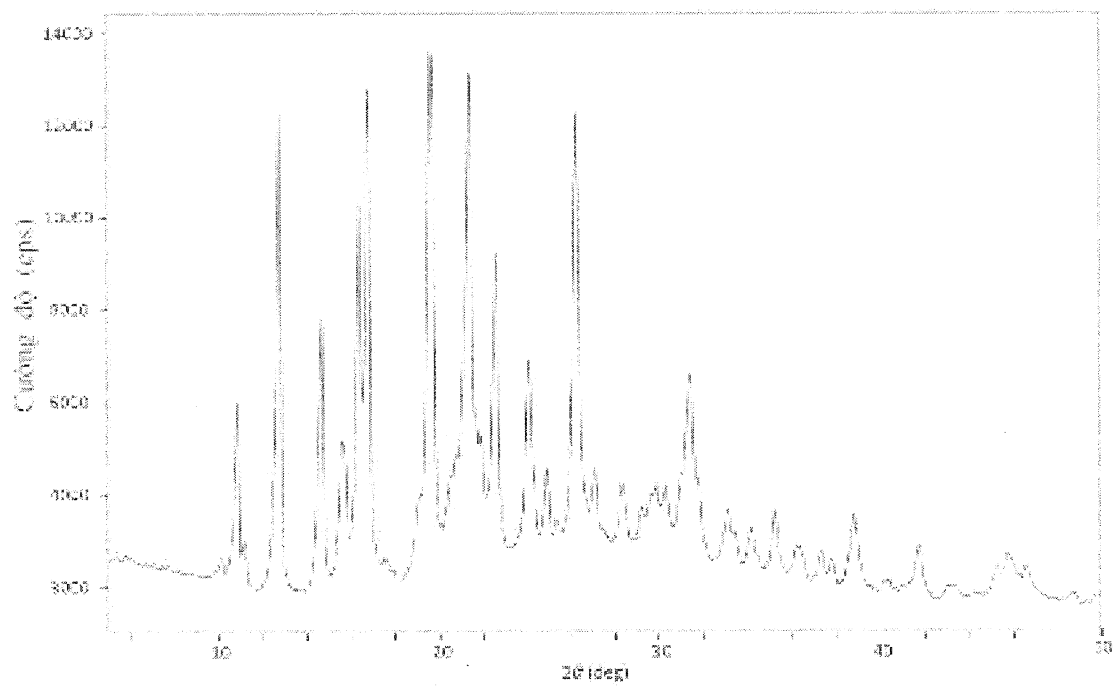


Fig.5

