



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

(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ



1-0050310

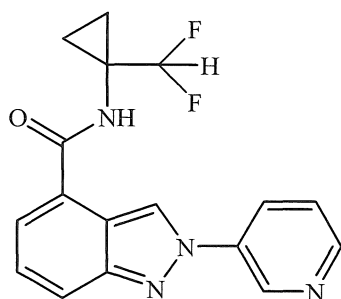
(51)^{2020.01} C07D 401/04; A01N 43/40; A01N 43/52 (13) B

(21) 1-2021-00182 (22) 12/07/2019
(86) PCT/US2019/041547 12/07/2019 (87) WO2020/018362 23/01/2020
(30) 62/698035 14/07/2018 US; 62/778992 13/12/2018 US
(45) 25/08/2025 449 (43) 26/04/2021 397A
(73) FMC Corporation (US)
2929 Walnut Street, Philadelphia, Pennsylvania 19104, United States of America
(72) ZHANG, Wenming (CN).
(74) Công ty Luật TNHH Phạm và Liên danh (PHAM & ASSOCIATES)

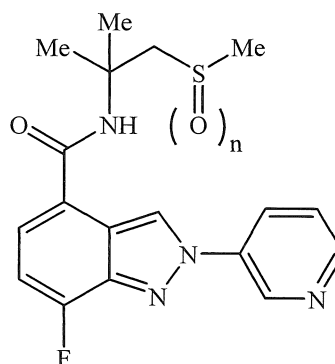
(54) HỢP CHẤT INDAZOL LÀM THUỐC TRỪ SÂU, CHẾ PHẨM CỦA CHÚNG VÀ
PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT LOÀI GÂY HẠI KHÔNG XƯƠNG SỐNG

(21) 1-2021-00182

(57) Sáng chế đề cập đến Hợp chất 1 và hợp chất có Công thức 2,



Hợp chất 1



Công thức 2

Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, hoặc hỗn hợp của chúng và phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

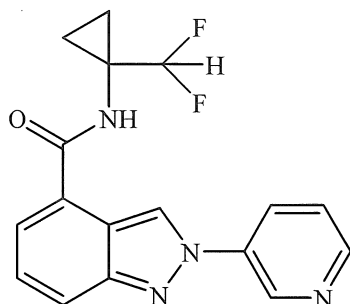
Sáng chế đề cập đến một số hợp chất indazol được thể và chế phẩm thích hợp của nó để sử dụng trong nông học và phi nông học, và phương pháp sử dụng chúng để kiểm soát loài gây hại không xương sống như động vật chân khớp trong cả môi trường nông học và môi trường phi nông học.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

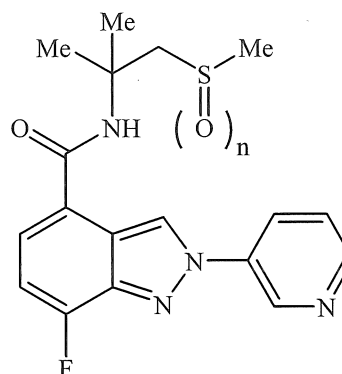
Việc kiểm soát loài gây hại không xương sống là vô cùng quan trọng trong việc đạt được hiệu quả cây trồng cao. Thiệt hại do loài gây hại không xương sống đối với cây trồng nông nghiệp đang phát triển và khi bảo quản có thể làm giảm đáng kể năng suất và do đó làm tăng chi phí cho người dùng. Việc kiểm soát loài gây hại không xương sống trong lâm nghiệp, cây trồng trong nhà kính, trang trí, vườn ươm, thực phẩm được lưu kho và các sản phẩm sợi, chăn nuôi, hộ gia đình, cỏ, sản phẩm gỗ và sức khỏe cộng đồng và sức khỏe động vật cũng rất quan trọng. Nhiều sản phẩm có sẵn trên thị trường cho các mục đích này, nhưng vẫn tiếp tục có nhu cầu về các hợp chất mới hiệu quả hơn, ít tồn kém hơn, ít độc hại hơn, an toàn hơn với môi trường hoặc có các vị trí tác động khác nhau. Công bố đơn sáng chế PCT số WO 2015/038503 A1 bộc lộ các hợp chất indazol có liên quan.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Sáng chế đề cập đến Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, chế phẩm chứa chúng, và việc sử dụng chúng để kiểm soát loài gây hại không xương sống:



Hợp chất 1



Công thức 2

trong đó n là 0, 1, hoặc 2.

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, hoặc hỗn hợp của các hợp chất bất kỳ này.

Sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng. Theo một phương án, sáng chế còn đề xuất chế phẩm để kiểm soát loài gây hại không xương sống chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế đề xuất phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 (ví dụ, như chế phẩm được mô tả trong sáng chế này). Sáng chế còn đề cập đến phương pháp mà trong đó, loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, và ít nhất một thành phần bổ sung được

chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Sáng chế còn đề xuất phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho hạt tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 (ví dụ, như chế phẩm được mô tả trong sáng chế này). Sáng chế còn đề cập đến hạt đã được xử lý này.

Mô tả chi tiết sáng chế

Như được sử dụng trong tài liệu này, các thuật ngữ “bao gồm”, “gồm”, “có”, “chứa”, “khác biệt ở chỗ” hoặc dạng biến thể bất kỳ khác của nó có nghĩa là để bao hàm sự bao gồm không dành riêng, theo bất kỳ giới hạn nào được chỉ định rõ ràng. Ví dụ, chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp bao gồm danh sách các yếu tố không nhất thiết chỉ giới hạn ở các yếu tố đó mà có thể bao gồm các yếu tố khác không được liệt kê rõ ràng hoặc vốn có của chế phẩm, hỗn hợp, quy trình hoặc phương pháp đó.

Thuật ngữ biến chuyển “chứa các” không bao gồm yếu tố, bước hoặc thành phần bất kỳ không được chỉ định. Nếu trong yêu cầu bảo hộ, điều này sẽ đóng yêu cầu đối với việc bao gồm các chất khác không phải các chất đã được trích dẫn ngoại trừ các tạp chất liên quan thông thường. Khi thuật ngữ “chứa các” xuất hiện trong mệnh đề của phần Yêu cầu bảo hộ, thay vì ngay sau phần mở đầu, nó chỉ giới hạn phần tử được nêu trong mệnh đề đó; các yếu tố khác không được loại trừ khỏi yêu cầu bảo hộ nói chung.

Thuật ngữ biến chuyển “về cơ bản chứa” được sử dụng để xác định chế phẩm hoặc phương pháp mà bao gồm các chất, bước, các dấu hiệu, các hợp phần, hoặc các thành tố, ngoài các loại được liệt kê rõ ràng, với điều kiện các chất, bước, các dấu

hiệu, các hợp phần, hoặc các thành tố bổ sung này không ảnh hưởng về chất lên các đặc tính cơ bản và mới của sáng chế. Thuật ngữ “về cơ bản chứa” xảy ra giữa “chứa” và “chứa các”.

Trong trường hợp người nộp đơn đã xác định sáng chế hoặc một phần của nó bằng một thuật ngữ kết thúc mở như là “bao gồm”, thì nên hiểu rằng (trừ khi có quy định khác) phần mô tả nên được mô tả để mô tả sáng chế này bằng cách sử dụng các thuật ngữ “về cơ bản chứa” hay “chứa các”.

Hơn nữa, trừ khi được tuyên bố rõ ràng ngược lại, thì “hoặc” dùng để chỉ sự bao gồm hoặc không phải là sự loại trừ. Ví dụ, một điều kiện A hoặc B được thỏa mãn bởi bất kỳ một trong những điều sau đây: A là đúng (hoặc hiện tại) và B là sai (hoặc không có mặt), A là sai (hoặc không có mặt) và B là đúng (hoặc hiện tại) và cả A và B đều đúng (hoặc hiện tại).

Ngoài ra, các mạo từ không xác định, “một” trước một phần tử hoặc thành phần của sáng chế được dự định là không hạn chế về số các trường hợp (tức là sự xuất hiện) của phần tử hoặc thành phần. Do đó, “một” nên được hiểu là bao gồm một hoặc ít nhất một, và dạng từ số ít của thành phần hoặc thành phần cũng bao gồm số nhiều trừ khi số đó rõ ràng là số ít.

Như được đề cập trong Bản mô tả này, thuật ngữ “loài gây hại không xương sống” có thể bao gồm động vật chân đốt, động vật chân bụng, giun tròn và giun sán có tầm quan trọng về mặt kinh tế như sâu bệnh. Thuật ngữ “động vật chân khớp” bao gồm côn trùng, ve bét, nhện, bọ cạp, rết, rết nhiều chân, bọ thuốc và rết vườn. Thuật ngữ “động vật chân bụng” bao gồm ốc sên, sên và các loại bộ ốc cạn khác. Thuật ngữ “giun tròn” bao gồm các thành viên của ngành giun tròn, giun tròn ăn cây và giun tròn thuộc giun sán ký sinh trên động vật. Thuật ngữ “giun sán” bao gồm tất cả các loại giun tròn (phylum Nematoda), giun lõi (phylum Nematoda, lớp Secernentea), sán

lá (phylum Platyhelminthes, lớp Tematoda), giun đầu móc (phylum Acanthocephala), và sán dây (phylum Platyhelminthes, lớp Cestoda).

Trong bản mô tả này, thuật ngữ “kiểm soát loài gây hại không xương sống” tức là ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (bao gồm cả tỷ lệ tử vong, giảm ăn, và/hoặc gián đoạn giao phối), và các thuật ngữ liên quan được xác định tương tự.

Thuật ngữ “nông học” là để chỉ việc sản xuất các loại cây trồng như thực phẩm và chất xơ và bao gồm sự phát triển của ngô hoặc bắp, đậu nành và các loại đậu khác, gạo, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và gạo), rau lá (ví dụ, rau diếp, bắp cải và các loại cây trồng khác), rau quả (ví dụ, cà chua, hạt tiêu, cà tím, cây họ cải và dưa chuột), khoai tây, khoai lang, nho, bông, trái cây (ví dụ, dạng quả táo, quả hạch và dòng cam quýt), trái cây nhỏ (ví dụ, quả mọng và anh đào) và các loại cây trồng đặc sản khác (ví dụ, cải dầu, hướng dương và ô liu).

Thuật ngữ “phi nông học” là để chỉ các loại khác với các loại cây trồng trên cánh đồng, chẳng hạn như cây trồng làm vườn (ví dụ, nhà kính, vườn ươm hoặc cây cảnh không được trồng trên một cánh đồng), dân cư, nông nghiệp, thương mại và công nghiệp, cỏ (ví dụ, trang trại cỏ xanh, đồng cỏ, sân golf, bãi cỏ, sân thể thao, v.v.), sản phẩm gỗ, sản phẩm được lưu trữ, quản lý nông-lâm nghiệp và thực vật, ứng dụng y tế công cộng (tức là người) và y tế cho động vật (ví dụ, động vật đã được thuần hóa như vật nuôi, gia súc và gia cầm, động vật chưa được thuần hóa như động vật hoang dã).

Thuật ngữ “sức sống của cây trồng” là để chỉ tỷ lệ sinh trưởng hoặc tích lũy sinh khối của cây trồng. “sự gia tăng về sức sống” là để chỉ sự gia tăng sinh trưởng hoặc tích lũy sinh khối ở cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý. Thuật ngữ “năng suất cây trồng” là để chỉ phần thu được của nguyên liệu cây trồng, cả về số lượng và chất lượng, thu được sau khi thu hoạch một cây trồng. Thuật ngữ

“gia tăng năng suất cây trồng” là để chỉ việc tăng năng suất cây trồng so với cây trồng đối chứng không được xử lý.

Thuật ngữ “lượng hữu hiệu về mặt sinh học” là để chỉ lượng hợp chất có hoạt tính sinh học (ví dụ, Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2) đủ để tạo ra hiệu quả sinh học mong muốn khi dùng cho (tức là tiếp xúc với) loài gây hại không xương sống cần được kiểm soát hoặc môi trường của nó, hoặc cho cây, hạt giống mà từ đó cây được trồng, hoặc vị trí của cây (ví dụ, môi trường sinh trưởng) để bảo vệ cây khỏi bị tổn thương bởi loài gây hại không xương sống hoặc cho hiệu quả mong muốn khác (ví dụ, tăng sức sống của cây).

Các phương án của sáng chế như được mô tả trong phần Bản chất kỹ thuật của Sáng chế bao gồm những phương án được mô tả dưới đây.

Phương án 1. Hợp chất 1.

Phương án 2. Hợp chất có Công thức 2, trong đó n là 0, 1, hoặc 2

Phương án 3. Hợp chất có Công thức 2, trong đó n là 0.

Phương án 4. Hợp chất có Công thức 2, trong đó n là 1.

Phương án 5. Hợp chất có Công thức 2, trong đó n là 2.

Phương án 6. Hợp chất, trong đó hợp chất này được chọn từ:

N-[1-(diflometyl)xcyclopropyl]-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit; *N*-[1,1-dimetyl-2-(metylthio)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit; *N*-[1,1-dimetyl-2-(metylsulfinyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit; và *N*-[1,1-dimetyl-2-(metylsulfonyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit; hoặc hỗn hợp của các hợp chất bất kỳ này.

Phương án 7. Chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Phương án 8. Chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acephate, acequinocyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, xycloxaprid, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxit, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flucythrinate, flufenrim, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, fluorpyram, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, heptafluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methopren, metoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, monofluthrin, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion,

parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumide, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn gây bệnh côn trùng, tất cả các chủng thuộc virus *Nucleo polyhedrosis*, virus gây bệnh côn trùng và nấm gây bệnh côn trùng.

Phương án 9. Chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, 3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylaminocarbonyl)phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamid, buprofezin, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron,

hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methopren, metoxyfenozide, metofluthrin, monofluthrin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, tetrametylfluthrin, triazamate, triflumuron, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng thuộc virus *Nucleo polyhedrosis*.

Phương án 10. Phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2.

Phương án 11. Hạt giống đã được xử lý chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% trọng lượng của hạt giống trước khi xử lý.

Đáng chú ý là các hợp chất của sáng chế được đặc trưng bởi các mô hình trao đổi chất thuận lợi và/hoặc đất còn sót lại và có hoạt tính kiểm soát phổ của các loài gây hại không xương sống nông học và phi nông học.

Đặc biệt lưu ý, vì lý do phổ kiểm soát loài gây hại không xương sống và tầm quan trọng kinh tế, bảo vệ cây trồng nông học khỏi thiệt hại hoặc thương tích do loài gây hại không xương sống bằng cách kiểm soát loài gây hại không xương sống là các phương án của sáng chế. Các hợp chất của sáng chế vì tính chất chuyển vị thuận lợi hoặc tính hệ thống của chúng trong thực vật cũng bảo vệ lá hoặc các bộ phận khác của cây không tiếp xúc trực tiếp với Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 hoặc chế phẩm chứa hợp chất này.

Cũng đáng chú ý vì các Phương án theo sáng chế là các chế phẩm chứa hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên, cũng như Phương án bất kỳ khác được mô tả trong tài liệu này, và bất kỳ sự kết hợp nào của chúng, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, các chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

Đáng chú ý hơn nữa là các Phương án theo sáng chế là chế phẩm để kiểm soát loài gây hại không xương sống chứa hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên, cũng như Phương án bất kỳ khác được mô tả trong tài liệu này, và bất kỳ sự kết hợp nào được chọn từ nhóm bao gồm của một chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng chất lỏng, các chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung. Phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên (ví dụ, như chế phẩm được mô tả trong sáng chế này).

Phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm chứa hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên, ở dạng chế phẩm lỏng ngâm trong đất. Phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho đất tiếp xúc với chế phẩm lỏng dưới dạng ngâm trong đất chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên.

Phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm dạng phun để kiểm soát loài gây hại không xương sống chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên và một chất đẩy. Phương án theo sáng chế còn bao gồm chế phẩm dạng bã để kiểm soát loài gây hại không xương sống chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học hợp chất theo Phương án bất kỳ trong

số các Phương án trên, một hoặc nhiều thức ăn, tùy ý một chất hấp dẫn, và tùy ý chất giữ ẩm. Phương án theo sáng chế còn bao gồm cơ cấu để kiểm soát loài gây hại không xương sống chứa chế phẩm dạng bả nêu trên và một phòng giữ thích hợp để nhận được chế phẩm dạng bả nêu trên, trong đó phòng giữ này có ít nhất một lỗ có kích thước để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua lỗ mở để loài gây hại không xương sống có thể tiếp cận với thành phần mồi này từ một vị trí bên ngoài phòng giữ và trong đó phòng giữ còn được điều chỉnh phù hợp hơn để được đặt trong hoặc gần một địa điểm có hoạt động tiềm năng hoặc đã biết đối với loài gây hại không xương sống.

Phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho hạt giống tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên.

Phương án theo sáng chế cũng bao gồm các phương pháp bảo vệ động vật khỏi loài gây hại ký sinh ở động vật không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho động vật dùng một lượng hữu hiệu chống ký sinh trùng hợp chất theo Phương án bất kỳ trong số các Phương án trên.

Phương án theo sáng chế còn bao gồm phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 (ví dụ, như chế phẩm được mô tả trong sáng chế này), với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp điều trị y tế cho cơ thể người bằng liệu pháp.

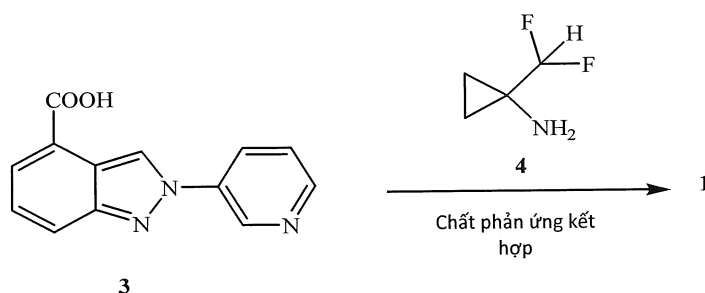
Sáng chế còn đề cập đến phương pháp mà trong đó, loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó được tiếp xúc với chế phẩm chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha

loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp điều trị y tế cho cơ thể người bằng liệu pháp.

Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 có thể được điều chế bằng các phương pháp và biến thể sau đây như được mô tả trong các Sơ đồ 1 và 2. các chữ viết tắt sau đây được sử dụng: DMF là *N,N*-dimethylformamit, DCC là *N,N'*-dicyclohexylcarbodiimide, và HATU là 1-[bis(dimethylamino)metylen]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]pyridini 3-oxid hexaflo-phosphat.

Hợp chất 1-có thể được điều chế từ Hợp chất 3 bằng phương pháp được thể hiện trong Sơ đồ 1. Trong phương pháp này, Hợp chất 1 được điều chế bằng phản ứng tạo thành liên kết amit của nhóm carboxyl của Hợp chất 3-với nhóm amin của Hợp chất 4 với sự có mặt của tác nhân kết hợp amit như DCC hoặc HATU. Đối với tác nhân phản ứng và điều kiện phản ứng tiêu biểu, xem tài liệu Jones, J. *The Chemical Synthesis of Peptides*, International Series of Monographs on Chemistry, Oxford University: Oxford, 1994.

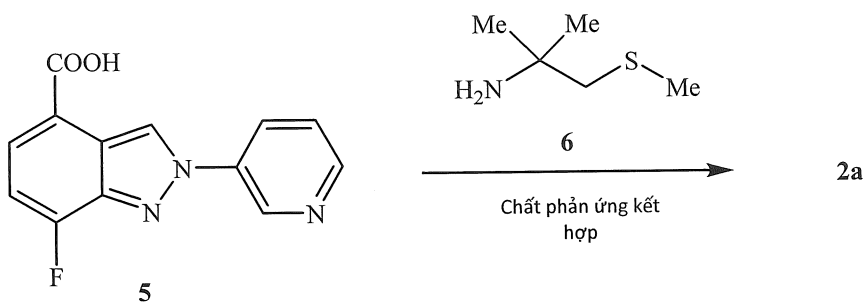
Sơ đồ 1



Hợp chất 3 (CAS Registry Number 2001277-98-9) là đã biết trong lĩnh vực kỹ thuật này.

Hợp chất có Công thức 2 trong đó n là 0 (Hợp chất 2a) có thể được điều chế từ Hợp chất 5 bằng phương pháp được thể hiện trong Sơ đồ 2. Phương pháp theo Sơ đồ 2 là tương tự như phương pháp được mô tả để điều chế Hợp chất 1 trong Sơ đồ 1. Trong phương pháp này, hợp chất có Công thức 2 được điều chế bằng phản ứng tạo liên kết amit của nhóm carboxylic của Hợp chất 5 với nhóm amin của Hợp chất 6 với sự có mặt của chất phản ứng kết hợp amit như DCC hoặc HATU.

Sơ đồ 2



Hợp chất có Công thức 2 trong đó n là 1 hoặc 2 (tức là tương ứng là sulfoxit 2b hoặc sulfon 2c) có thể được điều chế bằng cách oxy hóa sulfua 2a. Nhiều phương pháp và chất phản ứng đã được biết đến trong lĩnh vực kỹ thuật này để oxy hóa sulfua thành sulfoxit và sulfon. Ví dụ về các chất phản ứng oxy hóa như vậy bao gồm axit *meta*-cloperoxybenzoic và natri periodat.

Cần phải hiểu rằng, một số chất phản ứng và các điều kiện phản ứng được mô tả trên đây để điều chế Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 có thể không tương hợp với một số chức có mặt trong các sản phẩm trung gian. Trong các trường hợp này, việc đưa trình tự bảo vệ/khử bảo vệ hoặc hoán chuyển nhóm chức vào quy trình tổng hợp sẽ giúp thu được các sản phẩm mong muốn. Việc sử dụng và lựa chọn các nhóm bảo vệ là dễ dàng đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực tổng hợp

hóa học (xem, ví dụ, Greene, T. W.; Wuts, P.g. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cần hiểu rằng, trong một số trường hợp, sau khi đưa vào chất phản ứng như được thể hiện trong các sơ đồ riêng rẽ, có thể cần thực hiện bước tổng hợp bổ sung không được mô tả chi tiết để hoàn thành quy trình tổng hợp Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng có thể cần thực hiện kết hợp các bước được minh họa trong các Sơ đồ trên đây theo một trình tự ngoài trình tự được thể hiện cụ thể để điều chế Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2.

Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này cũng cần hiểu rằng, Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và các sản phẩm trung gian được mô tả ở đây có thể tham gia vào các phản ứng ưa điện tử, ái nhân, gốc, kim loại hữu cơ, oxy hoá, và khử để bổ sung phân tử thể hoặc cải biến phân tử thể đang có.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Không cần mô tả chi tiết hơn, tin rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này bằng cách sử dụng phần mô tả trên đây có thể sử dụng sáng chế ở phạm vi rộng nhất của nó. Vì vậy, các Ví dụ tổng hợp sau chỉ minh họa và không giới hạn phần mô tả theo cách bất kỳ. Các bước trong các Ví dụ tổng hợp minh họa quy trình cho mỗi bước trong toàn bộ một quá trình chuyển hóa, và nguyên liệu ban đầu cho mỗi bước có thể không nhất thiết được điều chế bằng con đường điều chế cụ thể có quy trình được mô tả trong các Ví dụ hoặc Bước khác. Tỷ lệ phần trăm là khối lượng chỉ khác là hỗn hợp dung môi sắc ký hoặc trừ khi có quy định khác. Các phần và tỷ lệ phần trăm của hỗn hợp dung môi sắc ký được tính theo thể tích, trừ khi có quy định khác. Phổ ^1H NMR được thông báo theo trường thấp ppm từ dung dịch tetrametylsilan; “s” nghĩa là vạch đơn, “d” nghĩa là vạch đôi, “t” nghĩa là vạch ba, “q” có nghĩa là vạch bốn, “m” có nghĩa là đa trùng, “dd” có nghĩa là vạch đôi của vạch

đôi, “dt” có nghĩa là vạch đôi của vạch ba, và “br s” có nghĩa là vạch đơn rộng. DMF tức là *N,N*-dimethylformamit. Số các hợp chất là để chỉ BẢNG Chỉ số A.

Ví dụ tổng hợp 1

Điều chế *N*-[1-(diflometyl)xyclopropyl]-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit (Hợp chất 1)

Bước A: Điều chế *N*-[1-(diflometyl)xyclopropyl]-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit

Dung dịch chứa axit 2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxylic (100mg, 0,42mmol, CAS Registry Number 2001277-98-9), HATU (190mg, 0,5mmol), 1-(diflometyl)xyclopropanamin hydroclorua (71mg, 0,5mmol) trong DMF (2ml) được xử lý bằng triethylamin (174μl, 1,25mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy qua đêm ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng tiếp đó được tinh chế trực tiếp bằng cách sắc ký cột pha nghịch đảo [cột C18 được rửa giải bằng 10%-100% MeCN/MeOH (1:1) với nước] để thu được hợp chất nêu ở đề mục này, hợp chất theo sáng chế (105mg, hiệu suất 76%). ¹H NMR (500MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9,35-9,39 (m, 2H) 9,14 (s, 1H) 8,67-8,68 (m, 1H) 8,55-8,58 (m, 1H) 7,94-7,97 (m, 1H), 7,73-7,75 (m, 1H), 7,63-7,67 (m, 1H), 7,41-7,45 (m, 1H), 6,21 (t, 1H), 1,13-1,17 (m, 2H), 1,02-1,06 (m, 2H).

Ví dụ tổng hợp 2

Điều chế *N*-[1,1-dimetyl-2-(metylthio)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit (Hợp chất 2a)

Bước A: Điều chế *N*-[1,1-dimetyl-2-(metylthio)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit (Hợp chất 2a)

Dung dịch chứa axit 7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxylic (10g, 39mmol), HATU (17,7g, 47mmol), 2-metyl-1-metylsulfanyl-propan-2-amin (7g, 58mmol) trong DMF (100ml) được xử lý bằng trietylamin (16ml, 117mmol). Hỗn hợp phản ứng được khuấy trong 4 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Hỗn hợp phản ứng được pha loãng bằng EtOAc (300ml) và được rửa bằng nước (6 x 100ml). Lớp hữu cơ được tách riêng và được cô trong chân không. Chất rắn thô thu được được tinh chế bằng cách sắc ký pha bình thường (silicagel rửa giải bằng 70-100% EtOAc trong hexan) để thu được hợp chất nêu ở đề mục này, hợp chất theo sáng chế (9,9g, hiệu suất 71%). ¹H NMR (500MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm 9,37-9,43 (m, 2H), 8,69-8,72 (m, 1H), 8,56-8,60 (m, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,64-7,70 (m, 2 H), 7,22-7,27 (m, 1H), 3,11 (s, 2H), 2,09 (s, 3H), 1,47 (s, 6H).

Hợp chất 2b (*N*-[1,1-dimetyl-2-(metylsulfinyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H* indazol-4-carboxamit), và Hợp chất 2c (*N*-[1,1-dimetyl-2-(metylsulfonyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H* indazol-4-carboxamit, có thể được điều chế bằng cách oxy hóa Hợp chất 2a.

Hợp chất theo sáng chế thường được sử dụng làm hoạt chất diệt loài gây hại không xương sống trong chế phẩm, tức là chế phẩm, với ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng dạng rắn và chất pha loãng dạng lỏng, dùng làm chất mang. Các thành phần của chế phẩm hoặc

hỗn hợp được chọn phù hợp với các tính chất lý học của hoạt chất, kiểu dùng và các yếu tố môi trường như loại đất, độ ẩm và nhiệt độ.

Dạng pha chế hữu ích bao gồm cả chế phẩm dạng lỏng và chế phẩm dạng rắn. Chế phẩm dạng lỏng bao gồm dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa), huyền phù, nhũ tương (bao gồm vi nhũ tương và/hoặc nhũ tương dầu trong nước) và các dạng tương tự tùy ý có thể được làm đặc thành các gel. Chế phẩm dạng lỏng chứa nước thường là dạng cô đặc tan, dạng cô đặc hỗn dịch, hỗn dịch viên nang, nhũ tương cô đặc, vi nhũ tương, nhũ tương dầu trong nước, chất cô đặc dễ chảy và nhũ tương-huyền phù. Chế phẩm dạng lỏng không chứa nước thường là dạng cô đặc dễ nhũ hóa, dạng cô đặc vi nhũ hóa, dạng cô đặc dễ phân tán và dạng phân tán dạng dầu.

Dạng thông thường của chế phẩm dạng rắn là dạng bột rắc, bột, dạng hạt, dạng viên tròn, viên hình thoi, viên nén, dạng màng bao (chứa các lớp phủ hạt) và các dạng tương tự, có thể dễ phân tán trong nước (“thấm ướt”) hoặc hòa tan trong nước. Lớp màng và lớp phủ được tạo ra từ các dung dịch tạo màng hoặc huyền phù dễ chảy đặc biệt hữu ích dùng để xử lý hạt. Hoạt chất có thể được bao (vi) nang và còn được tạo thành hỗn dịch hoặc chế phẩm rắn; theo cách khác, toàn bộ chế phẩm chứa hoạt chất có thể được bao nang (hoặc “được bao ngoài”). Việc bao nang này có thể kiểm soát hoặc làm chậm quá trình giải phóng hoạt chất. Hạt dễ nhũ hóa kết hợp được các ưu điểm của cả chế phẩm dạng cô đặc dễ nhũ hóa lẫn chế phẩm dạng hạt khô. Chế phẩm đậm đặc được sử dụng chủ yếu làm chất trung gian để pha chế tiếp.

Chế phẩm dạng phun thường được đưa vào môi trường thích hợp trước khi phun. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn như vậy được pha chế để được pha loãng một cách dễ dàng trong môi trường phun, thường là nước, nhưng đôi khi là môi trường thích hợp khác như hydrocacbon thơm hoặc parafin hoặc dầu thực vật. Lượng dung dịch để phun có thể nằm trong khoảng từ một tới một vài nghìn lít cho một hecta, nhưng thường là nằm trong khoảng từ mười tới vài trăm lít cho một hecta. Chế phẩm

phun có thể được trộn sẵn trong thùng với nước hoặc môi trường thích hợp khác dùng để xử lý lá bằng cách phun lên không trung hoặc đưa vào đất, hoặc đưa vào môi trường sinh trưởng của thực vật. Chế phẩm dạng lỏng và dạng rắn có thể được định lượng trực tiếp trong hệ tưới phun hoặc được định lượng trong rãnh khi gieo trồng.

Chế phẩm thường chứa lượng hữu hiệu của hoạt chất, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt trong khoảng gần đúng sau đây để tổng lượng là 100 phần trăm khối lượng.

	Phần trăm khối lượng		
	<u>Hoạt chất</u>	<u>Chất pha loãng</u>	<u>Chất hoạt động bề mặt</u>
Hạt, viên nén và bột dễ hòa tan trong nước và dễ phân tán trong nước	0,001–90	0–99,999	0–15
Thể phân tán dạng dầu, huyền phù, nhũ tương, dung dịch (bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa)	1–50	40–99	0–50
Bột mịn dễ rắc khô	1–25	70–99	0–5
Hạt và viên tròn	0,001–99	5–99,999	0–15
Chế phẩm đậm đặc	90–99	0–10	0–2

Chất pha loãng dạng rắn bao gồm, ví dụ, đất sét như bentonit, montmorillonit, attapulgit và kaolanh, thạch cao, xenluloza, titan dioxit, kẽm oxit, tinh bột, dextrin, đường (ví dụ, lactoza, sucroza), silic oxit, bột đá talc, mica, đất tảo silic, ure, canxi carbonat, natri carbonat và bicarbonat, và natri sulfat. Chất pha loãng dạng rắn thông thường được mô tả trong Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Chất pha loãng dạng lỏng bao gồm, ví dụ, nước, *N,N*-dimetylalkanamit (ví dụ, *N,N*-dimetylformamit), limonen, dimetyl sulfoxit, *N*-alkylpyroliton (ví dụ, *N*-metylpyrolitinon), etylen glycol, trietylen glycol, propylen glycol, dipropylen glycol, polypropylen glycol, propylen carbonat, butylen carbonat, parafin (ví dụ, dầu khoáng trắng, parafin thông thường, isoparafin), alkylbenzen, alkylnaphtalen, glyxerin, glyxerol triaxetat, sorbitol, triacetin, hydrocacbon thơm, chất béo đã được khử gốc thơm, alkylbenzen, alkylnaphtalen, keton như xyclohexanon, 2-heptanon, isophoron và 4-hydroxy-4-metyl-2-pentanon, axetat như isoamyl axetat, hexyl axetat, heptyl axetat, octyl axetat, nonyl axetat, tridexyl axetat và isobornyl axetat, các este khác như este lactat alkylat hóa, este dibazơ và γ -butyrolacton, và các rượu, chúng có thể là mạch thẳng, mạch nhánh, bão hoà hoặc không bão hoà như metanol, etanol, *n*-propanol, rượu isopropylic, *n*-butanol, rượu isobutylic, *n*-hexanol, 2-etylhexanol, *n*-octanol, decanol, rượu isodexylic, isooctadecanol, rượu xetylic, rượu laurylic, rượu tridexylic, rượu oleylic, xyclohexanol, rượu tetrahydrofurfurylic, rượu diaxeton và rượu benzylic. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm các este glyxerol của các axit béo bão hoà và không bão hoà (thường là có 6 đến 22 nguyên tử cacbon), như dầu thực vật từ hạt và quả (ví dụ, dầu ôliu, thầu dầu, hạt lanh, vừng, ngũ cốc (ngô), lạc, hướng dương, hạt nho, rum, hạt bông, đậu tương, hạt cải dầu, dừa và cọ), chất béo có nguồn gốc động vật (ví dụ, mỡ bò, mỡ lợn, dầu gan cá tuyết, dầu cá), và các hỗn hợp của chúng. Chất pha loãng dạng lỏng cũng bao gồm các axit béo được alkylat hóa (ví dụ, được metyl hóa, etyl hóa, butyl hóa) trong đó các axit béo có thể thu được bằng cách thủy phân các este glyxerol từ các nguồn thực vật và động vật, và có thể được tinh chế bằng cách chưng cất. Chất pha loãng dạng lỏng thông thường được mô tả trong Marsden, *Solvents Guit*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Chế phẩm dạng rắn và dạng lỏng theo sáng chế thường chứa một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Khi bổ sung vào chất lỏng, chất hoạt động bề mặt thường biến đổi, thường làm giảm, sức căng bề mặt của chất lỏng. Tùy thuộc vào bản chất của các

nhóm ưa nước và ưa chất béo trong phân tử chất hoạt động bề mặt, có thể sử dụng chất hoạt động bề mặt làm chất thấm ướt, chất phân tán, chất nhũ hoá hoặc chất khử bọt.

Chất hoạt động bề mặt có thể được phân loại thành dạng không ion, anion hoặc cation. Chất hoạt động bề mặt không ion hữu dụng đối với các hỗn hợp này bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: rượu alkoxylat như rượu alkoxylat trên cơ sở các rượu tự nhiên và tổng hợp (có thể là mạch nhánh hoặc mạch thẳng) và được điều chế từ các rượu và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng; etoxylat amin, alkanolamit và alkanolamit được etoxylat hóa; triglyxerit được alkoxylat hóa như đậu tương được etoxylat hóa, dầu thầu dầu và hạt cải dầu; alkylphenol alkoxylat như octylphenol etoxylat, nonylphenol etoxylat, dinonyl phenol etoxylat và dodexyl phenol etoxylat (được điều chế từ các phenol và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); polyme khối được điều chế từ etylen-oxit hoặc propylen-oxit và các polyme khối nghịch, trong đó các khối ở cuối mạch được điều chế từ propylen-oxit; các axit béo etoxylat hóa; các este béo và các dầu được etoxylat hóa; các metyl este được etoxylat hóa; tristyrylphenol được etoxylat hóa (bao gồm các dạng được điều chế từ etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các este của axit béo, các este glyxerol, các dẫn xuất nền mỡ lông cừu, các este polyetoxylat như các este sorbitan axit béo được polyetoxy hoá, các este sorbitol axit béo được polyetoxy hoá và các este glyxerol axit béo được polyetoxy hoá; các dẫn xuất sorbitan khác như các este sorbitan; chất hoạt động bề mặt polyme như các copolyme ngẫu nhiên, các copolyme khối, nhựa peg alkyl (polyetylen glycol), các polyme ghép hoặc dạng lược và các polyme hình sao; polyetylen glycol (peg); các este polyetylen glycol axit béo; chất hoạt động bề mặt nền silic; và dẫn xuất của đường như este sucroza, alkyl polyglycosit và alkyl polysaccarit.

Chất hoạt động bề mặt anion hữu dụng bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các axit alkylaryl sulfonic và các muối của chúng; rượu được carboxylat hóa hoặc etoxylat alkylphenol; các dẫn xuất diphenyl sulfonat; lignin và các dẫn xuất của lignin như lignosulfonat; các axit maleic hoặc succinic hoặc các anhydrit của chúng; olefin sulfonat; các este phosphat như các este phosphat của rượu alkoxyat, các este phosphat của alkylphenol alkoxyat và các este phosphat của styryl phenol etoxyat; chất hoạt động bề mặt nền protein; dẫn xuất sarcosin; styryl phenol ete sulfat; sulfat và sulfonat của các dầu và các axit béo; sulfat và sulfonat của alkylphenol được etoxylat hóa; sulfat của các rượu; sulfat của các rượu được etoxylat hóa; các sulfonat của amin và các amit như *N,N*-alkyltaurat; các sulfonat của benzen, cumen, toluen, xylen, và dodexyl và tridexylbenzen; các sulfonat của naphtalen ngưng tụ; các sulfonat của naphtalen và alkyl naphtalen; các sulfonat của dầu mỏ được cất phân đoạn; sulfosuccinamat; và sulfosuccinat và các dẫn xuất của chúng như muối dialkyl sulfosuccinat.

Chất hoạt động bề mặt cation hữu ích bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở: các amit và các amit được etoxylat hóa; các amin như *N*-alkyl propandiamin, tripropylentriamin và dipropylentetramin, và các amin được etoxylat hóa, các diamin được etoxylat hóa và các amin được propoxyat hóa (được điều chế từ các amin và etylen-oxit, propylen-oxit, butylen-oxit hoặc hỗn hợp của chúng); các muối amin như amin axetat và các muối diamin; các muối amoni bậc bốn như muối bậc bốn, các muối bậc bốn và các muối được tạo bậc bốn hai lần được etoxylat hóa; và amin-oxit như alkyl dimetylamin-oxit và bis-(2-hydroxyetyl)-alkylamin-oxit.

Cũng hữu dụng đối với các chế phẩm theo sáng chế là hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và anion hoặc hỗn hợp của chất hoạt động bề mặt không ion và cation. Chất hoạt động bề mặt không ion, anion và cation và các dạng sử dụng được khuyến dùng của chúng được đề cập trong nhiều ấn phẩm đã được công bố bao gồm *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, Ấn phẩm hàng năm của Mỹ và quốc

tế do McCutcheon's Division xuất bản, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; and A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa hỗn hợp tá dược và chất phụ gia, là đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực dưới dạng chất trợ điều chế (một số chất trong số các chất này có thể được xem là hoạt động chức năng như chất pha loãng dạng rắn, chất pha loãng dạng lỏng và chất hoạt động bề mặt). Tá dược và chất phụ gia như vậy có thể kiểm soát được: độ pH (dung dịch đệm), hiện tượng tạo bọt trong quá trình xử lý (chất chống tạo bọt như polyorganosiloxan), hiện tượng lắng hoạt chất (chất tạo huyền phù), độ nhớt (chất làm đặc tạo sol-gel thuận nghịch), sự phát triển của vi khuẩn trong đồ chứa (chất kháng khuẩn), sự đông đặc của sản phẩm (chất chống đông), màu sắc (chất phân tán tạo màu/chất nhuộm), hiện tượng rửa trôi (chất tạo màng hoặc chất dính), sự bay hơi (chất làm chậm bay hơi), và các hiện tượng khác tương tự. Chất tạo màng bao gồm, ví dụ, polyvinyl axetat, copolyme polyvinyl axetat, copolyme polyvinylpyrroliton-vinyl axetat, rượu polyvinyllic, copolyme rượu polyvinyllic và sáp. Ví dụ về tá dược và chất phụ gia cho chế phẩm bao gồm chất được liệt kê trong *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, các ấn phẩm hàng năm của thế giới và Bắc Mỹ do McCutcheon's Division xuất bản, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; và Công bố đơn PCT số WO 03/024222.

Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và các hoạt chất khác bất kỳ thường được đưa vào các hỗn hợp này bằng cách hoà tan hoạt chất trong dung môi hoặc bằng cách nghiền trong chất pha loãng dạng lỏng hoặc khô. Các dung dịch, bao gồm dạng cô đặc dễ nhũ hóa, có thể được điều chế đơn giản bằng cách trộn các thành phần này với nhau. Nếu dung môi chứa hỗn hợp lỏng được dự định để sử dụng làm dạng cô đặc dễ nhũ hóa là không thể trộn lẫn với nước, thì chất nhũ hoá thường được

bổ sung để nhũ hóa dung môi chứa hoạt chất khi pha loãng với nước. Huyền phù đặc chứa hoạt chất, với hạt có đường kính tới $2,000\mu\text{m}$ có thể được nghiền ướt bằng cách sử dụng các thiết bị nghiền để thu được các hạt có đường kính trung bình dưới $3\mu\text{m}$. Dung dịch nước huyền phù đặc có thể được tạo thành hỗn dịch dạng cô đặc (ví dụ, xem, U.S. 3,060,084) hoặc được xử lý tiếp bằng cách sấy phun để thu được hạt phân tán trong nước. Chế phẩm khô thường cần tới quy trình nghiền khô, quy trình này tạo ra đường kính hạt trung bình nằm trong khoảng từ 2 tới $10\mu\text{m}$. Bột mịn để rắc khô và bột có thể được điều chế bằng cách trộn và thường là nghiền như bằng máy nghiền búa hoặc máy nghiền dùng năng lượng lỏng. Các hạt và viên tròn có thể được tạo ra bằng cách phun hoạt chất lên chất mang dạng hạt đã được tạo ra trước hoặc bằng các kỹ thuật kết tụ. Xem, Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry’s Chemical Engineer’s Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, các trang 8–57 và sau đó, và WO 91/13546. Dạng viên tròn có thể được bào chế như được mô tả trong U.S. 4,172,714. Hạt phân tán trong nước và tan trong nước có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 và DE 3,246,493. Viên nén có thể được điều chế như được mô tả trong U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 và U.S. 5,208,030. Các lớp màng có thể được điều chế như được mô tả trong GB 2,095,558 và U.S. 3,299,566.

Để biết thêm thông tin về các phương pháp điều chế đã được đề cập trong lĩnh vực kỹ thuật này, xem T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture” in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Cũng xem trong U.S. 3,235,361, cột 6, dòng 16 đến cột 7, dòng 19 và các Ví dụ 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, dòng 43 đến cột 7, dòng 62 và các Ví dụ 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 và 169–182; U.S. 2,891,855, Cột 3, dòng 66 đến cột 5, dòng 17 và các Ví dụ 1–4;

Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, trang 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; và *Developments in Formulation Technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

Trong các ví dụ sau đây, tất cả các chế phẩm đều được điều chế theo cách thông thường. Không cần mô tả kỹ hơn, các tác giả sáng chế cho rằng người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này có thể sử dụng phần mô tả trên của sáng chế với phạm vi rộng nhất. Do đó, các ví dụ sau chỉ nhằm mục đích minh họa sáng chế và không giới hạn phần mô tả theo bất kỳ cách nào. Phần trăm được tính theo khối lượng trừ khi có quy định khác.

Ví dụ A

Chế phẩm cô đặc có nồng độ cao

Hợp chất 1	98,5%
silic oxit aerogel	0,5%
silic oxit mịn vô định hình tổng hợp	1,0%

Ví dụ B

Bột thấm ướt

Hợp chất 2a	65,0%
dodexylphenol polyetylen glycol ete	2,0%
natri ligninsulfonat	4,0%
natri silicoaluminat	6,0%
monmorilonit (nung)	23,0%

Ví dụ C

Dạng hạt

Hợp chất 2b	10,0%
-------------	-------

hạt atapulgít (chất bay hơi thấp 0,71/0,30mm; hạt đi qua rây Mỹ cỡ số 25–50)	90,0%
--	-------

Ví dụ DViên ép đùn

Hợp chất 2c	25,0%
natri sulfat khan	10,0%
canxi ligninsulfonat thô	5,0%
natri alkylnaphtalensulfonat	1,0%
canxi/magie bentonit	59,0%

Ví dụ EChế phẩm cô đặc dễ nhũ hóa

Hợp chất 1	10,0%
polyoxyetylen sorbitol hexoleat	20,0%
este của axit béo C6–C10 metyl	70,0%

Ví dụ FVi nhũ tương

Hợp chất 2a	5,0%
polyvinylpyrroliton-vinyl axetat copolyme	30,0%
Alkylpolyglycosit	30,0%
glyxeryl monooleat	15,0%
nước	20,0%

Ví dụ GXử lý hạt giống

Hợp chất 2b	20,00%
polyvinylpyrrolidon-vinyl axetat copolyme	5,00%
sáp axit montan	5,00%
canxi ligninsulfonat	1,00%

copolyme khối polyoxyetylen/polyoxypropylen	1,00%
rượu stearyllic (POE 20)	2,00%
polyorganosilan	0,20%
chất nhuộm màu đỏ	0,05%
nước	65,75%

Ví dụ HThanh phân bón

Hợp chất 2c	2,5%
pyrrolidon-styren copolyme	4,8%
tristyrylphenyl 16-etoxylat	2,3%
Bột đá talc	0,8%
tinh bột ngô	5,0%
Phân bón giải phóng chậm	36,0%
kaolin	38,0%
nước	10,6%

Ví dụ IHuyền phù đặc

Hợp chất 1	35%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt nền silic	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
nước	53,7%

Ví dụ JNhũ tương trong nước

Hợp chất 2a	10,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
copolyme axit stearic/polyetylen glycol	1,0%
polyme styren acrylic	1,0%
gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%
chất khử bọt nền silic	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon nền dầu mỏ thơm	20,0
nước	58,7%

Ví dụ KChất phân tán dạng dầu

Hợp chất 2b	25%
polyoxyetylen sorbitol hexaoleat	15%
Đất sét bentonit được cải biến bằng hữu cơ	2,5%
metyl este của axit béo	57,5%

Ví dụ LHuyền phù-nhũ tương

hợp chất 2c	10,0%
imidacloprid	5,0%
copolyme khối butyl polyoxyetylen/polypropylen	4,0%
axit stearic /polyetylen glycol copolyme	1,0%
styren acrylic polyme	1,0%
Gôm xanthan	0,1%
propylen glycol	5,0%

chất khử bọt trên cơ sở silicon	0,1%
1,2-benzisothiazolin-3-on	0,1%
hydrocacbon thơm từ dầu mỏ	20,0%
nước	53,7%

Các hợp chất của sáng chế này thể hiện hoạt tính chống lại một loạt các loài gây hại không xương sống. Những loài gây hại này bao gồm các động vật không xương sống sinh sống ở nhiều môi trường khác nhau, chẳng hạn như tán lá, rễ cây, đất, cây trồng đã thu hoạch hoặc thực phẩm khác, các công trình xây dựng hoặc nguyên tắc động vật. Những loài gây hại này bao gồm, ví dụ, động vật không xương sống ăn lá (bao gồm cả lá, thân, hoa và quả), hạt giống, gỗ, sợi dệt, hoặc máu hoặc mô động vật, và do đó gây thương tích hoặc thiệt hại cho, ví dụ, cây trồng nông học đang sinh trưởng hoặc được lưu giữ, rừng, cây trồng trong nhà kính, đồ trang trí, cây thơm, thực phẩm dự trữ hoặc các sản phẩm sợi, hoặc nhà ở hoặc các công trình kiến trúc khác hoặc phía bên trong của chúng, hoặc có hại cho sức khỏe động vật hoặc sức khỏe cộng đồng. Những người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực kỹ thuật này sẽ biết rõ rằng không phải tất cả các hợp chất đều có hiệu quả như nhau đối với tất cả các giai đoạn phát triển của tất cả các loài gây hại.

Do đó, các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế này rất hữu ích về mặt nông học để bảo vệ cây trồng ngoài đồng ruộng khỏi các loài gây hại từ loài gây hại không xương sống thực vật, và cũng không phải về mặt pháp lý để bảo vệ các loại cây trồng và thực vật làm vườn khác khỏi các loài gây hại loài gây hại không xương sống thực vật. Tiềm năng này bao gồm bảo vệ cây trồng và các loại cây khác (tức là cả nông học và phi nông học) có chứa vật liệu di truyền được đưa vào bằng kỹ thuật di truyền (tức là chuyển gen) hoặc được sửa đổi bằng cách gây đột biến để cung cấp các đặc điểm có lợi. Ví dụ về các đặc điểm đó bao gồm khả năng chống chịu thuốc diệt cỏ, kháng

sâu bệnh thực vật (ví dụ: côn trùng, ve, rệp, nhện, tuyến trùng, ốc sên, nấm gây bệnh thực vật, vi khuẩn và virus), cải thiện sự phát triển của cây trồng, tăng khả năng chống chịu với các điều kiện phát triển bất lợi như nhiệt độ cao hoặc thấp, độ ẩm đất thấp hoặc cao, và độ mặn cao, tăng ra hoa hoặc đậu quả, năng suất thu hoạch lớn hơn, trưởng thành nhanh hơn, chất lượng cao hơn và/hoặc giá trị dinh dưỡng của sản phẩm thu hoạch hoặc cải thiện tính chất bảo quản hoặc chế biến của sản phẩm thu hoạch. Cây chuyển gen có thể được biến đổi để biểu hiện nhiều tính trạng. Ví dụ về thực vật có chứa các đặc điểm được cung cấp bởi kỹ thuật di truyền hoặc gây đột biến bao gồm các giống ngô, bông, đậu tương và khoai tây biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* diệt côn trùng như YIELD GARD[®], KNOCKOUT[®], STARLINK[®], BOLLGARD[®], NuCOTN[®] và NEWLEAF[®], INVICTA RR2 PROTM, và các giống ngô, bông, đậu tương và hạt cải dầu dung nạp thuốc diệt cỏ như ROUNDUP READY[®], LIBERTY LINK[®], IMI[®], STS[®] và CLEARFIELD[®], cũng như cây trồng biểu hiện *N*-acetyltransferase (GAT) để kháng thuốc diệt cỏ glyphosat, hoặc cây trồng chứa gen HRA kháng thuốc diệt cỏ ức chế acetolactat synthase (ALS). Các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế có thể tương tác hiệp đồng với các tính trạng được đưa vào bằng kỹ thuật di truyền hoặc được sửa đổi bằng cách gây đột biến, do đó tăng cường sự biểu hiện kiểu hình hoặc hiệu quả của các tính trạng hoặc tăng hiệu quả kiểm soát loài gây hại không xương sống của các hợp chất và chế phẩm hiện tại. Đặc biệt, các hợp chất và chế phẩm hiện nay có thể tương tác hiệp đồng với sự biểu hiện kiểu hình của protein hoặc các sản phẩm tự nhiên khác độc hại đối với loài gây hại không xương sống để kiểm soát tốt hơn các chất phụ gia đối với những loài gây hại này.

Chế phẩm theo sáng chế này cũng có thể tùy ý chứa các chất dinh dưỡng thực vật, ví dụ, chế phẩm phân bón chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn lọc từ nitơ, photpho, kali, lưu huỳnh, canxi, magiê, sắt, đồng, bo, mangan, kẽm và molybden. Cần lưu ý là các chế phẩm chứa ít nhất một chế phẩm phân bón bao gồm ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật được chọn lọc từ nitơ, phospho, kali, lưu huỳnh,

canxi và magie. Chế phẩm theo sáng chế còn chứa ít nhất một chất dinh dưỡng thực vật có thể ở dạng chất lỏng hoặc chất rắn. Lưu ý là các công thức rắn ở dạng hạt, que nhỏ hoặc viên nén. Chế phẩm rắn bao gồm chế phẩm phân bón có thể được điều chế bằng cách trộn hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế với chế phẩm phân bón cùng với các thành phần công thức và sau đó điều chế công thức bằng các phương pháp như tạo hạt hoặc ép đùn. Các chế phẩm dạng rắn khác có thể được điều chế bằng cách phun dung dịch hoặc huyền phù của hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế trong dung môi dễ bay hơi lên chế phẩm phân bón đã chuẩn bị trước đó ở dạng hỗn hợp ổn định về kích thước, ví dụ: hạt, que nhỏ hoặc viên nén, và sau đó làm bay hơi dung môi.

Sử dụng phi nông học là để chỉ kiểm soát loài gây hại không xương sống trong những khu vực khác ngoài cánh đồng trồng cây. Sử dụng phi nông học các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế bao gồm kiểm soát loài gây hại không xương sống ở ngũ cốc, đậu và thực phẩm dự trữ khác, và trong hàng dệt có thể như quần áo và thảm. Sử dụng phi nông học các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm kiểm soát loài gây hại không xương sống ở cây cảnh, rừng, sân bãi, ven đường và đường sắt, và trên bãi cỏ như bãi cỏ, sân gôn và đồng cỏ. Sử dụng phi nông học các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm kiểm soát loài gây hại không xương sống trong các ngôi nhà và các tòa nhà khác có thể có con người và/hoặc bạn đồng hành, trang trại, trang trại, sở thú hoặc các động vật khác. Sử dụng phi nông học các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế còn bao gồm việc kiểm soát các loài gây hại như mối mọt có thể làm hỏng gỗ hoặc các vật liệu kết cấu khác được sử dụng trong các tòa nhà.

Việc sử dụng phi nông học của hợp chất và chế phẩm theo sáng chế cũng bao gồm bảo vệ sức khỏe con người và động vật bằng cách kiểm soát các loài gây hại không xương sống ký sinh hoặc truyền bệnh truyền nhiễm. Kiểm soát ký sinh trùng trên động vật bao gồm kiểm soát ký sinh trùng bên ngoài ký sinh trên bề mặt cơ thể

vật chủ (ví dụ, vai, nách, bụng, phần trong của đùi) và ký sinh trùng bên trong ký sinh vào bên trong cơ thể của động vật chủ (ví dụ, dạ dày, ruột, phổi, tĩnh mạch, dưới da, mô bạch huyết). Các loài gây hại truyền bệnh hoặc ký sinh bên ngoài bao gồm, ví dụ, bọ chét rất nhỏ, ve, rận, muỗi, ruồi, ve và bọ chét. Nội ký sinh bao gồm giun tim, giun móc và giun xoắn. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để kiểm soát toàn thân và/hoặc không toàn thân đối với sự xâm nhập hoặc lây nhiễm của ký sinh trùng trên động vật. Các hợp chất và chế phẩm theo sáng chế đặc biệt thích hợp để chống lại dịch hại ký sinh bên ngoài hoặc truyền bệnh. Hợp chất và chế phẩm theo sáng chế thích hợp để chống lại các ký sinh trùng phá hoại động vật làm việc nông nghiệp, như gia súc, cừu, dê, ngựa, lợn, lừa, lạc đà, trâu, thỏ, gà mái, gà tây, vịt, ngỗng và ong; động vật nuôi và động vật nuôi như chó, mèo, chim cảnh và cá cảnh; cũng như những động vật được gọi là động vật thử nghiệm, chẳng hạn như chuột đồng, chuột lang, chuột cống và chuột nhắt. Bằng cách chống lại những ký sinh trùng này, tỷ lệ tử vong và độ giảm hiệu suất (về thịt, sữa, len, da, trứng, mật ong, v.v.) được giảm xuống, do đó việc áp dụng chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế cho phép chăn nuôi động vật đơn giản và kinh tế hơn.

Ví dụ về loài gây hại không xương sống nông học hoặc phi nông học bao gồm trứng, ấu trùng và con trưởng thành của loài Lepidoptera, như sâu cắn gié, sâu cắn rễ, sâu đo, và sâu hại bông thuộc họ Noctuidae (ví dụ, sâu đục thân màu hồng (*Sesamia inferens* Walker), sâu đục thân ngô (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), sâu cắn gié miền nam (*Spodoptera eridania* Cramer), sâu cắn gié mùa thu (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), sâu cắn gié củ cải đường (*Spodoptera exigua* Hübner), sâu ăn lá bông (*Spodoptera littoralis* Boisduval), sâu cắn lá vằn vàng (*Spodoptera* hoặc *cnithogalli* Guenée), sâu cắn rễ đen (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), sâu bướm đậu nhung (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), sâu ăn quả xanh (*Lithophane antennata* Walker), sâu cắn gié bắp cải (*Barathra brassicae* Linnaeus), sâu đo đậu tương (*Pseudoplusia includens* Walker), sâu đo cải bắp (*Trichoplusia ni* Huber), sâu đục

chồi thuốc lá (*Heliothis virescens* Fabricius)); sâu đục thân, sâu kén, sâu kéo màng, sâu ốc chóp, sâu cải bắp và sâu gặm thịt lá thuộc họ Pyralidae (ví dụ, sâu đục ngô châu Âu (*Ostrinia Nubilalis* Hubner), sâu cam rôn (*Amyelois transitella* Walker), sâu kéo màng rế ngô (*Crambus caliginosellus* Clemens), cỏ sâu kéo màng (Pyralidae: Crambinae) như sâu cỏ (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), sâu đục thân mía (*Chilo infuscatellus* Snellen), sâu đục thân cà chua (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), sâu cuốn lá xanh (*Cnaphalocrocis medinalis*), sâu gập lá nhỏ (*Desmia funeralis* Hübner), sâu dừa (*Diaphania nitidalis* Stoll), giò giữa bắp cải (*Helluala hydralis* Guenée), sâu đục thân vàng (*Scirpophaga incertulas* Walker), sâu đục cành non (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), sâu đục thân trắng (*Scirpophaga innotata* Walker), sâu đục quả (*Scirpophaga nivella* Fabricius), sâu đục thân hại lúa đầu đen (*Chilo polychrysus* Meyrick), sâu đục thân hại lúa sọc (*Chilo suppressalis* Walker), giò cụm bắp cải (*Crocidolomia binotalis* English)); sâu cuốn lá, sâu đục chồi, sâu hạt, và sâu trái cây thuộc họ Tortricidae (ví dụ, bướm hại táo (*Cydia pomonella* Linnaeus), bướm hại nhỏ (*Endopiza viteana* Clemens), bướm trái cây phương đông (*Grapholita molta* Busck), sâu bướm tuyết hại cam quýt (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), sâu đục quả cam quýt (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), sâu cuốn lá dải đỏ (*Argyrotaenia velutinana* Walker), sâu cuốn lá dải xiên (*Choristoneura rosaceana* Harris), sâu bướm táo màu nâu nhạt (*Epiphyas postvittana* Walker), sâu bướm quả nhỏ European (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), sâu bướm đêm nụ táo (*Pandemis pyrusana* Kearfott), sâu cuốn lá ăn tạp (*Platynota stultana* Walsingham), bướm đêm (barred fruit-tree tortrix: là một loài bướm đêm thuộc họ Tortricidae. Nó được tìm thấy ở châu Âu. Sải cánh dài 16–25 mm) (*Pandemis cerasana* Hübner), bướm đêm hại táo (apple brown tortrix) (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); và nhiều loại thuộc bộ Cánh vẩy có ảnh hưởng về mặt kinh tế khác (ví dụ, sâu tơ (*Plutella xylostella* Linnaeus), sâu hồng hại bông (*Pectinophora gossypiella* Saunders), bướm gypsy (*Lymantria dispar* Linnaeus), sâu đục quả đào (*Carposina niponensis* Walsingham), sâu đục cành đào (*Anarsia lineatella* Zeller), sâu khoai tây

(*Phthorimaea operculella* Zeller), sâu đục lá teniform đốm (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), sâu đục lá táo châu Á (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), sâu gập lá lúa (*Lerodea eufala* Edwards), sâu đục lá táo (*Leucoptera scitella* Zeller)); trứng, nhộng và dạng trưởng thành thuộc loài Blattodea bao gồm gián thuộc họ Blattellidae và Blattidae (ví dụ, gián phương đông (*Blatta orientalis* Linnaeus), gián châu Á (*Blattella asahinai* Mizukubo), gián Đức (*Blattella germanica* Linnaeus), gián sọc nâu (*Supella longipalpa* Fabricius), gián nâu đen (*Periplaneta americana* Linnaeus), gián nâu (*Periplaneta brunnea* Burmeister), gián Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), gián khói nâu (*Periplaneta fuliginosa* Service), gián Úc (*Periplaneta australasiae* Fabr.), gián tôm hùm (*Nauphoeta cinerea* Olivier) và gián tron (*Symploce pallens* Stephens)); trứng, ấu trùng ăn lá, ăn quả, ăn rễ, ăn hạt và mô nước và dạng trưởng thành ăn lá thuộc loài Coleoptera bao gồm một ngũ cốc thuộc họ Anthribidae, Bruchidae, và Curculionidae (ví dụ, bọ vòi voi hại bông (*Anthonomus grandis* Boheman), bọ vòi voi hại lúa nước (*Lissorhoptrus oryzophilus* kuschel), một kho thóc (*Sitophilus granarius* Linnaeus), một gạo (*Sitophilus Oryzae* Linnaeus)), một xanh hàng năm (*Listronotus maculicollis* Dietz), một cỏ xanh (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), một săn (*Sphenophorus venatus vestitus*), một Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); bọ nhảy, bọ cánh cứng hại dưa chuột, sâu hại rễ, bọ ăn lá, bọ cánh cứng hại khoai tây, và sâu đục lá thuộc họ Chrysomelidae (ví dụ, bọ cánh cứng hại khoai tây Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), sâu hại rễ ngô phương tây (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); bọ da và bọ cánh cứng khác thuộc họ Scarabaeidae (ví dụ, bọ cánh cứng Nhật bản (*Popillia japonica* Newman), bọ cánh cứng phương đông (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), bọ rầy mặt nạ phương bắc (*Xyclocephala borealis* Arrow), bọ rầy mặt nạ phương nam (*Xyclocephala immaculata* Olivier hoặc *C. lurida* Bland), bọ phân và bọ xít trắng (*Aphodius* spp.), côn trùng cỏ đen (*Ataenius spretulus* Haldeman), bọ thág sáu xanh (*Cotinis nitida* Linnaeus), bọ cánh cứng vườn châu Á (*Maladera castanea* Arrow), Bọ thág 5/tháng

6 (*Phyllophaga* spp.) và bộ rầy châu Âu (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); bộ thảm từ họ Dermestidae; bộ bọ củi thuộc họ Elateridae; bộ cánh cứng ăn vỏ thuộc họ Scolytidae và một bọ thuộc họ Tenebrionidae.

Ngoài ra, loài sâu hại trong lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp bao gồm: trứng, dạng trưởng thành và ấu trùng thuộc loài Dermaptera bao gồm bộ đuôi nhện thuộc họ Forficulidae (ví dụ, bộ đuôi nhện châu Âu (*Forficula auricularia* Linnaeus), bộ đuôi nhện đen (*Chelisoches morio* Fabricius)); trứng, dạng chưa trưởng thành, dạng trưởng thành và nhộng thuộc loài Hemiptera và Homoptera như, rệp cây thuộc họ Miridae, ve sầu thuộc họ Cicadidae, rầy xanh đuôi đen (ví dụ, *Empoasca* spp.) thuộc họ Cicadellidae, rệp giường (ví dụ, *Cimex lectularius* Linnaeus) thuộc họ Cimicidae, ve sâu nhảy cây thuộc họ Fulgoroidae và Delphaxitae, ve sâu nhảy cây thuộc họ Membraxitae, rệp lá thuộc họ Psyllidae, ruồi trắng thuộc họ Aleyrodidae, rệp thuộc họ Aphididae, rệp sáp thuộc họ Phylloxeridae, rệp sáp thuộc họ Pseudococcidae, rệp cây thuộc họ Coccidae, Diaspididae và Margarodidae, rệp vằn thuộc họ Tingidae, rệp thối thuộc họ Pentatomidae, rệp (ví dụ, bộ lông (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) và bộ lông phương nam (*Blissus insularis* Barber)) và rệp hạt khác thuộc họ Lygaeidae, rệp dãi thuộc họ Cercopidae, rệp bí thuộc họ Coreidae, và rệp đỏ và nhuộm màu bông thuộc họ Pyrrhocoridae.

Các loài gây hại nông học và phi nông học còn bao gồm: trứng, ấu trùng, nhộng và dạng trưởng thành thuộc loài Acari (ve) như bộ ve nhện và bộ ve đỏ thuộc họ Tetranychidae (ví dụ, bộ ve đỏ châu Âu (*Panonychus ulmi* Koch), bộ ve nhện hai chấm (*Tetranychus urticae* Koch), bộ ve McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), bộ ve dẹt thuộc họ Tenuipalpidae (ví dụ, bộ ve dẹt hại chanh (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), bộ ve ăn chồi và gỉ sắt thuộc họ Eriophyidae và các loại bộ ve ăn lá khác và ve quan trọng đối với sức khỏe con người và động vật, tức là bộ ve bụi thuộc họ Epidermoptidae, bộ ve kén thuộc họ Demodicidae, bộ ve thóc lúa thuộc họ Glycyphagidae, ve thuộc họ Ixodidae, thường được gọi là bộ ve cứng (ví dụ,

ve hươu nai (*Ixodes scapularis* Say), ve gây liệt Úc (*Ixodes holocyclus* Neumann), ve chó Mỹ (*Dermacentor variabilis* Say), bọ que (*Amblyomma americanum* Linnaeus) và bọ ve thuộc họ Argasidae, thường được gọi là ve mềm (ví dụ, ve gây sốt tái phát (*Ornithodoros turicata*), ve gà thông thường (*Argas radiatus*)), và ve dạng vảy và ve ngứa thuộc họ Psoroptidae, Pyemotidae, và Sarcoptidae; trứng, dạng trưởng thành và dạng non thuộc loài Orthoptera bao gồm châu chấu và dế (ví dụ, châu chấu di cư (ví dụ, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), châu chấu Mỹ (ví dụ, *Schistocerca americana* Drury), châu chấu sa mạc (*Schistocerca gregaria* Forskal), châu chấu di cư (*Locusta migratoria* Linnaeus), châu chấu bụi rậm (*Zonocerus*), dế nhà (*Acheta domestica* Linnaeus), dế chũi (ví dụ, dế mèn đen (*Scapteriscus vicinus* Scudder) và dế chũi phương nam (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); trứng, dạng trưởng thành và dạng non thuộc loài Diptera bao gồm sâu đục lá, (ví dụ, *Liriomyza* spp. như sâu vẽ bùa rau củ (*Liriomyza sativae* Blanchard)), côn trùng hai cánh, ruồi giấm (Tephritidae), ruồi lúa mì (ví dụ, *Oscinella frit* Linnaeus), giòi đất, ruồi nhà (ví dụ, *Musca domestica* Linnaeus), ruồi nhà nhỏ (ví dụ, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), ruồi chuồng ngựa (ví dụ, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), ruồi mặt, ruồi sừng, ruồi trứng (ví dụ, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), và các loài ruồi rêu khác, ruồi ngựa (ví dụ, *Tabanus* spp.), ruồi (ví dụ, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), giòi gia súc (ví dụ, *Hypoderma* spp.), ruồi hươu (ví dụ, *Chrysops* spp.), kết (ví dụ, *Melophagus ovinus* Linnaeus) và các loài Brachycera khác, muỗi (ví dụ, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), ruồi đen (ví dụ, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), côn trùng hai cánh đốt, ruồi cát, ruồi đen nhỏ, và các loài Nematocera khác; dạng trưởng thành và dạng non thuộc loài Thysanoptera bao gồm bọ trĩ hành (*Thrips tabaci* Lindeman) và bọ trĩ ăn lá khác; côn trùng thuộc loài Hymenoptera bao gồm kiến thuộc họ Formicidae bao gồm kiến đục gỗ Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), kiến đục gỗ đỏ (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), kiến đục gỗ đen (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), kiến chân trắng (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), kiến đầu to (*Pheidole* sp.), kiến ma (*Tapinoma*

melanocephalum Fabricius); kiến Pharaoh (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), kiến lửa con (*Wasmannia auropunctata* Roger), kiến lửa (*Solenopsis geminata* Fabricius), kiến lửa nhập khẩu đỏ (*Solenopsis invicta* Buren), kiến Argentine (*Iridomyrmex humilis* Mayr), kiến điên (*Paratrechina longicornis* Latreille), kiến vỉa hè (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), kiến Cornfield (*Lasius alienus* Forster), kiến hôi (*Tapinoma sessile* Say)). Các loài Hymenoptera bao gồm ong (bao gồm ong thợ mội), ong bầu vàng, ong bắp cày áo vàng, ong bắp cày và ong cắn lá (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); côn trùng thuộc loài Isoptera bao gồm mối thuộc họ Termitidae (ví dụ, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (ví dụ, *Cryptotermes* sp.), và Rhinotermitidae (ví dụ, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), mối dưới đất phương đông (*Reticulitermes flavipes* Kollar), mối dưới đất phương tây (*Reticulitermes hesperus* Banks), mối dưới đất Formosan (*Coptotermes formosanus* Shiraki), mối gỗ khô tây ấn (*Incisitermes immigrans* Snyder), mối bột (*Cryptotermes brevis* Walker), mối gỗ khô (*Incisitermes snyderi* Light), mối ngấm đông nam (*Reticulitermes virginicus* Banks), mối gỗ khô phương tây (*Incisitermes minor* Hagen), mối trên cây như *Nasutitermes* sp. và các loài mối khác có ảnh hưởng đến kinh tế; côn trùng thuộc loài Thysanura như cá vền (*Lepisma saccharina* Linnaeus) và bọ lò (*Thermobia domestica* Packard); côn trùng thuộc loài Mallophaga và bao gồm chấy (*Pediculus humanus capitis* De Geer), rận (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), rận gà (*Menacanthus straminus* Nitsch), rận chó (*Trichodectes canis* De Geer), chấy lông (*Goniocotes gallinae* De Geer), rận cừ (*Bovicola ovis* Schrank), rận gia súc mũi ngắn (*Haematopinus eurytenuis* Nitsch), rận gia súc mũi dài (*Linognathus vituli* Linnaeus) và chấy rận ký sinh nhai và hút khác tấn công người và động vật; côn trùng thuộc loài Siphonoptera bao gồm bọ chét chuột phương đông (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), bọ chét mèo (*Ctenocephalogenus felis* Bouche), bọ chét chó (*Ctenocephalogenus canis* Curtis), bọ chét gà (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), bọ chét que (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), bọ chét người (*Pulex irritans* Linnaeus) và các loại bọ chét khác tấn

công động vật có vú và chim. Loài sâu hại dạng động vật chân đốt khác bao gồm: nhện thuộc loài Araneae như nhện hoang nâu (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) và nhện goá đen (*Latrodectus mactans* Fabricius), và rết thuộc loài Scutigeromorpha như rết nhà (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ví dụ về loài gây hại không xương sống gây hại cho ngũ cốc dự trữ bao gồm sâu đục hạt lớn hơn (*Prostephanus truncatus*), sâu đục hạt nhỏ hơn (*Rhyzopertha dominica*), mọt gạo (*Stiophilus hoăcyzae*), mọt ngô (*Stiophilus zeamais*), mọt đậu đũa (*Callosobruchus maculatus*), bọ bột đỏ (*Tribolium castaneum*), mọt lúa (*Stiophilus granarius*), bướm đêm lương thực Ấn Độ (*Plodia interpunctella*), bọ bột Địa Trung Hải (*Ephestia kuhniella*) và bọ hạt phẳng hoặc gỉ (*Cryptolestis ferrugineus*).

Hợp chất theo sáng chế còn có tác dụng với các loài thuộc lớp Giun tròn, Sán dây, Sán lá, và Giun đầu móc bao gồm các loài có ảnh hưởng về kinh tế thuộc loài Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida, và Enoplida như không chỉ giới hạn ở loài sâu hại trong lĩnh vực nông nghiệp ảnh hưởng về mặt kinh tế (tức là giun tròn nốt sần thuộc giống *Meloidogyne*, giun tròn gây tổn thương thuộc giống *Pratylenchus*, giun tròn rễ ngắn thuộc giống *Trichodorus*, v.v..) và loài sâu hại cho sức khoẻ người và động vật (tức là tất cả các loại sán lá, sán dây, và giun tròn ảnh hưởng về mặt kinh tế, như *Strongylus vulgaris* ở ngựa, *Toxocara canis* ở chó, *Haemonchus contortus* ở cừu, *Dirofilaria immitis* Leidy ở chó, *Anoplocephala perfoliata* ở ngựa, *Fasciola hepatica* Linnaeus ở động vật nhai lại, v.v..).

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đặc biệt cao đối với loài sâu hại thuộc loài Lepidoptera (ví dụ, *Alabama argillacea* Hubner (sâu lá bông), *Archips argyrospila* Walker (sâu cuốn lá cây ăn quả), *A. rosana* Linnaeus (sâu cuốn lá châu Âu) và các loài *Archips* khác, *Chilo suppressalis* Walker (sâu đục thân lúa), *Cnaphalocrosis Medinalis* Guenée (sâu cuốn lá lúa), *Crambus Caliginosellus* Clemens (sâu kéo màng rế ngô), *Crambus teterrellus* Zincken (sâu kéo màng cỏ poa),

Cydia pomonella Linnaeus (bướm tuyết), *Earias insulana* Boisduval (sâu xanh gai), *Earias vittella* Fabricius (sâu xanh đốm), *Helicoverpa Armigera* Hubner (sâu xanh Mỹ), *Helicoverpa zea* Boddie (sâu xanh hại ngô), *Heliothis virescens* Fabricius (sâu đục chồi thuốc lá), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (sâu kéo màng cỏ), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermuller (bướm hại quả nho), *Pectinophora gossypiella* Saunders (sâu hồng hại bông), *Phyllocnistis citrella* Stainton (sâu đục lá hại chanh), *Pieris Brassicae* Linnaeus (bướm trắng lớn), *Pieris rapae* Linnaeus (bướm trắng nhỏ), *Plutella xylostella* Linnaeus (sâu tơ), *Spodoptera exigua* Hubner (sâu hành quân củ cải đường), *Spodoptera litura* Fabricius (sâu bướm đàn, sâu cắn rễ thuốc lá), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (sâu hành quân roi), *Trichoplusia ni* Hubner (sâu đo cải bắp) và *Tuta absoluta* Meyrick (sâu đục lá cà chua)).

Hợp chất theo sáng chế có hoạt tính đáng kể với các thành phần thuộc họ Homoptera bao gồm: *Acyrtosiphon pisum* Harris (rệp đậu), *Aphis craccivora* Koch (rệp đậu đũa), *Aphis fabae* Scopoli (rệp đậu đen), *Aphis Gossypii* Glover (rệp bông, rệp dưa), *Aphis pomi* De Geer (rệp táo), *Aphis spiraecola* Patch (rệp mơ trên châu), *Aulacorthum Solani* Kaltenbach (rệp cây địa hoàng), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (rệp dâu tây), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (rệp lúa mì Nga), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (rệp táo hồng), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (rệp táo lông), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (rệp mận xanh), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (rệp củ cải), *Metopolophium dirrhodum* Walker (rệp ngũ cốc), *Macrosiphum Euphorbiae* Thomas (rệp lá hại khoai tây), *Myzus persicae* Sulzer (rệp hại đào khoai tây, rệp đào xanh), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (rệp rau diếp), *Pemphigus* spp. (rệp rế và rệp tạo vú lá), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (rệp lá ngô), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (rệp đào), *Schizaphis graminum* Rondani (rệp xanh lục), *Sitobion avenae* Fabricius (rệp thóc lúa Anh), *Therioaphis maculata* Buckton (rệp cỏ linh lăng đốm), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (rệp hại chanh đen), và *Toxoptera citricida* Kirkaldy (rệp hại chanh nâu); *Adelges* spp. (adelgids); *Phylloxera Devastatrix* Pergande (rệp sáp hồ đào); *Bemisia tabaci* Gennadius (ruồi trắng hại

thuốc lá, ruồi trắng hại khoai lang), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (ruồi trắng lá bạc), *Dialeurodes citri* Ashmead (ruồi trắng hại chanh) và *Trialeurodes Vaporariorum* Westwood (ruồi trắng hại cây trồng trong nhà kính); *Empoasca fabae* Harris (rầy xanh đuôi đen hại khoai tây), *Laodelphax Striatellus* Fallen (ve sầu nhảy hại cây màu nâu nhỏ), *Macroleste quadrilineatus* Forbes (rầy xanh đuôi đen cúc tây), *Nephotettix cincticeps* Uhler (rầy xanh đuôi đen xanh), *Nephotettix nigropictus* Stål (rầy xanh đuôi đen hại lúa), *Nilaparvata lugens* Stål (ve sầu nhảy hại cây màu nâu), *Peregrinus maidis* Ashmead (ve sầu nhảy hại ngô), *Sogatellafurcifera* Horvath (ve sầu nhảy hại cây lung trắng), *Sogatodes orizicola* Muir (delphaxit lúa), *Typhlocyba Pomaria* McAtee (rầy xanh đuôi đen hại táo trắng, *Erythroneoura* spp. (rầy xanh đuôi đen hại nho); *Magicidada septendecim* Linnaeus (ve sầu theo chu kỳ); *Icerya purchasi* Maskell (rệp đốm bông), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (rệp San Jose); *Planococcus citri* Risso (rệp mai hại chanh); *Pseudococcus* spp. (rệp mai hỗn hợp khác); *Cacopsyla pyricola* Foerster (rệp lá lê), *Trioza diospyri* Ashmead (rệp lá quả hồng).

Hợp chất theo sáng chế còn có tác dụng với các thành phần thuộc họ Hemiptera bao gồm: *Acrosternum hilare* Say (rệp hôi xanh), *Anasa tristis* De Geer (rệp bí), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (rệp hại cỏ ngũ cốc), *Cimex lectularius* Linnaeus (rệp giường), *Corythuca gossypii* Fabricius (rệp viền bông), *Cyrtopeltis modesta* Distant (rệp cà chua), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (đốm bông), *Euchistus servus* Say (rệp hôi nâu), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (rệp hôi một đốm), *Graptosthetus* spp. (rệp hạt các loại), *Halymorpha halys* Stål (bọ xít nâu), *Leptoglossus corculus* Say (rệp hạt thông chân lá), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (rệp cây mờ), *Nezara viridula* Linnaeus (rệp hôi xanh miền nam), *Oebalus pugnax* Fabricius (rệp hôi lúa), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (rệp bông tai to), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (bọ nhảy bông). Các họ côn trùng khác phòng trừ được bằng hợp chất theo sáng chế bao gồm Thysanoptera (ví dụ, *Frankliniella Occidentalis* Pergande (bọ trĩ hoa miền tây), *Scirtothrips citri* Moulton (bọ trĩ hại

chanh), *Sericothrips variabilis* Beach (bộ trĩ đậu tương), và *Thrips tabaci* Lindeman (bộ trĩ hành); và họ Coleoptera (ví dụ, *Leptinotarsa decemlineata* Say (bọ cánh cứng hại khoai tây Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (bọ cánh cứng đậu Mexican) và bọ bả củi thuộc loài *Agriotes*, *Athous* hoặc *Limonius*).

Lưu ý rằng một số hệ thống phân loại hiện nay xếp Homoptera như một họ phụ trong họ Hemiptera.

Đáng chú ý là sử dụng các hợp chất của sáng chế này để kiểm soát bộ trĩ hoa miền tây (*Frankliniella occidentalis*). Đáng chú ý là sử dụng các hợp chất của sáng chế này để kiểm soát rầy xanh đuôi đen hại khoai tây (*Empoasca fabae*). Đáng chú ý là sử dụng các hợp chất của sáng chế này để kiểm soát rệp bông, rệp dưa (*Aphis gossypii*). Đáng chú ý là sử dụng các hợp chất của sáng chế này để kiểm soát rệp đào xanh (*Myzus persicae*). Đáng chú ý là sử dụng các hợp chất của sáng chế này để kiểm soát ruồi trắng hại khoai lang (*Bemisia tabaci*).

Các hợp chất theo sáng chế còn có thể được sử dụng để làm gia tăng sức sống của cây trồng. Phương pháp này bao gồm việc cho cây trồng (ví dụ, lá, hoa, quả hoặc rễ) hoặc hạt mà từ đó cây trồng sinh trưởng tiếp xúc với Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 với lượng đủ để đạt được tác dụng sức sống của cây trồng mong muốn (tức là lượng hữu hiệu về mặt sinh học). Thông thường, Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 được dùng trong một chế phẩm có công thức. Mặc dù Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 thường được dùng trực tiếp cho cây trồng hoặc hạt của nó, nhưng nó cũng có thể được dùng cho vùng đất của cây trồng, tức là môi trường của cây trồng, đặc biệt là phần môi trường đủ gần với cho phép Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 di chuyển vào cây trồng. Vị trí có liên quan đến phương pháp này phổ biến nhất bao gồm môi trường sinh trưởng (tức là môi trường cung cấp chất dinh dưỡng cho cây), thường là đất mà cây được trồng. Xử lý cây trồng để tăng sức sống của cây trồng bao gồm việc cho tiếp xúc cây trồng, hạt mà từ đó cây trồng sinh

trưởng hoặc vị trí của cây trồng với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2.

Tăng sức sống của cây trồng có thể dẫn đến một hoặc nhiều tác động quan sát được sau đây: (a) thiết lập cây trồng tối ưu thể hiện qua khả năng nảy mầm tốt của hạt giống, cây trồng nổi lên và cây trồng đứng yên; (b) tăng cường sự phát triển của cây trồng được thể hiện bằng sự phát triển nhanh chóng và mạnh mẽ của lá (ví dụ, được đo bằng chỉ số diện tích lá), chiều cao cây, số nhánh đẻ nhánh (ví dụ, đối với lúa), khối lượng rễ và trọng lượng khô tổng thể của khối sinh vật của cây trồng; (c) cải thiện năng suất cây trồng, thể hiện qua thời gian ra hoa, thời gian ra hoa, số lượng hoa, tổng sinh khối tích lũy (tức là số lượng sản lượng) và / hoặc khả năng thị trường của quả hoặc cấp hạt của sản phẩm (tức là chất lượng sản lượng); (d) nâng cao khả năng của cây trồng để chống chọi hoặc ngăn ngừa nhiễm bệnh thực vật và sự xâm nhập của động vật chân đốt, tuyến trùng hoặc động vật thân mềm; và (e) tăng khả năng của cây trồng để chống lại các áp lực môi trường như tiếp xúc với nhiệt độ khắc nghiệt, độ ẩm dưới mức tối ưu hoặc hóa chất độc hại thực vật.

Các hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của cây trồng đã qua xử lý so với cây trồng không được xử lý bằng cách tiêu diệt hoặc ngăn chặn sự ăn của loài gây hại không xương sống ăn thực vật trong môi trường của cây trồng. Nếu không có sự kiểm soát như vậy đối với các loài gây hại không xương sống trong ăn thực vật, các loài gây hại sẽ làm giảm sức sống của cây trồng bằng cách tiêu thụ các mô hoặc nhựa cây, hoặc truyền qua các mầm bệnh cây trồng như virus. Ngay cả khi không có các loài gây hại không xương sống ăn thực vật, hợp chất theo sáng chế có thể làm tăng sức sống của cây trồng bằng cách điều chỉnh sự trao đổi chất của cây trồng. Nói chung, sức sống của cây trồng sẽ được tăng lên đáng kể nhất bằng cách xử lý cây trồng bằng hợp chất theo sáng chế nếu cây trồng được trồng trong môi trường không nhiễm độc, tức là môi trường bao gồm một hoặc nhiều khía cạnh bất lợi cho

cây trồng đạt được tiềm năng di truyền đầy đủ nó sẽ thể hiện trong một môi trường lý tưởng.

Đáng lưu ý là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là được sinh trưởng trong môi trường chứa loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Còn đáng lưu ý nữa là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là được sinh trưởng trong môi trường không chứa loài gây hại không xương sống ăn thực vật. Còn đáng lưu ý nữa là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là được sinh trưởng trong môi trường chứa hàm lượng ẩm nhỏ hơn lý tưởng để hỗ trợ sự sinh trưởng của cây trồng. Đáng lưu ý nữa là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là lúa. Còn đáng lưu ý nữa là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó cây trồng là ngô (bắp). Còn đáng lưu ý nữa là phương pháp làm gia tăng sức sống của cây trồng, trong đó crop là đậu nành.

Hợp chất theo sáng chế cũng có thể trộn với một hoặc nhiều tác nhân hoặc hoạt chất sinh học khác bao gồm thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc sát trùng, thuốc diệt bọ ve, thuốc diệt cỏ, chất an toàn thuốc diệt cỏ, chất điều hoà sinh trưởng như chất ức chế sự lột xác của côn trùng và chất kích thích mọc rễ, thuốc gây vô sinh, giả hoá chất, thuốc trừ rệp, chất dẫn dụ côn trùng, pheromon, chất kích thích ăn, các hoạt chất sinh học khác hoặc vi khuẩn, virus hoặc nấm gây bệnh cho côn trùng để tạo thành thuốc trừ sâu nhiều thành phần có tác dụng bảo vệ cây với phổ rộng hơn. Do đó, sáng chế còn đề xuất chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, và ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung. Đối với các hỗn hợp theo sáng chế, hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác có thể được kết hợp cùng với các hợp chất theo sáng chế, bao gồm cả các Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, để tạo thành hỗn hợp trộn sơ bộ, hoặc các hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác

có thể được bào chế riêng biệt với các hợp chất theo sáng chế, bao gồm cả các Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, và hai công thức kết hợp với nhau trước khi dùng thuốc (ví dụ, trong bình phun) hoặc, cách khác, được dùng liên tiếp.

Ví dụ về tác nhân hoặc hoạt chất sinh học có thể kết hợp với hợp chất theo sáng chế là thuốc trừ sâu như abamectin, acephate, acequinocyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen ($[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(\text{xyclopropylcarbonyl})\text{oxy}]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b\text{-decahydro-6,12-dihydroxy-4,6a,12b-trimethyl-11-oxo-9-(3-pyridinyl)-2H,11H-naphtho}[2,1-b]\text{pyrano}[3,4-e]\text{pyran-4-yl}]methyl\ xyclopropanecarboxylat)$), amidoflumet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole (3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-metyl-6-[(methylamino)carbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), cyclaniliprole (3-bromo-*N*-[2-bromo-4-clo-6-[(1-xyclopropyletyl)amino]carbonyl]phenyl]-1-(3-clo-2-pyridinyl)-1*H*-pyrazol-5-carboxamit), xycloprothrin, xycloxaprid ($((5S,8R)-1-[(6\text{-clo-3-pyridinyl})methyl]-2,3,5,6,7,8\text{-hexahydro-9-nitro-5,8-Epoxy-1H-imidazo}[1,2-a]azepine)$) cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxit, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flometoquin (2-etyl-3,7-dimetyl-6-[4-(triflometoxy)phenoxy]-4-quinolinyl metyl carbonate), flonicamid, flubendiamit, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron, flufenoxystrobin (metyl (αE)-2-[[2-clo-4-(triflometyl)phenoxy]metyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat), flufensulfone (5-clo-2-[(3,4,4-triflo-3-buten-1-yl)sulfonyl]thiazol), fluhexafon, fluopyram, flupiprole (1-[2,6-diclo-4-

(triflometyl)phenyl]-5-[(2-metyl-2-propen-1-yl)amino]-4-[(triflometyl)sulfinyl]-1*H*-pyrazol-3-carbonitril), flupyradifurone (4-[[[(6-clo-3-pyridinyl)metyl](2,2-difloetyl)amino]-2(5*H*)-furanone), fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, heptafluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2-dimetyl-3-[(1*Z*)-3,3,3-triflo-1-propen-1-yl]xyclopropanecarboxylat), hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl (1*R*,3*S*)-3-(2,2-dicloethenyl)-2,2-dimetyl-xyclopropanecarboxylat), metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxychlor, metofluthrin, metoxyfenozide, metofluthrin, monocrotophos, monoflothrín ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 3-(2-xyano-1-propen-1-yl)-2,2-dimetyl-xyclopropanecarboxylat), nicotine, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumide (1,3,5-trimetyl-*N*-(2-metyl-1-oxopropyl)-*N*-[3-(2-metylpropyl)-4-[2,2,2-triflo-1-metoxo-1-(triflometyl)etyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-4-carboxamit), pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin (metyl (α *E*)-2-[[[2-[(2,4-diclophenyl)amino]-6-(triflometyl)-4-pyrimidinyl]oxy]metyl]- α -(metoxymetylen)benzenaxetat), pyriprole, pyriproxifen, rotenone, ryanodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor (*N*-[metyloxido[1-[6-(triflometyl)-3-pyridinyl]etyl]- λ^4 -sulfanyliden]cyanamit), tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin ([2,3,5,6-tetraflo-4-(metoxymetyl)phenyl]metyl 2,2,3,3-tetrametyl-xyclopropanecarboxylat), tetraniliprole, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tioxazafen (3-phenyl-5-(2-thienyl)-1,2,4-oxadiazol), tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumezopyrim (muối nội 2,4-

dioxo-1-(5-pyrimidinylmetyl)-3-[3-(triflometyl)phenyl]-2*H*-pyrido[1,2-*a*]pyrimidini), triflumuron, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin, vi khuẩn gây bệnh côn trùng, virus gây bệnh côn trùng và nấm gây bệnh côn trùng.

Đáng chú ý là thuốc trừ sâu như abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfone, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methoprene, metoxyfenozide, metofluthrin, monofluthrin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumezopyrim, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng thuộc nucleopolyhedrovirus.

Một phương án về tác nhân sinh học để trộn với các hợp chất theo sáng chế bao gồm vi khuẩn gây bệnh côn trùng như *Bacillus thuringiensis*, và delta-endotoxin được bao nang chứa *Bacillus thuringiensis* là như thuốc trừ sâu sinh học MVP® và MVP-II® được điều chế bằng quy trình CellCap® (CellCap®, MVP® và MVP-II® là thương hiệu của Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); nấm gây bệnh

côn trùng như nấm xạ xanh; và virus gây bệnh côn trùng (cả tự nhiên và biến đổi gen) bao gồm cả virus baculovirus, nucleopolyhedro virus (NPV) như *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus (HzNPV), *Anagrapha falcifera* nucleopolyhedrovirus (AfNPV); và granulosis virus (GV) như *Cydia pomonella* granulosis virus (CpGV).

Một phương án khác về tác nhân sinh học để trộn với hợp chất theo sáng chế bao gồm một hoặc hỗn hợp của (i) một loại vi khuẩn thuộc giống *Actinomyces*, *Agrobacterium*, *Arthrobacter*, *Alcaligenes*, *Aureobacterium*, *Azobacter*, *Bacillus*, *Beijerinckia*, *Bradyrhizobium*, *Brevibacillus*, *Burkholderia*, *Chromobacterium*, *Clostridium*, *Clavibacter*, *Comamonas*, *Corynebacterium*, *Curtobacterium*, *Enterobacter*, *Flavobacterium*, *Gluconobacter*, *Hydrogenophaga*, *Klebsiella*, *Metylobacterium*, *Paenibacillus*, *Pasteuria*, *Photorhabdus*, *Phyllobacterium*, *Pseudomonas*, *Rhizobium*, *Serratia*, *Sphingobacterium*, *Stenotrophomonas*, *Streptomyces*, *Variovorax*, hoặc *Xenorhabdus*, for example a bacterium of *Bacillus amyloliquefaciens*, *Bacillus cereus*, *Bacillus firmus*, *Bacillus, licheniformis*, *Bacillus pumilus*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bradyrhizobium japonicum*, *Chromobacterium subtsugae*, *Pasteuria nishizawae*, *Pasteuria pentrans*, *Pasteuria usage*, *Pseudomonas fluorescens*, và *Streptomyces lydicus*; (ii) một loại nấm như nấm xạ xanh; (iii) một loại virus bao gồm baculovirus, nucleopolyhedro virus như *Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus, *Anagrapha falcifera* nucleopolyhedrovirus; granulosis virus như *Cydia pomonella* granulosis virus.

Đặc biệt lưu ý là sự kết hợp như vậy trong đó hoạt chất kiểm soát loài gây hại không xương sống khác thuộc nhóm hóa học khác hoặc có vị trí hoạt động khác với Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2. Trong một số trường hợp nhất định, việc kết hợp với ít nhất một hoạt chất kiểm soát loài gây hại không xương sống khác thành phần có phạm vi kiểm soát tương tự nhưng vị trí tác dụng khác sẽ đặc biệt thuận lợi cho việc quản lý kháng thuốc. Do đó, chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa một

lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học ít nhất một hoạt chất kiểm soát loài gây hại không xương sống bổ sung có phổ kiểm soát tương tự nhưng thuộc một nhóm hóa học khác hoặc có vị trí tác dụng khác. Các hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung này bao gồm, nhưng không giới hạn ở, các chất ức chế axetylcholinesteraza (AChE) như các carbamat methomyl, oxamyl, thiodicarb, triazamate và organophosphate chlorpyrifos; chất đối kháng kênh clorua GABA như xycloclodien dieldrin và endosulfan, và phenylpyrazol ethiprole và fipronil; chất điều biến kênh natri như pyrethroid bifenthrin, cyfluthrin, *beta*-cyfluthrin, cyhalothrin, *lambda*-cyhalothrin, cypermethrin, deltamethrin, dimefluthrin, esfenvalerate, metofluthrin và profluthrin; chất chủ vận thụ thể nicotinic axetylcholine (nAChR) như neonicotinoid axetamiprid, clothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiacloprid, và thiamethoxam, và sulfoxaflor; chất hoạt hóa allosteric thụ thể nicotinic axetylcholine (nAChR) như spinosyns spinetoram và spinosad; chất hoạt hóa kênh clorua như avermectins abamectin và emamectin; chất bắt chước hormone thanh niên như diofenolan, methoprene, fenoxycarb và pyriproxyfen; chất phong bế ăn homopteran chọn lọc như pymetrozine và flonicamid; chất ức chế sự phát triển của bọ ve như etoxazol; chất ức chế ATP synthaza ty thể như propargite; các chất thúc đẩy quá trình phosphoryl hóa oxy hóa thông qua sự phá vỡ gradien proton như chlorfenapyr; thuốc chặn kênh thụ thể nicotinic axetylcholine (nAChR) như cartap nereistoxin; các chất ức chế sinh tổng hợp kitin như benzoylureas flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron và triflumuron, và buprofezin; chất gây rối loạn tẩy lông dipteran như cyromazine; chất chủ vận thụ thể ecdysone như diacylhydrazine methoxyfenozide và tebufenozide; chất chủ vận thụ thể octopamine như amitraz; chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp III của ty thể như hydramethylnon; các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp I của ty thể như pyridaben; thuốc chặn kênh natri phụ thuộc vào điện áp như indoxacarb; chất ức chế axetyl CoA carboxylase như axit tetronic và tetramic spiroadiclofen, spiromesifen và spirotetramat; các chất ức chế vận chuyển điện tử phức hợp II của ty thể như

cyenopyrafen β -ketonitrile và cyflumetofen; chất điều biến thụ thể ryanidine như chlorantraniliprole anthranilic diamide, cyantraniliprole và cyantraniliprole, diamide như flubendiamide, và phối tử thụ thể ryanodine như ryanodine; các hợp chất trong đó vị trí mục tiêu chịu trách nhiệm về hoạt tính sinh học chưa được xác định hoặc chưa được xác định như azadirachtin, bifenazat, pyridalyl, pyrifluquinazon và triflumezopyrim; vi sinh vật phá vỡ màng giữa côn trùng như *Bacillus thuringensis* và delta-endotoxin mà chúng tạo ra và *Bacillus sphaericus*; và các tác nhân sinh học bao gồm virus nucleopolyhedro (NPV) và các virus diệt côn trùng biến đổi gen hoặc tự nhiên khác.

Ví dụ thêm về các hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học mà có thể được kết hợp với các hợp chất of sáng chế là: thuốc diệt nấm như acibenzolar-S-methyl, aldimorph, ametoctradin, amisulbrom, anilazine, azaconazol, azoxystrobin, benalaxyl (bao gồm cả benalaxyl-M), benodanil, benomyl, benthiavalicarb (bao gồm cả benthiavalicarb-isopropyl), benzovindiflupyr, bethoxazin, binapacryl, biphenyl, bitertanol, bixafen, blasticidin-S, boscalid, bromuconazol, bupirimate, buthiobate, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloneb, clothalonil, chlozolate, copper hydroxit, copper oxyclorea, copper sulfate, coumoxystrobin, cyazofamid, cyflufenamid, cymoxanil, cyproconazol, cyprodinil, dichlofluanid, diclocymet, diclomezine, dicloran, diethofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimethirimol, dimethomorph, dimoxystrobin, diniconazol (bao gồm cả diniconazol-M), dinocap, dithianon, dithiolanes, dodemorph, dodine, econazol, etaconazol, edifenphos, enoxastrobin (còn được biết là enestroburin), epoxiconazol, ethaboxam, ethirimol, etridiazol, famoxadone, fenamidone, fenaminstrobin, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamit, fenoxanil, fencpiclonil, fenpropidin, fenpropimorph, fenpyrazamin, fentin axetat, fentin hydroxit, ferbam, ferimzone, flometoquin, fluazinam, fludioxonil, flufenoxystrobin, flumorph, fluopicolide, fluopyram, fluoxastrobin, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamid, flutianil, flutolanil, flutriafol, fluxapyroxad, folpet, fthalide (còn được biết là phthalide), fuberidazol,

furalaxyl, furametpyr, hexaconazol, hymexazol, guazatine, imazalil, imibenconazol, iminoctadine albesilate, iminoctadine triaxetat, iodcarb, ipconazol, isofetamid, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, isoprothiolane, isopyrazam, isotianil, kasugamycin, kresoxim-metyl, mancozeb, mandipropamid, mandestrobin, maneb, mapanipyrin, mepronil, meptyldinocap, metalaxyl (bao gồm cả metalaxyl-M/mefenoxam), metconazol, methasulfocarb, metiram, metominostrobin, metrafenone, myclobutanil, naftitine, neo-asozin (ferric metanarsonate), nuarimol, othilinone, ofurace, hoặcsastrobine, oxadixyl, oxathiapiprolin, oxolinic acid, oxpoconazol, oxycarboxin, oxytetracycline, penconazol, pencycuron, penflufen, penthiopyrad, perfurazoate, phosphorous acid (bao gồm cả salts thereof, ví dụ, fosetyl-aluminm), picoxystrobin, piperalin, polyoxin, probenazol, prochloraz, procymidone, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, prothiocarb, prothioconazol, pyraclostrobin, pyrametostrobin, pyraoxystrobin, pyrazophos, pyribencarb, pyributacarb, pyrifenox, pyriofenone, perisoxazol, pyrimetamil, pyrifenox, pyrolnitrin, pyroquilon, quinconazol, quinmethionate, quinoxifen, quintozone, silthiofam, sedaxane, simeconazol, spiroxamin, streptomycin, sulfur, tebuconazol, tebufloquin, teclofthalam, tecloftalam, tecnazene, terbinafine, tetraconazol, thiabendazol, thifluzamit, thiophanate, thiophanate-metyl, thiram, tiadinil, tolclufos-metyl, tolprocarb, tolyfluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxit, tribasic copper sulfate, triclopyricarb, tridemorph, trifloxystrobin, triflumizole, trimopramit tricyclazol, trifloxystrobin, triforine, triticonazol, uniconazol, validamycin, valifenalate (còn được biết là valifenal), vinclozolin, zineb, ziram, zoxamit và 1-[4-[4-[5-(2,6-diflophenyl)-4,5-dihydro-3-isoxazolyl]-2-thiazolyl]-1-piperidiny]-2-[5-metyl-3-(triflometyl)-1H-pyrazol-1-yl]etanone; thuốc diệt giun tròn như fluopyram, spirotetramat, thiodicarb, fosthiazate, abamectin, iprodione, fluensulfone, dimetyl disulfide, tioxazafen, 1,3-diclopropene (1,3-D), metam (natri và potassium), dazomet, clopicrin, fenamiphos, ethoprophos, cadusaphos, terbufos, imicyafos, oxamyl, carbofuran, tioxazafen, *Bacillus firmus* và

Pasteuria nishizawae; thuốc diệt vi khuẩn như streptomycin; acaricides như amitraz, chinomethionat, clobenzilate, cyhexatin, dicofol, dienochlor, etoxazol, fenazaquin, fenbutatin oxit, fenpropathrin, fenpyroximate, hexythiazox, propargite, pyridaben và tebufenpyrad.

Trong một số trường hợp nhất định, hỗn hợp của hợp chất theo sáng chế với các hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học khác (đặc biệt là kiểm soát loài gây hại không xương sống) (tức là các thành phần hoạt tính) có thể dẫn đến tác dụng lớn hơn khi cộng vào (tức là hiệp đồng). Giảm lượng hoạt chất thải ra môi trường mà vẫn đảm bảo kiểm soát dịch hại hiệu quả luôn là điều mong muốn. Khi cơ chế hiệp đồng của thành phần hoạt tính kiểm soát loài gây hại không xương sống xảy ra ở tỷ lệ áp dụng mang lại mức độ kiểm soát loài gây hại không xương sống đạt yêu cầu về mặt nông học, sự kết hợp như vậy có thể có lợi để giảm chi phí sản xuất cây trồng và giảm tải môi trường.

Các hợp chất theo sáng chế và các chế phẩm của chúng có thể được áp dụng cho thực vật được biến đổi gen để biểu hiện các protein độc đối với loài gây hại không xương sống (chẳng hạn như *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin). Một ứng dụng như vậy có thể tạo ra một phạm vi bảo vệ thực vật rộng hơn và có lợi cho việc quản lý kháng thuốc. Tác dụng của các hợp chất kiểm soát loài gây hại không xương sống được ứng dụng ngoại sinh theo sáng chế có thể hiệp đồng với các protein độc tố biểu hiện.

Các tài liệu tham khảo chung về chất bảo vệ trong nông nghiệp này (tức là các thuốc trừ sâu, thuốc diệt nấm, thuốc diệt giun tròn, thuốc diệt ve bét, thuốc diệt cỏ và tác nhân sinh học) gồm *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Loài gây hại không xương sống được phòng trừ trong lĩnh vực nông nghiệp và phi nông nghiệp bằng cách áp dụng một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế, thường ở dạng chế phẩm, với lượng hữu hiệu về mặt sinh học, vào môi trường có vật gây hại bao gồm nơi ở nhiễm bệnh trên cây nông nghiệp và/hoặc cây phi nông nghiệp, vào diện tích cần được được bảo vệ, hoặc trực tiếp lên vật gây hại cần phòng trừ.

Do vậy, sáng chế đề xuất phương pháp phòng trừ loài gây hại không xương sống trong lĩnh vực nông học và/hoặc phi nông học, phương pháp này bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một hoặc nhiều hợp chất theo sáng chế với lượng hữu hiệu về mặt sinh học, hoặc với chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này hoặc chế phẩm chứa ít nhất một hợp chất này và một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung. Ví dụ về chế phẩm thích hợp chứa hợp chất theo sáng chế và và một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung bao gồm chế phẩm dạng hạt trong đó tác nhân hoặc hoạt chất sinh học bổ sung cũng có mặt dưới dạng hạt như hợp chất theo sáng chế hoặc trong các hạt tách ra từ hợp chất theo sáng chế.

Để đạt được sự tiếp xúc với hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế nhằm bảo vệ cây trồng ngoài đồng ruộng khỏi loài gây hại không xương sống, hợp chất hoặc chế phẩm này thường được áp dụng cho hạt giống cây trồng trước khi trồng, lên tán lá (ví dụ: lá, thân, hoa, quả) của cây trồng, hoặc đất hoặc phương tiện sinh trưởng khác trước hoặc sau khi cây trồng được trồng.

Một phương án về phương pháp tiếp xúc là phương pháp phun. Theo cách khác, chế phẩm dạng hạt chứa các hợp chất này có thể được đưa lên lá cây hoặc vào đất trồng. Hợp chất theo sáng chế còn có thể được phân phối hữu hiệu nhờ sự hấp thu của cây bằng cách cho cây tiếp xúc với chế phẩm gồm hợp chất theo sáng chế theo phương pháp bón gốc bằng chế phẩm dạng dung dịch, đưa chế phẩm dạng hạt vào

đất, xử lý hộp ươm cây hoặc nhúng cây ghép. Đáng chú ý là một chế phẩm của sáng chế ở dạng chế phẩm lỏng ngâm trong đất. Cũng cần lưu ý là phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó tiếp xúc với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất theo sáng chế hoặc với chế phẩm chứa một lượng hữu hiệu về hoạt tính sinh học hợp chất theo sáng chế. Lưu ý thêm là phương pháp này trong đó môi trường là đất và thành phần được áp dụng cho đất dưới dạng chế phẩm ngâm trong đất. Cần lưu ý thêm là, các hợp chất theo sáng chế này cũng có hiệu quả bằng cách áp dụng cục bộ vào vị trí nhiễm bệnh. Các phương pháp tiếp xúc khác bao gồm việc áp dụng một hợp chất hoặc một chế phẩm theo sáng chế bằng cách phun trực tiếp và tồn lưu, phun trên không, gel, lớp phủ hạt, vi nang, hấp thụ toàn thân, bã, thẻ tai, bu lông, thuốc phun sương, thuốc xông hơi, bình xịt, bụi và nhiều khác. Một phương án về phương pháp tiếp xúc là hạt, que hoặc viên phân bón ổn định về kích thước chứa hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế. Các hợp chất theo sáng chế này cũng có thể được ngâm tẩm vào vật liệu để chế tạo thiết bị kiểm soát động vật không xương sống (ví dụ, lưới chắn côn trùng).

Các hợp chất theo sáng chế được sử dụng trong việc xử lý tất cả các loại cây, các bộ phận của cây và hạt giống. Các biến thể cây và hạt và hạt giống có thể thu được bằng phương pháp nhân giống và truyền giống thông thường hoặc bằng các phương pháp sử dụng kỹ thuật di truyền. Cây trồng và hạt giống biến đổi gen (cây trồng và hạt giống chuyển gen) là các loại mà trong đó gen khác loài (gen chuyển) đã được hợp nhất một cách ổn định vào bộ gen của cây trồng và hạt giống. Gen chuyển mà được xác định bằng vị trí cụ thể của nó trong bộ gen của cây trồng được gọi là gen biến nạp hoặc gen chuyển.

Cây trồng và hạt giống biến đổi gen có thể được xử lý theo sáng chế bao gồm các cây trồng có tính kháng một hoặc nhiều áp lực sinh học (loài gây hại như giun tròn, sâu bọ, ve bét, nấm, v.v.) hoặc áp lực phi sinh học (hiện tượng khô hạn, nhiệt

độ lạnh, độ mặn của đất, v.v.), hoặc chứa các đặc tính mong muốn khác. Cây trồng và hạt có thể được biến đổi về mặt di truyền để có các tính trạng, ví dụ, kháng thuốc diệt cỏ, kháng sâu bọ, cải thiện protein dầu hoặc chống chịu sự khô hạn.

Việc xử lý cây trồng và hạt giống biến đổi gen bằng các hợp chất theo sáng chế có thể tạo ra hiệu ứng siêu phụ gia hoặc hiệp đồng. Ví dụ, giảm tỷ lệ ứng dụng, mở rộng phổ hoạt động, tăng khả năng chống chịu với các căng thẳng sinh học/phi sinh học hoặc tăng cường độ ổn định lưu trữ có thể lớn hơn mong đợi chỉ từ các tác động phụ gia đơn giản của việc áp dụng các hợp chất theo sáng chế trên cây và hạt biến đổi gen.

Các hợp chất theo sáng chế này còn được sử dụng trong việc xử lý hạt giống để bảo vệ hạt giống khỏi loài gây hại không xương sống. Trong bản mô tả của sáng chế và yêu cầu bảo hộ, xử lý hạt giống có nghĩa là cho hạt tiếp xúc với một lượng hữu hiệu sinh học của hợp chất theo sáng chế, thường được bào chế dưới dạng chế phẩm theo sáng chế. Phương pháp xử lý hạt giống này bảo vệ hạt giống khỏi động vật không xương sống gây hại đất và nói chung cũng có thể bảo vệ rễ và các bộ phận thực vật khác tiếp xúc với đất của cây con phát triển từ hạt nảy mầm. Xử lý hạt giống cũng có thể bảo vệ tán lá bằng cách chuyển vị hợp chất theo sáng chế này hoặc thành phần hoạt chất thứ hai trong cây đang phát triển. Xử lý hạt giống có thể được áp dụng cho tất cả các loại hạt giống, bao gồm cả những loại hạt mà từ đó cây trồng được biến đổi gen để biểu hiện các tính trạng chuyên biệt sẽ nảy mầm. Các ví dụ đại diện bao gồm những protein biểu hiện độc đối với loài gây hại không xương sống, như *Bacillus thuringiensis* toxin, hoặc những protein biểu hiện tính kháng thuốc diệt cỏ như glyphosate acetyltransferase, cung cấp khả năng chống lại glyphosate. Xử lý hạt giống bằng các hợp chất theo sáng chế này cũng có thể làm tăng sức sống của cây mọc từ hạt giống.

Một phương pháp xử lý hạt giống là bằng cách phun hoặc phủ bụi hạt giống bằng hợp chất theo sáng chế (tức là chế phẩm đã được pha chế) trước khi gieo hạt.

Các chế phẩm được pha chế để xử lý hạt giống thường bao gồm chất tạo màng hoặc chất kết dính. Do đó, thường chế phẩm phủ hạt theo sáng chế bao gồm một lượng hữu hiệu sinh học của Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, và chất tạo màng hoặc chất kết dính. Hạt giống có thể được bao phủ bằng cách phun trực tiếp hỗn dịch đậm đặc dễ chảy vào luống hạt và sau đó làm khô hạt. Ngoài ra, có thể phun các dạng chế phẩm khác như bột ướt, dung dịch, nhũ tương, chất cô đặc có thể tạo nhũ và nhũ tương trong nước. Quá trình này đặc biệt hữu ích để áp dụng các lớp phủ phim trên hạt giống. Nhiều máy móc và quy trình phủ khác nhau có sẵn cho một người có tay nghề cao trong lĩnh vực nghệ thuật này. Các quy trình phù hợp bao gồm các quy trình được liệt kê trong tài liệu P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57, và các tài liệu tham khảo được liệt kê ở đây.

Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và các chế phẩm của chúng, cả một mình và kết hợp với các loại thuốc trừ sâu, thuốc diệt côn trùng và thuốc diệt nấm khác, đặc biệt hữu ích trong việc xử lý hạt giống cho cây trồng bao gồm, nhưng không giới hạn ở ngô hoặc bắp, đậu tương, bông, ngũ cốc (ví dụ, lúa mì, yến mạch, lúa mạch, lúa mạch đen và gạo), khoai tây, rau và hạt cải dầu.

Thuốc trừ sâu khác mà với nó Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 có thể được kết hợp cùng để thu được hỗn hợp được sử dụng trong xử lý hạt giống bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, amitraz, avermectin, azadirachtin, bensultap, bifenthrin, buprofezin, cadusafos, carbaryl, carbofuran, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizone, methiocarb,

methomyl, methoprene, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, triazamate, triflumuron, *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng thuộc nucleopolyhedrovirus.

Thuốc diệt nấm mà với nó Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 có thể được kết hợp cùng để thu được hỗn hợp được sử dụng trong xử lý hạt giống bao gồm amisulbrom, azoxystrobin, boscalid, carbendazim, carboxin, cymoxanil, cyproconazol, difenoconazol, dimethomorph, fluazinam, fludioxonil, fluquinconazol, fluopicolide, fluoxastrobin, flutriafol, fluxapyroxad, ipconazol, iprodione, metalaxyl, mefenoxam, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penflufen, picoxystrobin, prothioconazol, pyraclostrobin, sedaxane, silthiofam, tebuconazol, thiabendazol, thiophanate-metyl, thiram, trifloxystrobin và triticonazol.

Chế phẩm chứa Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 được sử dụng để xử lý hạt giống có thể còn chứa vi khuẩn và nấm có khả năng bảo vệ khỏi tác hại của nấm hoặc vi khuẩn gây bệnh thực vật và/hoặc động vật sinh ra trong đất như giun tròn. Vi khuẩn có các đặc tính chống giun tròn có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* và *Pasteuria penetrans*. Chủng *Bacillus firmus* thích hợp là chủng CNCM I-1582 (GB-126) mà có sẵn ở trên thị trường dưới tên BioNemTM. Chủng *Bacillus cereus* thích hợp là chủng NCMM I-1592. Cả hai chủng *Bacillus* này đều được bộc lộ trong US 6,406,690. Vi khuẩn có các hoạt tính chống giun tròn thích hợp khác là chủng *B. amyloliquefaciens* IN937a và *B. subtilis* GB03. Vi khuẩn có các đặc tính chống nấm có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở chủng *B. pumilus* GB34. Các loài nấm có đặc tính chống giun tròn có thể bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* và *Purpureocillium lilacinum*.

Xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều tác nhân diệt nematode có nguồn gốc tự nhiên như protein elicitor được gọi là harpin được phân lập từ một số vi khuẩn gây bệnh thực vật như *Erwinia amylovora*. Một ví dụ là công nghệ xử lý hạt giống Harpin-N-Tek có sẵn dưới dạng N-HibitTM Gold CST.

Xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều loài vi khuẩn nốt sần ở rễ cây họ đậu như vi khuẩn cố định đạm vi sinh *Bradyrhizobium japonicum*. Những chủng cây này có thể tùy ý bao gồm một hoặc nhiều lipo-chitooligosaccharit (LCO), là các yếu tố tạo nốt sần (Nod) do vi khuẩn rhizobia tạo ra trong quá trình bắt đầu hình thành nốt sần trên rễ của cây họ đậu. Ví dụ, công nghệ xử lý hạt giống nhãn hiệu Optimize[®] phối hợp với LCO Promoter TechnologyTM khi kết hợp với chủng cây.

Xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều isoflavon có thể làm tăng mức độ xâm chiếm rễ của nấm rễ. Nấm rễ cải thiện sự phát triển của thực vật bằng cách tăng cường khả năng hấp thu các chất dinh dưỡng như nước, sulfat, nitrat, phosphat và các kim loại. Ví dụ về isoflavon bao gồm, nhưng không giới hạn ở, genistein, biochanin A, formononetin, daidzein, glycitein, hesperetin, naringenin và pratensein. Formononetin có sẵn dưới dạng hoạt chất trong các sản phẩm chủng cây nấm rễ như PHC Colonize[®] AG.

Xử lý hạt giống cũng có thể bao gồm một hoặc nhiều chất kích hoạt thực vật gây ra sức đề kháng có được toàn thân ở thực vật sau khi tiếp xúc với mầm bệnh. Ví dụ về chất kích hoạt thực vật tạo ra các cơ chế bảo vệ như vậy là acibenzolar-*S*-methyl.

Hạt giống đã được xử lý thường bao gồm hợp chất theo sáng chế với lượng từ khoảng 0,1g đến 1kg trên 100 kg hạt (nghĩa là từ khoảng 0,0001 đến 1% trọng lượng hạt trước khi xử lý). Chế phẩm huyền phù dễ chảy được pha chế để xử lý hạt giống thường bao gồm từ khoảng 0,5 đến khoảng 70% thành phần hoạt tính, từ khoảng 0,5 đến khoảng 30% chất kết dính tạo màng, từ khoảng 0,5 đến khoảng 20% chất phân tán, từ 0 đến khoảng 5% chất làm đặc, từ 0 đến khoảng 5% chất màu và/hoặc thuốc

nhuộm, từ 0 đến khoảng 2% chất chống tạo bọt, từ 0 đến khoảng 1% chất bảo quản, và từ 0 đến khoảng 75% chất pha loãng lỏng dễ bay hơi.

Hợp chất theo sáng chế có thể được kết hợp với chế phẩm môi sẽ được loài gây hại không xương sống ăn hoặc được sử dụng trong các thiết bị như bẫy, chỗ đặt môi, và các dạng tương tự. Chế phẩm môi này có thể là ở dạng hạt chứa (a) hoạt chất, chính là lượng hữu hiệu về mặt sinh học Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2, (b) một hoặc nhiều thức ăn, tùy ý (c) chất dẫn dụ tùy ý, và tùy ý (d) một hoặc nhiều chất làm ẩm tùy ý. Đáng chú ý là hạt hoặc chế phẩm môi chứa hoạt chất với lượng nằm trong khoảng từ 0,001-5%; thức ăn và/hoặc chất dẫn dụ với lượng nằm trong khoảng từ 40-99%; và chất làm ẩm tùy ý với lượng nằm trong khoảng từ 0,05-10%; mà có tác dụng phòng trừ côn trùng trong đất với nồng độ sử dụng rất thấp, cụ thể với liều lượng hoạt chất mà côn trùng sẽ bị chết do ăn chứ không phải bằng cách tiếp xúc trực tiếp. Một số thức ăn có cả vai trò làm nguồn thức ăn và chất dẫn dụ. Thức ăn bao gồm carbohydrat, protein và lipid. Ví dụ về thức ăn là bột rau quả, đường, tinh bột, mỡ động vật, dầu thực vật, dịch chiết nấm men và sữa khô. Ví dụ về chất dẫn dụ là chất tạo mùi và hương liệu, như các phần chiết của quả hoặc cây, dầu thơm, hoặc các thành phần của cây hoặc động vật khác, pheromon hoặc khác các chất đã biết để hấp dẫn loài gây hại không xương sống cần phòng trừ. Ví dụ về chất làm ẩm, tức là các chất duy trì độ ẩm, là glycol và rượu polyhydric khác, glycerin và sorbitol. Đáng chú ý là chế phẩm môi (và phương pháp sử dụng chế phẩm môi này) được sử dụng để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm loài kiến, mối, và gián riêng rẽ hoặc hỗn hợp của chúng. Thiết bị phòng trừ loài gây hại không xương sống có thể chứa chế phẩm môi theo sáng chế và vỏ thiết bị được làm thích ứng để chứa chế phẩm môi, trong đó vỏ thiết bị có ít nhất một lỗ được định cỡ để cho phép loài gây hại không xương sống đi qua lỗ này sao cho loài gây hại không xương sống có thể đi đến gần chế phẩm môi từ vị trí bên ngoài vỏ thiết bị, và trong đó vỏ thiết bị được làm thích ứng để đặt bên trong hoặc gần nơi ở hoặc phạm vi hoạt động tiềm năng hoặc đã biết của loài gây hại không xương sống.

Một phương án của sáng chế đề cập đến phương pháp kiểm soát loài gây hại không xương sống, bao gồm việc pha loãng chế phẩm thuốc trừ sâu theo sáng chế (Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 được tạo thành với chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng hoặc hỗn hợp được pha chế của Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2 và ít nhất một loại thuốc trừ sâu khác) với nước, và tùy chọn thêm tá dược để tạo thành chế phẩm pha loãng và tiếp xúc với sinh vật gây hại động vật không xương sống hoặc môi trường của chúng với một lượng hữu hiệu của chế phẩm đã pha loãng nói trên.

Mặc dù chế phẩm phun được tạo thành bằng cách pha loãng với nước với nồng độ vừa đủ của chế phẩm thuốc trừ sâu hiện tại có thể cung cấp đủ hiệu quả để kiểm soát loài gây hại không xương sống, các sản phẩm hỗ trợ được pha chế riêng biệt cũng có thể được thêm vào hỗn hợp bình phun. Những tá dược bổ sung này thường được gọi là “tá dược phun” hoặc “tá dược trộn trong thùng”, và bao gồm bất kỳ chất nào được trộn trong thùng phun để cải thiện hiệu suất của thuốc trừ sâu hoặc thay đổi tính chất vật lý của hỗn hợp phun. Tá dược có thể là chất hoạt động bề mặt, chất tạo nhũ, dầu thực vật có nguồn gốc từ dầu mỏ, dầu hạt có nguồn gốc từ cây trồng, chất axit hóa, chất đệm, chất làm đặc hoặc chất khử bọt. Tá dược được sử dụng để tăng cường hiệu quả (ví dụ, tính sẵn có sinh học, độ bám dính, độ thâm nhập, độ đồng đều của độ che phủ và độ bền của lớp bảo vệ), hoặc giảm thiểu hoặc loại bỏ các vấn đề của ứng dụng phun liên quan đến sự không tương thích, tạo bọt, trôi, bay hơi, bay hơi và suy thoái. Để đạt được hiệu suất tối ưu, tá dược được lựa chọn dựa trên các đặc tính của thành phần hoạt chất, chế phẩm và mục tiêu (ví dụ, cây trồng, côn trùng gây hại).

Trong số tá dược phun, các loại dầu bao gồm dầu thực vật, cô đặc dầu thực vật, cô đặc dầu thực vật và cô đặc dầu hạt metyl hóa được sử dụng phổ biến nhất để cải thiện hiệu quả của thuốc trừ sâu, có thể bằng cách thúc đẩy cận phun đồng đều và đồng đều hơn. Trong các tình huống có thể gây ra độc tính thực vật do dầu hoặc các

chất lỏng không hòa tan trong nước khác gây ra, các chế phẩm dạng xịt được điều chế từ chế phẩm của sáng chế nói chung sẽ không chứa tá dược dạng xịt gốc dầu. Tuy nhiên, trong các tình huống mà độc tố thực vật gây ra bởi tá dược phun gốc dầu là không đáng kể về mặt thương mại, các chế phẩm phun được điều chế từ thành phần của chế phẩm hiện tại cũng có thể chứa tá dược phun gốc dầu, có khả năng tăng khả năng kiểm soát loài gây hại không xương sống, cũng như nhanh mưa.

Các sản phẩm được xác định là “dầu từ cây trồng” thường chứa 95 đến 98% parafin hoặc dầu mỏ trên cơ sở naphta và 1 đến 2% của một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt hoạt động như chất nhũ hóa. Các sản phẩm được xác định là “dịch cô đặc từ dầu thực vật” thường bao gồm 80 đến 85% dầu trên cơ sở dầu mỏ có thể nhũ hóa và 15 đến 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Các sản phẩm được xác định một cách chính xác là “dịch cô đặc dầu thực vật” thường bao gồm 80 đến 85% dầu thực vật (tức là dầu hạt hoặc trái cây, phổ biến nhất là từ bông, hạt lanh, đậu nành hoặc hướng dương) và 15 đến 20% chất hoạt động bề mặt không ion. Hiệu suất hỗ trợ có thể được cải thiện bằng cách thay thế dầu thực vật bằng metyl este của axit béo thường có nguồn gốc từ dầu thực vật. Ví dụ về dịch cô tinh dầu hạt metyl hóa bao gồm MSO[®] Concentrate (UAP-Loveland Products, Inc.) và dầu phun metyl hóa MSO cao cấp (Helena Chemical Company).

Lượng tá dược được thêm vào hỗn hợp phun thường không vượt quá 2,5% thể tích, và thông thường hơn là lượng từ khoảng 0,1 đến khoảng 1% thể tích. Tỷ lệ sử dụng các tá dược được thêm vào hỗn hợp phun thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5 lít mỗi ha. Các ví dụ đại diện về tá dược dạng phun bao gồm: Adigor[®] (Syngenta) dầu hạt cải dầu được metyl hóa 47% trong hydrocacbon lỏng, Silwet[®] (Helena Chemical Company) heptametyltrisiloxan được biến đổi polyalkylenoxit và Assist[®] (BASF) hỗn hợp chất hoạt động bề mặt 17% pha trộn trong dầu khoáng gốc parafin 83%.

Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng mà không có tá dược khác, nhưng thường được sử dụng nhất là dạng chế phẩm bao gồm một hoặc nhiều hoạt chất với chất mang, chất pha loãng và chất hoạt động bề mặt thích hợp và có thể kết hợp với chất dinh dưỡng tùy thuộc vào mục đích sử dụng cuối cùng. Một phương pháp để áp dụng bao gồm phun dung dịch phân tán trong nước hoặc dung dịch dầu tinh chế chứa các hợp chất theo sáng chế. Chế phẩm với dầu phun, chất cô đặc dạng dầu phun, chất dính thấm ướt, chất hỗ trợ, các dung môi khác, và chất hiệp đồng như piperonyl butoxit thường làm tăng hiệu quả của hợp chất. Để sử dụng trong môi trường phi nông nghiệp, các chế phẩm phun này có thể được phun từ bình phun như bình chứa, chai hoặc thùng chứa khác, bằng bơm hoặc làm chúng bay ra từ thùng chứa chịu áp, ví dụ, bình xịt sơn khí chịu áp. Chế phẩm phun này có thể có các dạng khác nhau, ví dụ, bụi nước, sương mù, bột, khói hoặc mù. Do đó, chế phẩm phun này có thể chứa thêm chất đẩy, chất tạo bột, v.v. tùy theo từng trường hợp. Đáng chú ý là chế phẩm phun chứa hợp chất hoặc chế phẩm có hoạt tính sinh học theo sáng chế và chất mang. Một phương án về chế phẩm phun này chứa một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất hoặc chế phẩm theo sáng chế chất đẩy. Chất đẩy điển hình bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, metan, etan, propan, butan, isobutan, buten, pentan, isopentan, neopentan, penten, hydroflocacbon, cloflocacbon, dimetyl ete, và hỗn hợp của chúng. Đáng chú ý là chế phẩm phun (và phương pháp sử dụng chế phẩm phun được phân phối từ bình xịt) được sử dụng để phòng trừ ít nhất một loài gây hại không xương sống được chọn từ nhóm bao gồm các loài muỗi, ruồi đen, ruồi chó, ruồi hươu, ruồi trâu, ong bắp cày, ruồi vàng, ong bầu vàng, tic, nhện, kiến, muỗi mắt, bao gồm từng loài tương tự riêng rẽ hoặc hỗn hợp của chúng.

Các thử nghiệm sau đây chứng minh hiệu quả phòng trừ của hợp chất theo sáng chế trên vật gây hại cụ thể. "Hiệu quả phòng trừ" là khả năng ức chế sự phát triển của loài gây hại không xương sống (kể cả việc làm chết) làm giảm đáng kể tỷ lệ ăn. Tuy nhiên, hiệu quả bảo vệ phòng trừ vật gây hại thu được bởi hợp chất theo sáng chế không chỉ giới hạn trong các loài này.

Thử nghiệm sinh học

Chế phẩm và phương pháp phun đối với các Thử nghiệm A-D

Hợp chất thử nghiệm được tạo ra bằng cách sử dụng dung dịch chứa 10% axeton, 90% nước và chất hoạt động bề mặt không chứa ion X-77® Spreader Lo-Foam Formula chứa alkylarylpolyoxyetylen, axit béo tự do, glycol và isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Các hợp chất đã được tạo ra được áp dụng trong 1ml chất lỏng thông qua một vòi phun SUJ2 với thân thông thường 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA) được đặt cao hơn 1,27cm (0,5 inch) trên đỉnh của mỗi đơn vị thử nghiệm. Các hợp chất thử nghiệm được phun theo tỷ lệ được chỉ định và mỗi thử nghiệm được lặp lại ba lần.

Thử nghiệm A

Để đánh giá khả năng kiểm soát rệp đào xanh (*Myzus persicae* (Sulzer)) thông qua thiết bị tiếp xúc và/hoặc hệ thống, thiết bị thử nghiệm bao gồm một thùng nhỏ mở với một cây củ cải 12-15 ngày tuổi bên trong. Rệp này đã được lây nhiễm trước bằng cách đặt 30–40 con rệp vào lá của cây thử nghiệm trên một phần lá được cắt ra từ cây nuôi cấy (phương pháp cắt lá). Rệp di chuyển vào cây thử nghiệm khi phần lá được làm khô. Sau khi nhiễm sơ bộ, đất của đơn vị thử nghiệm đã được phủ một lớp cát.

Hợp chất thử nghiệm được tạo ra và được phun ở 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun hợp chất thử nghiệm đã được tạo ra, mỗi đơn vị thử nghiệm unit được để đến khô trong 1 giờ và tiếp đó đặt một nắp đen có màn che lên trên. Đơn vị thử nghiệm được giữ trong 6 ngày trong buồng sinh trưởng ở 19–21°C và độ ẩm tương đối 50–70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá trực quan về tỷ lệ chết của côn trùng.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 250ppm, các hợp chất sau đây dẫn đến ít nhất 80% tỷ lệ chết: 1 và 2a.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 50ppm, các hợp chất sau đây dẫn đến ít nhất 80% tỷ lệ chết: 1, 2a, 2b và 2c.

Thử nghiệm B

Để đánh giá khả năng kiểm soát rệp bông, rệp dưa (*Aphis gossypii* (Glover)) thông qua thiết bị tiếp xúc và/hoặc hệ thống, thiết bị thử nghiệm gồm một thùng nhỏ mở với một cây đậu bắp 6-7 ngày tuổi bên trong cây bông. Loại này đã được nhiễm sơ bộ 30–40 côn trùng trên một mẫu lá theo phương pháp cắt lá, và đất của bộ phận thử nghiệm được phủ một lớp cát.

Hợp chất thử nghiệm được tạo ra và được phun ở 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, đơn vị thử nghiệm được giữ trong buồng sinh trưởng trong 6 ngày ở 19°C và độ ẩm tương đối 70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá trực quan về tỷ lệ chết của côn trùng.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 50ppm, các hợp chất sau đây dẫn đến ít nhất 80% tỷ lệ chết: 1, 2a, 2b và 2c.

Thử nghiệm C

Để đánh giá khả năng kiểm soát ruồi trắng hại khoai lang (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) thông qua thiết bị tiếp xúc và/hoặc hệ thống, thiết bị thử nghiệm gồm một hộp nhỏ mở với một cây bông 12-14 ngày tuổi bên trong. Trước khi phun thuốc, cả hai lá mầm đã được cắt bỏ khỏi cây, để lại một lá thật cho thử nghiệm. Những con ruồi trắng trưởng thành được phép đẻ trứng trên cây và sau đó được lấy ra khỏi thiết bị thử nghiệm. Những cây bông bị nhiễm ít nhất 15 trứng đã được đưa đi thử nghiệm để phun thuốc.

Hợp chất thử nghiệm được tạo ra và được phun ở 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, đơn vị thử nghiệm được để đến khô trong 1 giờ. Sau đó, các ống trụ được lấy ra, và các đơn vị được đưa đến một buồng sinh trưởng và được giữ trong 13 ngày

ở 28°C và độ ẩm tương đối 50–70%. Mỗi đơn vị thử nghiệm sau đó được đánh giá trực quan về tỷ lệ chết của côn trùng.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 250ppm, các hợp chất sau đây dẫn đến ít nhất 50% tỷ lệ chết: 1 và 2b.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 50ppm, các hợp chất sau đây dẫn đến ít nhất 50% tỷ lệ chết: 1.

Thử nghiệm D

Để đánh giá khả năng kiểm soát bọ trĩ hoa miền tây (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) thông qua thiết bị tiếp xúc và/hoặc hệ thống, thiết bị thử nghiệm gồm một thùng nhỏ mở với một cây đậu Soleil 5-7 ngày tuổi bên trong.

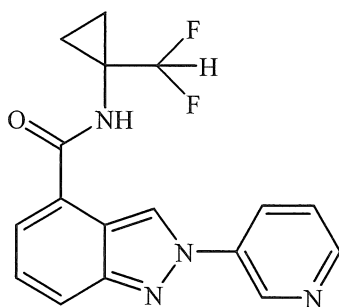
Hợp chất thử nghiệm được tạo ra và được phun ở 250 và/hoặc 50ppm. Sau khi phun, đơn vị thử nghiệm được để đến khô trong 1 giờ, và tiếp đó ~ 22-27 bọ trĩ trưởng thành được thêm vào mỗi đơn vị. Một nắp đen, có màn che được đặt lên trên và các đơn vị thử nghiệm được giữ trong 6 ngày ở 25°C và độ ẩm tương đối 45–55%.

Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 250ppm, các hợp chất sau đây tạo ra mức hiệu quả kiểm soát từ rất tốt đến tuyệt vời (30% hoặc nhỏ hơn tổn hại cây trồng và/hoặc 100% tỷ lệ chết): 1, 2a và 2b.

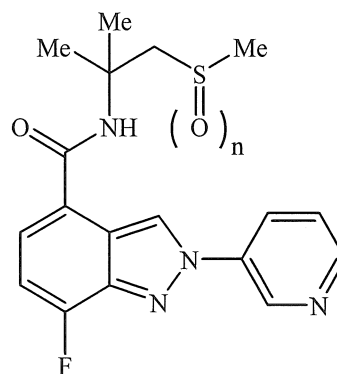
Trong số các hợp chất được thử nghiệm ở 50ppm, các hợp chất sau đây tạo ra mức hiệu quả kiểm soát từ rất tốt đến tuyệt vời (30% hoặc nhỏ hơn tổn hại cây trồng và/hoặc 100% tỷ lệ chết): 1, 2a và 2b.

Yêu cầu bảo hộ

1. Hợp chất 1 hoặc hợp chất có Công thức 2:



Hợp chất 1



Công thức 2,

trong đó n là 0, 1, hoặc 2.

2. Hợp chất 1 theo điểm 1.

3. Hợp chất có Công thức 2 theo điểm 1, trong đó n là 0.

4. Hợp chất có Công thức 2 theo điểm 1, trong đó n là 1.

5. Hợp chất có Công thức 2 theo điểm 1, trong đó n là 2.

6. Hợp chất theo điểm 1, trong đó hợp chất được chọn từ:

N-[1-(difluoromethyl)cyclopropyl]-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamid, *N*-[1,1-dimethyl-2-(methylthio)ethyl]-7-fluoro-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamid, *N*-[1,1-

dimethyl-2-(metylsulfinyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit, và *N*-[1,1-dimethyl-2-(metylsulfonyl)etyl]-7-flo-2-(3-pyridinyl)-2*H*-indazol-4-carboxamit.

7. Chế phẩm chứa hợp chất theo điểm 1 và ít nhất một thành phần bổ sung được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt, chất pha loãng rắn và chất pha loãng lỏng, chế phẩm này còn tùy ý chứa ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung.

8. Chế phẩm theo điểm 7, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung là được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, acephate, acequinocyl, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amidoflomet, amitraz, avermectin, azadirachtin, azinphos-metyl, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, bifenazate, bistrifluron, borate, buprofezin, carbaryl, carbofuran, cartap, carzol, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorfluazuron, chlorpyrifos, chlorpyrifos-metyl, chromafenozide, clofentezin, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, xycloxaprid, cyflumetofen, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, diafenthiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimefluthrin, dimehypo, dimethoate, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxit, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenpropathrin, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flucythrinate, flufenrim, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, fluorpyram, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, tau-fluvalinate, fonophos, formetanate, fosthiazate, halofenozide, heptafluthrin, hexaflumuron, hexythiazox, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, insecticidal soaps, isofenphos, lufenuron, malathion, meperfluthrin, metaflumizone, metaldehyde, methamidophos, methidathion, methiodicarb, methomyl, methopren, metoxychlor, metofluthrin, monocrotophos, monofluthrin, metoxyfenozide, nitenpyram, nithiazine, novaluron, noviflumuron, oxamyl, parathion, parathion-metyl, permethrin,

phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, pirimicarb, profenofos, profluthrin, propargite, protrifenbute, pyflubumide, pymetrozine, pyrafluprole, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyrifluquinazon, pyriminostrobin, pyriprole, pyriproxyfen, rotenone, ryanodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozide, tebufenpyrad, teflubenzuron, tefluthrin, terbufos, tetrachlorvinphos, tetramethrin, tetrametylfluthrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tolfenpyrad, tralomethrin, triazamate, trichlorfon, triflumuron, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis*, vi khuẩn gây bệnh côn trùng, tất cả các chủng thuộc virus *Nucleo polyhedrosis*, virus gây bệnh côn trùng và nấm gây bệnh côn trùng.

9. Chế phẩm theo điểm 7, trong đó ít nhất một hợp chất hoặc tác nhân có hoạt tính sinh học bổ sung là được chọn từ nhóm bao gồm abamectin, axetamiprid, acrinathrin, afidopyropen, amitraz, avermectin, azadirachtin, benfuracarb, bensultap, bifenthrin, 3-bromo-1-(3-clo-2-pyridinyl)-*N*-[4-xyano-2-metyl-6-[(metylaminocarbonyl]phenyl]-1*H*-pyrazol-5-carboxamit, buprofezin, carbaryl, cartap, chlorantraniliprole, chlorfenapyr, chlorpyrifos, clothianidin, cyantraniliprole, cyclaniliprole, xycloprothrin, cyfluthrin, beta-cyfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gamma-cyhalothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyromazine, deltamethrin, dieldrin, dinotefuran, diofenolan, emamectin, endosulfan, esfenvalerate, ethiprole, etofenprox, etoxazol, fenitrothion, fenothiocarb, fenoxycarb, fenvalerate, fipronil, flometoquin, flonicamid, flubendiamit, flufenoxuron, flufenoxystrobin, flufensulfon, flupiprole, flupyradifurone, fluvalinate, formetanate, fosthiazate, heptafluthrin, hexaflumuron, hydrametylnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, meperfluthrin, metaflumizone, methiodicarb, methomyl, methopren, metoxyfenozide, metofluthrin, monofluthrin, nitenpyram, nithiazine, novaluron, oxamyl, pyflubumide, pymetrozine, pyrethrin, pyridaben, pyridalyl, pyriminostrobin, pyriproxyfen, ryanodine, spinetoram, spinosad, spiroadiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozide, tetramethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiodicarb, thiosultap-natri, tralomethrin, tetrametylfluthrin, triazamate,

triflumuron, tất cả các chủng thuộc *Bacillus thuringiensis* và tất cả các chủng thuộc virus *Nucleo polyhedrosis*.

10. Phương pháp để kiểm soát loài gây hại không xương sống, phương pháp này bao gồm việc cho tiếp xúc loài gây hại không xương sống hoặc môi trường của nó với một lượng hữu hiệu về mặt sinh học hợp chất theo điểm 1, với điều kiện là phương pháp này không phải là phương pháp điều trị cho người hoặc động vật bằng trị liệu.

11. Hạt giống đã được xử lý chứa hợp chất theo điểm 1 với lượng nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 1% trọng lượng của hạt giống trước khi xử lý.