



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

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

(11)   
**1-0022641**

(51)<sup>7</sup> **A01N 43/42, 25/30, 25/00, A01P 3/00** (13) **B**

---

|      |                                                                                       |            |            |               |            |
|------|---------------------------------------------------------------------------------------|------------|------------|---------------|------------|
| (21) | 1-2012-01803                                                                          | (22)       | 07.12.2010 |               |            |
| (86) | PCT/JP2010/071856                                                                     | 07.12.2010 | (87)       | WO2011/071026 | 16.06.2011 |
| (30) | 2009-279235                                                                           | 09.12.2009 | JP         |               |            |
| (45) | 27.01.2020                                                                            | 382        | (43)       | 25.09.2012    | 294        |
| (73) | MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD. (JP)<br>4-16, Kyobashi 2-Chome, Chuo-Ku, Tokyo-To, Japan |            |            |               |            |
| (72) | YABUZAKI Mitsuyuki (JP), UENO Shigeru (JP), OKUDA Tomohiko (JP), OCHIAI Kazuko (JP)   |            |            |               |            |
| (74) | Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)                                                           |            |            |               |            |

---

(54) **CHẾ PHẨM HÓA NÔNG DẠNG HUYỀN PHÙ CHỨA NƯỚC ỔN ĐỊNH**

(57) Sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm:

(a) 6- tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; và  
(b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion. Chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước có thể ngăn sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8- floquinolyl-4-axetat, có khả năng phân tán lại, và có độ ổn định bảo quản tuyệt vời.

**Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập**

Sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính.

**Tình trạng kỹ thuật của sáng chế**

Cho đến nay, dịch cô đặc nhũ hóa, bột có thể thấm ướt và các dạng tương tự được biết đến ở dạng bào chế để pha loãng với nước. Một lượng lớn dung môi hữu cơ được sử dụng cho dịch cô đặc nhũ hóa. Hầu hết các dung môi hữu cơ giống các chất nguy hại và có khả năng tỏa mùi và phân tán dung môi hữu cơ trong khi sử dụng. Bột có thể thấm ướt có khả năng là người sử dụng bị phơi nhiễm bột có thể thấm ướt này do sự tạo bụi trong quá trình điều chế hóa chất lỏng. Vì các lý do này, chế phẩm dạng huyền phù chứa nước được yêu cầu.

Thuốc diệt khuẩn dùng cho lúa mô tả trong WO01/92231 (tài liệu Patent 1) và WO2004/039156 (tài liệu Patent 2) được biết đến ở dạng chế phẩm chứa 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat (dưới đây đôi khi gọi là “hợp chất A”) hữu dụng làm chất diệt khuẩn nông nghiệp, và chế phẩm dạng rắn mô tả trong Đơn xin cấp patent Nhật số 155234/2009 (tài liệu Patent 3) được biết đến ở dạng chế phẩm ổn định chứa hợp chất A. Tuy nhiên, chế phẩm chứa hợp chất A dạng huyền phù chứa nước ổn định cho đến nay chưa được biết đến một cách chi tiết.

Hợp chất A có cấu tạo tương tự như hợp chất 2 mô tả trong tài liệu Patent 2 và tương tự như 4-axetoxyl-6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolin mô tả trong tài liệu Patent 3.

Hợp chất A, khi cho tiếp xúc với nước, được thủy phân theo thời gian và do đó đặt ra một vấn đề trong sự phát triển chế phẩm dạng huyền phù chứa nước. Chế phẩm dạng huyền phù chứa nước, khi bảo quản, gặp bất lợi là không thể giữ được trạng thái huyền phù và gây ra sự kết cục (đóng rắn) dẫn đến lắng cặn, việc tạo cặn này có thể dẫn đến khả

năng phân tán lại. Do đó, được phẩm chứa hợp chất A có khả năng phân tán lại và có độ ổn định bảo quản tuyệt vời được mong đợi.

Để cải thiện độ ổn định của thành phần hoạt tính trong chế phẩm huyền phù chứa nước, các tài liệu sau được bộc lộ trong phần tình trạng kỹ thuật của sáng chế. Việc trộn các thành phần hóa chất nông nghiệp và chất có hoạt tính bề mặt được bộc lộ trong đơn xin cấp patent Nhật số 29773/2009 (tài liệu Patent 4) và đơn xin cấp patent Nhật số 363005/2002 (tài liệu Patent 5). Tuy nhiên, các thành phần nông nghiệp mô tả trong các tài liệu Patent 4 và 5 khác với hợp chất A về cấu tạo, cũng như các đặc tính vật lý. Hơn nữa, các tài liệu Patent 4 và 5 không bộc lộ mà cũng không gợi ý các loại chất có hoạt tính bề mặt được kết hợp với thành phần nông nghiệp khi các thành phần nông nghiệp này khác với các thành phần nông nghiệp mô tả trong tài liệu Patent 4 và 5.

Tài liệu patent 1: WO01/92231

Tài liệu patent 2: WO2004/039156

Tài liệu patent 3: Đơn xin cấp patent Nhật số 155234/2009

Tài liệu patent 4: Đơn xin cấp patent Nhật số 29773/2009

Tài liệu patent 5: Đơn xin cấp patent Nhật số 363005/2002

### **Bản chất kỹ thuật của sáng chế**

Các tác giả sáng chế đã nhận thấy chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion có thể ngăn sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat, là có thể phân tán lại, và có độ ổn định bảo quản tuyệt vời. Sáng chế được viết dựa trên những kết quả thu được này.

Mục đích của sáng chế là đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước mà có thể kìm hãm sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat, có thể phân tán lại, và có độ ổn định bảo quản tuyệt vời.

Theo một khía cạnh, sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion.

Hơn nữa, theo một khía cạnh khác, sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; và (b) chất có hoạt tính bề mặt polyoxyetylen arylphenyl ete hoặc chất có hoạt tính bề mặt polyoxyalkylen arylphenyl ete anion hoặc không ion.

Vẫn theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; (b) chất có hoạt tính bề mặt polyoxyetylen arylphenyl ete hoặc chất có hoạt tính bề mặt polyoxyalkylen arylphenyl ete anion hoặc không ion; và (c) tricanxi phosphat.

Theo khía cạnh nữa, sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; và (b) chất có hoạt tính bề mặt polyoxyetylen arylphenyl ete hoặc chất có hoạt tính bề mặt polyoxyalkylen arylphenyl ete anion hoặc không ion; và (c) tricanxi phosphat, chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước có độ pH là từ 5,5 đến 9,0.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion; và (d) hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt nấm làm thành phần hoạt tính.

Sáng chế có thể đề xuất chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước mà có thể kìm hãm sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat, có thể phân tán lại, và độ ổn định bảo quản tuyệt vời.

### **Mô tả chi tiết sáng chế**

Thành phần hợp chất A trong chế phẩm của sáng chế không bị giới hạn cụ thể nhưng tốt hơn là từ 1 đến 50 phần trọng lượng/100 phần trọng lượng chế phẩm.

Chất có hoạt tính bề mặt anion và chất có hoạt tính bề mặt không ion thường sử dụng trong chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước có thể dùng được ở dạng chất

có hoạt tính bề mặt anion và chất có hoạt tính bề mặt không ion sử dụng trong chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo sáng chế.

Chất có hoạt tính bề mặt anion sử dụng trong chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể miễn là sáng chế đạt hiệu quả. Các ví dụ về chất có hoạt tính bề mặt bao gồm lignin sulfonat, chất ngưng tụ natri naphtalensulfonat formalin; chất ngưng tụ natri alkylnaphtalensulfonat formalin; một hoặc nhiều polyoxyetylen arylphenyl ete sulfat được chọn từ polyoxyetylen styrylphenyl ete sulfat và polyoxyetylen tristyrylphenyl ete sulfat; polyoxyalkylen arylphenyl ete sulfat; một hoặc nhiều polyoxyetylen arylphenyl ete phosphat được chọn từ polyoxyetylen styrylphenyl ete phosphat và polyoxyetylen tristyrylphenyl ete phosphat; polyoxyalkylen arylphenyl ete phosphat; hoặc chất co-polyme của axit alkylmaleic.

Chất có hoạt tính bề mặt không ion sử dụng trong chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể miễn là sáng chế đạt hiệu quả. Do đó, các ví dụ về polyoxyalkylen arylphenyl ete, polyoxyetylen alkyl ete, polyoxyalkylen alkyl ete, hoặc chất trùng hợp khối PO/EO.

Chất có hoạt tính bề mặt anion và chất có hoạt tính bề mặt không ion sử dụng trong chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo sáng chế không bị giới hạn cụ thể miễn là đạt được hiệu quả của sáng chế. Tốt hơn là chất có hoạt tính bề mặt polyoxyetylen arylphenyl ete hoặc chất có hoạt tính bề mặt polyoxyalkylen arylphenyl ete. Tốt hơn nữa là một hoặc nhiều polyoxyetylen arylphenyl ete sulfat được chọn từ polyoxyetylen styrylphenyl ete sulfat và polyoxyetylen tristyrylphenyl ete sulfat; polyoxyalkylen arylphenyl ete sulfat; và polyoxyalkylen arylphenyl ete. Polyoxyetylen styrylphenyl ete sulfat hoặc polyoxyalkylen arylphenyl ete sulfat vẫn được ưu tiên hơn.

Lượng chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion được kết hợp trong chế phẩm theo sáng chế được giới hạn cụ thể miễn là sáng chế đạt hiệu quả. Lượng chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion được kết hợp tốt hơn là từ 0,05 đến 25 phần trọng lượng/100 phần trọng lượng chế phẩm.

Khi tricanxi phosphat được kết hợp trong chế phẩm theo sáng chế, lượng tricanxi phosphat được kết hợp có thể thay đổi phụ thuộc vào loại chất có hoạt tính bề mặt được

sử dụng nhưng tốt hơn là từ 0,01 đến 10 phần trọng lượng/100 phần trọng lượng chế phẩm.

Nếu cần thiết, tá dược bào chế khả dụng nông hóa học có thể còn được kết hợp trong chế phẩm của sáng chế. Do đó, các ví dụ bao gồm tá dược khác nhau mô tả trong “Guide for agricultural chemical preparations” (công bố bởi Japan Plant Protection Association năm 1997). Đặc biệt, các chất thấm ướt bao gồm các muối của axit dioctylsulfosuccinic, các muối của axit alkylsulfonic, POE alkyl ete, POE aryl ete, axetylen diol, và chất trùng hợp khối PO/EO. Chất làm đặc bao gồm chất làm đặc hữu cơ như gôm xanthan, polyvinyl pyrrolidin, rượu polyvinyl, polyetylen glycol, metylxenluloza, và axit alginic hoặc chất làm đặc vô cơ như bentonit. Chất chống đông bao gồm dung môi phân cực như propylen glycol, etylen glycol, và glyxerin. Chất chống tạo bọt bao gồm nhũ tương silicon, dầu silicon, axetylen diol, và chất trùng hợp khối PO/EO. Chất điều chỉnh độ pH bao gồm các muối của axit phosphoric. Các tá dược khác bao gồm các chất chống nấm.

Giá trị pH của chế phẩm theo sáng chế được giới hạn cụ thể miễn là sáng chế đạt hiệu quả nhưng tốt hơn là từ 5,5 đến 9,0, tốt hơn nữa là từ 6,0 đến 8,5. Khi giá trị pH của chế phẩm theo sáng chế nằm trong khoảng đã xác định ở trên, chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước có thể có khả năng kìm hãm sự thủy phân 6-tert-butyl-2,3-dimethyl-8-floquinolyl-4-axetat ở mức cao hơn và có độ ổn định bảo quản tốt hơn.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được sản xuất bằng các phương pháp khác nhau. Quy trình bào chế được ưu tiên là như sau: Hợp chất A, chất có hoạt tính bề mặt, chất thấm ướt, chất chống đông, chất chống tạo bọt, và nước được trộn bằng máy khuấy để tạo ra bột nhão. Bột nhão này được nghiền bằng máy nghiền ướt tạo ra hạt có đường kính được xác định trước để điều chế bột nhão mịn. Chất làm đặc, chất chống nấm, chất điều chỉnh độ pH, và tricanxi phosphat được thêm vào bột nhão, tiếp đó khuấy thành trạng thái đồng nhất.

Chế phẩm theo sáng chế nếu cần thiết có thể chứa một hoặc nhiều hợp chất làm thành phần hoạt tính mà các hợp chất này không phải là hợp chất A và có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ. Hàm lượng tổng (hàm lượng thành phần hoạt tính)

của hợp chất A và (các) hợp chất không phải hợp chất A và có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ không bị giới hạn cụ thể miễn là đạt được hiệu quả của sáng chế. Ví dụ, hàm lượng tổng có thể là từ 0,1 đến 60 phần trọng lượng, tốt hơn là từ 5 đến 50 phần trọng lượng/100 phần trọng lượng chế phẩm.

Tỷ lệ trộn của hợp chất A so với (các) hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ không bị giới hạn cụ thể miễn là đạt được hiệu quả của sáng chế. Ví dụ, tỷ lệ trộn nằm trong khoảng từ 2:50 đến 50:2, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1:10 đến 10:1.

Các hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, các hợp chất sau.

Các hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn bao gồm azoxystrobin, kresoxym-metyl, trifloxystrobin, orylsastrobin, picoxystrobin, fuoxastrobin, metominostrobin, mepanipyrin, pyrimethanil, xyprodinil, triadimefon, bitertanol, triflumizol, propiconazol, myclobutanil, xyproconazol, tebuconazol, hexaconazol, prochloraz, simeconazol, quinomethionat, maneb, zineb, mancozeb, polycarbamat, propineb, diethofencarb, clothalonil, benomyl, thiophanat-metyl, carbendazol, metalaxyl, oxadixyl, hydroxyisoxazol, fosetyl-nhôm, tolclofos-metyl, captan, folpet, proxymidon, iprodion, thifluzamit, furametpyr, flutolanil, mepronil, boscalid, penthiopyrad, fluopyram, fenpropimorph, dimethomorph, fludioxonil, enpiclonil, fthalid, probenazol, axibenzolar-S-metyl, tiadinil, isotianil, carpropamid, dicloxytmet, fenoxanil, trioxclazol, pyroquilon, ferimzon, fluazinam, xymoxanil, triforin, pyrifenox, fenarimol, fenpropidin, penxycuron, xyazofamid, xyflufenamid, proquinazid, quinoxifen, famoxadon, fenamidon, iprovalicarb, benthiavalicarb-isopropyl, fluopicolid, pyribencarb, streptomycin, kasugamixin, hoặc validamycin.

Các hợp chất có hoạt tính diệt côn trùng bao gồm axephat, dichlorvos, EPN, fenitotion, fenamifos, prothiofos, profenofos, pyraclofos, chlorpyrifos-metyl, chlorfenvinphos, demeton, ethion, malathion, coumaphos, isoxathion, fenthion, diazinon, thiodocarb, aldicarb, oxamyl, propoxur, carbaryl, fenobucarb, ethiofencarb, fenothiocarb, pirimicarb, carbofuran, carbosulfan, furathiocarb, hyquincarb, alanycarb, methomyl,

benfuracarb, cartap, thioxycam, bensultap, dicofol, tetradifon, acrinathrin, bifenthrin, xycloprothrin, xyfluthrin, dimefluthrin, empenthrin, fenfluthrin, fenpropathrin, imiprothrin, metofluthrin, permethrin, phenothrin, resmethrin, tefluthrin, tetranethrin, tralomethrin, transfluthrin, xypermethrin, deltamethrin, xyhalothrin, fenvalerat, fluvalinat, ethofenprox, flufenprox, halfenprox, silafluofen, xyromazin, diflubenzuron, teflubenzuron, fluxycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, penfluron, triflumuron, chlorfluazuron, diafenthion, methopren, fenoxycarb, pyriproxyfen, halofenozid, tebufenozid, metoxyfenozid, chromafenozid, dixyclanil, buprofezin, hexythiazox, amitraz, chlordimeform, pyridaben, fenpyroxymat, flufenerim, pyrimidifen, tebufenpyrad, tolfenpyrad, fluacrypyrim, axequinoxyl, xyflumetofen, flubendiamid, ethiprol, fipronil, ethoxazol, imidacloprid, nitenpyram, clothianidin, acetamiprid, dinotefuran, thiachloprid, thiamethoxam, pymetrozin, bifenazot, spiroticlofen, spiromesifen, flonicamid, chlorfenapyr, pyriproxyfen, indoxacarb, pyridalyl, spinosad, avermectin, milbemycin, azadirachtin, nicotine, rotenone, chất BT, chất entomopathogenic virus, emamectin benzoate, spinetoram, pirifluquinazon, chloranthraniliprol, xenopyraferen, spirotetramer, lepimectin, metaflumizon, pyrafluprol, pyriprol, dimefluthrin, fenazaflor, hydrametyl non, hoặc triazamat.

Các hợp chất có hoạt tính diệt cỏ bao gồm mefenacet, daimuron, pentazon, prometryn, bensulfuron-metyl, pyrazosulfuron-etyl, imazosulfuron, xyhalofop-butyl, oxaziclomefon, fentrazaid, clomeprop, anilofos, benzobixyclon, cafenstrol, pentoxazon, indanofan, DCMU, linuron, hoặc trifluralin.

Theo khía cạnh được ưu tiên, sáng chế đề xuất chế phẩm kết hợp bao gồm: chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion; và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ.

Theo khía cạnh được ưu tiên khác của sáng chế, trong chế phẩm kết hợp, chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt

tính bề mặt không ion được đề xuất ở dạng chế phẩm thứ nhất, và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ được đề xuất ở dạng chế phẩm thứ hai chứa hợp chất làm thành phần hoạt tính. Trong trường hợp này, chế phẩm thứ hai có thể ở dạng liều bất kỳ chứa hợp chất kết hợp với chất mang hoặc tá dược thích hợp. Chế phẩm kết hợp này có thể được đề xuất ở dạng thuốc hoặc tương tự.

Vẫn theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất phương pháp bao gồm dùng chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ đồng thời hoặc riêng rẽ với nhau (tốt hơn là đồng thời) cho vùng cần xử lý.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ thực vật hữu ích khỏi bệnh và côn trùng gây hại, phương pháp này bao gồm dùng chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ đồng thời hoặc riêng rẽ với nhau (tốt hơn là đồng thời) cho vùng cần xử lý.

Theo phương pháp này, việc dùng “đồng thời” bao gồm trường hợp, trong đó chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ được trộn với nhau trước khi dùng cho đất cần xử lý và hỗn hợp được dùng cho vùng mục tiêu. Mặt khác, việc dùng “riêng rẽ” bao gồm trường hợp, trong đó, không trộn trước chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion và hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ, chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion được dùng trước khi dùng hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ, và trường hợp trong đó chế phẩm hóa nông

dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion được dùng sau khi dùng hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ.

Theo khía cạnh được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ thực vật hữu ích khỏi các bệnh và côn trùng gây hại, phương pháp này bao gồm dùng

- (1) chế phẩm thứ nhất bao gồm chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat và (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion làm thành phần hoạt tính và
- (2) chế phẩm thứ hai bao gồm hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ làm thành phần hoạt tính

cho vùng cần xử lý.

Chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế nếu cần thiết có thể được pha loãng với nước hoặc chất tương tự trước khi sử dụng trong việc xử lý như là rải, phun, hoặc thấm ướt vùng cần xử lý. Các ví dụ cụ thể của việc xử lý bao gồm việc dùng cho bản thân thực vật hữu ích (xử lý lá) và dùng cho vùng gieo trồng thực vật hữu ích (ví dụ, đất, lúa nước, hoặc các hộp gieo trồng cây giống con).

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ thực vật hữu ích khỏi các bệnh và côn trùng gây hại, phương pháp này bao gồm dùng lượng có hiệu quả của chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế cho vùng cần xử lý. Thuật ngữ “vùng cần xử lý” để chỉ vùng nên được xử lý bằng cách sử dụng chế phẩm theo sáng chế cho mục đích bảo vệ thực vật hữu ích. Do đó, các ví dụ bao gồm bản thân thực vật hữu ích, vùng gieo trồng thực vật hữu ích (ví dụ, đất, lúa nước, hoặc các hộp gieo trồng cây giống con). Vùng cần được xử lý tốt hơn là bản thân thực vật hữu ích.

Vẫn theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất việc sử dụng chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế để bảo vệ thực vật hữu ích khỏi các bệnh và côn trùng gây hại.

Lượng chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế được dùng có thể thay đổi phụ thuộc vào điều kiện bảo quản, tình trạng phát triển của thực vật, tỷ lệ trộn của thành phần hoạt tính, thời điểm dùng, phương pháp xử lý, và loại bệnh được phòng trừ. Thông thường, lượng chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế đã dùng là từ 1 đến 1500g, tốt hơn là từ 10 đến 150g thành phần hoạt tính /10A (1000m<sup>2</sup>) đất gieo trồng. Ví dụ, khi chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế được dùng cho cây lúa, lượng chế phẩm hoặc chế phẩm kết hợp theo sáng chế được dùng là từ 5 đến 500g, tốt hơn là từ 10 đến 100g thành phần hoạt tính/10A (1000m<sup>2</sup>) đất gieo trồng.

Theo khía cạnh được ưu tiên, sáng chế đề xuất phương pháp kìm hãm sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimethyl-8-floquinolyl-4-axetat, phương pháp cải thiện khả năng phân tán lại, và phương pháp cải thiện độ ổn định bảo quản, các phương pháp này bao gồm thêm (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion vào (a) 6-tert-butyl-2,3-dimethyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính.

Theo khía cạnh được ưu tiên khác, sáng chế đề xuất phương pháp kìm hãm sự thủy phân của 6-tert-butyl-2,3-dimethyl-8-floquinolyl-4-axetat, phương pháp cải thiện khả năng phân tán lại, và phương pháp cải thiện độ ổn định bảo quản, các phương pháp này bao gồm thêm (b) chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion và tricanxi phosphat và/hoặc hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ làm thành phần hoạt tính vào (a) 6-tert-butyl-2,3-dimethyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính.

Sáng chế còn được minh họa bằng các ví dụ và ví dụ so sánh sau mà không nhằm mục đích giới hạn sáng chế.

### **Ví dụ thực hiện sáng chế**

#### **Ví dụ điều chế**

Trộn hợp chất A, chất có hoạt tính bề mặt, chất chống đông, chất chống tạo bọt, và một phần nước vào máy khuấy theo công thức (thành phần và tỷ lệ) cụ thể trong bảng 1 và 2 dưới đây để tạo ra bột nhão. Nghiền bột nhão trong máy nghiền ướt thành đường kính hạt là 2µm. Thêm chất làm đặc, tricanxi phosphat, và nước còn lại vào bột nhão đã

nghiền, và khuấy bột nhão đến trạng thái đồng nhất. Do đó, tạo ra các chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước của các ví dụ từ 1 đến 9 và các ví dụ so sánh từ 1 đến 7.

Bảng 1

| Ví dụ                             | 1       | 2       | 3       | 4       | 5       | 6       | 7       | 8       | 9       |
|-----------------------------------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|
| Hợp chất A *1                     | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    |
| Sorpol T-20SPG *2                 | 5,0     | 5,0     |         |         |         |         |         |         |         |
| Newkalgen FS-700SW *3             |         |         | 5,0     | 5,0     |         |         |         |         |         |
| Newkalgen FS-77PG *4              |         |         |         |         | 5,0     | 5,0     |         |         |         |
| Newkalgen CP-15-200 *5            |         |         |         |         |         |         | 5,0     | 5,0     |         |
| SOPROPHOR 4D384 *6                |         |         |         |         |         |         |         |         | 5,0     |
| Propylen glycol                   | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     |
| Chất chống tạo bọt silicon        | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     |
| Dung dịch nước của gôm xanthan 1% | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    |
| Tricanxi phosphat                 |         | 1,0     |         | 1,0     |         | 1,0     |         | 1,0     | 1,0     |
| Nước                              | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại |
| Độ pH ban đầu                     | 4,8     | 6,4     | 5,2     | 6,4     | 5,4     | 6,6     | 4,9     | 6,0     | 4,7     |

(Chữ số là % theo trọng lượng; thêm nước vào thu được lượng tổng là 100%; độ pH ban đầu là giá trị pH trước khi bảo quản ở 50°C theo các ví dụ thử nghiệm sau đây.)

Bảng 2

| Ví dụ so sánh                     | 1       | 2       | 3       | 4       | 5       | 6       | 7       |
|-----------------------------------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|---------|
| Hợp chất A *1                     | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    | 20,7    |
| SANX P-252 *7                     | 5,0     | 5,0     |         |         |         |         |         |
| Bột DEMOL EP *8                   |         |         | 5,0     |         |         |         |         |
| DEMOL N *9                        |         |         |         | 5,0     |         |         | 5,0     |
| Morwet D-425 *10                  |         |         |         |         | 5,0     | 5,0     |         |
| TAYCAPOWER BC2070M *11            |         |         | 1,0     | 1,0     |         | 1,0     | 1,0     |
| Propylen glycol                   | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     | 5,0     |
| Chất chống tạo bọt silicon        | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     | 0,5     |
| Dung dịch nước của gôm xanthan 1% | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    | 10,0    |
| Tricanxi phosphat                 |         | 1,0     |         |         |         |         | 1,0     |
| Nước                              | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại | Còn lại |
| Độ pH ban đầu                     | 5,8     | 6,0     | 9,7     | 6,3     | 7,5     | 7,7     | 6,6     |

(Chữ số là % theo trọng lượng; thêm nước vào thu được lượng tổng là 100%; độ pH ban đầu là giá trị pH trước khi bảo quản ở 50°C theo các ví dụ thử nghiệm sau đây.)

\*1: 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat (độ tinh khiết: 96,83%)

\*2: polyoxyetylen (19) styrylphenyl ete nhôm sulfat propylen glycol: 20% (TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)

\*3: natri polyoxyalkylen arylphenyl ete sulfat-nước (Takemoto Oil & Fats Co., Ltd.)

- \*4: nhôm polyoxyetylen arylphenyl ete sulfat propylen glycol (Takemoto Oils & Fats Co., Ltd.)
- \*5: polyoxyalkylen arylphenyl ete (Takemoto Oils & Fats Co., Ltd.)
- \*6: nhôm polyoxyetylen (16) tristyrylphenyl ete sulfat (Rhodia Nicca)
- \*7: natri ligninsulfonat (NIPPON PAPER CHEMICALS Co., Ltd.)
- \*8: copolyme của axit alkylmaleic (Kao Corp.)
- \*9: sản phẩm ngưng tụ natri naphthalensulfonat formalin (Kao Corp.)
- \*10: sản phẩm ngưng tụ natri alkylnaphtalensulfonat formalin (LION AKZO CO., LTD.)
- \*11: canxi dodexylbenzensulfonat (TAYCA Corp.)

#### Ví dụ thử nghiệm

Bảo quản chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước điều chế theo các ví dụ từ 1 đến 9 và các ví dụ so sánh từ 1 đến 7 trong lọ thủy tinh ở 50°C. Sau khi bảo quản trong khoảng thời gian xác định trước, phân tích chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước để xác định thành phần hợp chất A, và xác định tốc độ phân hủy dựa vào sự thay đổi thành phần từ thành phần ban đầu. Hơn nữa, đánh giá khả năng phân tán lại sau thời gian 2 tháng từ khi bắt đầu bảo quản ở 50°C. Các kết quả của thử nghiệm được chỉ ra ở bảng 3 và 4. Trong các bảng 3 và 4, “50°C x 1 tháng” và “50°C x 2 tháng” nghĩa là việc bảo quản mẫu trong một tháng ở 50°C và việc bảo quản mẫu trong hai tháng ở 50°C, tương ứng. “-” nghĩa là phép đo không được thực hiện.

#### Các điều kiện phân tích HPLC

Cột: Inertsil ODS-2 (5µm; sản xuất bởi GL Sciences Inc., 4,6mm đường kính trong x 250mm chiều dài)

Pha động: axetonitril/nước = 60/40 (% thể tích)

Lưu lượng: 1,0mL/phút

Nhiệt độ cột: 40°C

Bước sóng dò tìm: 254nm

Các điều kiện đo khả năng phân tán lại

Lấy mẫu từ máy ủ 50°C để ở nhiệt độ trong phòng để làm mát tự nhiên. Đặt mẫu đã làm mát ở nhiệt độ trong phòng vào lọ, và, trong trường hợp này, lọ được đảo một lần / giây. Khi có thể đạt được sự phân tán đồng nhất, lọ được đảo 10 lần hoặc ít hơn, đánh giá khả năng phân tán lại là o; và, khi không thể đạt được sự phân tán đồng nhất thì lọ được đảo 10 lần, đánh giá khả năng phân tán lại là x. “-“ nghĩa là có thể đo được.

Bảng 3

| Ví dụ                                          | 1   | 2   | 3   | 4   | 5    | 6   | 7    | 8   | 9    |
|------------------------------------------------|-----|-----|-----|-----|------|-----|------|-----|------|
| Tốc độ phân hủy sau khi ở 50°C x 1 tháng, (%)  | 0,3 | 0,0 | 0,8 | 0,0 | 8,4  | 1,0 | 4,5  | 0,7 | 12,2 |
| Tốc độ phân hủy sau khi ở 50°C x 2 tháng, (%)  | 4,3 | 3,0 | 8,5 | 0,1 | 24,1 | 3,4 | 17,2 | 3,3 | 13,5 |
| Khả năng phân tán lại sau khi ở 50°C x 2 tháng | o   | o   | o   | o   | o    | o   | o    | o   | o    |

Bảng 4

| Ví dụ so sánh                                  | 1              | 2              | 3           | 4    | 5    | 6    | 7    |
|------------------------------------------------|----------------|----------------|-------------|------|------|------|------|
| Tốc độ phân hủy sau khi ở 50°C x 1 tháng, (%)  | 10,5           | 10,8           | 4,8         | 96,3 | 95,2 | 96,9 | 46,9 |
| Tốc độ phân hủy sau khi ở 50°C x 2 tháng, (%)  | -              | -              | -           | -    | -    | -    | -    |
| Khả năng phân tán lại sau khi ở 50°C x 2 tháng | X<br>Đóng bánh | X<br>Đóng bánh | X<br>Kết tụ | -    | -    | -    | -    |

Các kết quả trên minh họa cho thấy rằng việc thêm chất có hoạt tính bề mặt anion hoặc chất có hoạt tính bề mặt không ion làm cải thiện độ ổn định bảo quản của chế phẩm dạng huyền phù chứa nước của hợp chất A, nghĩa là, ngăn sự thủy phân của hợp chất A, và có thể đưa ra các chế phẩm có khả năng phân tán lại. Hơn nữa, các kết quả này cũng chứng minh được rằng việc thêm tricanxi phosphat vào chế phẩm có thể thấy rõ độ ổn định bảo quản được cải thiện hơn.

**YÊU CẦU BẢO HỘ**

1. Chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước bao gồm: (a) 6-tert-butyl-2,3-dimetyl-8-floquinolyl-4-axetat làm thành phần hoạt tính; và (b) chất hoạt động bề mặt anion hoặc chất hoạt động bề mặt không ion, trong đó chất hoạt động bề mặt anion hoặc chất hoạt động bề mặt không ion (b) này là chất hoạt động bề mặt polyoxyetylen arylphenyl ete hoặc chất hoạt động bề mặt polyalkylen arylphenyl ete.
2. Chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo điểm 1, trong đó chế phẩm này còn chứa (c) tricanxi phosphat.
3. Chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo điểm 1 hoặc điểm 2, trong đó chế phẩm này có giá trị pH là từ 5,5 đến 9,0.
4. Chế phẩm hóa nông dạng huyền phù chứa nước theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó chế phẩm này còn chứa (d) hợp chất có hoạt tính diệt khuẩn, diệt côn trùng, hoặc diệt cỏ làm thành phần hoạt tính.