



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

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

(11)



1-0024551

(51)⁷ A01N 43/40; C05G 3/02; A01N 43/56

(13) B

(21) 1-2014-01587

(22) 03/10/2012

(86) PCT/CN2012/083837 03/10/2012

(87) WO2013/067894A1 16/05/2013

(30) 1119286.1 08/11/2011 GB

(45) 27/07/2020 388

(43) 27/10/2014 319A

(73) ROTAM AGROCHEM INTERNATIONAL CO., LTD. (CN)

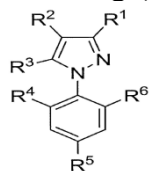
26/F, E-Trade Plaza, 24 Lee Chung Street, Chai Wan, Hong Kong, S. A. R.

(72) BRISTOW, James Timothy (GB).

(74) Công ty TNHH Sở hữu trí tuệ WINCO (WINCO CO., LTD.)

(54) PHƯƠNG PHÁP LÀM GIẢM TÍNH ĐỘC THỰC VẬT CỦA HỢP CHẤT Ở VỊ TRÍ CỦA CÂY TRỒNG

(57) Sáng chế đề cập đến phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) ở vị trí của cây trồng:



(I)

trong đó:

R¹ là alkyl, halogen, hoặc CN;

R² là 4,5-dixyanoimidazol 2-yl, haloalkyl, hoặc S(O)_mR⁷;

R³ là hydro, halogen, NR⁸R⁹, S(O)_nR¹⁰, C(O) R¹¹, alkyl, haloalkyl, OR¹², hoặc N=CR¹³R¹⁴;

mỗi nhóm R⁴ và R⁶ độc lập là hydro, halogen, haloalkyl, CN, hoặc NO₂;

R⁵ là hydro, halogen, haloalkyl, haloalkoxy, hoặc S(O)_pR¹⁵; mỗi nhóm R⁷, R¹⁰, R¹² và R¹⁵ độc lập là alkyl hoặc haloalkyl;

mỗi nhóm R⁸ và R⁹ độc lập là hydro, alkyl, alkenyl, haloalkyl, metoxy cacbonyl, hoặc S(O)_qCF₃;

mỗi nhóm R¹¹ và R¹⁴ độc lập là hydro hoặc alkyl;

R¹³ là nhóm phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc thành phần được chọn từ OH, alkyl, alkoxy, và xyano; và m, n, p, và q độc lập là 0, 1, hoặc 2;

nhóm alkyl, haloalkyl, haloalkoxy và alkenyl có từ 1 đến 12 nguyên tử cacbon; và phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có công thức chung (I) cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến chế phẩm hóa nông và phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất ở vị trí của cây trồng, cụ thể hơn là đề cập đến chế phẩm hóa nông chứa hợp chất có hoạt tính trừ sâu và phân bón.

Cụ thể, sáng chế đề cập đến chế phẩm chứa một hoặc nhiều thuốc trừ sâu *N*-aryl pyrazol và một hoặc nhiều phân bón trên cơ sở nitơ. Sáng chế còn đề cập đến phương pháp cải thiện hiệu quả trừ sâu của chế phẩm này và cải thiện năng suất của cây trồng.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các hợp chất *N*-aryl pyrazol là đã biết trong lĩnh vực này và được sử dụng rộng rãi làm thuốc trừ sâu. Các hợp chất này đã được bộc lộ và mô tả trong US 5232940. Phổ rộng của chúng cho phép phòng trừ hữu hiệu nhiều loại sinh vật gây hại cây trồng bao gồm kiến, bọ cánh cứng, bọ chết, tíc, bọ trĩ, sâu hại rễ, bọ vòi voi, dế dũi, và cụ thể là mối và gián. Các hợp chất *N*-aryl pyrazol có tác dụng ngăn chặn con đường vận chuyển ion clorua và do đó phá vỡ hệ thần kinh trung ương của côn trùng đích.

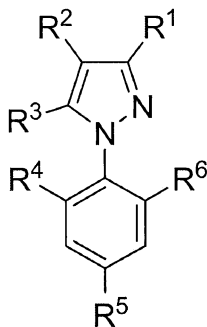
EP0822746 bộc lộ phương pháp xử lý cây trồng để gây đáp ứng điều hòa sinh trưởng bằng cách sử dụng lượng không có tính độc thực vật của hợp chất *N*-aryl pyrazol cho cây trồng này.

Đã phát hiện được rằng chế phẩm chứa một hoặc nhiều hợp chất *N*-aryl pyrazol và phân bón trên cơ sở nitơ có hiệu quả trừ sâu được cải thiện đáng kể và năng suất cây trồng được gia tăng. Phân bón có thể có tác dụng làm “chất bảo vệ”, nghĩa là làm giảm đến mức tối thiểu đáp ứng có hại của cây trồng với thuốc trừ sâu *N*-aryl pyrazol. Do đó, chế phẩm này làm giảm hoặc loại trừ đáng kể tác dụng phụ hoặc mức độ hư hại cây trồng do việc sử dụng lượng hữu hiệu có tác dụng trừ sâu của các thuốc trừ sâu *N*-aryl pyrazol gây ra. Nói theo cách khác, phân bón làm gia tăng sức chịu đựng của cây trồng với thuốc trừ sâu *N*-aryl pyrazol. Ngoài ra, đã phát hiện được rằng việc sử dụng thuốc trừ sâu *N*-aryl pyrazol và phân bón trên cơ sở nitơ để xử lý kết hợp cho cây trồng có hiệu quả phòng trừ sâu được cải thiện đáng kể và làm tăng năng suất cây trồng đáng kể.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Do đó, theo khía cạnh thứ nhất, sáng chế đề xuất chế phẩm thuốc trừ sâu chứa:

- a) lượng hữu hiệu có tác dụng trừ sâu của một hoặc nhiều hợp chất có công thức chung (I):



(I)

trong đó:

R^1 là alkyl, halogen, hoặc CN;

R^2 là 4,5-dixyanoimidazol 2-yl, haloalkyl, hoặc $S(O)_m R^7$;

R^3 là hydro, halogen, $NR^8 R^9$, $S(O)_n R^{10}$, $C(O) R^{11}$, alkyl, haloalkyl, OR^{12} , hoặc $N=CR^{13} R^{14}$;

mỗi nhóm R^4 và R^6 độc lập là hydro, halogen, haloalkyl, CN, hoặc NO_2 ;

R^5 là hydro, halogen, haloalkyl, haloalkoxy, hoặc $S(O)_p R^{15}$;

mỗi nhóm R^7 , R^{10} , R^{12} và R^{15} độc lập là alkyl hoặc haloalkyl;

mỗi nhóm R^8 và R^9 độc lập là hydro, alkyl, alkenyl, haloalkyl, alkoxyacetyl, hoặc $S(O)_q CF_3$;

mỗi nhóm R^{11} và R^{14} độc lập là hydro hoặc alkyl;

R^{13} là nhóm phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc thành phần được chọn từ OH, alkyl, alkoxy, và xiano; và

m, n, p, và q độc lập là 0, 1, hoặc 2;

và

- b) ít nhất một phân bón trên cơ sở nitơ.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ cây trồng chống lại sâu bọ để làm tăng năng suất, phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) như được xác định trên đây và phân bón trên cơ sở nitơ cho cây trồng hoặc bộ phận của nó hoặc xung quanh cây này.

Theo một khía cạnh khác nữa, sáng chế đề xuất phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) như được mô tả trên đây ở vị trí của cây

trồng, phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có công thức chung (I) như đã xác định trên đây cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.

Theo một khía cạnh khác nữa, sáng chế đề xuất phân bón trên cơ sở nitơ để làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) như đã xác định trên đây.

Mô tả chi tiết sáng chế

Sáng chế sử dụng phân bón trên cơ sở nitơ để làm tăng hiệu quả trừ sâu của thành phần hoạt tính là hợp chất *N*-aryl pyrazol. Nitơ là thành phần chủ yếu trong phân bón và đã được mô tả chi tiết trong Sổ tay hóa chất nông nghiệp: the Farm Chemicals Handbook, 1992 Ed. trang B23. Các phân bón trên cơ sở nitơ có bán trị thường bao gồm các muối amoni (ví dụ, phosphat, sulfat, clorua), nitrat, amoniac khan, ure, dung dịch nitơ (kể cả dung dịch ure amoni nitrat), và hỗn hợp của chúng. Các phân bón này có thể được tạo ra bằng các phương pháp đã biết trong lĩnh vực này.

Các hỗn hợp của thuốc trừ sâu và phân bón đã biết trong lĩnh vực này ở dạng hạt, viên nén, dạng que và phiến mỏng. Tuy nhiên, tính năng của các sản phẩm này là không thỏa đáng, cụ thể là đối với việc sử dụng trong nông nghiệp trên quy mô lớn. Ví dụ, patent Mỹ số US 5783203 mô tả hỗn hợp chứa các phân bón và chất chủ vận hoặc chất đối kháng của thụ thể nicotin axetylcholin của các côn trùng. Hỗn hợp này ở dạng que nên thích hợp cho việc bảo vệ cây cảnh trồng trong nhà. Tuy nhiên, hỗn hợp này không thích hợp để sử dụng trong nông nghiệp.

Các chế phẩm phân bón có tác dụng trừ sâu dùng để phun đã được mô tả trong Công bố đơn yêu cầu cấp patent Mỹ số US 2006/0166939. Tuy nhiên, sự có mặt của các muối của axit mạnh gây hư hại cho cây trồng khi chế phẩm này được sử dụng.

Đã phát hiện được rằng việc sử dụng chế phẩm theo sáng chế làm giảm đáng kể sự tác động đến môi trường và giảm bớt công việc cho người nông dân. Quan trọng hơn, chế phẩm theo sáng chế có hiệu quả trừ sâu tăng lên đáng kể so với các chế phẩm chứa *N*-aryl pyrazol đã biết, điều này lại làm tăng đáng kể năng suất cây trồng. Cụ thể, đã phát hiện được rằng sự có mặt của phân bón trên cơ sở nitơ làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có hoạt tính có công thức chung (I), dẫn đến mức độ hư hại của cây trồng đích giảm đi và năng suất tăng lên.

Chế phẩm theo sáng chế chứa một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I), như đã nêu trên đây. Trong các hợp chất có công thức chung (I),

các gốc alkyl, haloalkyl và haloalkoxy có thể chứa số lượng nguyên tử cacbon thích hợp bất kỳ, trong đó tốt hơn nếu các gốc này có từ 1 đến 12 nguyên tử cacbon, tốt hơn nữa là từ 1 đến 8 nguyên tử cacbon, đặc biệt tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm được ưu tiên là methyl, halomethyl, halometoxy, etyl, haloetyl, haloetoxy, propyl, halopropyl và halopropyl.

Tương tự, các gốc alkenyl có mặt trong hợp chất có công thức chung (I) có thể chứa số lượng nguyên tử cacbon thích hợp bất kỳ, trong đó tốt hơn nếu các gốc này có từ 1 đến 12 nguyên tử cacbon, tốt hơn nữa là từ 1 đến 8 nguyên tử cacbon, đặc biệt tốt hơn là từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon. Các nhóm được ưu tiên là nhóm etenyl và nhóm propenyl.

Các nhóm alkyl, alkenyl, haloalkyl và haloalkoxy có mặt trong hợp chất có công thức chung (I) có thể là nhóm có mạch thẳng hoặc mạch nhánh.

Các nhóm chứa halogen có mặt trong hợp chất có công thức chung (I) có thể chứa một hoặc nhiều nguyên tử halogen thích hợp, trong đó các gốc flo hoặc clo là được ưu tiên.

Trong các hợp chất có công thức chung (I), tốt hơn nếu R^1 được chọn từ methyl, halogen, cụ thể là gốc flo hoặc clo, hoặc CN. Các hợp chất có công thức chung (I) được ưu tiên là các hợp chất trong đó R^1 là CN.

Ngoài ra, trong các hợp chất có công thức chung (I), tốt hơn nếu R^2 được chọn từ 4,5-dixyanoimidazol-2-yl, gốc halomethyl, cụ thể là methyl được thế bằng một hoặc nhiều gốc flo hoặc clo, hoặc nhóm có công thức chung $S(O)_mR^7$. Trong các nhóm có công thức $S(O)_mR^7$, m có thể là số nguyên nằm trong khoảng từ 0 đến 2, trong đó các nhóm có m bằng 1 là được ưu tiên. R^7 có thể là nhóm alkyl hoặc haloalkyl, trong đó nhóm haloalkyl được ưu tiên, cụ thể là các nhóm haloalkyl chứa một hoặc nhiều nguyên tử flo. Các hợp chất có công thức chung (I) được ưu tiên đặc biệt là các hợp chất trong đó R^7 là methyl mang một hoặc nhiều nhóm thế flo, đặc biệt là CF_3 .

R^3 có mặt trong các hợp chất có công thức chung (I) là nhóm được chọn từ hydro, halogen, NR^8R^9 , $S(O)_nR^{10}$, $C(O)R^{11}$, alkyl, haloalkyl, OR^{12} , hoặc $N=CR^{13}R^{14}$. Nếu có mặt dưới dạng halogen, tốt hơn nếu R^3 là clo hoặc flo. Trong các hợp chất trong đó R^3 là nhóm có công thức $S(O)_nR^{10}$, tốt hơn nếu n bằng 1 và tốt hơn nếu R^{10} là nhóm methyl hoặc nhóm methyl mang một hoặc nhiều halogen, tốt hơn nếu là flo hoặc clo. Trong các hợp chất trong đó R^3 là nhóm có công thức $C(O)R^{11}$, tốt hơn nếu R^{11} là

hydro hoặc metyl. Theo cách khác, R^3 có thể là nhóm alkyl, tùy ý mang một hoặc nhiều nhóm thế halogen, trong đó các nhóm được ưu tiên là nhóm metyl hoặc nhóm metyl mang một hoặc nhiều halogen, tốt hơn nếu là flo hoặc clo. Trong các hợp chất có công thức chung (I) trong đó R^3 là nhóm có công thức OR^{12} , R^{12} là nhóm alkyl, tùy ý mang một hoặc nhiều nhóm thế halogen, với các nhóm được ưu tiên là nhóm metyl hoặc nhóm metyl mang một hoặc nhiều halogen, tốt hơn nếu là flo hoặc clo. Theo cách khác, R^3 có thể là nhóm có công thức $N=CR^{13}R^{14}$, trong đó R^{13} là gốc phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều halogen, tốt hơn nếu là clo hoặc flo, OH, alkyl, tốt hơn nếu là metyl, alkoxy, tốt hơn nếu là metoxy, và xyano.

Các hợp chất có công thức chung (I) được đặc biệt ưu tiên là các hợp chất trong đó R^3 là nhóm có công thức NR^8R^9 . Trong các nhóm này, R^8 và R^9 có thể độc lập được chọn từ hydro, alkyl, tốt hơn nếu là metyl, alkenyl, tốt hơn nếu là etenyl hoặc propenyl, tùy ý có một hoặc nhiều mạch nhánh metyl, haloalkyl, tốt hơn nếu là nhóm metyl mang một hoặc nhiều nguyên tử flo hoặc clo, alkoxycarbonyl, tốt hơn nếu là metoxy carbonyl, hoặc $S(O)_qCF_3$, tốt hơn nếu trong đó q bằng 1. Đặc biệt được ưu tiên nếu R^3 là nhóm có công thức NR^8R^9 , trong đó cả nhóm R^8 và R^9 đều là hydro ($-NH_2$). Theo phương án khác, R^3 là nhóm có công thức NR^8R^9 , trong đó R^8 là hydro và R^9 là nhóm alkenyl, cụ thể là propenyl mang mạch nhánh metyl.

Trong các hợp chất có công thức chung (I), R^4 và R^6 có thể là hydro, halogen, haloalkyl, tốt hơn nếu là nhóm metyl mang một hoặc nhiều nguyên tử flo hoặc clo, CN, hoặc NO_2 . Các hợp chất được đặc biệt ưu tiên để đưa vào chế phẩm theo sáng chế là các hợp chất trong đó cả R^4 và R^6 đều là halogen, cụ thể là cùng là halogen, tốt hơn nếu là clo.

R^5 trong các hợp chất có công thức chung (I) có thể được chọn từ hydro, halogen, tốt hơn nếu là clo hoặc flo, haloalkyl, tốt hơn nếu là nhóm metyl mang một hoặc nhiều nguyên tử flo hoặc clo, haloalkoxy, tốt hơn nếu là nhóm metoxy mang một hoặc nhiều nguyên tử flo hoặc clo, hoặc $S(O)_pR^{15}$. Tốt hơn, nếu khi R^5 là nhóm có công thức $S(O)_pR^{15}$, p bằng 1 và R^{15} là nhóm metyl hoặc nhóm metyl mang một hoặc nhiều nguyên tử flo hoặc clo. Đặc biệt được ưu tiên nếu R^5 là nhóm metyl mang ba nhóm thế halogen, cụ thể là CF_3 .

Ví dụ về các hợp chất có công thức chung (I) được ưu tiên để đưa vào chế phẩm theo sáng chế bao gồm các hợp chất sau:

5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-[(triflometyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (fipronil);

1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-5-(2-metylalylamino)-4-[(triflometyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (flufiprol);

5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-[(etyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (ethiprol);

1-[5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-(metylsulfinyl)pyrazol-3-yl]etanon (axetoprol);

(RS)-[O-1-(4-clophenyl)pyrazol-4-yl O-etyl S-propyl phosphorothioat] (pyraclofos);

1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-(flometylthio)-5-[(pyrazinylmetyl)amino]pyrazol-3-cacbonitril (pyrafluprol);

1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-(diflometylthio)-5-[(2-pyridylmetyl)amino]pyrazol-3-cacbonitril (pyriprol);

3-metyl-1-phenylpyrazol-5-yl dimetylcarbamat (pyrolan); và

(E)-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-5-(4-hydroxy-3-metoxymetylidenamino)-4-triflometylthiopyrazol-3-cacbonitril (vaniliprol).

Đã phát hiện được rằng chế phẩm theo sáng chế là cách đặc biệt hữu hiệu để tạo ra hợp chất 5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-[(triflometyl) sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril, có tên thường gọi là fipronil.

Hợp chất có công thức chung (I) có thể có mặt trong chế phẩm theo sáng chế với lượng trong khoảng lượng rộng, tùy thuộc vào các yếu tố như cách sử dụng và mục đích cuối của chế phẩm này khi xử lý ở vị trí. Tốt hơn, nếu hợp chất có công thức chung (I) có mặt trong chế phẩm này với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 80% trọng lượng, tốt hơn nữa là từ 1 đến 50% trọng lượng.

Chế phẩm theo sáng chế còn chứa một hoặc nhiều phân bón trên cơ sở nito. Thuật ngữ “phân bón trên cơ sở nito” dùng để chỉ chất dinh dưỡng chủ yếu chứa nito cần thiết cho tất cả các cây trồng với lượng đáng kể cho sự sinh trưởng của cây này. Phân bón trên cơ sở nito thích hợp bất kỳ có thể được đưa vào chế phẩm này. Tốt hơn, nếu phân bón trên cơ sở nito được chọn từ các muối amoni như amoni sulphat, các muối nitrat, phosphat, amoniac khan, dung dịch amoniac, phân bón chứa nito lỏng, ure, sản phẩm ngưng tụ ure-formaldehyt, ure amoni nitrat, các axit amin, và các muối

nitrat kim loại như natri nitrat, kali nitrat, canxi nitrat, và magie nitrat. Tùy ý, các muối của chất dinh dưỡng vi lượng (tốt hơn nếu là mangan, magie, sắt, bo, đồng, kẽm, molybden, và/hoặc coban) và các hormon thực vật (ví dụ, vitamin B1 hoặc axit indol-3-axetic) có thể được thêm vào.

Phân bón trên cơ sở nitơ có thể có mặt trong chế phẩm theo sáng chế với lượng thích hợp bất kỳ, và thường có mặt với lượng nằm trong khoảng 0,5 đến 50% trọng lượng, tốt hơn nữa là từ 2 đến 40% trọng lượng, đặc biệt tốt hơn là từ 5 đến 20% trọng lượng.

Hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thể có mặt trong chế phẩm theo sáng chế hoặc được sử dụng với tỷ lệ tương ứng của hai thành phần này bất kỳ. Cụ thể, tốt hơn nếu tỷ lệ trọng lượng của hai thành phần trong chế phẩm độc lập nằm trong khoảng từ 100:1 đến 1:100, tốt hơn là từ 1:20 đến 20:1.

Hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thể được sử dụng trong một chế phẩm hoặc trong các chế phẩm riêng biệt. Trong trường hợp được sử dụng ở dạng các chế phẩm riêng biệt, hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thể được sử dụng lần lượt, riêng rẽ hoặc đồng thời.

Chế phẩm theo sáng chế có thể tùy ý chứa một hoặc nhiều chất phụ trợ. Các chất phụ trợ được sử dụng trong chế phẩm này và lượng của chúng sẽ tùy thuộc vào loại chế phẩm và/hoặc cách mà trong đó chế phẩm này cần được sử dụng bởi người dùng cuối. Các chất phụ trợ thích hợp là tất cả các thành phần hoặc chất phụ trợ công nghệ thông thường như các dung môi, chất hoạt động bề mặt, chất ổn định, chất chống tạo bọt, chất chống đông, chất bảo quản, chất chống oxy hóa, chất tạo màu, chất làm đặc và chất độn trơ. Các chất phụ trợ này là đã biết trong lĩnh vực và có sẵn trên thị trường. Việc sử dụng chúng trong việc tạo ra chế phẩm theo sáng chế sẽ trở nên rõ ràng với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này.

Chế phẩm theo sáng chế có thể chứa một hoặc nhiều dung môi. Dung môi có thể là dung môi hữu cơ hoặc vô cơ. Các dung môi thích hợp được chọn từ tất cả các dung môi thông thường mà chúng hòa tan hoàn toàn các chất có hoạt tính hóa nông được sử dụng. Chúng đã được biết trong lĩnh vực này và có sẵn trên thị trường. Các ví dụ bao gồm nước; các dung môi thơm như xylen (ví dụ, các sản phẩm dung môi có bán trên thị trường từ Solvesso™); các dầu khoáng; mỡ động vật; dầu thực vật; rượu,

ví dụ, metanol, butanol, pentanol, và rượu benzylic; các keton, ví dụ, xyclohexanon, và gama-butyrolacton; các hợp chất pyrolidon như NMP, và NOP; các hợp chất axetat như glycol diaxetat; glycol; dimetylamin của axit béo; các axit béo; và este của axit béo

Chế phẩm theo sáng chế còn tùy ý chứa một hoặc nhiều chất hoạt động bề mặt. Các chất hoạt động bề mặt thích hợp bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, muối kim loại kiềm, muối kim loại kiềm thổ và muối amoni của axit lignosulfonic, axit naphtalensulfonic, axit phenolsulfonic, axit dibutylnaphtalensulfonic, alkylarylsulfonat, alkyl sulfat, alkylsulfonat, arylsulfonat, hợp chất sulfat của rượu béo, axit béo và ete glycol của rượu béo sulfat hóa, ngoài ra các sản phẩm ngưng tụ của naphtalen sulfonat hóa và các dẫn xuất naphtalen với formaldehyt, các sản phẩm ngưng tụ của naphtalen hoặc của axit naphtalensulfonic với phenol, octylphenol, nonylphenol, các ete alkylphenyl polyglycol, ete tributylphenyl polyglycol, ete tristearylphenyl polyglycol, các rượu alkylaryl polyete, các sản phẩm ngưng tụ rượu và rượu béo/etylen oxit, dầu thầu dầu etoxy hóa, ete polyoxyetylen alkyl, polyoxypropylen etoxy hóa, rượu laurylic polyglycol ete axetal, sorbitol este, nước thải lignin-sulfit và metylxenluloza và các copolyme khối etylen oxit/propylen oxit.

Chế phẩm theo sáng chế còn tùy ý chứa một hoặc nhiều chất ổn định polyme. Các chất ổn định polyme có thể được sử dụng trong sáng chế bao gồm, nhưng không chỉ giới hạn ở, polypropylen, polyisobutylen, polyisopren, các copolyme của monoolefin và diolefin, polyacrylat, polystyren, polyvinyl axetat, polyuretan hoặc polyamit. Các chất ổn định thích hợp là đã biết trong lĩnh vực này và có sẵn trên thị trường.

Chế phẩm theo sáng chế có thể chứa chất chống tạo bọt. Các chất chống tạo bọt thích hợp bao gồm các chất mà có thể thường được sử dụng cho mục đích này trong các chế phẩm hóa nông và sẽ trở nên rõ ràng với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này. Các chất chống tạo bọt là đã biết trong lĩnh vực này và có sẵn trên thị trường. Các chất chống tạo bọt được đặc biệt ưu tiên là các hỗn hợp của polydimetylsiloxan và axit perfluoroalkylphosphonic như chất chống tạo bọt là silicon (ví dụ, có bán trên thị trường từ Công ty GE hoặc Compton).

Một hoặc nhiều chất bảo quản cũng có thể có mặt trong chế phẩm theo sáng chế. Các chất bảo quản thích hợp bao gồm các chất mà có thể thường được sử dụng cho mục đích này trong các chế phẩm hóa nông của loại chất này và chúng đã được

biết rõ trong lĩnh vực này. Các ví dụ thích hợp về chất này có thể được đề cập bao gồm Preventol® (có bán trên thị trường từ Công ty Bayer AG) và Proxel® (có bán trên thị trường từ Công ty Bayer AG).

Ngoài ra, chế phẩm theo sáng chế có thể chứa một hoặc nhiều chất chống oxy hóa. Các chất chống oxy hóa thích hợp bao gồm tất cả các chất mà có thể thường được sử dụng cho mục đích này trong các chế phẩm hóa nông, như đã biết trong lĩnh vực này. Chất chống oxy hóa được ưu tiên là, ví dụ, hydroxytoluen butylat hóa.

Các chế phẩm theo sáng chế còn có thể chứa một hoặc nhiều chất kết dính dạng rắn. Các chất này là đã biết trong lĩnh vực này và có sẵn trên thị trường. Chúng bao gồm các chất kết dính hữu cơ, kể cả chất tăng dính, như xenluloza của xenluloza được thể, các polyme tự nhiên và tổng hợp ở dạng bột, hạt, hoặc mạng tinh thể, và các chất kết dính vô cơ như thạch cao, silic oxit, hoặc xi măng.

Các chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa một hoặc nhiều chất độn trơ. Các chất độn trơ này là đã biết trong lĩnh vực và có sẵn trên thị trường. Chúng bao gồm, ví dụ, các khoáng vật tự nhiên đã nghiền như kaolin, alumina, bột talc, đá phấn, thạch anh, atapulgit, montmorillonit, và đất tảo silic, hoặc các khoáng vật tổng hợp đã nghiền như axit silixic được phân tán ở mức cao, nhôm oxit, silicat, và canxi phosphat và canxi hydro phosphat. Các chất độn trơ thích hợp cho chế phẩm dạng hạt bao gồm, các khoáng vật tự nhiên đã nghiền và tách chiết như canxit, đá hoa, đá bột, sepiolit, và dolomit, hoặc các hạt vật liệu vô cơ và hữu cơ tổng hợp đã nghiền, cũng như các hạt vật liệu hữu cơ như mật cưa, vỏ dừa, lõi ngô, và thân cây thuốc lá.

Các chế phẩm theo sáng chế có thể còn chứa một hoặc nhiều chất làm đặc. Các chất làm đặc thích hợp bao gồm các chất mà có thể thường được sử dụng cho mục đích này trong các chế phẩm hóa nông. Ví dụ về các chất làm đặc thích hợp bao gồm các chất như xanthan, PVOH, xenluloza và các dẫn xuất của nó, đất sét silicat hydrat hóa, magie nhôm silicat hoặc hỗn hợp của chúng. Hơn nữa, các chất làm đặc này là đã biết trong lĩnh vực và có sẵn trên thị trường.

Hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ, và tùy ý các thuốc diệt sinh vật gây hại cây trồng khác bất kỳ, có thể được sử dụng và được sử dụng ở dạng tinh khiết, làm thành phần có hoạt tính dạng rắn, ví dụ, với cỡ hạt cụ thể, hoặc tốt hơn là cùng với ít nhất một thành phần phụ trợ hoặc độn dưới dạng chất thông thường trong công nghệ điều chế, như được mô tả chi tiết trên

đây.

Chế phẩm thuốc trừ sâu có thể ở dạng thích hợp bất kỳ đã mô tả trên đây. Tốt hơn, nếu chế phẩm này là chế phẩm dạng hạt, dịch cô huyền phù, chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước, chế phẩm dạng hạt tan trong nước, chế phẩm dạng bột phân tán được trong nước, chế phẩm dạng bột tan trong nước, hoặc chế phẩm dạng huyền phù chảy được.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng cho cây trồng đích hoặc cây trồng quan tâm, sử dụng cho một hoặc nhiều bộ phận của nó (như lá hoặc hạt), hoặc xung quanh cây này.

Theo một phương án, hỗn hợp của hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được sử dụng kết hợp thành một chế phẩm như được mô tả dưới đây.

Ví dụ về các dạng trình bày của các phương án về chế phẩm trộn sẵn theo sáng chế là như sau:

A) Dịch cô tan trong nước (SL)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được hòa tan trong dung môi tan trong nước. Một hoặc nhiều chất thấm ướt và/hoặc các chất phụ trợ khác có thể được đưa vào. Hợp chất có hoạt tính hòa tan khi pha loãng bằng nước.

B) Dịch cô nhũ hóa được (EC)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được hòa tan trong dung môi đồng thời bổ sung thêm một hoặc nhiều chất nhũ hóa anion và không anion. Hỗn hợp này được trộn, ví dụ bằng cách khuấy để thu được hỗn hợp đồng nhất. Pha loãng bằng nước để tạo ra nhũ tương ổn định.

C) Nhũ tương (EW)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được hòa tan trong một hoặc nhiều dung môi thích hợp đồng thời bổ sung thêm một hoặc nhiều chất nhũ hóa anion và không anion. Hỗn hợp tạo thành được cho vào nước bằng phương tiện thích hợp như máy nhũ hóa để tạo ra nhũ tương đồng nhất. Pha loãng bằng nước để thu được nhũ tương ổn định.

D) Huyền phù (SC, OD, FS)

Trong máy nghiền bi có khuấy, một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được nghiền, đồng thời bổ sung thêm một hoặc nhiều chất phân tán và chất thấm ướt, và nước hoặc dung môi để tạo ra huyền phù chứa hợp chất có hoạt tính dạng mịn. Pha loãng bằng nước để thu được nhũ tương của hợp chất có hoạt tính.

E) Hạt phân tán được trong nước và hạt tan trong nước (WG, SG)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được nghiền mịn, đồng thời bổ sung thêm một hoặc nhiều chất phân tán và chất thấm ướt và được điều chế dưới dạng hạt phân tán được trong nước hoặc dạng hạt tan trong nước bằng kỹ thuật thích hợp, ví dụ bằng cách ép đùn, sấy trong tháp phun, hoặc bằng cách xử lý trong tầng sôi. Pha loãng bằng nước để thu được hệ phân tán hoặc dung dịch ổn định chứa hợp chất có hoạt tính.

F) Bột phân tán được trong nước và bột tan trong nước (WP, SP)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được nghiền trong thiết bị thích hợp như thiết bị nghiền kiểu roto-stato, đồng thời bổ sung thêm một hoặc nhiều chất phân tán, chất thấm ướt và silicagel. Pha loãng bằng nước để thu được hệ phân tán hoặc dung dịch ổn định chứa hợp chất có hoạt tính.

G) Hạt (GR, FG, GG, MG)

Một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được nghiền mịn trong thiết bị thích hợp, đồng thời bổ sung thêm các chất mang với lượng tối đa là 99,5 phần trọng lượng. Sau đó, các hạt được tạo ra hoặc bằng các kỹ thuật thích hợp như ép đùn, sấy phun hoặc bằng cách sử dụng tầng sôi.

Theo khía cạnh khác, sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ cây trồng chống lại sâu bọ để làm tăng năng suất, phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) như được xác định trên đây và phân bón trên cơ sở nitơ cho cây trồng hoặc bộ phận của nó hoặc xung quanh cây này.

Chế phẩm theo sáng chế cho phép cây trồng cần được xử lý ngăn ngừa hoặc loại trừ sự phá hoại của sâu bọ và thúc đẩy sự sinh trưởng của cây trồng này.

Cụ thể, chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng để làm tăng năng suất cây

trồng. Các cây trồng thích hợp bao gồm, cụ thể là các cây ngũ cốc như cây lúa mì, cây lúa mạch, cây lúa mạch đen, cây yến mạch, cây lúa, cây ngô, cây lúa miến, cây kê và cây sắn; các cây củ cải như cây củ cải đường và cây củ cải bò; các cây ăn quả như quả có nhiều hạt, quả cứng và quả mềm, chẳng hạn như quả táo, quả lê, quả mận, quả đào, quả hạnh, quả anh đào, hoặc các quả mềm như quả dâu tây, quả mâm xôi; các cây họ đậu như cây đậu, cây đậu lăng, cây đậu Hà Lan và cây đậu tương; các cây có dầu như cây cải dầu, cây cải, cây thuốc phiện, cây oliu, cây hướng dương, cây dừa, cây thầu dầu, hạt cacao và hạt lạc; các cây họ bầu bí (*cucurbitaceae*) như cây bí, cây dưa chuột và cây dưa hấu; các cây có sợi như cây bông, cây lanh, cây gai dầu và cây đay; các cây họ cam quýt như cây cam, cây chanh, cây bưởi và cây quýt; các cây rau như cây rau bina, cây rau diếp, cây măng tây, cây cải bắp, cây cà rốt, cây hành, cây cà chua, cây khoai tây và cây ớt tây; các cây thuộc họ long não (*lauraceae*) như cây lê tàu, cây quế và cây long não; và cây thuốc lá, quả hạch, cây cà phê, cây cà tím, cây mía, cây chè, cây hồ tiêu, cây nho, cây huplông, cây chuối, cây cao su tự nhiên, cây bạch đàn cũng như các cây cảnh. Các khu vực được đặc biệt ưu tiên sử dụng là các cây trồng bao gồm cây lạc, hạt cacao, cây mía, cây dừa, cây lúa, cây bông, cây kê, cây ngô, cây sắn, cây lúa miến và cây bạch đàn.

Nói chung, chế phẩm theo sáng chế có thể được điều chế và sử dụng sao cho thành phần có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) được sử dụng với tỷ lệ thích hợp bất kỳ, theo yêu cầu của vị trí cần được xử lý. Cụ thể, chế phẩm này có thể được điều chế sao cho hợp chất có công thức chung (I) được sử dụng với tỷ lệ nằm trong khoảng từ 10g đến 1000g/hecta, tốt hơn là từ 10g đến 500g, tốt hơn nữa là từ 10g đến 200g/hecta.

Hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và các phân bón trên cơ sở nitơ có thể được sử dụng ở dạng thích hợp bất kỳ, và được sử dụng ở vị trí cần phòng trừ một cách đồng thời hoặc liên tục trong các khoảng thời gian ngắn, ví dụ, vào cùng một ngày. Theo một phương án được ưu tiên, hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và các phân bón trên cơ sở nitơ được sử dụng đồng thời, cụ thể là theo cách sử dụng chế phẩm theo sáng chế. Hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và các phân bón trên cơ sở nitơ có thể sử dụng cho cây trồng hoặc vị trí theo thứ tự bất kỳ. Mỗi hợp chất có thể được sử dụng chỉ một lần hoặc nhiều lần. Tốt hơn, nếu mỗi hợp chất được sử dụng nhiều lần, cụ thể là từ 2 đến 5 lần, tốt hơn nữa là 3 lần.

Hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và các phân bón trên cơ sở nitơ có thể được sử dụng với tỷ lệ tương ứng của hai thành phần này bất kỳ. Cụ thể, lượng tương đối của các hợp chất cần được sử dụng cho cây trồng hoặc vị trí là như được mô tả trên đây, tốt hơn là với tỷ lệ của hợp chất có công thức chung (I) với các phân bón nằm trong khoảng từ 1:100 đến 100:1.

Trong trường hợp hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và các phân bón trên cơ sở nitơ được sử dụng đồng thời, chúng có thể thu được từ các nguồn điều chế riêng biệt và được trộn lẫn với nhau (được gọi là hỗn hợp trộn trong thùng, hỗn hợp trộn sẵn, hỗn hợp phun, hoặc huyền phù đặc), tùy ý với các thuốc diệt sinh vật gây hại cây trồng khác, hoặc chúng có thể thu được dưới dạng một nguồn hỗn hợp điều chế (được gọi là hỗn hợp trộn sẵn, dịch cô, hợp chất (hoặc sản phẩm) điều chế được), và tùy ý được trộn lẫn với các thuốc diệt sinh vật gây hại cây trồng khác.

Theo một khía cạnh khác, sáng chế mô tả việc sử dụng hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) như đã xác định trên đây và phân bón trên cơ sở nitơ để xử lý ở vị trí của cây trồng. Như đã nêu, việc sử dụng có thể là sử dụng hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ theo cách riêng biệt hoặc kết hợp trong một chế phẩm.

Như đã nêu trên đây, việc sử dụng một hoặc nhiều hợp chất có hoạt tính trừ sâu có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ như đã mô tả trên đây có thể cải thiện năng suất của cây trồng đích được xử lý. Thuật ngữ "năng suất" như được sử dụng ở đây dùng để chỉ sản phẩm của cây trồng bất kỳ có giá trị kinh tế được tạo ra bởi cây trồng này như hạt ngũ cốc, quả, rau, hạt, hạt giống, gỗ hoặc hoa. Các sản phẩm của cây trồng có thể còn được sử dụng và/hoặc chế biến sau khi thu hoạch. Việc cải thiện "năng suất" có thể được xác định bằng cách so sánh các đặc tính sau đây của cây trồng với cây trồng sinh trưởng trong cùng điều kiện mà không sử dụng phân bón trừ sâu theo sáng chế:

- trọng lượng và/hoặc chiều cao của cây trồng tăng lên,
- sinh khối như trọng lượng khi tươi và/hoặc trọng lượng khi khô cao hơn
- các chồi nhiều hơn và/hoặc khỏe hơn
- lá to hơn và/hoặc xanh hơn
- lá gốc ít rụng hơn
- sự sinh trưởng của chồi tăng lên

- sự nảy mầm sớm hơn
- sự ra hoa sớm hơn
- sự chín hạt sớm hơn
- năng suất ngũ cốc cao hơn
- nhiều quả hơn và năng suất (trọng lượng) quả cao hơn
- hàm lượng protein tăng lên
- hàm lượng dầu tăng lên
- hàm lượng tinh bột tăng lên
- hàm lượng sắc tố tăng lên.

Theo một khía cạnh khác nữa, sáng chế đề xuất phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) như đã mô tả trên đây ở vị trí của cây trồng, phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có công thức chung (I) như đã xác định trên đây với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.

Theo một khía cạnh khác nữa, sáng chế đề xuất phân bón trên cơ sở nitơ để làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) như đã xác định trên đây.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn cùng với các ví dụ sau đây, các ví dụ này chỉ nhằm mục đích minh họa.

Ví dụ 1- chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước (SL)

Điều chế chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thành phần được nêu trong bảng sau đây:

Pyriprol	25g
Amoni sulphat	5g
TWEEN 80 (Sorbitan monooleat etoxylat)	10g
N-metyl pyrrolidon	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 2 - Chế phẩm dạng dịch cô nhũ hóa được (EC)

Điều chế chế phẩm dạng dịch cô nhũ hóa được chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thành phần được nêu trong bảng sau đây:

Fipronil	50g
----------	-----

Ure	2,5g
TWEEN 80 (Sorbitan monooleat etoxylat)	10g
Canxi dodecylphenylsulfonat (70B)	4g
Solvesso 200	10g
N-metyl pyrrolidon	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 3 – Chế phẩm dạng bột phân tán được trong nước (WP)

Điều chế chế phẩm dạng bột phân tán được trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thành phần được nêu trong bảng sau đây:

Flufiprol	80g
Kali nitrat	0,8g
Dispersogen 1494 (muối natri của sản phẩm ngưng tụ cresol-formaldehyt)	5g
Kaolin	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 4 – Chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước (WG)

Điều chế chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có thành phần được nêu trong bảng sau đây:

Fipronil	60g
Magie nitrat	3g
Rượu polyvinyllic	2g
Dispersogen 1494 (muối natri của sản phẩm ngưng tụ cresol-formaldehyt)	5g
Kaolin	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 5 - Chế phẩm dạng huyền phù

Điều chế chế phẩm dạng huyền phù chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ. Thành phần của chế phẩm này được tóm tắt trong bảng sau đây:

Fipronil	2g
Amoniac khan	2g
Dispersogen 4387 (este polyme anion)	5g

Propylen glycol	5g
Gôm xanthan	2g
Nước	lượng còn lại cho đủ 100 g

Ví dụ 6 - Chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước (SL)

Điều chế chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nito. Thành phần của chế phẩm này được tóm tắt trong bảng sau:

Ethiprol	0,5g
Ure amoni nitrat	50g
TWEEN 80 (Sorbitan monooleat etoxylat)	10g
N-metyl pyrrolidon	5g
Nước	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 7 –Chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước (WG)

Điều chế chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nito, thành phần của chế phẩm này được nêu trong bảng sau đây:

Fipronil	1g
Canxi nitrat	20g
Rượu polyvinyllic	2g
Dispersogen 1494 (muối natri của sản phẩm ngưng tụ cresol-formaldehyt)	5g
Kaolin	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 8 –Chế phẩm chảy được để xử lý hạt giống (FS)

Điều chế chế phẩm chảy được để xử lý hạt giống có thành phần được nêu trong bảng sau đây:

Fipronil	2g
Các axit amin	40g
Dispersogen 4387 (este polyme anion)	5g
Propylen glycol	5g
Gôm xanthan	2g
Polyvinyl pyrolidon	4g
Carmosin	12g
Nước	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 9- Chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước (SL)

Điều chế chế phẩm dạng dịch cô tan trong nước chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ. Thành phần của chế phẩm này được tóm tắt trong bảng sau:

Pyraclofos	25g
Dung dịch amoniac	0,5g
TWEEN 80 (Sorbitan monooleat etoxylat)	10g
N-metyl pyrolidon	lượng còn lại cho đủ 100g

Ví dụ 10 –Chế phẩm dạng hạt (GR) bả ăn được

Điều chế chế phẩm dạng hạt chứa hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ. Thành phần của chế phẩm này được tóm tắt trong bảng sau:

Vaniliprol	1g
Phân bón chứa nitơ lỏng	8g
Bột mì	80g
Rỉ đường	lượng còn lại cho đủ 100g

Thử nghiệm 1 – Thử nghiệm về năng suất cây đậu tương

Hạt đậu tương được gieo trong nhà kính. Cây đậu tương được xử lý bằng fipronil (Regent® từ công ty BASF) và các chế phẩm của mỗi ví dụ trong số các Ví dụ

từ 1 đến 10 đã nêu trên đây ở giai đoạn phát triển và khi bắt đầu ra hoa. Tỷ lệ sử dụng được đưa ra trong bảng sau. Khi chín, cây trồng được thu hoạch và sản lượng hạt được xác định theo tấn/hecta.

	Tỷ lệ sử dụng (g/hecta)* (công thức (I) + phân bón trên cơ sở nitơ)	Sản lượng hạt (tấn/hecta)
Không xử lý	0	1,97
Regent®	100	1,86
Ví dụ 1	100 + 20	2,75
Ví dụ 2	100 + 5	2,38
Ví dụ 3	100 + 1	2,18
Ví dụ 4	100 + 5	2,38
Ví dụ 5	100 + 100	2,91
Ví dụ 6	100 + 10000	3,09
Ví dụ 7	100 + 2000	3,09
Ví dụ 8	100 + 2000	3,09
Ví dụ 9	100 + 2	2,29
Ví dụ 10	100 + 800	2,95

* Tỷ lệ sử dụng (Fipronil + phân bón trên cơ sở nitơ) tính theo g/hecta

Các số liệu trên đây cho thấy việc đưa phân bón trên cơ sở nitơ vào chế phẩm xử lý cây đậu tương làm cải thiện đáng kể sản lượng hạt. So với các cây đối chứng không được xử lý, khi xử lý bằng chế phẩm chứa thành phần hoạt tính mà không có phân bón trên cơ sở nitơ, sản lượng hạt bị giảm đi do tính độc thực vật của fipronil. Việc đưa phân bón trên cơ sở nitơ vào chế phẩm xử lý cho cây trồng làm giảm tính độc thực vật của thành phần có hoạt tính. Ở nồng độ cao hơn, thành phần phân bón có hiệu quả làm giảm tính độc thực vật của fipronil và làm tăng sản lượng hạt.

Thử nghiệm 2 – Thử nghiệm về năng suất cây lúa

Hạt lúa được cho nảy mầm trong 48 giờ trong nước ở nhiệt độ 30°C và sau đó gieo hạt này trong chậu. Sau khi phát triển thành cây mạ, fipronil (Regent® từ BASF)

và các chế phẩm của mỗi Ví dụ từ 1 đến 10 đã nêu trên đây được sử dụng cho đất. Tỷ lệ sử dụng được đưa ra trong bảng sau. Các cây lúa được để chín đến khi thu hoạch, khi đó sản lượng hạt được tính theo tấn/hecta.

	Tỷ lệ sử dụng (g/hecta)*	Sản lượng hạt (tấn/hecta)
Không xử lý	0	5,73
Regent®	100	5,42
Ví dụ 1	100 + 20	6,35
Ví dụ 2	100 + 5	6,26
Ví dụ 3	100 + 1	6,01
Ví dụ 4	100 + 5	6,27
Ví dụ 5	100 + 100	6,41
Ví dụ 6	100 + 10000	6,76
Ví dụ 7	100 + 2000	6,74
Ví dụ 8	100 + 2000	6,74
Ví dụ 9	100 + 2	6,19
Ví dụ 10	100 + 800	6,50

* Tỷ lệ sử dụng (Fipronil + Phân bón trên cơ sở nitơ) tính theo g/hecta

Thử nghiệm 3 – Thử nghiệm về đặc tính trừ sâu đối với kiến lửa *Solenopsis invicta*

Các ô thử nghiệm có kích thước khoảng 5000 ft² (khoảng 465m²) và chứa trung bình 9 ổ kiến lửa/ô được bố trí và xử lý vào đầu mùa hè. Số lượng ổ kiến lửa còn sống trong mỗi ô thử nghiệm được đếm trước khi xử lý. Mỗi thử nghiệm được lặp lại ba lần. Fipronil (Regent® từ BASF) và các chế phẩm của mỗi Ví dụ từ 1 đến 10 đã nêu trên đây được sử dụng. Hiệu quả được đánh giá vào các ngày thứ 30, 60, và 90 ngày sau khi xử lý ("day after treatment: DAT") (cho đến đầu mùa thu) bằng cách đếm số lượng ổ kiến còn sống và tỷ lệ % số ổ kiến giảm đi so với số lượng trước khi xử lý. Các kết quả được thể hiện trong bảng sau.

	Tỷ lệ sử dụng (g/hecta)*	Tỷ lệ % số ổ kiến lửa giảm		
		30 DAT	60 DAT	90 DAT
Không xử lý	0	0	3	12
Regent®	100	10	21	35
Ví dụ 1	100 + 20	38	52	70
Ví dụ 2	100 + 5	22	31	49
Ví dụ 3	100 + 1	13	25	42
Ví dụ 4	100 + 5	22	31	49
Ví dụ 5	100 + 100	44	53	75
Ví dụ 6	100 + 10000	57	94	98
Ví dụ 7	100 + 2000	49	66	83
Ví dụ 8	100 + 2000	48	67	83
Ví dụ 9	100 + 2	17	28	44
Ví dụ 10	100 + 800	34	25	35

* Tỷ lệ sử dụng (Fipronil + Phân bón trên cơ sở nito) tính theo g/hecta

Thử nghiệm 4 – Thử nghiệm về đặc tính trừ sâu đối với tíc *Ixodes scapularis*

Các đĩa lá củ cải được để trong aga trong đĩa petri và được gây nhiễm bằng 20 ấu trùng (ấu trùng *Ixodes* giai đoạn 2). Bốn đĩa sao chép được dùng cho mỗi lần xử lý, được phun Fipronil (Regent® từ BASF) và các chế phẩm của mỗi Ví dụ từ 1 đến 10 đã nêu trên đây. Tỷ lệ ấu trùng chết được xác định trong 4 hoặc 5 ngày sau khi xử lý. Các kết quả được thể hiện trong bảng sau.

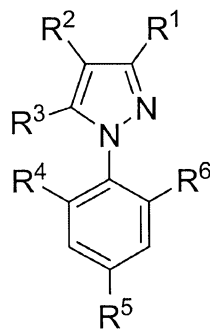
	Tỷ lệ sử dụng (g/hecta)*	Tỷ lệ % ấu trùng chết
Không xử lý	0	0
Regent®	100	50
Ví dụ 1	100 + 20	80

Ví dụ 2	$100 + 5$	65
Ví dụ 3	$100 + 1$	55
Ví dụ 4	$100 + 5$	65
Ví dụ 5	$100 + 100$	100
Ví dụ 6	$100 + 10000$	100
Ví dụ 7	$100 + 2000$	100
Ví dụ 8	$100 + 2000$	100
Ví dụ 9	$100 + 2$	60
Ví dụ 10	$100 + 800$	75

* Tỷ lệ sử dụng (Fipronil + Phân bón trên cơ sở nitơ) tính theo g/hecta

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất có công thức chung (I) ở vị trí của cây trồng:



(I)

trong đó:

R^1 là alkyl, halogen, hoặc CN;

R^2 là 4,5-dixyanoimidazol 2-yl, haloalkyl, hoặc $S(O)_mR^7$;

R^3 là hydro, halogen, NR^8R^9 , $S(O)_nR^{10}$, $C(O)R^{11}$, alkyl, haloalkyl, OR^{12} , hoặc $N=CR^{13}R^{14}$;

mỗi nhóm R^4 và R^6 độc lập là hydro, halogen, haloalkyl, CN, hoặc NO_2 ;

R^5 là hydro, halogen, haloalkyl, haloalkoxy, hoặc $S(O)_pR^{15}$;

mỗi nhóm R^7 , R^{10} , R^{12} và R^{15} độc lập là alkyl hoặc haloalkyl;

mỗi nhóm R^8 và R^9 độc lập là hydro, alkyl, alkenyl, haloalkyl, metoxy carbonyl, hoặc $S(O)_qCF_3$;

mỗi nhóm R^{11} và R^{14} độc lập là hydro hoặc alkyl;

R^{13} là nhóm phenyl tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen hoặc thành phần được chọn từ OH, alkyl, alkoxy, và xiano; và

m, n, p, và q độc lập là 0, 1, hoặc 2;

nhóm alkyl, haloalkyl, haloalkoxy và alkenyl có từ 1 đến 12 nguyên tử cacbon; và

phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất có công thức chung (I) cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.

2. Phương pháp theo điểm 1, trong đó R^1 là flo, clo hoặc CN.

3. Phương pháp theo điểm 2, trong đó R^1 là CN.
4. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm trên đây, trong đó R^2 là nhóm có công thức chung $S(O)_mR^7$.
5. Phương pháp theo điểm 4, trong đó R^7 là haloalkyl.
6. Phương pháp theo điểm 5, trong đó R^7 là CF_3 .
7. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó m bằng 1.
8. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^3 là nhóm có công thức NR^8R^9 .
9. Phương pháp theo điểm 8, trong đó cả nhóm R^8 và R^9 đều là hydro.
10. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó cả nhóm R^4 và R^6 đều là halogen.
11. Phương pháp theo điểm 10, trong đó cả nhóm R^4 và R^6 đều là clo.
12. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó R^5 là haloalkyl.
13. Phương pháp theo điểm 12, trong đó R^5 là CF_3 .
14. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó hợp chất có công thức chung (I) được chọn từ các hợp chất sau:
5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-[(triflometyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (fipronil);
1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-5-(2-metylalylamino)-4-[(triflometyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (flufiprol);

5-amino-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-[(etyl)sulfinyl]pyrazol-3-cacbonitril (ethiprol); và

(E)-1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-5-(4-hydroxy-3-metoxybenzylidenamino)-4-triflometylthiopyrazol-3-cacbonitril (vaniliprol).

15. Phương pháp theo điểm 14, trong đó hợp chất có công thức chung (I) là fipronil.
16. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó hợp chất có công thức chung (I) có mặt với lượng nằm trong khoảng từ 1 đến 50% trọng lượng.
17. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó phân bón trên cơ sở nitơ được chọn từ muối amoni, phân bón chứa nitơ lỏng, ure, sản phẩm ngưng tụ ure-formaldehyt, ure amoni nitrat, axit amin, nitrat kim loại, và hỗn hợp của chúng.
18. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó phương pháp này còn sử dụng một hoặc nhiều muối của các chất dinh dưỡng vi lượng.
19. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó phân bón trên cơ sở nitơ có mặt trong chế phẩm với lượng nằm trong khoảng từ 0,5 đến 50% trọng lượng.
20. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ có mặt với tỷ lệ trọng lượng nằm trong khoảng từ 1:20 đến 20:1.
21. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó phương pháp này còn bao gồm bước sử dụng hợp chất có công thức chung (I) cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí của cây trồng.
22. Phương pháp theo điểm 21, trong đó hợp chất có công thức chung (I) được sử

dùng cùng với phân bón trên cơ sở nitơ dưới dạng chế phẩm, trong đó chế phẩm này là chế phẩm dạng hạt, chế phẩm dạng dịch cô huyền phù, chế phẩm dạng hạt phân tán được trong nước, chế phẩm dạng hạt tan trong nước, chế phẩm dạng bột phân tán được trong nước, chế phẩm dạng bột tan trong nước, hoặc chế phẩm dạng huyền phù chảy được.

23. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 3, trong đó hợp chất có công thức chung (I) và phân bón trên cơ sở nitơ được sử dụng cho một hoặc nhiều bộ phận của cây trồng hoặc xung quanh cây trồng này.
24. Phương pháp theo điểm bất kỳ trong số các điểm 1 đến 3, trong đó cây trồng được chọn từ cây ngũ cốc, cây ăn quả, cây họ đậu, cây có dầu, cây họ bầu bí *cucurbitaceae*, cây có sợi, cây rau, cây họ long não *lauraceae*, hoặc cây cảnh.
25. Phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất (RS)-[O-1-(4-clophenyl)pyrazol-4-yl O-ethyl S-propyl phosphorothioat] (pyraclofos) ở vị trí của cây trồng, trong đó phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất pyraclofos cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.
26. Phương pháp làm giảm tính độc thực vật của hợp chất 1-(2,6-diclo- α,α,α -triflo-p-tolyl)-4-(diflometylthio)-5-[(2-pyridylmetyl)amino]pyrazol-3-cacbonitril (pyriprol) ở vị trí của cây trồng, trong đó phương pháp này bao gồm bước sử dụng hợp chất pyraclofos cùng với phân bón trên cơ sở nitơ ở vị trí nêu trên.