



(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)



1-0024785

(51)⁷ A01N 25/14; A01P 7/04; A01N 43/90

(13) B

(21) 1-2013-03417

(22) 30/05/2012

(86) PCT/CN2012/076299 30/05/2012

(87) WO2012/130190A1 04/10/2012

(30) 201110081047.1 31/03/2011 CN

(45) 27/07/2020 388

(43) 27/01/2014 310A

(73) 1. SHANGHAI SHENGNONG PESTICIDE CO., LTD. (CN)

51 Dongzhou Rd., Dongjing Town, Songjiang District, Shanghai 201619, China

2. EAST CHINA UNIVERSITY OF SCIENCE AND TECHNOLOGY (CN)

No.130 Meilong Road, Xuhui District, Shanghai 200237, China

(72) LI, Zhong (CN); ZHANG, Zhiping (CN); XU, Xiaoyong (CN); XU, Haiyan (CN);
SHAO, Xusheng (CN); SHI, Shunfa (CN); ZENG, Buling (CN); CHEN, Jun (CN);
JIANG, Xiaohua (CN).

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

(54) HẠT XYCLOXAPRIT PHÂN TÁN ĐƯỢC TRONG NƯỚC VÀ PHƯƠNG PHÁP BẢO CHẾ HẠT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến hạt phân tán được trong nước của xycloxadrit và phương pháp bảo chế hạt này. Hoạt chất của hạt xycloxadrit phân tán được trong nước là xycloxadrit, hạt này được bổ sung chất làm ướt, chất phân tán, chất hấp phụ, chất gây phân rã, chất dính kết, chất làm ổn định và chất mang mà được trộn cho đến khi đồng nhất; hỗn hợp được nghiền bột trong dòng không khí để tạo ra bột thấm ướt được, sau đó bột này được ngào trộn, tạo hạt, làm khô, và sàng để thu sản phẩm cuối. Hạt xycloxadrit phân tán được trong nước theo sáng chế là một dạng của xycloxadrit dùng trong nông nghiệp, và thuận tiện để lưu giữ, dễ sử dụng, không cần dung môi, và sự bảo vệ hoạt chất để đảm bảo hiệu quả thích hợp.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến dạng bào chế của xycloxaprit và phương pháp bào chế dạng này, cụ thể, đề cập đến hạt xycloxaprit phân tán được trong nước và phương pháp bào chế hạt này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Xycloxaprit là thuốc trừ sâu dùng trong nông nghiệp có hoạt tính cao và độc tính thấp được phát triển bởi đại học khoa học và công nghệ Đông Trung Quốc (East China University of Science and Technology). Xycloxaprit có tính trừ sâu cao đối với sinh vật gây hại thuộc bộ côn trùng cánh giống Homoptera, và cũng có hiệu quả đối với các loài sinh vật gây hại thuộc bộ cánh vảy Lepidoptera. Đặc biệt, có tính trừ sâu cao đối với các sinh vật gây hại nghiêm trọng cho cây lúa như *Nilaparvata lugens* và các sinh vật gây hại ngoại lai như côn trùng cánh nửa *Bemisia tabaci*. Hơn nữa, xycloxaprit có thể được sử dụng để diệt trừ các loài sinh vật gây hại như *Brevicoryne brassicae*, *plutella xylostella* và *Cnaphalocrocis medinalis* Guenee. Hiện nay, đơn yêu cầu cấp patent Trung Quốc và đơn quốc tế PCT đã được nộp liên quan đến sự tổng hợp và cách sử dụng xycloxaprit, tuy nhiên, dạng bào chế của xycloxaprit chưa được công bố.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Một vấn đề kỹ thuật cần được giải quyết bởi sáng chế là tạo ra hạt xycloxaprit phân tán được trong nước để bù cho sự khuyết thiếu ở giải pháp kỹ thuật trước đây, trong đó hạt xycloxaprit phân tán được trong nước là một chế phẩm dùng trong nông nghiệp chứa xycloxaprit, có nhiều ưu điểm như phân rã nhanh, khả năng phân tán và khả năng tạo huyền phù tốt, tính ổn định tuyệt vời, thuận tiện để bảo quản và sử dụng, không cần dung môi, bảo vệ các thành phần hoạt tính không bị bay hơi.

Một vấn đề kỹ thuật khác cần được giải quyết bởi sáng chế là đề xuất phương pháp bào chế hạt xyclozaprit phân tán được trong nước.

Mô tả chi tiết sáng chế

Theo khía cạnh thứ nhất của sáng chế, hạt xyclozaprit phân tán được trong nước chứa xyclozaprit làm hoạt chất, dạng bào chế của xyclozaprit là hạt phân tán được trong nước.

Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước này còn chứa chất phụ trợ và chất mang.

Chất phụ trợ là chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm chất làm ướt, chất phân tán, chất gây phân rã, chất dính kết, và chất làm ổn định.

Theo một phương án ưu tiên, tỷ lệ phần trăm khối lượng của từng nguyên liệu thô là: 2-90% xyclozaprit, 1-10% chất làm ướt, 2-15% chất phân tán, 1-5% chất hấp phụ, 0-10% chất gây phân rã, 1-10% chất dính kết, 1-10% chất làm ổn định, với phần còn lại là chất mang, tính theo tổng lượng nguyên liệu thô ở hạt xyclozaprit phân tán được trong nước.

Theo phương án cụ thể nêu trên, chất làm ướt là một loại hoặc hai loại được chọn từ nhóm bao gồm chất hoạt động bề mặt anion và chất hoạt động bề mặt không phân li.

Chất hoạt động bề mặt anion là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều loại được chọn từ nhóm bao gồm nekal, dodexyl natri sulfat, NNO, lignin sulfonat, dodexylbenzen canxi sulfonat.

Chất hoạt động bề mặt không phân li là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm dãy alkyl polyoxyetylen ete OP, dãy 602, dãy 1601, dãy By.

Chất phân tán là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm các chất hoạt động bề mặt anion, các chất hoạt động bề mặt không phân li, chất polyme tan trong nước, chất phân tán vô cơ, và

bột nhão sulfit lỏng và các sản phẩm tự nhiên dạng rắn khô của chúng.

Chất hoạt động bề mặt sulfonat anion là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm sulfonat, polycacboxylat và phosphat.

Sulfonat không phân li là copolyme khối polyoxyetylen polyoxypropylen ete hoặc alkylphenol polyoxyetylen phosphat este.

Chất polyme tan trong nước là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm rượu polyvinyl, poly etylen glycol, và polyvinylpyrrolidon.

Chất phân tán vô cơ là phosphat ngưng tụ.

Sulfonat là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm naphtalen hoặc alkyl naphtalen sulfonat, sulfonat của các sản phẩm cộng của etylen oxit rượu béo, alkyl phenol polyoxyetylen sulfonat, lignin và dẫn xuất của nó (sulfonat), hoặc poly (alkyl aryl sulfonat).

Polycacboxylat là natri polyacrylat.

Phosphat là một chất hoặc hai chất được chọn từ nhóm bao gồm phosphat của sản phẩm cộng của etylen oxit rượu béo hoặc các muối alkyl phenol polyoxyetylen ete phosphat este.

Chất hấp phụ là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm xelit, attapulgit, canxi cacbonat, muội than trắng, thenardit khan, xenluloza vi tinh thể.

Các chất gây phân rã là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm ure, amoni sulfat, canxi clorua, natri clorua, magie clorua và nhôm clorua.

Chất dính kết là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm tinh bột hoà tan được, dextrin, gôm Arabic và polyvinyl axetat.

Chất làm ổn định là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm natri hydroxit, natri cacbonat, natri bicacbonat, benzoic, axit xitric.

Chất mang là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm xelit, muối than trắng, bentonit, cao lanh, canxi cacbonat nhẹ và attapulgit.

Theo khía cạnh thứ hai, sáng chế đề xuất phương pháp bào chế hạt xycloxaprit phân tán được trong nước, phương pháp này bao gồm bước trộn xycloxaprit, chất làm ướt, chất phân tán, chất hấp phụ, các chất gây phân rã, các chất dính kết, các chất làm ổn định, và chất mang theo tỷ lệ nhất định; nghiền mịn hỗn hợp thu được trong dòng không khí, như vậy thu được bột thấm ướt được; ngào trộn bột thấm ướt được và lượng thích hợp của nước trong máy ngào trộn, như vậy thu được chất dẻo; tạo hạt cho chất dẻo trong máy ép tạo hạt; và làm khô và rây các hạt thu được, bằng cách đó thu được các hạt phân tán được trong nước.

Hạt xycloxaprit phân tán được trong nước theo sáng chế là ổn định dưới điều kiện lưu giữ của các phương pháp thử nghiệm lưu giữ tăng cường "2.3" như được quy định trong Tiêu chuẩn quốc gia Trung Quốc GB/T 19136-2003 (Chinese national standard GB/T 19136-2003), và đối tượng cần được diệt trừ bao gồm các sinh vật gây hại như rầy nâu gây hại cho lúa và rầy xanh Cicadellidae.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Nhằm để giải thích rõ ràng giải pháp kỹ thuật và các ưu điểm của sáng chế, sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn dựa vào sự tham khảo các ví dụ sau đây. Cần hiểu rằng các ví dụ này chỉ nhằm mục đích giải thích sáng chế kỹ hơn, chứ không giới hạn phạm vi của sáng chế. Các phương án đã đề xuất một số chế phẩm hạt xycloxaprit phân tán được trong nước mà có thể được sử dụng như là các sự tham khảo cho người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực này có thể bào chế chúng.

Ví dụ 1

Tính theo tỷ lệ phần trăm khối lượng, 50% xycloxaprit, 3% lauryl natri sulfat, 6% natri lignosulphonat, 5% muối than trắng, 3% cacbamat, 1% tinh bột hoà tan được, 3% natri cacbonat được trộn, với phần còn lại là xelit. Hỗn hợp được nghiền mịn trong dòng không khí, ngào trộn với nước, và sau đó tạo hạt trong máy tạo hạt. Các hạt thu được được làm khô và sàng, bằng cách đó thu được hạt xycloxaprit phân tán được trong nước.

Ví dụ 2

70% xycloxaprit, 4% lauryl natri sulfat, 7% natri lignosulphonat, 5% muối than trắng, 3% cacbamat, 1% tinh bột hoà tan được, 5% natri cacbonat được trộn với phần còn lại là cao lanh. Hỗn hợp được nghiền mịn trong dòng không khí, ngào trộn với nước, và sau đó tạo hạt trong máy tạo hạt. Các hạt thu được được làm khô và sàng, bằng cách đó thu được hạt xycloxaprit phân tán được trong nước.

Ví dụ 3

Xác định hiệu lực của xycloxaprit ở cánh đồng thực tế:

50% hạt xycloxaprit phân tán được trong nước thu được trong ví dụ 1 được sử dụng ở 15g.ai/hm^2 , 30g.ai/hm^2 , 60g.ai/hm^2 để diệt trừ rầy nâu gây hại cho lúa, và hiệu quả diệt trừ đối với rầy nâu gây hại cho lúa được đánh giá vào ngày thứ 1, ngày thứ 3, ngày thứ 7 và ngày thứ 15 sau khi sử dụng. Các kết quả đánh giá được so sánh với hiệu quả diệt trừ của thuốc diệt côn trùng gây hại đối chứng, mà cho thấy kết quả được thể hiện ở bảng 1. Các kết quả đánh giá được so sánh với hiệu quả diệt trừ của thuốc diệt côn trùng gây hại đối chứng, mà chứng tỏ rằng 50% hạt xycloxaprit phân tán được trong nước tạo ra hiệu quả diệt trừ tốt hơn đối với rầy nâu gây hại cho lúa, thời gian hiệu lực tương đối lâu dài, và hạt này là an toàn cho cây lúa. Các kết quả được thể hiện ở bảng 1.

Bảng 1: Các kết quả của quá trình xác định hiệu lực diệt trừ rầy nâu gây hại cho lúa với 50% xyclozaprit WG ở trên cánh đồng thực tế

Thuốc diệt sinh vật gây hại được sử dụng	Lượng thành phần hoạt tính (g thành phần hoạt tính/hm ²)	1 ngày sau khi sử dụng	5 ngày sau khi sử dụng	15 ngày sau khi sử dụng	30 ngày sau khi sử dụng
		Hiệu lực diệt trừ chính xác trung bình (%)			
50% xyclozaprit WG	22,5	1,00	81,01Bb	59,90Dd	70,91Cc
50% xyclozaprit WG	30,0	1,92	89,56ABab	76,07Cc	81,57BCb
50% xyclozaprit WG	37,5	2,73	94,54Aa	88,06Bb	90,77ABab
25% pymetrozin WP	90,0	10,49	93,85Aa	99,65Aa	99,60Aa
10% imidacloprit WP	60,0	1,87	59,00Cc	54,18Dd	47,36Dd
30% thiametoxam WP	15,0	2,78	61,48Cc	60,92Dd	49,52Dd

70% xyclozaprit WG thu được trong ví dụ 2 được pha loãng 3000 lần, 5000 lần và 20000 lần và được sử dụng để diệt trừ rầy xanh hại cây nho và hiệu quả diệt trừ được đánh giá vào ngày thứ 1, ngày thứ 3, ngày thứ 7 và ngày thứ 14 sau khi sử dụng. Các kết quả cho thấy rằng 70% xyclozaprit WG tạo ra hiệu quả diệt trừ cao đối với các nhộng trần của rầy xanh hại cây nho, và hiệu quả diệt trừ của từng chế phẩm được nâng cao theo thời gian sau khi sử dụng, điều đó có nghĩa là chế phẩm này có tính lưu trú tốt, và an toàn đối với sự sinh trưởng của cây nho. Các kết quả được thể hiện trên bảng 2.

Bảng 2: Hiệu quả trên cánh đồng thực khi sử dụng 70% xyclozaprit WG

Thuốc diệt sinh vật gây hại được dùng	Tỷ lệ pha loãng	1 ngày sau khi sử dụng	3 ngày sau khi sử dụng	7 ngày sau khi sử dụng	14 ngày sau khi sử dụng
		Hiệu lực diệt trừ chính xác trung bình (%)			
70% xyclozaprit WG	20000	78,3a	88,4a	88,9a	82,87b
	5000	83,5a	92,5a	94,3a	94,57a
	3000	88,8a	95,2a	97,1a	99,28a
70% imidacloprit WG	20000	88,2a	93,7a	94,7a	95,25a

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước, trong đó hạt này chứa xyclozaprit là thành phần hoạt tính, và dạng bào chế của nó là hạt phân tán được trong nước; tỷ lệ phần trăm khối lượng của từng nguyên liệu thô là: 2-90% xyclozaprit, 1-10% chất làm ướt, 2-15% chất phân tán, 1-5% chất hấp phụ, 0-10% các chất gây phân rã, 1-10% các chất dính kết, 1-10% các chất làm ổn định, với phần còn lại là chất mang, tính theo tổng lượng nguyên liệu thô trong hạt xyclozaprit phân tán được trong nước;

chất làm ướt là lauryl natri sulfat, và chất phân tán là lignosulphonat.

2. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước theo điểm 1, trong đó chất hấp phụ là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm xelit, attapulgit, canxi cacbonat, muối than trắng, thenardit khan, xenluloza vi tinh thể.

3. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước theo điểm 1, trong đó các chất gây phân rã là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm ure, amoni sulfat, canxi clorua, natri clorua, magie clorua và nhôm clorua.

4. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước theo điểm 1, trong đó chất dính kết là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm tinh bột hoà tan được, dextrin, gôm Arabic và polyvinyl axetat.

5. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước theo điểm 4, trong đó chất làm ổn định là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm natri hydroxit, natri cacbonat, natri bicacbonat, axit benzoic, axit xitric.

6. Hạt xyclozaprit phân tán được trong nước theo điểm 1, trong đó chất mang là một chất hoặc hỗn hợp của hai hoặc nhiều chất được chọn từ nhóm bao gồm xelit, muối than trắng, bentonit, cao lanh, canxi cacbonat nhẹ và attapulgit.

7. Phương pháp bào chế hạt xycloxaprit phân tán được trong nước theo điểm 1, trong đó phương pháp này bao gồm bước trộn xycloxaprit, chất làm ướt, chất phân tán, chất hấp phụ, các chất gây phân rã, các chất dính kết, các chất làm ổn định và chất mang theo tỷ lệ; nghiền mịn hỗn hợp thu được trong dòng không khí, do đó thu được bột thấm ướt được; sàng trộn bột thấm ướt được và lượng nước thích hợp trong máy sàng trộn, như vậy thu được chất dẻo; tạo hạt chất dẻo trong máy ép tạo hạt; và, làm khô và rây các hạt thu được, bằng cách đó thu được các hạt phân tán được trong nước.