



(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



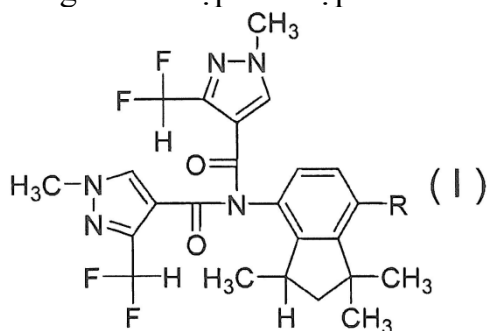
1-0039474

(51)⁸ C07D 231/14; A01N 43/56; A01P 3/00 (13) B

- (21) 1-2019-01655 (22) 29/08/2017
(86) PCT/JP2017/030861 29/08/2017 (87) WO 2018/047670 A1 15/03/2018
(30) 2016-174381 07/09/2016 JP; 2016-229797 28/11/2016 JP
(45) 25/04/2024 433 (43) 25/09/2019 378A
(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048260 Japan
(72) TANIMOTO, Masaya (JP); DOTA, Koichiro (JP).
(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) HỢP CHẤT IMIT, THUỐC VÀ CHẾ PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY

(57) Sáng chế đề cập đến hợp chất imit có công thức (I)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro]
có hiệu quả diệt trừ vượt trội đối với các bệnh cây trồng. Sáng chế cũng đề cập đến thuốc
và chế phẩm chứa hợp chất này.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

[0001]

Sáng chế đề cập đến hợp chất imit và sử dụng hợp chất này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

[0002]

Các hợp chất khác nhau để diệt trừ các bệnh cây trồng đã được phát triển ở một mức độ nào đó (xem Tài liệu sáng chế 1).

Tài liệu trích dẫn

Tài liệu sáng chế

[0003]

Tài liệu sáng chế 1: công bố đơn số WO 02/059086

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Các vấn đề được giải quyết bởi sáng chế

[0004]

Mục đích của sáng chế là đề xuất các hợp chất có hiệu quả diệt trừ vượt trội đối với các bệnh cây trồng.

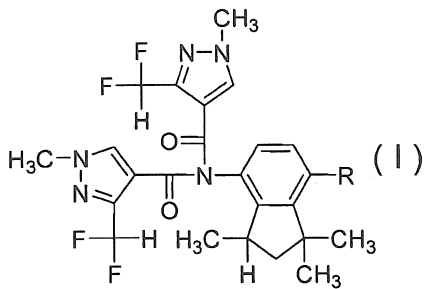
Cách thức giải quyết vấn đề

[0005]

Các tác giả sáng chế đã nghiên cứu để phát hiện ra các hợp chất có hiệu quả diệt trừ vượt trội đối với các bệnh cây trồng. Kết quả là, họ phát hiện ra là hợp chất imit có công thức (I) dưới đây có hiệu quả diệt trừ vượt trội đối với các bệnh cây trồng.

Cụ thể, sáng chế đề xuất các khía cạnh dưới đây.

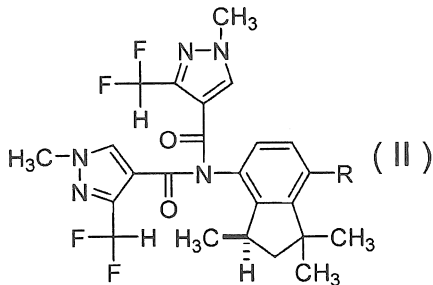
[1] Hợp chất imit có công thức (I)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro]

(dưới đây gọi là "Hợp chất theo sáng chế").

[2] Hợp chất imit theo mục [1], trong đó hợp chất imit có công thức (I) là hợp chất imit có công thức (II)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro]

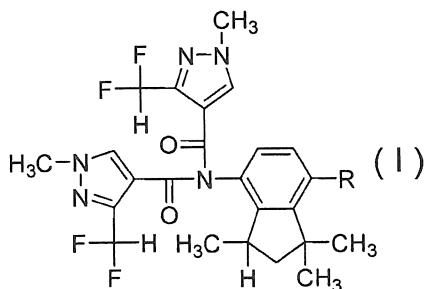
(dưới đây gọi là "Hợp chất (II)").

[3] Thuốc diệt trừ bệnh ở cây trồng chứa hợp chất imit theo mục [1] hoặc [2] và chất mang trợ (dưới đây gọi là "Chất diệt trừ theo sáng chế").

[4] Phương pháp diệt trừ bệnh ở cây trồng chứa áp dụng lượng hữu hiệu hợp chất imit theo mục [1] hoặc [2] cho cây trồng hoặc đất.

[5] Sử dụng hợp chất imit theo mục [1] hoặc [2] để diệt trừ bệnh ở cây trồng.

[6] Chế phẩm chứa hợp chất imit có công thức (I)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro]

và một thành phần hoặc nhiều thành phần được chọn từ nhóm bao gồm hoạt chất trừ sâu, hoạt chất diệt ve bét, hoạt chất diệt giun tròn, thành phần điều hòa sinh trưởng ở cây trồng, chất hỗ trợ, và một thành phần khác để diệt trừ bệnh ở cây trồng.

[0006]

Sáng chế có thể diệt trừ các bệnh cây trồng.

Mô tả chi tiết sáng chế

[0007]

Các ví dụ về hợp chất theo sáng chế bao gồm các hợp chất dưới đây.

Hợp chất theo sáng chế, trong đó R là nguyên tử flo;

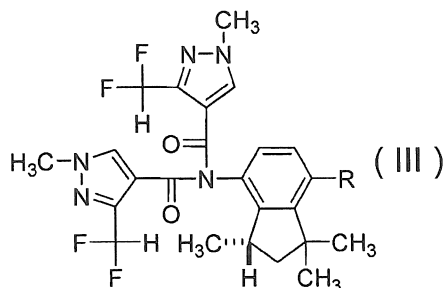
Hợp chất theo sáng chế, trong đó R là nguyên tử hydro;

Hợp chất (II), trong đó R là nguyên tử flo;

Hợp chất (II), trong đó R là nguyên tử hydro;

[0008]

Hợp chất chứa hợp chất (II) và hợp chất imit có công thức (III)



(dưới đây gọi là "Hợp chất (III)") theo tỷ lệ là 1/1 đến 100000/1;

Hợp chất chứa hợp chất (II) trong đó R là nguyên tử flo và hợp chất (III) trong đó R là nguyên tử flo theo tỷ lệ là 1/1 đến 100000/1;

Hợp chất chứa hợp chất (II) trong đó R là nguyên tử hydro và hợp chất (III) trong đó R là nguyên tử flo theo tỷ lệ là 1/1 đến 100000/1;

[0009]

Hợp chất chứa hợp chất (II) và hợp chất (III) theo tỷ lệ là 4/1 đến 100000/1;

Hợp chất chứa hợp chất (II) trong đó R là nguyên tử flo và hợp chất (III) trong đó R là nguyên tử flo theo tỷ lệ là 4/1 đến 100000/1;

Hợp chất chứa hợp chất (II) trong đó R là nguyên tử hydro và hợp chất (III) trong đó R là nguyên tử hydro theo tỷ lệ là 4/1 đến 100000/1;

[0010]

Chất diệt trừ theo sáng chế chứa hợp chất theo sáng chế và chất mang trợ. Chất diệt trừ theo sáng chế thường được điều chế bằng cách trộn hợp chất theo sáng chế với chất mang trợ như chất mang rắn và chất mang lỏng, dầu, chất hoạt tính bề mặt, và/hoặc các chất khác, và nếu cần, bổ sung chất phụ vào chế phẩm như chất kết dính, tác nhân phân tán, và chất làm ổn định, để điều chế thành bột có thể hút ẩm, bột có thể hút ẩm dạng hạt, chất có thể chảy được, chất tạo hạt, chất có thể chảy được khô, chất cô đặc nhũ hóa được, dung dịch nước, dung dịch dầu, chất phát khói, sol khí, vi nang, hoặc các chất khác. Các chế phẩm này chứa thường là 0,1 đến 99% theo trọng lượng, tốt hơn là 0,2 đến 90% theo trọng lượng của hợp chất theo sáng chế.

[0011]

Các ví dụ về chất mang rắn bao gồm các bột hoặc hạt mịn của đất sét (chẳng hạn, đất sét cao lanh, đất điatomi, silic oxit tổng hợp được hydrat hóasilic oxit tổng hợp được hydrat hóa, đất sét Fubasami, bentonit, hoặc đất sét trắng axit), đá tan, các chất khoáng vô cơ khác (chẳng hạn, serixit, bột thạch anh, bột lưu huỳnh, than hoạt tính, hoặc canxi cacbonat), và các chất khác.

Các ví dụ về chất mang lỏng bao gồm nước; các rượu (chẳng hạn, metanol, etanol, rượu isopropyl, butanol, hexanol, rượu benzylic, etylen glycol, propylen glycol, hoặc phenoxy etanol); các keton (chẳng hạn, axeton, metyl etyl keton, hoặc xyclohexanon); các hydrocacbon thơm (chẳng hạn, toluen, xylen, etyl benzen, dodexyl benzen, phenyl xylyl etan, hoặc metylnaphtalen); các hydrocacbon béo (chẳng hạn, hexan, xyclohexan, dầu hỏa, hoặc dầu nhẹ); các este (chẳng hạn, etyl axetat, butyl axetat, isopropyl myristat, etyl oleat,

diisopropyl adipat, diisobutyl adipat, hoặc propylen glycol monometyl ete axetat); các nitril; các ete (chẳng hạn, diisopropyl ete, 1,4-dioxan, etylen glycol dimetyl ete, dietylen glycol dimetyl ete, dietylen glycol monometyl ete, propylen glycol monometyl ete, dipropylen glycol monometyl ete, hoặc 3-methoxy-3-metyl-1-butanol); các amit; và các sulfoxit.

[0012]

Các ví dụ về chất hoạt tính bề mặt bao gồm các alkyl sulfat, các alkyl sulfonat, các alkyl aryl sulfonat, các alkyl aryl ete và các hợp chất polyoxyetylen hóa của nó, các polyoxyetylen glycol ete, các este rượu polyhydric, và các dẫn xuất rượu đường.

[0013]

Các ví dụ về các chất phụ khác đối với chế phẩm bao gồm các chất kết dính, các tác nhân phân tán, và các chất làm ổn định. Các ví dụ cụ thể của nó bao gồm casein, gelatin, các polysacarit (chẳng hạn, tinh bột, gôm arabic, các dẫn xuất xenluloza, hoặc axit alginic), các dẫn xuất lignin, bentonit, các sacarit, các polyme tổng hợp tan trong nước (chẳng hạn, rượu polyvinyl, polyvinyl pyrrolidon, hoặc các axit polyacrylic), isopropyl phosphat axit, 2,6-di-tert-butyl-4-metylphenol, BHA (hỗn hợp của 2-tert-butyl-4-methoxyphenol và 3-tert-butyl-4-methoxyphenol), các dầu thực vật, các dầu khoáng, và các axit béo.

[0014]

Các ví dụ về dầu và chất hoạt tính bề mặt có thể được trộn với và được sử dụng kết hợp với hợp chất theo sáng chế bao gồm Nimbus (tên thương mại đăng ký), Assist (tên thương mại đăng ký), Aureo (tên thương mại đăng ký), Iharol (tên thương mại đăng ký), Silwet L-77 (tên thương mại đăng ký), BreakThru (tên thương mại đăng ký), SundanceII (tên thương mại đăng ký), Induce (tên thương mại đăng ký), Penetrator (tên thương mại đăng ký), AgriDex (tên thương mại đăng ký), Lutensol A8 (tên thương mại đăng ký), NP-7 (tên thương mại

đăng ký), Triton (tên thương mại đăng ký), Nufilm (tên thương mại đăng ký), Emulgator NP7 (tên thương mại đăng ký), Emulad (tên thương mại đăng ký), TRITON X 45 (tên thương mại đăng ký), AGRAL 90 (tên thương mại đăng ký), AGROTIN (tên thương mại đăng ký), ARPON (tên thương mại đăng ký), EnSpray N (tên thương mại đăng ký), và BANOLE (tên thương mại đăng ký).

[0015]

Hợp chất theo sáng chế được áp dụng ở dạng chất diệt trừ theo sáng chế. Phương pháp áp dụng chất diệt trừ theo sáng chế không bị giới hạn ở phương pháp cụ thể miễn là chất diệt trừ theo sáng chế có thể thực chất được áp dụng. Các ví dụ về phương pháp này bao gồm áp dụng đối với phần chính của cây như áp dụng đối với lá, áp dụng đối với diện tích canh tác của cây trồng như xử lý đất, và áp dụng đối với hạt như khử trùng hạt.

Lượng hợp chất theo sáng chế được áp dụng theo phương pháp diệt trừ theo sáng chế khác nhau tùy thuộc vào loại cây trồng cần xử lý, loại hoặc tần số xuất hiện bệnh cây trồng cần diệt trừ, dạng liều, thời gian xử lý, phương pháp xử lý, địa điểm cần xử lý, điều kiện thời tiết, và các yếu tố khác. Khi được áp dụng đối với lá của cây trồng hoặc đất để trồng cây trồng, lượng hợp chất theo sáng chế thường là 1 đến 500 g trên 1000 m².

Chất cô đặc có thể nhũ hóa được, bột có thể hút ẩm, chất có thể chảy được, hoặc tương tự thường được áp dụng bằng cách pha loãng với nước, và rời rạc. Trong trường hợp này, nồng độ của hợp chất theo sáng chế thường nằm trong khoảng từ 0,0005 đến 2% theo trọng lượng. Bụi, chất tạo hạt, hoặc tương tự thường được áp dụng nguyên dạng như vậy mà không cần pha loãng.

[0016]

Hợp chất theo sáng chế có thể được sử dụng làm chất diệt trừ các bệnh cây trồng ở đất trồng như ruộng, ruộng lúa, các bãi cỏ, và đất vườn. Hợp chất theo sáng chế có thể diệt trừ các bệnh ở đất trồng v.v. để trồng (các) cây trồng dưới đây v.v.

[0017]

Các cây: ngô, lúa, lúa mỳ, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, lúa miến, bông, đậu tương, lạc, kiều mạch, củ cải, nho, hướng dương, mía đường, thuốc lá, và các cây trồng khác;

Các loại rau: các cây họ cà (chẳng hạn, cà tím, cà chua, ớt, tiêu, hoặc khoai tây), các cây họ bầu bí (chẳng hạn, dưa chuột, bí ngô, bí xanh, dưa hấu, hoặc dưa), các cây họ cải (chẳng hạn, củ cải đường Nhật Bản, củ cải trắng, củ cải ngựa, su hào, bắp cải Trung Quốc, bắp cải, cải cay, bông cải xanh, hoặc súp lơ), các cây họ cúc (chẳng hạn, cây ngưu bàng, cây hoa cúc, atisô, hoặc rau diếp), các cây họ huệ tây (chẳng hạn, hành lá, hành, tỏi, hoặc măng tây), các cây họ hoa tán (chẳng hạn, cà rốt, mùi tây, cần tây, hoặc củ cải vàng), các cây họ rau muối (chẳng hạn, cải bó xôi hoặc củ cải Thụy Sĩ), các cây họ long não (chẳng hạn, cây bụi Perilla, bạc hà, hoặc húng quế), dâu tây, khoai lang, củ từ, khoai môn, và các cây khác;

các loại hoa;

các cây lấy lá;

Các cây ăn quả: các cây họ táo (chẳng hạn, táo, lê, lê Nhật Bản, cây mọng qua Trung Quốc, hoặc cây mọng qua), các cây họ hạt cùi (chẳng hạn, đào, mận, xuân đào, mơ Nhật Bản (*Prunus mume*), anh đào, mơ, hoặc mận khô), các cây họ cam (chẳng hạn, cam Nhật Bản, cam, chanh, cây sương muối, hoặc bưởi), cây hạnh nhân (chẳng hạn, cây hạt giẻ, cây óc chó, cây hạt phỉ, hạch hạnh, cây hồ trăn, cây đào lộn hột, hoặc các cây macadamia), cây quả mọng (chẳng hạn, cây việt quất, nam việt quất, cây mâm xôi, hoặc quả ngấy), nho, hồng Nhật Bản, ôliu, mận Nhật Bản, chuối, cà phê, cây chà là, cây dứa, và các cây trồng khác; và

Các cây không phải là cây ăn quả: chè, dâu tằm, cây lấy hoa, cây mọng ven đường (chẳng hạn, cây tần bì, cây bạch dương, cây sơn thù du, cây bạch đàn, bạch quả *Ginkgo biloba* (*ginkgo biloba*), cây tử đinh hương, cây phong, cây sồi

(*quercus*), cây dương, cây họ đỗ, cây sau sau (*Liquidambar formosana*), cây ngô đồng, cây Chi Cừ, cây trắc bá Nhật (*Thuja standishii*), cây gỗ lũa, cây độc cần, cây bách xù, cây thông Pinus, Picea, hoặc cây thông Taxus (*Taxus cuspidate*)), và các cây trồng khác.

[0018]

”(Các) cây trồng” nêu trên có thể bao gồm (các) cây trồng biến đổi gen.

[0019]

Các ví dụ về bệnh cây trồng mà có thể được diệt trừ bằng hợp chất theo sáng chế bao gồm các bệnh gây ra bởi mầm bệnh ở cây trồng như nấm sợi và vi khuẩn. Các ví dụ cụ thể về bệnh cây trồng bao gồm các bệnh dưới đây. Tên khoa học mỗi mầm bệnh gây ra bệnh được thể hiện trong dấu ngoặc đơn.

[0020]

Các bệnh ở cây lúa: bệnh đạo ôn (*Magnaporthe grisea*), bệnh đốm nâu (*Cochliobolus miyabeanus*), bệnh khô vằn (*Rhizoctonia solani*), bệnh bakanae (*Gibberella fujikuroi*), và bệnh mốc sương (*Sclerophthora macrospora*);

Các bệnh ở cây lúa mỳ: bệnh phấn trắng (*Blumeria graminis*), bệnh bạc đầu Fusarium (*Fusarium graminearum*, *Fusarium avenaceum*, *Fusarium culmorum*, *Microdochium nivale*), bệnh gỉ sắt sọc (*Puccinia striiformis*), bệnh rỉ sắt thân (*Puccinia graminis*), bệnh rỉ sắt lá (*Puccinia recondita*), bệnh nấm mốc tuyết (*Microdochium nivale*, *Microdochium majus*), bệnh tàn lụi tuyết Typhula (*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*), bệnh nấm than xốp (*Ustilago tritici*), bệnh than hôi thối (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa*), bệnh đốm mắt (*Pseudocercospora herpotrichoides*), bệnh đốm lá Septoria (*Septoria tritici*), bệnh đốm vết trên lá (*Stagonospora nodorum*), đốm nâu vàng (*Pyrenophora tritici-repentis*), bệnh héo cây gây ra bởi nấm rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*), và bệnh héo cây (*Gaeumannomyces graminis*);

Các bệnh ở cây lúa mạch: bệnh phấn trắng (*Blumeria graminis*), bệnh bạc đầu Fusarium (*Fusarium graminearum*, *Fusarium avenaceum*, *Fusarium*

culmorum, *Microdochium nivale*), bệnh gỉ sắt sọc (*Puccinia striiformis*), bệnh gỉ sắt thân (*Puccinia graminis*), bệnh rỉ sắt lá (*Puccinia hordei*), bệnh rỉ sắt lá nhỏ (*Puccinia hordei*), bệnh nấm than xốp (*Ustilago nuda*), bệnh bông lúa mạch (*Rhynchosporium secalis*), bệnh gỉ sắt (*Pyrenophora teres*), bệnh đốm lá nhỏ (*Cochliobolus sativus*), bệnh đốm nâu lúa mạch (*Pyrenophora graminea*), bệnh đốm lá Ramuraria (*Ramularia collo-cygni*), và bệnh héo cây gây ra bởi nấm rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*);

Các bệnh ở cây ngô: bệnh gỉ sắt (*Puccinia sorghi*), bệnh gỉ sắt (*Puccinia polysora*), northern bệnh bạc lá phương bắc (*Setosphaeria turcica*), bệnh gỉ sắt nhiệt đới (*Physopella zae*), bệnh bạc lá phương nam (*Cochliobolus heterostrophus*), bệnh loét (*Colletotrichum graminicola*), bệnh đốm lá xám (*Cercospora zae-maydis*), bệnh đốm mắt (*Kabatiella zae*), bệnh đốm lá Phaeosphaeria (*Phaeosphaeria maydis*), *Stenocarpella maydis*, *Stenocarpella macrospora*, bệnh thối thân (*Fusarium graminearum*, *Fusarium verticillioides*, *Colletotrichum graminicola*), và nấm than (*Ustilago maydis*);

Các bệnh ở cây bông: bệnh loét (*Colletotrichum gossypii*), nấm mốc sương areola (*Ramularia areola*), bệnh đốm lá (*Alternaria macrospora*, *Alternaria gossypii*), và bệnh thối rễ Black gây ra bởi nấm Thielaviopsis (*Thielaviopsis basicola*);

Các bệnh ở cây cà phê: bệnh gỉ sắt (*Hemileia vastatrix*) và bệnh đốm lá (*Cercospora coffeicola*);

Các bệnh ở cây nho: bệnh thối sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), bệnh đốm lá alternaria (†) (*Alternaria brassicae*), và bệnh thối rễ (*Phoma lingam*);

Các bệnh ở cây mía: bệnh gỉ sắt (*Puccinia melanocephala*, *Puccinia kuehni*) và bệnh nấm than (*Ustilago scitaminea*);

Các bệnh ở cây hướng dương: bệnh gỉ sắt (*Puccinia helianthi*) và bệnh mốc sương (*Plasmopara halstedii*);

Các bệnh ở cây họ cam quýt: bệnh đốm nâu (*Diaporthe citri*), bệnh nấm

vảy (*Elsinoe fawcetti*), bệnh thối quả (*Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum*), và bệnh Phytophthora (*Phytophthora parasitica*, *Phytophthora citrophthora*);

Các bệnh ở cây táo: bệnh rụi đầu hoa (*Monilinia mali*), bệnh loét (*Valsa ceratosperma*), bệnh phấn trắng (*Podosphaera leucotricha*), bệnh đốm lá *Alternaria* (*Alternaria alternata apple pathotype*), bệnh nấm vảy (*Venturia inaequalis*), bệnh loét (*Glomerella cingulata*), bệnh đốm lá (*Diplocarpon mali*), bệnh thối vòng (*Botryosphaeria berengeriana*), và bệnh thối ngọn (*Phytophthora cactorum*);

Các bệnh ở cây lê: bệnh nấm vảy (*Venturia nashicola*, *Venturia pirina*), bệnh đốm đen (*Alternaria alternata Japanese pear pathotype*), và bệnh gỉ sắt (*Gymnosporangium haraeaeum*);

Các bệnh ở cây đào: bệnh thối nâu (*Monilinia fructicola*), bệnh nấm vảy (*Cladosporium carpophilum*), và bệnh thối mục do nấm *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.);

Các bệnh ở cây nho: bệnh loét (*Elsinoe ampelina*), bệnh thối quả (*Glomerella cingulata*), bệnh phấn trắng (*Uncinula necator*), bệnh gỉ sắt (*Phakopsora ampelopsidis*), bệnh thối đen (*Guignardia bidwellii*), và bệnh mốc sương (*Plasmopara viticola*);

Các bệnh của cây hồng Nhật Bản: bệnh loét (*Gloeosporium kaki*) và bệnh đốm lá (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*);

Các bệnh của cây họ bầu bí: bệnh loét (*Colletotrichum lagenarium*), bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca fuliginea*), bệnh tàn lụi thân cây (*Didymella bryoniae*), bệnh đốm lá corynespora (*Corynespora cassiicola*), bệnh héo lá *Fusarium* (*Fusarium oxysporum*), bệnh mốc sương (*Pseudoperonospora cubensis*), bệnh thối rễ *Phytophthora* (*Phytophthora* sp.), và bệnh héo cây (*Pythium* sp.);

Các bệnh ở cà chua: bệnh úa sớm (*Alternaria solani*), bệnh mốc lá (*Cladosporium fulvum*), bệnh mốc lá cercospora (*Pseudocercospora fuligena*),

bệnh úa muôn (*Phytophthora infestans*), và bệnh phấn trắng (*Leveillula taurica*);

Các bệnh ở cây cà tím: đốm nâu (*Phomopsis vexans*) và bệnh phấn trắng (*Erysiphe cichoracearum*);

Các bệnh của họ cải: đốm lá *Alternaria* (*Alternaria japonica*), đốm trắng (*Cercospora brassicae*), bệnh thối rễ (*Plasmodiophora brassicae*), và bệnh mốc sương (*Peronospora parasitica*);

Các bệnh ở cây hành: bệnh gỉ sắt (*Puccinia allii*);

Các bệnh ở cây đậu tương: bệnh lép (*Cercospora kikuchii*), bệnh nấm vảy *Sphaceloma* (*Elsinoe glycines*), bệnh tàn lụi quả và thân (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*), bệnh gỉ sắt (*Phakopsora pachyrhizi*), bệnh đốm đích (*Corynespora cassiicola*), bệnh loét (*Colletotrichum glycines*, *Colletotrichum truncatum*), bệnh thối do *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), bệnh đốm nâu septoria (*Septoria glycines*), bệnh đốm lá *Cercospora* (*Cercospora sojae*), bệnh thối sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), bệnh phấn trắng (*Microsphaera diffusa*), bệnh thối rễ và thối thân phytophthora (*Phytophthora sojae*), bệnh mốc sương (*Peronospora manshurica*), và hội chứng chết đột ngột (*Fusarium virguliforme*);

Các bệnh ở đậu tây: bệnh thối thân (*Sclerotinia sclerotiorum*), bệnh gỉ sắt (*Uromyces appendiculatus*), bệnh đốm góc lá (*Phaeoisariopsis griseola*), và bệnh loét (*Colletotrichum lindemuthianum*);

Các bệnh ở cây lạc: đốm lá (*Cercospora personata*), đốm lá nâu (*Cercospora arachidicola*), và bệnh úa (*Sclerotium rolfsii*);

Các bệnh ở cây đậu Hà Lan: bệnh phấn trắng (*Erysiphe pisi*);

Các bệnh ở khoai tây: bệnh úa sớm (*Alternaria solani*), bệnh úa muôn (*Phytophthora infestans*), bệnh thối củ (*Phytophthora erythroseptica*), bệnh nấm vảy bột (*Spongospora subterranea* f. sp. *subterranea*), và bệnh héo lá *Verticillium* (*Verticillium albo-atrum*, *Verticillium dahliae*, *Verticillium nigrescens*);

Các bệnh ở dâu tây: bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca humuli*);

Các bệnh ở cây trà: bệnh nấm rộp lá (*Exobasidium reticulatum*), bệnh nấm vảy trắng (*Elsinoe leucospila*), bệnh tàn rụi xám (*Pestalotiopsis* sp.), và bệnh loét (*Colletotrichum theae-sinensis*);

Các bệnh ở cây thuốc lá: đốm nâu (*Alternaria longipes*), bệnh loét (*Colletotrichum tabacum*), bệnh mốc sương (*Peronospora tabacina*), và bệnh đốm đen (*Phytophthora nicotianae*);

Các bệnh ở củ cải: bệnh đốm lá cercospora (*Cercospora beticola*), bệnh bạc lá (*Thanatephorus cucumeris*), bệnh thối rễ (*Thanatephorus cucumeris*), bệnh thối rễ aphanomyces (*Aphanomyces cochlioides*), và bệnh gỉ sắt (*Uromyces betae*);

Các bệnh ở hoa hồng: bệnh đốm đen (*Diplocarpon rosae*) và bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca pannosa*);

Các bệnh ở cây hoa cúc và cúc tây: bệnh bạc lá (*Septoria chrysanthemi-indici*) và bệnh gỉ sắt trắng (*Puccinia horiana*);

Các bệnh ở cây hành: bệnh bạc lá Botrytis (*Botrytis cinerea*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis squamosa*), bệnh thối củ (*Botrytis allii*), và bệnh xơ cứng nhỏ (*Botrytis squamosa*);

Các bệnh ở các cây trồng khác: bệnh mốc xám (*Botrytis cinerea*) và bệnh thối Sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*);

Các bệnh ở cây củ cải đường Nhật Bản: bệnh đốm lá Alternaria (*Alternaria brassicicola*);

Các bệnh ở cây cỏ xanh: bệnh đốm lá (*Sclerotinia homoeocarpa*) và bệnh đốm nâu và đốm lớn (*Rhizoctonia solani*);

Các bệnh ở cây chuối: bệnh đốm lá vàng Sigatoka *Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella musicola*);

Các bệnh về hạt hoặc các bệnh ở các giai đoạn phát triển sớm của các cây trồng khác được gây ra bởi các vi khuẩn *Aspergillus* spp., *Penicillium* spp.,

Fusarium spp., *Gibberella* spp., *Tricoderma* spp., *Thielaviopsis* spp., *Rhizopus* spp., *Mucor* spp., *Corticium* spp., *Phoma* spp., *Rhizoctonia* spp., *Diplodia* spp., hoặc các vi khuẩn khác;

Các bệnh do virus ở các cây trồng khác nhau được gây ra gián tiếp bởi *Polymyxa* spp., *Olpidium* spp., hoặc các virus khác;

Bệnh lụi cây con do vi khuẩn ở cây lúa (*Burkholderia plantarii*);

Đốm góc lá ở cây dưa chuột (*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*);

Bệnh héo lá do vi khuẩn ở cây cà tím (*Ralstonia solanacearum*);

Bệnh loét ở cây họ cam quýt (*Xanthomonas citri*);

Bệnh thối nhũn do vi khuẩn ở cây bắp cải Trung Quốc (*Erwinia carotovora*);

và các bệnh khác.

Ví dụ thực hiện sáng chế

[0021]

Các ví dụ dưới đây bao gồm các ví dụ điều chế, các ví dụ chế phẩm, và các ví dụ thử nghiệm giúp minh họa sáng chế một cách chi tiết hơn, mà không nhằm hạn chế sáng chế.

Đầu tiên, về điều chế hợp chất theo sáng chế, các ví dụ điều chế được trình bày dưới đây.

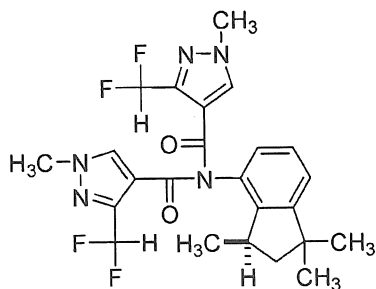
[0022]

Ví dụ điều chế 1

(R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan (0,20 g) (độ tinh sạch quang học 96%), diisopropyletylamin (1,2 mL), 4-dimethylaminopyridin (0,02 g), tetraetylen glycol dimetyl ete (5 mL), và clorua của axit 1-metyl-3-diflomeetylpyrazol-4-carboxylic (0,46 g) được trộn, và hỗn hợp thu được được khuấy ở 80°C trong 1 giờ, và rồi được khuấy ở 120°C trong 5 giờ. Hỗn hợp phản ứng được làm mát đến nhiệt độ phòng, và rồi nước, toluen, và 5% axit clohydric được bổ sung vào để tách hỗn hợp thu được. Lốp hữu cơ thu được

sau đó được rửa với nước, nước natri cacbonat cacbonat bão hòa, và nước, rồi được sấy khô trên magie sulfat, và được cô đặc ở điều kiện áp suất giảm. Cặn thu được được cho chạy sắc ký cột silicagel để thu được hợp chất dưới đây (dưới đây gọi là Hợp chất theo sáng chế "(1)") (độ tinh sạch quang học 99,9%).

Hợp chất theo sáng chế (1)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7,51 (1H, s), 7,32 (1H, dd, $J = 7,2$ Hz, 7,8 Hz), 7,22 (1H, d, $J = 7,2$ Hz), 7,13 (1H, t, $J = 54$ Hz), 7,07 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 6,96 (1H, t, $J = 54$ Hz), 6,52 (1H, s), 3,89 (3H, s), 3,72 (3H, s), 2,91-2,83 (1H, m), 2,05 (1H, dd, $J = 4,8$ Hz, 7,8 Hz), 1,57 (1H, dd, $J = 7,8$ Hz, 12,6 Hz), 1,36 (3H, s), 1,24 (3H, d, $J = 13,8$ Hz), 0,98 (3H, s).

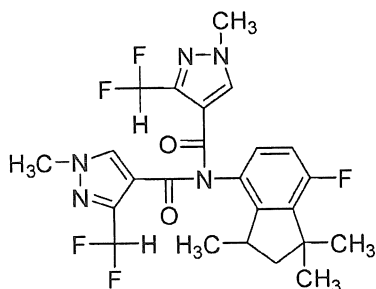
$[\alpha]_{\text{D}}^{22} = +113,5^\circ$ (CHCl_3 , c1.1)

[0023]

Ví dụ điều chế 2

Hợp chất theo sáng chế (2) dưới đây được điều chế bằng cách sử dụng 7-fluoro-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan thay cho (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan theo phương pháp được mô tả ở Ví dụ điều chế 1.

Hợp chất theo sáng chế (2)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7,53 (1H, s), 7,10 (1H, t, $J = 53,8$ Hz), 7,06 (1H, dd, $J =$

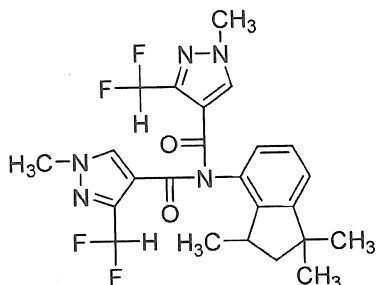
8,8, 4,4 Hz), 6,98 (1H, t, J = 8,8 Hz), 6,93 (1H, t, J = 54,5 Hz), 6,71 (1H, s), 3,91 (3H, s), 3,78 (3H, s), 2,97-2,88 (1H, m), 2,07 (1H, dd, J = 12,9, 8,1 Hz), 1,62 (1H, dd, J = 12,9, 8,1 Hz), 1,58 (3H, s), 1,48 (3H, s), 1,24 (3H, d, J = 6,9 Hz).

[0024]

Ví dụ điều chế 3

Hợp chất theo sáng chế (3) dưới đây được điều chế bằng cách sử dụng 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan thay cho (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan theo phương pháp được mô tả ở Ví dụ điều chế 1.

Hợp chất theo sáng chế (3)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7,51 (1H, s), 7,33 (1H, t, J = 7,6 Hz), 7,22 (1H, dd, J = 7,6, 1,0 Hz), 7,13 (1H, t, J = 53,5 Hz), 7,07 (1H, dd, J = 7,8, 1,0 Hz), 6,95 (1H, t, J = 54,8 Hz), 6,52 (1H, s), 3,91 (3H, s), 3,72 (3H, s), 2,92-2,83 (1H, m), 2,06 (1H, dd, J = 12,7, 7,7 Hz), 1,57 (1H, dd, J = 12,7, 7,5 Hz), 1,36 (3H, s), 1,24 (3H, d, J = 6,8 Hz), 0,99 (3H, s).

[0025]

Chế phẩm chứa hợp chất theo sáng chế và một thành phần hoặc nhiều thành phần được chọn từ nhóm bao gồm hoạt chất trừ sâu, hoạt chất diệt ve bét, hoạt chất diệt giun tròn, thành phần điều hòa sinh trưởng ở cây trồng, chất hỗ trợ, và một thành phần diệt trừ bệnh ở cây trồng khác (dưới đây gọi chung là "Thành phần theo sáng chế") có thể được áp dụng cho cây trồng hoặc đất để diệt trừ vật gây hại như động vật chân khớp gây hại, giun tròn gây hại, và các mầm bệnh ở cây trồng. Ngoài ra, hợp chất theo sáng chế và thành phần theo sáng chế có thể được áp dụng một cách riêng biệt để diệt trừ vật gây hại.

Các ví dụ về hoạt chất trừ sâu, hoạt chất diệt ve bét, và hoạt chất diệt giun tròn bao gồm các hoạt chất được chỉ rõ bởi IRAC (Insecticide Resistance Action Committee) và các hoạt chất khác.

Thành phần điều hòa sinh trưởng ở cây trồng chỉ thành phần kiểm soát sự sinh trưởng của cây trồng như thúc đẩy ra quả và thúc đẩy ra rễ, và các ví dụ của nó bao gồm axit indolebutyric.

Chất hỗ trợ chỉ thành phần có thể làm cho một chất khác có hiệu quả khi được sử dụng ở dạng hỗn hợp với chất này, và các ví dụ của nó bao gồm piperonyl butoxit.

Các ví dụ về thành phần diệt trừ bệnh ở cây trồng bao gồm hoạt chất diệt nấm. Hoạt chất diệt nấm là thành phần sử dụng để bảo vệ cây trồng khỏi các bệnh có nguồn gốc từ các mầm bệnh ở cây trồng (chẳng hạn, nấm sợi hoặc vi khuẩn), và các ví dụ của nó bao gồm các hoạt chất được chỉ rõ bởi FRAC (Fungicide Resistance Action Committee) và các hoạt chất khác.

[0026]

Dưới đây, các ví dụ về hỗn hợp chứa hợp chất theo sáng chế và thành phần theo sáng chế được mô tả. Chẳng hạn, "nazoltebuconazol + SX" chỉ hỗn hợp chứa nazoltebuconazol và SX. Chữ viết tắt "SX" chỉ một hợp chất bất kỳ được chọn từ hợp chất theo sáng chế. Ngoài ra, số trong dấu ngoặc đơn là số đăng ký CAS.

tebuconazol + SX, prothioconazol + SX, metconazol + SX, ipconazol + SX, triticonazol + SX, difenoconazol + SX, imazalil + SX, triadimenol + SX, tetraconazol + SX, flutriafol + SX, bromuconazol + SX, propiconazol + SX, mefentrifluconazol + SX, ipfentrifluconazol + SX, epoxiconazol + SX, cyproconazol + SX, mandestrobin + SX, azoxystrobin + SX, pyraclostrobin + SX, trifloxystrobin + SX, fluoxastrobin + SX, picoxystrobin + SX, fenamidon + SX, dimoxystrobin + SX, metominostrobin + SX, pyribencarb + SX, sedaxan + SX, penflufen + SX, fluxapyroxad + SX, fluopyram + SX, benzovindiflupyr +

SX, boscalid + SX, carboxin + SX, penthiopyrad + SX, flutolanil + SX, bixafen
 + SX, pydiflumetofen + SX,
 3-diflometyl-N-(7-flo-1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1-metylpyrazol-4-carboxamit
 (1383809-87-7) + SX,
 N-xyclopropyl-3-(diflometyl)-5-flo-N-(5-clo-2-isopropylbenzyl)-1-metyl-1H-py
 razol-4-carboxamit (1255734-28-1) + SX,
 3-diflometyl-1-metyl-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)pyrazol-4-carboxamit
 (141573-94-6) + SX,
 3-diflometyl-1-metyl-N-[(3R)-1,1,3-trimetylindan-4-yl]pyrazol-4-carboxamit
 (1352994-67-2) + SX, metalaxyl + SX, metalaxyl-M + SX, metrafenon + SX,
 cyflufenamid + SX, proquinazid + SX,
 3-clo-5-phenyl-6-metyl-4-(2,6-diflophenyl)pyridazin (1358061-55-8) + SX,
 1-(2-{{[1-(4-clophenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymetyl}}-3-metylphenyl)-4-metyl-1,4-
 dihydrotetrazol-5-on (1472649-01-6) + SX,
 4-(2-bromo-4-flophenyl)-N-(2-clo-6-flophenyl)-1,3-dimetyl-1H-pyrazol-5-amin
 (1362477-26-6) + SX, fempicoxamid + SX,
 N'-(2,5-dimetyl-4-phenoxyphenyl)-N-etyl-N-metylmetanimidamit
 (1052688-31-9) + SX, isotianil + SX, axit oxolinic + SX, ferimzon + SX, phtalit
 + SX, kasugamyxin + SX, tebufloquin + SX, quinofumelin + SX, fenpyrazamin
 + SX, procymidon + SX, fludioxonil + SX, tolclofos-metyl + SX, thiabendazol
 + SX, ethaboxam + SX, picarbutrazox + SX, oxathiapiprolin + SX, iminoctadin
 triaxetat + SX, iminoctadin albesilat + SX, fenpropimorph + SX, fenpropidin +
 SX, spiroxamin + SX, clothalonil + SX, folpet + SX, captan + SX, thiram + SX,
 silthiofam + SX, mancozeb + SX, cartap + SX, clothianidin + SX,
 thiamethoxam + SX, imidacloprid + SX, thiacloprid + SX, flupyradifuron + SX,
 sulfoxaflor + SX, triflumezopyrim + SX, dicloromezotiaz + SX, beta-cyfluthrin
 + SX, tefluthrin + SX, fipronil + SX, chlorantraniliprol + SX, cyantraniliprol +
 SX, tetraniliprol + SX, thiodicarb + SX, carbofuran + SX, fluxametamit + SX,

afoxolaner + SX, fluralaner + SX, broflanilide + SX, abamectin + SX, fluensulfon + SX, fluazaindolizin + SX, tioxazafen + SX, (E)-N-{1-[(6-clopyridin-3-yl)metyl]pyridin-2(1H)-yliden}-2,2,2-trifloaxetamit (1689566-03-7) + SX, *Mycorrhizal Fungi* + SX, *Bacillus firmus* + SX, *Bacillus amyloliquefaciens* + SX, *Pasteuria nishizawae* + SX, *Pasteuria penetrans* + SX.

[0027]

Các ví dụ về tỷ lệ của hợp chất theo sáng chế và thành phần theo sáng chế bao gồm, nhưng không bị giới hạn ở các tỷ lệ này, 1000:1 đến 1:1000, 500:1 đến 1:500, 100:1 đến 1:100, 50:1 đến 1:50, 20:1 đến 1:20, 10:1 đến 1:10, 3:1 đến 1:3, 1:1 đến 1:500, 1:1 đến 1:100, 1:1 đến 1:50, 1:1 đến 1:20, và 1:1 đến 1:10 theo tỷ lệ theo trọng lượng (Hợp chất theo sáng chế : Thành phần theo sáng chế).

[0028]

Áp dụng hợp chất theo sáng chế cho cây trồng đạt được hiệu quả thúc đẩy sự sinh trưởng của cây trồng như làm tăng tốc độ mọc cây con, làm tăng số lượng của lá khỏe mạnh, làm tăng chiều cao của cây trồng, làm tăng trọng lượng của cây trồng, làm tăng diện tích lá, làm tăng số lượng hoặc trọng lượng của các hạt hoặc quả, làm tăng số lượng lần ra hoa hoặc ra quả, và thúc đẩy sự phát triển của rễ. Ngoài ra, áp dụng hợp chất theo sáng chế cho cây trồng đạt được sự cải thiện về khả năng chống chịu đối với các yếu tố cực đoan phi sinh học như nhiệt độ bất lợi (chẳng hạn, nhiệt độ quá cao hoặc nhiệt độ quá thấp), bất lợi về mức nước (chẳng hạn, hạn hán hoặc quá dư nước), và nồng độ muối cao.

[0029]

Tiếp theo, các ví dụ chế phẩm được trình bày dưới đây.

[0030]

Ví dụ chế phẩm 1

Một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (50 phần), canxi lignin sulfonat (3 phần), magie lauryl sulfat (2 phần), và silic oxit tổng hợp được hydrat hóa (45 phần) được nghiền và được trộn hoàn toàn để thu được mỗi chế phẩm.

[0031]

Ví dụ chế phẩm 2

Một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (20 phần) và sorbitan trioleat (1,5 phần) được trộn với dung dịch nước (28,5 phần) chứa rượu polyvinyl (2 phần), và hỗn hợp thu được được nghiền mịn bằng phương pháp nghiền ướt. Rồi, dung dịch nước (40 phần) chứa gôm xanthan (0,05 phần) và nhôm magie silicat (0,1 phần) được bổ sung vào đó, propylen glycol (10 phần) được bổ sung thêm vào, và hỗn hợp thu được được trộn cùng với khuấy để thu được mỗi chế phẩm.

[0032]

Ví dụ chế phẩm 3

Một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (2 phần), đất sét cao lanh (88 phần), và đá tan (10 phần) được nghiền và được trộn hoàn toàn để thu được mỗi chế phẩm.

[0033]

Ví dụ chế phẩm 4

Một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (5 phần), polyoxyetylen styryl phenyl ete (14 phần), canxi dodexylbenzensulfonat (6 phần), và xylen (75 phần) được trộn hoàn toàn để thu được mỗi chế phẩm.

[0034]

Ví dụ chế phẩm 5

Một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (2 phần), silic oxit tổng hợp được hydrat hóa (1 phần), canxi lignin sulfonat (2 phần), bentonit (30 phần), và đất sét cao lanh (65 phần) được nghiền và được trộn hoàn toàn, và rồi nước được bổ sung vào, hỗn hợp thu được được nhào hoàn toàn, và được tạo hạt và được sấy khô để thu được mỗi chế phẩm.

[0035]

Ví dụ chế phẩm 6

Hỗn hợp của muối amoni của polyoxyetylen alkyl ete sulfat và cacbon trắng (trọng lượng tỷ lệ 1:1) (35 phần), một hợp chất theo sáng chế bất kỳ (20

phần), và nước (45 phần) được trộn hoàn toàn để thu được mỗi chế phẩm.

[0036]

Ví dụ thử nghiệm 1

Bình nhựa được đổ đầy đất, lúa mỳ (cultivar. Shirogane) được gieo vào đó, và lúa mỳ được sinh trưởng trong nhà kính trong chín ngày. Hợp chất theo sáng chế (1), hợp chất theo sáng chế (2), hoặc hợp chất theo sáng chế (3) được điều chế riêng biệt theo quy trình được mô tả ở Ví dụ chế phẩm 6 được trộn với nước để mỗi nồng độ của hợp chất theo sáng chế là 500 ppm. Hỗn hợp nói trên được xịt lên phần lá để bám một cách thích đáng lên các bề mặt của lá của lúa mỳ nói trên. Sau khi xịt hỗn hợp, lúa mỳ được sấy khô bằng không khí, được trồng ở 20°C ở điều kiện chiếu sáng trong năm ngày, và rồi các bào tử của *Puccinia recondita* được cấy bằng cách rắc vào đó. Sau khi cấy, lúa mỳ được đặt ở 23°C trong bóng tối và điều kiện ẩm trong một ngày, rồi được trồng ở 20°C ở điều kiện chiếu sáng trong tám ngày, và vùng thương tổn được kiểm tra. Từ các kết quả thử nghiệm, mỗi vùng thương tổn ở nhóm lúa mỳ đã xử lý bằng hợp chất theo sáng chế (1), hợp chất theo sáng chế (2), hoặc hợp chất theo sáng chế (3) là 10% hoặc nhỏ hơn so với vùng thương tổn ở nhóm lúa mỳ chưa được xử lý.

[0037]

Ví dụ thử nghiệm 2

Bình nhựa được đổ đầy đất, lúa mạch (cultivar. Nishinohoshi) được gieo vào đó, và lúa mạch được sinh trưởng trong nhà kính trong bảy ngày. Hợp chất theo sáng chế (2) hoặc hợp chất theo sáng chế (3) được điều chế theo quy trình được mô tả ở Ví dụ chế phẩm 6 được trộn với nước để nồng độ của hợp chất theo sáng chế là 500 ppm. Hỗn hợp này được xịt lên phần lá để bám một cách thỏa đáng lên các bề mặt của lá của lúa mạch nói trên. Sau khi xịt hỗn hợp, lúa mạch được làm khô bằng không khí, và hai ngày sau khi áp dụng, huyền phù nước chứa các bào tử của *Pyrenophora teres* được cấy bằng cách xịt vào đó. Sau khi cấy, lúa mạch được đặt ở 23°C vào ban ngày và 20°C vào ban đêm trong nhà

kính ở điều kiện ẩm trong ba ngày, rồi được trồng trong nhà kính trong bảy ngày, và rồi vùng thương tổn được kiểm tra. Từ các kết quả thử nghiệm, mỗi vùng thương tổn ở nhóm lúa mạch đã xử lý bằng hợp chất theo sáng chế (2) hoặc hợp chất theo sáng chế (3) là 10% hoặc nhỏ hơn so với vùng thương tổn ở nhóm lúa mạch chưa xử lý.

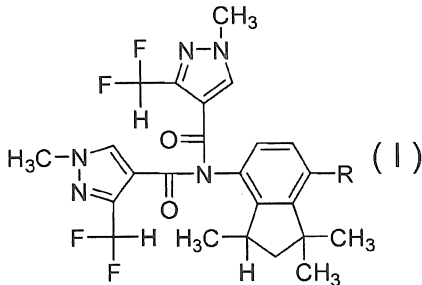
Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

[0038]

Hợp chất theo sáng chế có hiệu quả diệt trừ đối với các bệnh cây trồng và hữu ích làm hoạt chất của chất diệt trừ các bệnh cây trồng.

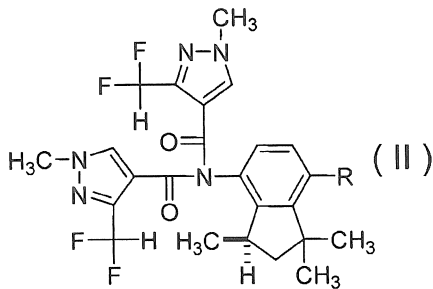
YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất imit có công thức (I)



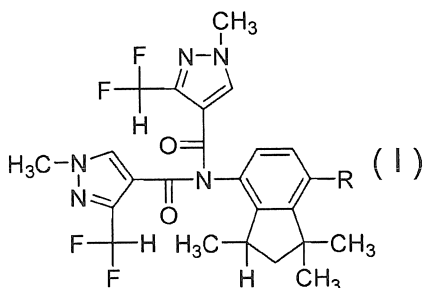
[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro].

2. Hợp chất imit theo điểm 1, trong đó hợp chất imit có công thức (I) là hợp chất imit có công thức (II)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro].

3. Thuốc diệt trừ bệnh ở cây trồng chứa hợp chất imit theo điểm 1 hoặc 2 và chất mang trợ.
4. Phương pháp diệt trừ bệnh ở cây trồng chứa bước áp dụng lượng hữu hiệu hợp chất imit theo điểm 1 hoặc 2 cho cây trồng hoặc đất.
5. Chế phẩm chứa hợp chất imit có công thức (I)



[trong đó R là nguyên tử flo hoặc nguyên tử hydro]

và một hoặc nhiều thành phần được chọn từ nhóm bao gồm hoạt chất trừ sâu, hoạt chất diệt ve bét, hoạt chất diệt giun tròn, thành phần điều hòa sinh trưởng ở cây trồng, chất hỗ trợ, và một thành phần khác để diệt trừ bệnh ở cây trồng.