



(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



1-0043878

(51)^{2020.01} A01N 47/38; A01N 25/12; A01N 25/30; (13) B
A01N 25/02; A01N 25/14

(21) 1-2020-02783

(22) 16/11/2018

(86) PCT/KR2018/014102 16/11/2018

(87) WO 2019/098755 23/05/2019

(30) 10-2017-0153278 16/11/2017 KR

(45) 25/03/2025 444

(43) 26/10/2020 391A

(73) LG CHEM, LTD. (KR)

128, Yeoui-daero, Yeongdeungpo-gu, Seoul 07336, Republic of Korea

(72) RYOO, Ki Hyun (KR); CHUN, Sam Jae (KR).

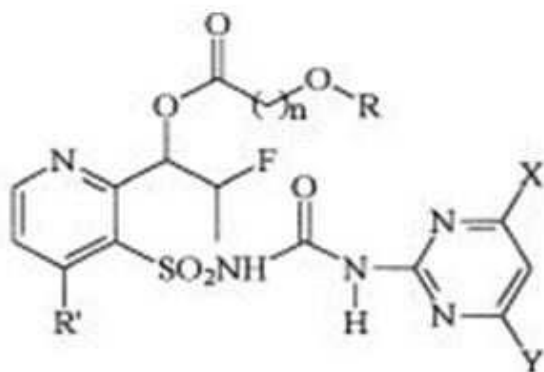
(74) Công ty TNHH Tầm nhìn và Liên danh (VISION & ASSOCIATES CO.LTD.)

(54) CHẾ PHẨM THUỐC DIỆT CỎ

(21) 1-2020-02783

(57) Sáng chế đề cập đến chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm hợp chất pyridin sulfonylurea, làm thành phần hoạt tính, được đại diện bằng Công thức 1 dưới đây, hợp chất pyridin sulfonylure là hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo, hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn:

[Công thức 1]



trong đó n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 3, R là nguyên tử hydro hoặc nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, R' là nguyên tử hydro, nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkyl có từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon, nhóm halogen, hoặc nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, và mỗi X và Y độc lập là nhóm alkyl có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, hoặc nhóm halogen.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm thành phần hoạt tính có tác dụng diệt cỏ thể hiện tác dụng diệt cỏ tuyệt vời.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

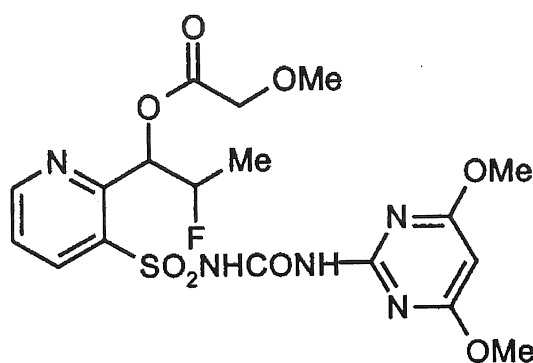
Trong quá trình trồng trọt cây trồng, điều quan trọng là phải bảo vệ cây trồng bằng cách khống chế cỏ dại làm kìm hãm sự phát triển của cây trồng. Để làm giảm thiệt hại như mất sự sinh trưởng hoặc năng suất cây trồng do cỏ dại mọc trong vùng trồng trọt, các hoạt chất diệt cỏ có khả năng khống chế một cách hiệu quả cỏ dại và an toàn cho cây trồng đã được phát triển. Cho đến nay đã phát triển được nhiều hoạt chất diệt cỏ đã được đăng ký cho các loại cây trồng cụ thể và được sử dụng để khống chế cỏ dại. Các hoạt chất diệt cỏ này được sử dụng để khống chế cỏ dại phát triển trong các vùng trồng trọt của các loại cây trồng cụ thể được ưu tiên có hoạt tính diệt cỏ mạnh và phổ diệt cỏ rộng và an toàn cho môi trường và cây trồng.

Trong khi các chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm các hoạt chất diệt cỏ như vậy đã được phát triển và được sử dụng trong các chế phẩm như bột dễ thấm ướt, chất cô dễ nhũ hóa, hạt dễ phân tán được trong nước, hạt, chất cô dạng huyền phù và dạng tương tự. Tuy nhiên, trong trường hợp của bột dễ thấm ướt, chất cô dễ nhũ hóa và hạt dễ phân tán được trong nước thường được pha loãng với nước đến nồng độ định trước để điều chế các dung dịch dễ phun, có một vấn đề đó là nó rất tốn kém và mất nhiều thời gian để phun đều khắp dung dịch này trên toàn bộ bề mặt của ruộng lúa hoặc cánh đồng. Mặc dù các vấn đề của bột dễ thấm ướt, chất cô dễ nhũ hóa và hạt dễ phân tán được trong nước có thể được giải quyết bằng cách sử dụng hạt có thể được sử dụng trực tiếp mà không cần pha loãng với nước, hạt như vậy bao gồm hàm lượng tương đối thấp của hoạt chất diệt cỏ dựa trên tổng lượng thuốc diệt cỏ, nhất thiết phải bao gồm một chất phụ trợ để tạo thành thuốc diệt cỏ, được sản xuất theo một quy trình phức tạp bao gồm quá trình tán thành bột, trộn, nghiền, tạo hạt, sấy khô, phân loại và quá trình tương tự, và có một vấn đề như sự xuất hiện vết bẩn do việc phun. Để giải quyết các vấn đề này, đã phát triển được chế phẩm chất cô dạng huyền phù, quy trình sản xuất chế phẩm này tương đối đơn giản và

thân thiện với môi trường và cho phép phun đơn giản và hiệu quả. Trong khi đó, khi sử dụng các chế phẩm thuốc diệt cỏ khác nhau, điều quan trọng là phải đảm bảo được sự ổn định của các chế phẩm thuốc diệt cỏ này ngay cả khi được bảo quản trong một thời gian dài.

Hợp chất [tên ISO được đề xuất: fluxetosulfuron] được đại diện bằng Công thức a dưới đây, là một hoạt chất diệt cỏ thuộc lớp sulfonylure, đã được đề xuất làm hoạt chất diệt cỏ trong patent Hàn Quốc số 10-0399366 (đơn yêu cầu cấp patent Hàn Quốc số 10-2000-0059990):

[Công thức a]



Fluxetosulfuron được biết là an toàn dùng cho lúa, lúa mì, lúa mạch (liều thích hợp: 10 đến 40 g a.i./ha), và cỏ (liều thích hợp: 50 đến 200g a.i./ha) khi xử lý đất trồng và lá và thể hiện tác dụng diệt cỏ tuyệt vời đối với các loại cỏ khác nhau như cỏ lá rộng, cỏ lá hẹp, cỏ lác, cỏ hàng năm, và cỏ lâu năm.

Tuy nhiên, vẫn còn vấn đề trong việc đảm bảo độ ổn định của chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm hoạt chất diệt cỏ này của lớp sulfonylure. Cụ thể, do độ ổn định của chế phẩm cô dạng huyền phù (SC) còn bị giảm giá trị do thủy phân khi được bảo quản ở nhiệt độ cao, nên khó bảo quản chế phẩm SC trong một thời gian dài.

Tài liệu kỹ thuật liên quan

Tư liệu Patent

Patent Hàn Quốc số 10-0399366

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

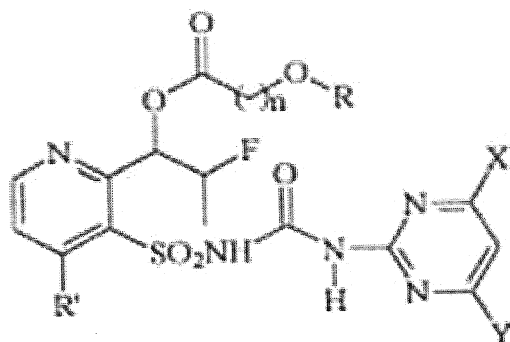
Vấn đề kỹ thuật

Do đó, mục đích của sáng chế là giải quyết các vấn đề nêu trên, và một mục đích của sáng chế là đề xuất chế phẩm thuốc diệt cỏ chứa hoạt chất diệt cỏ thuộc lớp sulfonylure, chế phẩm thuốc diệt cỏ này có độ ổn định tuyệt vời cùng với hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời và như vậy có khả năng bảo quản được trong một thời gian dài.

Giải pháp kỹ thuật

Một khía của sáng chế là đề xuất chế phẩm thuốc diệt cỏ, bao gồm hợp chất pyridin sulfonylure được đại diện bằng Công thức 1 dưới đây làm thành phần hoạt tính, hợp chất pyridin sulfonylure là hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo, hỗn hợp chất đồng phân này chứa dạng erythro bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn:

[Công thức 1]



trong đó n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 3, R là nguyên tử hydro hoặc nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, R' là nguyên tử hydro, nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkyl có từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon, nhóm halogen, hoặc nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, và mỗi X và Y độc lập là nhóm alkyl có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, hoặc nhóm halogen.

Hiệu quả có lợi

Theo sáng chế, sáng chế đề xuất chế phẩm thuốc diệt cỏ có tác dụng diệt cỏ tuyệt vời và tốc độ phân hủy thấp thậm chí khi được bảo quản ở nhiệt độ cao trong khoảng thời gian dài, cụ thể, có độ ổn định tuyệt vời thậm chí trong chế phẩm cô dạng huyền phù (SC).

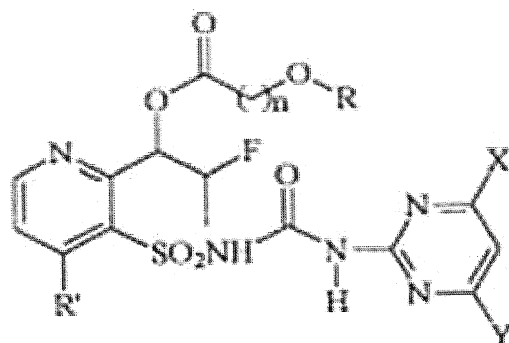
Mô tả chi tiết sáng chế

Cách thức thực hiện sáng chế

Bây giờ, sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn để giúp hiểu sáng chế. Các thuật ngữ hoặc các từ ngữ được sử dụng trong bản mô tả và trong các điểm yêu cầu bảo hộ dưới đây sẽ không bị giới hạn theo nghĩa thông thường hoặc theo từ điển, mà có nghĩa và khái niệm tương ứng với các khía cạnh kỹ thuật của các phương án theo sáng chế sao cho thể hiện một cách thích hợp nhất các phương án thực hiện của sáng chế.

Chế phẩm thuốc diệt cỏ của sáng chế bao gồm hợp chất pyridin sulfonylure được đại diện bằng Công thức 1 dưới đây làm thành phần hoạt tính, hợp chất pyridin sulfonylure là hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo, hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn:

[Công thức 1]



trong đó n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 3, R là nguyên tử hydro hoặc nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, R' là nguyên tử hydro, nhóm alkyl có từ 1 đến 4 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkyl có từ 1 đến 3 nguyên tử cacbon, nhóm halogen, hoặc nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, và mỗi X và Y độc lập là nhóm alkyl có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, hoặc nhóm halogen.

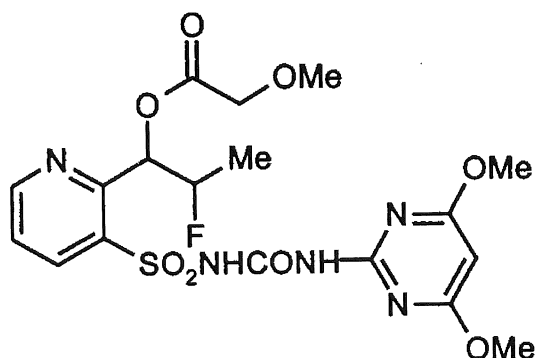
Tốt hơn là, trong Công thức 1, n có thể là số nguyên bằng 1 hoặc 2, R có thể là nguyên tử hydro hoặc nhóm metyl, R' có thể là nguyên tử hydro, nhóm halogen, hoặc nhóm metyl, và mỗi X và Y có thể là nhóm metoxy.

Tốt hơn nữa là, trong Công thức 1, n có thể là số nguyên bằng 1 hoặc 2, R có thể là metyl, R' có thể là nguyên tử hydro, Cl, Br, hoặc nhóm metyl, và mỗi X và Y có thể là metoxy.

Hợp chất pyridin sulfonylure được đại diện bằng Công thức 1 có thể là, ví dụ, ít nhất một hợp chất được chọn từ nhóm bao gồm N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-metox yaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-hydroxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-(3-hydroxypropion)oxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-(3-metoxypion)oxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-metyl-2-(2-flo-1-metox yaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-clo-2-(2-flo-1-metox yaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, và N-[(4,6-dimetoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-bromo-2-(2-flo-1-metox yaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit.

Tốt hơn là, hợp chất pyridin sulfonylure được đại diện bằng Công thức 1 có thể là hợp chất [tên ISO được đề xuất: fluxetosulfuron] được đại diện bằng Công thức 2 dưới đây:

Công thức 2



Vì hợp chất này được đại diện bằng Công thức 1 bao gồm hai nguyên tử cacbon bất đối, hợp chất này có thể có mặt ở dạng của chất đồng phân erythro hoặc chất đồng phân threo.

Chế phẩm thuốc diệt cỏ của sáng chế bao gồm hợp chất được đại diện bằng Công thức 1 làm hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo. Trong bản mô tả này, dạng erythro được bao gồm với lượng bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn dựa trên tổng khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân này. Tốt hơn là, dạng erythro có thể được bao gồm với lượng bằng 95% khối lượng hoặc nhiều hơn dựa trên tổng khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân này. Tốt hơn nữa là, dạng erythro có thể được bao gồm với lượng bằng 95% khối lượng đến 99% khối lượng dựa trên tổng khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân này.

Vì dạng erythro được bao gồm với lượng bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn dựa trên tổng khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân này chứa dạng erythro và dạng threo, thể hiện hoạt tính diệt cỏ tuyệt vời và độ ổn định được đảm bảo do tốc độ phân hủy thấp thậm chí khi được bảo quản ở nhiệt độ cao trong khoảng thời gian dài.

Khi chỉ bao gồm dạng erythro của hợp chất được đại diện bằng Công thức 1, thì hiệu quả sản xuất giảm đáng kể. Khi được bao gồm dạng threo của hợp chất được đại diện bằng Công thức 1, thì hoạt tính diệt cỏ giảm, và tốc độ phân hủy tăng đáng kể, do đó làm giảm độ ổn định. Ngoài ra, khi hợp chất được đại diện bằng Công thức 1 có mặt dưới dạng hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo, nhưng hàm lượng của dạng erythro trong hỗn hợp chất đồng phân này là nhỏ hơn 92% khối lượng, thì hoạt tính diệt cỏ giảm xuống, và tốc độ phân hủy tăng. Cụ thể, trong trường hợp chế phẩm lỏng, độ ổn định của nó giảm tiếp do sự thủy phân, nhờ đó khó bảo quản chế phẩm này ở nhiệt độ cao trong một thời gian dài.

Trong sáng chế này, chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm hỗn hợp chất đồng phân của hợp chất được đại diện bằng Công thức 1 nhìn chung có thể được sử dụng ở dạng chế phẩm thuốc diệt cỏ. Chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm hỗn hợp chất đồng phân này có thể còn bao gồm chất mang, chất hoạt động bề mặt, hoặc chất phụ gia, nhìn chung được sử dụng trong lĩnh vực bào chế, khi cần, và có thể được sử dụng ở các dạng bào chế khác nhau. Mỗi chất mang và chất phụ gia có thể là chất rắn hoặc chất lỏng, cụ thể là thành phần hữu ích được sử dụng trong lĩnh vực chế phẩm, chẳng hạn, chất vô cơ tự nhiên hoặc tổng hợp, dung môi, chất phân tán, tác nhân làm ẩm, chất kết dính, chất làm đặc, tác nhân liên kết, v.v.

Ví dụ, chế phẩm thuốc diệt cỏ có thể được điều chế thành ít nhất một chế phẩm được chọn từ nhóm bao gồm chất cô dạng huyền phù, dầu rải, bột có thể làm ẩm, hạt dễ phân tán được trong nước, bột có thể phân tán, bột dạng bụi, hạt nhỏ, hạt, và viên nén. Tốt hơn là, chế phẩm thuốc diệt cỏ có thể là chất cô dạng huyền phù. Khi chế phẩm thuốc diệt cỏ là chất cô dạng huyền phù, chế phẩm thuốc diệt cỏ này có thể còn bao gồm chất đệm, chất hoạt động bề mặt, và hỗn hợp chống đóng băng. Trong trường hợp của chất cô dạng huyền phù, quy trình sản xuất nó tương đối đơn giản, thân thiện với môi trường, và đơn giản và hiệu quả để phun chất cô này, nhưng độ ổn định của nó giảm do sự phân hủy bởi thủy phân. Tuy nhiên, vì dạng erythro được bao gồm với lượng bằng 92% khối lượng hoặc nhiều hơn trong hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo của chế phẩm thuốc diệt cỏ của sáng chế, độ ổn định được tăng lên đáng kể. Do vậy, sự phân hủy do sự thủy phân của chế phẩm cô dạng huyền phù này giảm xuống và có thể bảo quản chế phẩm này ở nhiệt độ cao trong một thời gian dài.

Chế phẩm thuốc diệt cỏ có thể được điều chế thành các công thức khác nhau, ví dụ, bằng cách trộn và/hoặc tán thành bột các thành phần hữu hiệu bằng dung môi, chất mang rắn, chất hoạt động bề mặt hoặc các chất phụ gia khác theo các phương pháp đã biết.

Để làm dung môi, các hydrocacbon thơm, chẳng hạn, hỗn hợp xylen hoặc naphtalen được thể; các rượu và các glycol như etanol, etylen glycol, etylen glycol monometyl ete, hoặc etylen glycol monoetyl ete và các ete và các este của nó; các keton như xyclohexanon, các dung môi phân cực mạnh như N-metyl-2-pyrrolidon, dimetyl sulfoxit, và dimetylformamit, các dầu thực vật đã được epoxit hóa hoặc chưa được epoxit hóa như dầu dừa được epoxit hóa và dầu đậu tương; hoặc nước có thể được sử dụng. Dung môi này có thể được dùng làm dung môi cho chế phẩm lỏng hoặc đồng dung môi cho chế phẩm dạng hạt.

Để làm ví dụ về chất mang rắn nhìn chung được sử dụng trong bột dạng bụi và chế phẩm dạng hạt, có các khoáng chất tự nhiên được tán thành bột như bột talc, cao lanh, montmorillonit, pyrophyllit, bentonit, và canxi cacbonat, các chất mang hấp phụ như zeolit, và cát. Ngoài ra, các nguyên liệu vô cơ hoặc hữu cơ đã được tán thành bột trước khác nhau có thể được sử dụng.

Chất hoạt động bề mặt có thể được chọn từ các chất hoạt động bề mặt dạng không ion, dạng cation và/hoặc dạng anion, thể hiện các đặc tính phân tán, làm ẩm, và làm trơn thích hợp, tùy thuộc vào các đặc tính của hợp chất được đại diện bằng Công thức 1 cần được tạo chế phẩm.

Đối với phương pháp dùng được ưu tiên hơn, chế phẩm thuốc diệt cỏ bao gồm hỗn hợp chất đồng phân của hợp chất được đại diện bằng Công thức 1, có phương pháp làm ẩm môi trường sống của thực vật bằng chế phẩm lỏng hoặc phương pháp đưa thành phần hoạt tính ở dạng rắn chẳng hạn dạng chế phẩm dạng hạt, vào đất (xử lý đất) để đến được cây trồng qua rễ và gốc thông qua đất hoặc nước. Theo cách khác, hoạt tính diệt cỏ của chế phẩm này có thể được thể hiện bằng cách phun trực tiếp vào lá của cây (phun lá). Tần suất và tỷ lệ dùng có thể khác nhau tùy thuộc vào các đặc tính sinh học của cây trồng, khí hậu, và môi trường đất.

Sau đây, các phương án cụ thể của sáng chế sẽ được mô tả. Tuy nhiên, cần được hiểu rằng các phương án không được đưa ra để làm giới hạn phạm vi của sáng chế và tất cả các phương án thay thế và các cải biến nằm trong phạm vi của các điểm yêu cầu bảo hộ kèm theo được bao gồm trong sáng chế này. Do vậy, các phương án cụ thể dưới đây sẽ được mô tả một cách kỹ lưỡng cho mục đích minh họa, và các quy trình và các khía cạnh sẽ được đưa ra để hiểu dễ hơn.

Các ví dụ dưới đây được đưa ra để mô tả cho người có kỹ năng trung bình trong lĩnh vực biết làm thế nào để tạo ra các hợp chất, các hợp phần, và các phương pháp được tạo ra và được đánh giá, chỉ cho mục đích minh họa. Do vậy, các ví dụ dưới đây không được dự định để làm giới hạn phạm vi của sáng chế. Có nhiều biến đổi và sự kết hợp của các điều kiện mà có thể được sử dụng để làm tối ưu hóa các điều kiện phản ứng, nồng độ của các thành phần, dung môi mong muốn, các hỗn hợp dung môi, nhiệt độ, áp suất, các thông số phản ứng khác, và các đặc tính của sản phẩm như độ tinh khiết và sản lượng. Các thông số này được xem là được bao gồm trong phạm vi của sáng chế. Sự kết hợp bất kỳ của tất cả các phương án có thể được bao gồm trong sáng chế này trừ khi có quy định theo cách khác ở đây hoặc theo cách trái ngược hẳn theo ngữ cảnh.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Ví dụ 1

Nước được bổ sung vào K_2HPO_4 và KH_2PO_4 để điều chế tổng cộng là 1L dung dịch, bằng cách đó điều chế được dung dịch đệm phosphat 0,1M. Tiếp theo 3,0 phần khối lượng CR-DOS70P (di(2-etylhexyl)sulfosuxinat, muối natri, Cas No. 577-11-7), 1,0 phần khối lượng của NK-SU500 (sucroza laurat, Cas No. 25339-99-5), và 0,2 phần khối lượng của SAG-622 làm chất khử bọt (được sản xuất bởi công ty Momentive) được bổ sung vào 65,8 phần khối lượng của dung dịch đệm, tiếp theo là trộn đủ. Ở trạng thái được trộn đồng nhất, 10,0 phần khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân bao gồm 96% khối lượng của dạng erythro của hợp chất 1-(3-{{[(4,6-dimetoxy-pyrimidin-2-yl)carbamoyl]sulfamoyl}-2-pyridinyl)-2-flopropyl metoxyaxetat (fluxetosulfuron, FTS) và 4% khối lượng của dạng threo của hợp chất này được bổ sung vào hỗn hợp, tiếp theo là trộn đủ bằng cách sử dụng dụng cụ khuấy. Các hạt thủy tinh được cho vào hỗn hợp tạo ra để thực hiện việc tán thành bột. Việc tán thành bột này được thực hiện cho đến khi cỡ hạt trung bình đạt đến kích thước 1 đến 2 μm . Như vậy, phần ẩm được điều chế.

Tiếp theo là bổ sung 0,1 phần khối lượng của X.G (gôm xanthan, Cas No. 11138-66-2) và 0,2 phần khối lượng của M.V [5-clo-2-metyl-4-isothiazolin-3-on (Cas No. 26172-55-4) và 2-metyl-4-isothiazolin-3-on (Cas No. 2682-20-4)] vào 3,0 phần khối lượng của P.G (propylen glycol, Cas No. 57-55-6), sau đó trộn đủ trong khi khuấy. Tiếp theo là bổ sung 16,7 phần khối lượng của dung dịch đệm phosphat 0,1 M vào, sau đó trộn đủ trong khi khuấy. Do vậy, phần đã được làm đặc được điều chế.

Tiếp theo là bổ sung 30 phần khối lượng của phần đã được làm đặc vào 70 phần khối lượng của phần ẩm, sau đó trộn đủ trong khi khuấy. Do vậy, điều chế được chế phẩm thuốc diệt cỏ có chế phẩm cô dạng huyền phù.

Ví dụ 2

Chế phẩm thuốc diệt cỏ có chế phẩm cô dạng huyền phù được điều chế theo phương pháp giống như trong Ví dụ 1, ngoại trừ hỗn hợp chất đồng phân bao gồm 92% khối lượng của dạng erythro của hợp chất FTS và 8% khối lượng của dạng threo của hợp chất này được sử dụng.

Ví dụ 3

15 phần khối lượng của CR-PE62 (polyetylen-polypropylen glycol, Cas No. 9003-11-6) được hấp phụ trên 20 phần khối lượng của xelit 281 (diatomit được canxi hóa, Cas No. 91053-39-3), và sau đó 10 phần khối lượng của hỗn hợp chất đồng phân bao gồm 96% khối lượng của dạng erythro của hợp chất 1-(3-[(4,6-dimethoxy-pyrimidin-2-yl)carbamoyl]sulfamoyl)-2-pyridinyl)-2-flopropyl methoxyacetat (fluxetosulfuron, FTS) và 4% khối lượng của dạng threo của hợp chất này, 2 phần khối lượng của NK-EFW (axit 2-naphtalensulfonic, polyme với formaldehyt, muối natri, Cas No. 36290-04-7), 3 phần khối lượng của NK-D425 (axit 2-naphtalensulfonic, polyme với formaldehyt, muối natri, Cas No. 36290-04-7), 1 phần khối lượng của CR-SDS (natri dodecyl sulfat, Cas No. 151-21-3), và 10 phần khối lượng của CR-UF100F (nhựa ure-formaldehyt (CAS no.9011-05-6)) được trộn lẫn. Tiếp theo, bột talc, là phần còn lại, được trộn lẫn sao cho tổng lượng của chế phẩm này bằng 100 phần khối lượng, tiếp theo là nghiền thành bột bằng cách sử dụng máy nghiền bột siêu mịn. Bổ sung 10 đến 12 phần khối lượng của nước vào hỗn hợp đã được tán thành bột, tiếp theo là nhào, tạo hạt bằng cách sử dụng máy tạo hạt, và sau đó làm khô bằng khí nóng ở nhiệt độ khoảng 80°C. Do vậy, điều chế được chế phẩm thuốc diệt cỏ dạng hạt dễ phân tán được trong nước chế phẩm.

Ví dụ so sánh 1

Chế phẩm thuốc diệt cỏ có chế phẩm cô dạng huyền phù được điều chế theo phương pháp giống như trong Ví dụ 1, ngoại trừ sử dụng hỗn hợp chất đồng phân bao gồm dạng erythro của FTS với lượng bằng 88% khối lượng và dạng threo của hợp chất này với lượng bằng 12% khối lượng.

Ví dụ so sánh 2

Chế phẩm thuốc diệt cỏ có chế phẩm cô dạng huyền phù được điều chế theo phương pháp giống như trong Ví dụ 1, ngoại trừ sử dụng hỗn hợp chất đồng phân bao gồm dạng erythro của FTS với lượng bằng 85% khối lượng và dạng threo của hợp chất này với lượng bằng 15% khối lượng.

Ví dụ so sánh 3

Chế phẩm thuốc diệt cỏ có hạt dễ phân tán được trong nước, chế phẩm được điều chế theo phương pháp giống như trong Ví dụ 3, ngoại trừ sử dụng hỗn

hợp chất đồng phân bao gồm dạng erythro của FTS với lượng bằng 88% khối lượng và dạng threo của hợp chất này với lượng bằng 12% khối lượng.

Ví dụ thử nghiệm: Đánh giá độ ổn định khi lưu giữ của chế phẩm thuốc diệt cỏ

Để đánh giá độ ổn định khi lưu giữ của các chế phẩm thuốc diệt cỏ của các Ví dụ 1 đến 3 và các Ví dụ so sánh 1 đến 3, khoảng 100 g của mỗi mẫu chất lỏng được nạp vào trong chai bằng nhựa được làm từ polyetylen (PE), và các mẫu dạng hạt được nạp vào vỏ phôi bằng bạc, sau đó là gắn kín. Tiếp theo, mỗi vỏ được bảo quản trong vi sóng được duy trì ở nhiệt độ $54(\pm 2)^{\circ}\text{C}$ trong 4 tuần, và sau đó giá trị vùng của thành phần hoạt tính được đo bằng cách sử dụng HPLC (được sản xuất bởi công ty Waters) để đánh giá tốc độ phân hủy. Các kết quả được tóm tắt trong Bảng 1 dưới đây.

Điều kiện phân tích HPLC là như sau:

Cột: 100 mm×4,6 mm đường kính trong cột “Capcell Pak” C18, hạt 3 μm

Pha động: axetonitril/nước (0,02 M amoni axetat + 0,1 M axit axetic) = 32/68

Dòng chảy: 1,0 mL/phút.

Nhiệt độ cột: 30°C

Thể tích bơm: 10 μl

Bước sóng phát hiện: 254 nm

Thời gian chạy: 20 phút.

Bảng 1

	Tốc độ phân hủy (%) sau khi bảo quản trong bốn tuần ở 54°C
Ví dụ 1	6,89
Ví dụ 2	9,82
Ví dụ 3	13,63

Ví dụ so sánh 1	9,94
Ví dụ so sánh 2	12,24
Ví dụ so sánh 3	17,85

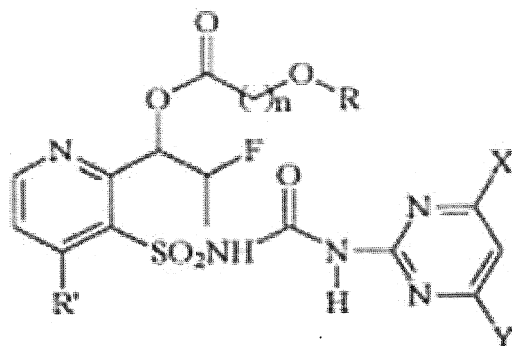
YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chế phẩm thuốc diệt cỏ, chứa hợp chất pyridin sulfonylurea, làm thành phần hoạt tính được đại diện bằng công thức 1 dưới đây,

hợp chất pyridin sulfonylure là hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro và dạng threo,

hỗn hợp chất đồng phân chứa dạng erythro với lượng bằng 95% khối lượng đến 99% khối lượng:

[Công thức 1]



trong đó n là số nguyên nằm trong khoảng từ 1 đến 3,

R là nguyên tử hydro hoặc nhóm alkyl có 1 đến 4 nguyên tử cacbon,

R' là nhóm hydro, nhóm alkyl có 1 đến 4 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkyl có 1 đến 3 nguyên tử cacbon, nhóm halogen, hoặc nhóm alkoxy có 1 đến 2 nguyên tử cacbon, và

mỗi X và Y độc lập là nhóm alkyl có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm alkoxy có từ 1 đến 2 nguyên tử cacbon, nhóm haloalkoxy có 1 đến 2 nguyên tử cacbon, hoặc nhóm halogen.

2. Chế phẩm thuốc diệt cỏ theo điểm 1, trong đó, trong công thức 1, n là số nguyên bằng 1 hoặc 2,

R là nguyên tử hydro hoặc nhóm methyl,

R' là nhóm hydro, nhóm halogen, hoặc nhóm methyl, và

mỗi X và Y là nhóm metoxy.

3. Chế phẩm thuốc diệt cỏ theo điểm 1, trong đó, trong công thức 1, n là số nguyên bằng 1 hoặc 2,

R là methyl,

R' là nhóm hydro, Cl, Br, hoặc nhóm methyl, và

mỗi X và Y là methoxy.

4. Chế phẩm thuốc diệt cỏ theo điểm 1, trong đó hợp chất pyridin sulfonylure được đại diện bằng công thức 1 có ít nhất được chọn từ nhóm bao gồm N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-methoxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-hydroxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-(3-hydroxypropion)oxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-2-(2-flo-1-(3-methoxypropion)oxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-methyl-2-(2-flo-1-methoxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-chloro-2-(2-flo-1-methoxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit, và N-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)aminocarbonyl]-4-bromo-2-(2-flo-1-methoxyaxetoxy-n-propyl)pyridin-3-sulfonamit.

5. Chế phẩm thuốc diệt cỏ theo điểm 1, trong đó chế phẩm thuốc diệt cỏ được điều chế thành ít nhất một chế phẩm được chọn từ nhóm bao gồm chất cô dạng huyền phù, dầu rải, bột có thể làm ẩm, hạt dễ phân tán được trong nước, bột có thể phân tán, bột dạng bụi, hạt nhỏ, hạt, và viên nén.

6. Chế phẩm thuốc diệt cỏ theo điểm 1, trong đó chế phẩm thuốc diệt cỏ được điều chế thành chế phẩm của chất cô dạng huyền phù (SC) mà còn bao gồm chất đệm, chất hoạt động bề mặt và hỗn hợp chống đóng băng.