

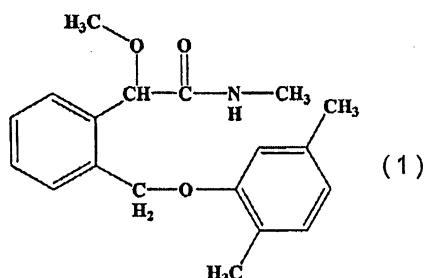


(12) BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ
(19) Cộng hòa xã hội chủ nghĩa Việt Nam (VN) (11)
CỤC SỞ HỮU TRÍ TUỆ 1-0021488
(51)⁷ A01N 25/26, 37/18 (13) B

(21) 1-2011-00726 (22) 17.09.2009
(86) PCT/JP2009/066837 17.09.2009 (87) WO2010/032873A1 25.03.2010
(30) 2008-241610 19.09.2008 JP
(45) 26.08.2019 377 (43) 25.07.2011 280
(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 Japan
(72) TAKAISHI, Masanao (JP), KURAHASHI, Makoto (JP)
(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) PHƯƠNG PHÁP BẢO VỆ CÂY TRỒNG VÀ HẠT GIỐNG ĐƯỢC XỬ LÝ BẰNG
HỢP CHẤT AXIT ALPHA-METOXYPHENYLAXETIC

(57) Sáng chế đề cập đến phương pháp bảo vệ cây trồng khỏi các bệnh thực vật
và hạt giống được xử lý bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α-
methoxyphenylaxetic có công thức (1):



Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến phương pháp bảo vệ cây tròng và hạt giống được xử lý bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Hợp chất axit phenylaxetic thê ở vị trí α thường đã được biết đến là một thành phần hoạt tính của thuốc diệt nấm (ví dụ, xem tài liệu sáng chế 1).

Tài liệu sáng chế 1: công bố đơn quốc tế số WO 95/27,693.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Vấn đề cần được giải quyết

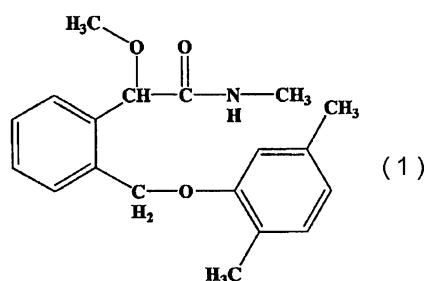
Mục đích của sáng chế là đề xuất hợp chất dùng để xử lý hạt giống có hiệu quả phòng trừ tốt các bệnh thực vật và phương pháp bảo vệ cây tròng khỏi các bệnh thực vật.

Các phương pháp giải quyết vấn đề

Sáng chế đề xuất phương pháp bảo vệ cây tròng khỏi các bệnh thực vật bằng cách xử lý hạt giống của cây tròng bằng hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) dưới đây và chế phẩm dùng để xử lý hạt giống để sử dụng trong phương pháp này.

Sáng chế dưới đây bao gồm các đối tượng sau:

[1] Chế phẩm dùng để xử lý hạt giống chứa hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) dưới đây làm hoạt chất:



2. Phương pháp bảo vệ cây trồng khỏi bệnh thực vật, trong đó phương pháp này bao gồm xử lý hạt giống cây trồng bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) theo mục 1.

3. Phương pháp bảo vệ cây trồng theo mục 2, trong đó cây trồng là hạt giống hoặc củ của các cây họ lúa (gramineous), cây họ đậu (legume), cây họ cải (brassicaceous), cây họ rau muối (chenopodiaceous), cây họ bông (malvaceous) hoặc cây họ cà (solanaceae).

4. Hạt giống hoặc củ của cây đã được xử lý bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) theo mục 1.

5. Sử dụng hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) theo mục 1 để xử lý hạt giống nhằm bảo vệ cây trồng khỏi các bệnh thực vật.

Cây trồng có thể được bảo vệ khỏi các bệnh thực vật bằng việc xử lý hạt giống hoặc củ của cây trồng với chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế.

Mô tả chi tiết sáng chế

Hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) để sử dụng trong sáng chế đã được mô tả. Dưới đây là các dạng hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1).

Hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) gồm các chất đồng phân như các chất đồng phân lập thể như các chất đồng phân quang học được tạo nên từ một nguyên tử cacbon không đối xứng và chất hỗn biến. Chất đồng phân bất kỳ cũng có thể được sử dụng riêng hoặc trong hỗn hợp với tỷ lệ chất đồng phân bất kỳ theo sáng chế.

Một vật liệu hoạt tính quang học hoặc một thể triệt quang của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) có thể được sử dụng theo sáng chế.

Hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) có thể ở dạng solvat (ví dụ, hydrat). Nó có thể được sử dụng ở dạng solvat theo sáng chế.

Hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) có thể ở dạng tinh thể và/hoặc dạng vô định hình. Nó có thể được sử dụng ở dạng bất kỳ theo sáng

chế.

Hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) là một hợp chất được mô tả trong Công bố đơn quốc tế số WO95/27,693. Các hợp chất này có thể được tổng hợp, ví dụ, bằng phương pháp đã được mô tả trong tài liệu đó.

Chất xử lý hạt giống theo sáng chế có thể được sử dụng, ví dụ, cho hạt hoặc củ của các cây trồng dưới đây. Ở đây, củ có nghĩa là củ, cây thân hành, thân rễ, cuống cây thân củ, rễ cây thân củ, rễ chổng.

Ví dụ về cây trồng là như sau:

Cây trồng: ngô, lúa gạo, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, lúa miến, bông, đậu tương, lạc, kiều mạch, củ cải đường, hạt cải dầu, hướng dương, mía, thuốc lá, v.v.;

Rau: rau thuộc họ cà (cà tím, cà chua, ớt, hò tiêu, khoai tây, v.v.), rau thuộc họ bầu bí (dưa chuột, bí ngô, bí ngô xanh (bí ngòi), dưa hấu, dưa, bí, v.v.), rau thuộc họ cải (củ cải Nhật, củ cải trắng, cải ngựa, su hào, bắp cải Trung Quốc, bắp cải, mù tạt, bông cải xanh, súp lơ, v.v.), rau thuộc họ cúc (cây ngưu bàng, cải cúc (tần ô), atiso, rau diếp, v.v.), rau thuộc họ huệ tây (hành lá, hành tây, tỏi, măng tây), cây thuộc họ hoa tán (cà rốt, rau mùi tây, cần tây, củ cải vàng, v.v.), cây thuộc họ rau muối (rau bina, củ cải Thụy Sĩ, v.v.), cây thuộc họ hoa môi (típ tó, bạc hà, húng quế, v.v.), dâu tây, khoai lang, củ nâu, cây mòn, v.v.,

hoa,

cây trồng lá,

cỏ phủ,

hoa quả: quả họ táo (táo, lê, lê Nhật, quả mộc qua Trung Quốc, quả mộc qua, v.v.), quả thịt (đào, mận, quả xuân đào, mai mơ, anh đào, mơ, mận khô, v.v.), quả họ cam (cam Nhật, cam, chanh, bưởi, v.v.), hạch (hạt dẻ, quả óc chó, quả phỉ, hạnh nhân, quả hồ trăn, hạt điều, hạt mắc ca, v.v.), các loại quả mọng (quả việt quất, nam việt quất, quả mâm xôi, v.v.), nho, quả hồng, ôliu, mận Nhật, chuối, cà phê, chà là, dừa, v.v..

Các loại cây khác cây ăn quả: chè, cây dâu tằm, cây ra hoa, các loại cây

bên đường (cây tần bì, cây bulo, cây sơn thù du, cây bạch đàn, cây bạch quả, cây tử đinh hương, cây gỗ thích, cây sồi Quercus, cây dương, cây họ đỗ, cây sau sau, cây tiêu huyền, cây chi cử, cây trắc bá, linh sam, cây độc càn, cây bách xù, cây thông Pinus, vân sam, cây thông đỏ), v.v..

Các cây trồng trên đây bao gồm các cây trồng, mà kháng chất úc chế HPPD như isoxaflutol, chất úc chế ALS như imazethapyr hoặc thifensulfuron-metyl, chất úc chế EPSP synthetaza, chất úc chế glutamin synthetaza, và các loại thuốc diệt cỏ như bromoxynil, dicamba, v.v. được tạo ra bởi phương pháp nhân giống cỏ điển hoặc công nghệ kỹ thuật di truyền.

Các ví dụ về cây trồng mà trong đó sức kháng bệnh được tạo ra bởi phương pháp nhân giống cỏ điển gồm Clearfield (nhãn hiệu đã được đăng ký) Canola kháng thuốc diệt cỏ imidazolinon như imazethapyr, và đậu nành STS kháng chất diệt cỏ gây úc chế ALS sunfonylurea như methyl-thifensulfuron. Hơn nữa, các ví dụ về cây trồng mà kháng bệnh được tạo ra bởi công nghệ kỹ thuật di truyền gồm ngô, đậu nành, bông, cây cải dầu kháng glyphosat và glufosinat, đã được bán trên thị trường dưới tên sản phẩm RoundupReady (nhãn hiệu đã được đăng ký), Rounup Ready 2 (nhãn hiệu đã được đăng ký), và LibertyLink (nhãn hiệu đã được đăng ký).

Các loại cây trồng trên đây bao gồm các loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền bằng cách sử dụng kỹ thuật di truyền, ví dụ, có thể tổng hợp các độc tố chọn lọc như đã được biết ở giống *Bacillus*.

Ví dụ về các loại độc tố có trong các loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền bao gồm: các protein trừ sâu có nguồn gốc từ *Bacillus cereus* hoặc *Bacillus popilliae*; δ-endotoxin như là Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 hoặc Cry9C, có nguồn gốc từ *Bacillus thuringiensis*; các protein trừ sâu như VIP1, VIP2, VIP3 hoặc VIP3A; protein trừ sâu có nguồn gốc từ giun tròn; độc tố sinh ra từ động vật, như nọc độc bọ cạp, nọc độc nhện, nọc độc ong, hoặc độc tố thần kinh đặc trưng của côn trùng; độc tố nấm mốc; lectin thực vật; chất ngưng kết; chất úc chế proteaza như chất úc chế tripxin, chất úc chế serin proteaza, patatin, cystatin, hoặc chất úc chế papain; protein bất

hoạt ribosom ở thực vật (RIP) như lysin, corn-RIP, abrin, luffin, saporin, hoặc briodin; enzym chuyển hóa xteoit như 3-hydroxysteroid oxidaza, enzym vận chuyển ecdysteroid-UDP-glucosyl, hoặc cholesterol oxidaza; chất ức chế hormon lột xác; men khử HMG-COA; chất ức chế kênh ion như chất ức chế kênh muối hoặc chất ức chế kênh canxi; hormon esteraza chưa trưởng thành; thụ thể hormon lợi tiểu; enzym xtinben syntaza; bibenzyl syntaza; chitinaza; và glucanaza.

Hơn nữa, độc tố có trong cây trồng được tạo ra về mặt di truyền cũng bao gồm: các độc tố lai của các protein δ-endotoxin như Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 hoặc Cry9C, và các protein trừ sâu như VIP1, VIP2, VIP3 hoặc VIP3A; độc tố xóa bỏ tùng phần; và các độc tố biến đổi. Các độc tố lai được tạo ra từ sự kết hợp mới của các miền khác nhau của protein, bằng cách sử dụng kỹ thuật di truyền. Như một độc tố xóa bỏ tùng phần, Cry1Ab đã được biết rõ bao gồm xóa bỏ một phần trình tự axit amin. Một độc tố biến đổi được tạo ra bằng việc thay thế một hoặc nhiều axit amin của các độc tố tự nhiên.

Các ví dụ về độc tố và các cây trồng được tạo ra về mặt di truyền có khả năng tổng hợp các độc tố này được mô tả trong EP-A-0 374 753, Công bố đơn quốc tế số WO 93/07278, Công bố đơn quốc tế số WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, Công bố đơn quốc tế số WO 03/052073, v.v..

Các độc tố chứa trong cây trồng được tạo ra về mặt di truyền đặc biệt có thể chống lại các loại côn trùng gây hại thuộc bộ cách cứng, bộ côn trùng hai cánh, và sâu bọ cánh phần.

Ngoài ra, cây trồng được tạo ra về mặt di truyền mà bao gồm một hoặc nhiều gen kháng sinh vật gây hại và nó chứa một hoặc nhiều độc tố, và một số loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền đã được bán trên thị trường. Ví dụ về các loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền này có trong YieldGard (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống ngô chứa độc tố Cry1Ab), YieldGard Rootworm (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống ngô chứa độc tố Cry3Bb1), YieldGard Plus (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống ngô chứa độc tố Cry1Ab và Cry3Bb1), Herculex I (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống ngô chứa lớp enzym vận chuyển

phosphinotrixin N-axetyl(PAT) nhằm kháng lại độc tố Cry1Fa2 và glufosinat), NuCOTN33B (giống bông chứa độc tố Cry1Ac), Bollgard I (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống bông chứa độc tố Cry1Ac), Bollgard II (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống bông chứa độc tố Cry1Ac và Cry2Ab), VIPCOT (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống bông chứa độc tố VIP), NewLeaf (nhãn hiệu đã được đăng ký) (giống khoai tây chứa độc tố Cry3A), NatureGard (nhãn hiệu đã được đăng ký) Agrisure (nhãn hiệu đã được đăng ký) GT Advantage (giống kháng GA21 glyphosat), Agrisure (nhãn hiệu đã được đăng ký) CB Advantage (giống sâu đục ngô Bt11 (CB)), và Protecta (nhãn hiệu đã được đăng ký).

Các loại cây nêu trên cũng bao gồm các loại cây trồng được tạo ra bằng cách sử dụng kỹ thuật di truyền, mà có khả năng sản sinh ra chất kháng bệnh có hoạt tính chọn lọc.

Protein PR và các dạng tương tự đã được biết rõ như chất kháng bệnh (PRP, EP-A-0 392 225). Chất kháng bệnh này và các loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền đã sản sinh ra chúng được mô tả trong EP-A-0 392 225, công bố đơn quốc tế số WO 95/33818, EP-A-0 353 191, v.v..

Ví dụ về các chất kháng bệnh này có trong các loại cây trồng được tạo ra về mặt di truyền gồm: chất ức chế kênh ion như một chất ức chế kênh muối hoặc một chất ức chế kênh canxi (độc tố KP1, KP4 và KP6, v.v., được biết là loại độc tố được tạo ra từ nhiều virút); Xtiben syntaza; bibenzyl syntaza; chitinaza; glucanaza; protein PR; chất kháng bệnh được sinh ra từ các vi sinh vật, như chất kháng sinh peptit, là chất kháng sinh gồm một dị vòng, một nhân protein liên kết với chất kháng bệnh thực vật (gọi là gen kháng bệnh thực vật và được mô tả trong công bố đơn quốc tế số WO 03/000906).

Các loại cây trồng được đề cập ở trên có thể gồm một dòng có hai hoặc nhiều tính trạng kháng thuốc diệt cỏ, kháng côn trùng gây hại, và kháng nhiều bệnh và v.v, như được mô tả trên đây đã được đưa ra mà sử dụng công nghệ nhãn giống cổ điển hoặc công nghệ kỹ thuật di truyền; và một dòng có hai hoặc nhiều tính trạng của dòng cha mẹ được thử nghiệm qua các cây trồng được tạo ra về mặt di truyền có các đặc tính giống và khác nhau.

Chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế có hiệu quả đối với các bệnh thực vật dưới đây, chẳng hạn như:

Các bệnh của lúa nước: bệnh cháy lá (*Magnapor the grisea*), bệnh đốm lá *Helminthosporium* (*Cochliobolus miyabeanus*), bệnh khô vắn (*Rhizoctonia solani*), và bệnh lúa von (*Gibberella fujikuroi*).

Các bệnh của lúa mì: bệnh phấn trắng (*Erysiphe graminis*), bệnh rụi lá *Fusarium* (*Fusarium graminearum*, *F. avenaceum*, *F. culmorum*, *Microdochium nivale*), bệnh gỉ sắt (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*), bệnh mốc trắng (*Micronectriella nivale*), bệnh héo trắng tuyết *Typhula* (*Typhula* sp.), bệnh nấm than xốp (*Ustilago tritici*), bệnh thối rụi (*Tilletia caries*), bệnh đốm mắt (*Pseudocercospora herpotrichoides*), bệnh đốm lá (*Mycosphaerella graminicola*), bệnh vết lá (*Stagonospora nodorum*), và bệnh đốm vàng nâu (*Pyrenophora tritici-repentis*).

Các bệnh của lúa mạch: bệnh phấn trắng (*Erysiphe graminis*), bệnh rụi lá *Fusarium* (*Fusarium graminearum*, *F. avenaceum*, *F. culmorum*, *Microdochium nivale*), bệnh gỉ sắt (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. hordei*), bệnh nấm than xốp (*Ustilago nuda*), bệnh rộp lá (*Rhynchosporium secalis*), bệnh màng lá (*Pyrenophora teres*), bệnh đốm lá (*Cochliobolus sativus*), bệnh vắn lá (*Pyrenophora graminea*), và bệnh chết rệp cây con *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của ngô: bệnh nấm than (*Ustilago maydis*), bệnh đốm nâu (*Cochliobolus heterostrophus*), bệnh đốm đồng (*Gloeocercospora sorghi*), bệnh gỉ sắt (*Puccinia polysora*), bệnh đốm lá xám (*Cercospora zae-maydis*), và bệnh chết rệp cây con *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của họ cam quýt: bệnh hắc tố (*Diaporthe citri*), bệnh nấm vảy (*Elsinoe fawcetti*), bệnh thối lá penicillium (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*), và bệnh mục nâu (*Phytophthora parasitica*, *Phytophthora citrophthora*).

Các bệnh của táo: bệnh rụi hoa (*Monilinia malii*), bệnh thối rụi (*Valsa ceratosperma*), bệnh phấn trắng (*Podosphaera leucotricha*), đốm lá *Alternaria* (*Alternaria alternata apple pathotype*), bệnh nấm vảy (*Venturia inaequalis*),

bệnh thối quả (*Colletotrichum acutatum*), bệnh thối ngọn (*Phytophthora cactorum*).

Các bệnh của lê: bệnh nấm vảy (*Venturia nashicola*, *V. pirina*), bệnh đốm đen (*Alternaria alternata Japanese pear pathotype*), bệnh gỉ sét (*Gymnosporangium haraeanaum*), và thối gốc chảy mủ (*Phytophthora cactorum*);

Các bệnh của đào: bệnh mục nâu (*Monilinia fructicola*), bệnh nấm vảy (*Cladosporium carpophilum*), và bệnh thối phomopsis (*Phomopsis sp.*).

Các bệnh của nho: bệnh loét cây (*Elsinoe ampelina*), bệnh thối chín (*Glomerella cingulata*), bệnh phấn trắng (*Uncinula necator*), bệnh gỉ sét (*Phakopsora ampelopsisidis*), bệnh thối đen (*Guignardia bidwellii*), bệnh mốc phấn (*Plasmopara viticola*).

Các bệnh của hồng: bệnh loét cây (*Gloeosporium kaki*), bệnh đốm lá (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*).

Các bệnh của họ bầu bí: bệnh loét cây (*Colletotrichum lagenarium*), bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca fuliginea*), bệnh rụi cuồng nhựa (*Mycosphaerella melonis*), bệnh héo úa *Fusarium* (*Fusarium oxysporum*), bệnh mốc phấn (*Pseudoperonospora cubensis*), thối mục *Phytophthora* (*Phytophthora sp.*), bệnh chết rụp cây con (*Pythium sp.*);

Các bệnh của cà chua: bệnh rụi sớm (*Alternaria solani*), mốc xám (*Cladosporium fulvum*), và bệnh rụi muộn (*Phytophthora infestans*).

Các bệnh của cà tím: đốm nâu (*Phomopsis vexans*), bệnh phấn trắng (*Erysiphe cichoracearum*).

Các bệnh của rau thuộc họ cải: bệnh đốm lá *Alternaria* (*Alternaria japonica*), bệnh đốm trắng (*Cercospora brassicae*), bệnh sưng rễ (*Plasmodiophora brassicae*), bệnh mốc phấn (*Peronospora parasitica*).

Các bệnh của hành lá: bệnh gỉ sét (*Puccinia allii*), bệnh mốc phấn (*Peronospora destructor*).

Các bệnh của đậu tương: bệnh hạt nhuộm màu tía (*Cercospora kikuchii*), bệnh sphaceloma (*Elsinoe glycines*), bệnh úa cuồng và vỏ (*Diaporthe phaseolorum var. sojae*), bệnh đốm nâu septoria (*Septoria glycines*), bệnh đốm

lá frogeye (*Cercospora sojina*), bệnh giását (*Phakopsora pachyrhizi*), bệnh úa cuống nâu (*Phytophthora sojae*), bệnh chết rạp cây con Rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của cây đậu tây: bệnh loét cây (*Colletotrichum lindemthianum*).

Các bệnh của cây lạc: bệnh đốm lá (*Cercospora personata*), bệnh đốm lá nâu (*Cercospora arachidicola*), bệnh úa héo (*Sclerotium rolfsii*).

Các bệnh của đậu Hà Lan: bệnh phấn trắng (*Erysiphe pisi*), và bệnh thối rễ (*Fusarium solani f. sp. pisi*).

Các bệnh của khoai tây: bệnh héo sóm (*Alternaria solani*), bệnh héo muộn (*Phytophthora infestans*), bệnh thối đỏ (*Phytophthora erythroseptica*) bệnh nấm vẩy phấn (*Spongospora subterranean f. sp. subterranea*).

Các bệnh của dâu tây: bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca humuli*), bệnh loét cây (*Glomerella cingulata*).

Các bệnh của cây chè: bệnh héo rộp màng (*Exobasidium reticulatum*), bệnh nấm vẩy trắng (*Elsinoe leucospila*), bệnh héo xám (*Pestalotiopsis sp.*), bệnh loét cây (*Colletotrichum theae-sinensis*).

Các bệnh của cây thuốc lá: bệnh đốm nâu (*Alternaria longipes*), bệnh phấn trắng (*Erysiphe cichoracearum*), bệnh loét cây (*Colletotrichum tabacum*), bệnh mốc phấn (*Peronospora tabacina*), bệnh cuồng đen (*Phytophthora nicotianae*).

Các bệnh của dâu hạt nho: bệnh thối sclerotinia (*Sclerotinia sclerotorum*), bệnh chết rạp cây con Rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của cây bông: bệnh chết rạp cây con Rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của củ cải đường: bệnh đốm lá Cercospora (*Cercospora beticola*), bệnh héo lá (*Thanatephorus cucumeris*), bệnh thối rễ (*Thanatephorus cucumeris*), bệnh thối rễ Aphanomyces (*Aphanomyces cochlioides*).

Các bệnh của hoa hồng: bệnh đốm đen (*Diplocarpon rosae*), bệnh phấn trắng (*Sphaerotheca pannosa*), và bệnh mốc phấn (*Peronospora sparsa*).

Các bệnh của cây thuộc họ cúc: bệnh mốc phấn (*Bremia lactucae*), bệnh

héo lá (*Septoria chrysanthemi-indici*), bệnh gỉ sét trắng (*Puccinia horiana*).

Các bệnh của nhiều nhóm: các bệnh do *Pythium* spp. gây ra (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium debarianum*, *Pythium graminicola*, *Pythium irregularare*, *Pythium ultimum*), bệnh mốc xám (*Botrytis cinerea*), và bệnh thối mục *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*).

Các bệnh của cải Nhật: bệnh đốm lá *Alternaria* (*Alternaria brassicicola*).

Các bệnh của cỏ: bệnh đốm đồng tiền (*Sclerotinia homeocarpa*), bệnh đốm nâu và đốm lớn (*Rhizoctonia solani*).

Các bệnh của chuối: bệnh nấm sigatoka (*Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella musicola*).

Các bệnh của hoa hướng dương: bệnh mốc phấn (*Plasmopara halstedii*).

Bệnh của hạt giống hoặc các bệnh xảy ra trong các giai đoạn đầu phát triển của nhiều loại cây do vi khuẩn thuộc giống *Aspergillus*, giống *Penicillium*, giống *Fusarium*, giống *Gibberella*, giống *Trichoderma*, giống *Thielaviopsis*, giống *Rhizopus*, giống *Mucor*, giống *Corticium*, giống *Phoma*, giống *Rhizoctonia* và giống *Diplodia*.

Các bệnh do virut của nhiều loại cây đều qua trung gian là giống *Polymixa* hoặc giống *Olpidium* và v.v..

Chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế được mong đợi là có hiệu quả phòng bệnh cao đặc biệt là đối với các loại bệnh thực vật thường gặp ở ngô, cây cao lương, lúa gạo, nho, đậu tương, khoai tây, củ cải đường và cây bông. Trong số các bệnh thực vật thường gặp ở các loại cây này, các bệnh thực vật có ảnh hưởng đặc biệt cao gồm bệnh do *Rhizoctonia* gây ra, bệnh do *Pythium* gây ra và bệnh do *Fusarium* gây ra.

Chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế có thể chứa hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1), nhưng hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) được trộn với chất mang trợ thích hợp để xử lý hạt giống, cùng với một chất có hoạt tính bề mặt và các chất bổ trợ điều chế khác đủ để hỗn hợp này được điều chế thành chất có dầu, nhũ tương, bột chảy được, bột thẩm nước được, bột thẩm nước kết hạt, chất bột v.v.. Hợp chất

axit α-methoxyphenylaxetic có công thức (1) được chứa trong chế phẩm dùng để xử lý hạt giống thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 99 % theo trọng lượng, tốt nhất là nằm trong khoảng từ 0,2 đến 90 % theo trọng lượng.

Các ví dụ về chất mang rắn được sử dụng trong điều chế gồm bột mịn hoặc hạt nhỏ như hạt khoáng như đất sét cao lanh, đất sét atapungit, đất sét bentonit, montmorilonit, đất sét trắng axit, đất cao lanh pyrophylit, bột talc, đất đá trầm tích và canxit; các vật liệu hữu cơ tự nhiên như bột cuống ngô, bột vỏ cây; vật liệu hữu cơ tổng hợp như ure; các loại muối như canxicacbonat và amonisunfat; các loại vật liệu vô cơ tổng hợp như oxit silic hydrat hóa nhân tạo; và như một chất mang lỏng, hydrocarbon thơm như xylen, alkylbenzen và metylnapthalen; rượu như rượu 2-propanol, rượu etylen glicol, propylen glicol, và etylen glicol monoetyl ete; keton như axeton, cyclohexanon (và isophoron; dầu thực vật như dầu đậu nành và dầu hạt bông; hydrocarbon béo thô, este, dimethyl sunfoxit, axetonitril và nước.

Các ví dụ về chất có hoạt tính bề mặt bao gồm chất có hoạt tính bề mặt ion âm như muối este sulfat alkyl, muối alkylaryl sulfonat, muối dialkyl sulfosuxinat, muối polyoxyetylen alkylaryl ete este phosphat, muối lignosulfonat và các chất đa trùng ngưng napthalen sulfonat formaldehyt; các chất có hoạt tính bề mặt không ion như polyoxyetylen alkyl aryl ete, copolyme khói polyoxyetylen alkylpolyoxypropylene và este của axit béo sorbitan và chất hoạt tính bề mặt ion dương như muối alkyltrimethylamoni.

Các ví dụ về các chất bổ trợ điều chế khác gồm polyme tan trong nước như rượu polyvinyl và polyvinylpyrrolidon (PVP), polisacarit như gôm arabic, axit alginic và muối này, CMC (carboxymethyl-xenluloza), gôm xanthan, các vật liệu vô cơ như nhôm magie silicat và sol nhôm oxit, chất bảo quản, chất tạo màu và các chất ổn định như PAP (axit phosphat isopropyl) và BHT.

Xử lý hạt giống hoặc củ theo sáng chế là, ví dụ, phương pháp xử lý hạt giống hoặc củ của cây trồng để bảo vệ cây trồng khỏi các bệnh thực vật bằng chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế, và các ví dụ cụ thể gồm xử lý bằng cách phun mà trong đó huyền phù gồm chế phẩm dùng để xử lý hạt giống

theo sáng chế được phun sương và phun lên bề mặt của hạt giống hoặc bե mặt củ; xử lý bôi là phương xử lý bằng bột thấm nước, nhũ tương, hoặc các bột chảy được hoặc tương tự chứa chế phẩm dùng để xử lý hạt giống của sáng chế hoặc được thêm vào một lượng nước nhỏ được áp dụng lên bề mặt hạt giống hoặc bե mặt củ; xử lý bằng cách ngâm mà trong đó hạt được ngâm trong dung dịch chứa chế phẩm dùng để xử lý hạt giống theo sáng chế trong một khoảng thời gian nhất định; xử lý bằng cách bao màng và xử lý bằng cách bao ngoài viêñ.

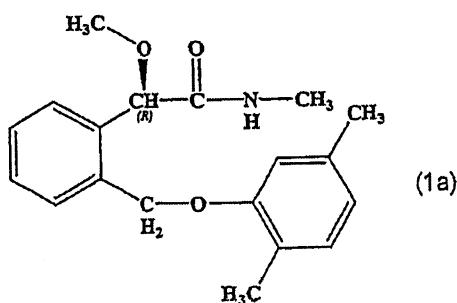
Trong trường hợp xử lý bằng cách phun, và xử lý bằng cách bôi, thì nhũ tương, bột thấm nước được hoặc huyền phù được sử dụng sau khi đã pha loãng với nước hoặc khi không được pha loãng và chất bột thường được sử dụng khi nó không bị pha loãng. Nồng độ của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) nằm trong khoảng từ 0,01 đến 99 %, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,05 đến 90 %. Tỷ lệ thể tích của hạt giống với chất lỏng xử lý nằm trong khoảng từ 1:0,0005 đến 1:0,05, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1:0,001 đến 1:0,02 với giả thiết thể tích hạt là 1. Lượng hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) được sử dụng thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 20g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 5g cho 1kg hạt giống.

Trong trường hợp xử lý bằng cách ngâm, chế phẩm thường được pha loãng với nước và được sử dụng, nồng độ của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1) thường nằm trong khoảng từ 0,0001 đến 99 %, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,001 đến 90 %. Tỷ lệ thể tích của hạt giống với dung dịch xử lý là nằm trong khoảng từ 1:1 đến 1:100, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 1:2 đến 1:20 với giả thiết thể tích hạt là 1. Thời gian ngâm từ 1 phút đến 48 giờ và nhiệt độ ngâm từ 0 đến 40°C, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 5 đến 25°C.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Dưới đây, sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn theo các ví dụ điều chế, ví dụ chế phẩm xử lý, và ví dụ thử nghiệm. Tuy nhiên, sáng chế không giới hạn ở các ví dụ này. Trong các ví dụ này, phần là phần theo trọng lượng, trừ khi có quy định cụ thể.

Hợp chất axit(R)- α -methoxyphenylaxetic (1a) có cấu trúc nguyên tử không gian loại R theo quy tắc Cahn-Ingold-Prelog có công thức (1a) dưới đây và cấu trúc raxemic (1b) của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic được sử dụng như hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1):



Ví dụ điều chế 1

2,5 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 14 phần polyoxyetylen styrylphenyl ete, 6 phần canxi dodexyl benzen sulfonat và 83,5 phần xylen được trộn kỹ, để thu được nhũ tương tương ứng.

Ví dụ điều chế 2

5 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 35 phần hỗn hợp cacbon tráng và muối polyoxyetylen alkyl ete sulfat amoni (tỷ lệ trọng lượng 1:1) và 60 phần nước được trộn, nghiền mịn hỗn hợp này theo phương pháp nghiền ướt, để thu được hợp bột chảy được tương ứng.

Ví dụ điều chế 3

5 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 1,5 phần sorbitan trioleat và 38,5 phần dung dịch chứa nước bao gồm 2 phần rượu polyvinyl được trộn, nghiền

mịn hỗn hợp này theo phương pháp nghiền ướt. Sau đó, thêm 45 phần dung dịch chứa nước bao gồm 0,05 phần gôm xanthan và 0,1 phần nhôm magie silicat vào hỗn hợp này, và thêm tiếp 10 phần glycol propylen vào. Khuấy đều hỗn hợp thu được, để thu được hỗn hợp bột chảy được tương ứng.

Ví dụ điều chế 4

40 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 5 phần glycol propylen (do Nacalai Tesque sản xuất), 5 phần SoprophorFLK (của Rhodia Nikka), 0,2 phần nhũ tương phản dạng C (do Dow Corning sản xuất), 0,3 phần proxel GXL (do Arch Chemicals sản xuất) và 49,5 phần nước trao đổi ion được trộn đều để thu được bột nhào. 150 phần hạt thủy tinh (đường kính = 1mm) được cho vào 100 phần bột nhào này, và hỗn hợp bột nhào này được nghiền trong khoảng 2 giờ trong khi được làm nguội bằng nước mát. Sau khi nghiền, hỗn hợp này được lọc bỏ hạt thủy tinh và thu được chất chảy được tương ứng.

Ví dụ điều chế 5

50 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 38,5 phần đất sét cao lanh NN (do Takehara Chemical Industrial sản xuất), 10 phần MorwetD425 và 1,5 phần MorwerEFW (do Akzo Nobel Corp. sản xuất) được trộn để thu được hỗn hợp trộn trước AI. Hỗn hợp trộn trước này được nghiền mịn bằng máy nghiền phun để thu được loại bột tương ứng.

Ví dụ điều chế 6

12,5 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 3 phần canxi lignin sulfonat, 2 phần natri lauryl sulfat và 84,5 phần silic oxit hydrat hóa tổng hợp đã nghiền hoàn toàn và được trộn để thu được bột thẩm nước được tương ứng.

Ví dụ điều chế 7

1 phần hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b), 87 phần đất sét cao lanh và 12 phần đá talc đã nghiền hoàn toàn và được trộn để thu bột tương ứng.

Ví dụ xử lý 1

Nhũ tương được điều chế trong ví dụ điều chế 1 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng 500ml/100kg hạt giống cây cao lương khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 2

Nhũ tương được điều chế theo ví dụ điều chế 1 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng 500ml/100kg hạt củ cải đường khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 3

Bột chảy được điều chế trong ví dụ điều chế 2 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng 50ml/10kg hạt nho khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 4

Bột chảy được điều chế trong ví dụ điều chế 2 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng 50ml/10kg hạt đậu nành khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 5

Bột chảy được điều chế theo ví dụ điều chế 3 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng 40ml/10kg hạt ngô khô bằng cách sử dụng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 6

Bột chảy được điều chế như trong ví dụ điều chế 3 được sử dụng để xử lý bôi với một lượng khoảng 500ml/100kg hạt ngô khô bằng cách sử dụng máy xử

lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 7

10 phần bột chảy được điều chế như trong ví dụ điều chế 4, 10 phần chất nhuộm màu BPD6135 (do Sun Chemical sản xuất) và 80 phần nước được trộn và hỗn hợp thu được này được sử dụng để xử lý bôi với một lượng khoảng 60ml/10kg hạt gạo khô bằng máy xử lý hạt quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 8

5 phần bột chảy được điều chế như trong ví dụ điều chế 4, 5 phần chất nhuộm màu BPD6135 (do Sun Chemical sản xuất) và 35 phần nước được trộn và hỗn hợp thu được này được sử dụng để xử lý bôi với một lượng khoảng 70ml/10kg lát khoai tây bằng máy xử lý hạt giống kiểu quay (máy xử lý hạt, do Hans-Ulrich sản xuất) để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 9

Bột được điều chế trong ví dụ điều chế 5 được sử dụng để xử lý bao ngoài bằng bột với một lượng khoảng 50g/10kg hạt bông khô để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ xử lý 10

1 phần bột chảy được được điều chế theo ví dụ điều chế 2 và 99 phần nước được trộn và 1kg hạt gạo đã ngâm trong 3000ml dung dịch pha loãng trong khoảng 24 giờ để thu được hạt giống đã được xử lý.

Ví dụ thử nghiệm 1

10μl dung dịch dimethylsulphoxit của hợp chất (1b) và 10g hạt giống đậu Hà Lan (Waiseiakabanakinusaya) được cho vào ống 50ml và được trộn để hợp chất (1b) dính vào bề mặt hạt giống và sau đó hỗn hợp này được để qua đêm để thu được hạt giống đã được xử lý theo sáng chế. Một bình nhựa được làm đầy

với đất cát, và gieo hạt giống đã được xử lý theo sáng chế vào đó. Sau đó, các hạt giống này được phủ đất đã được trộn với môi trường cám mà ở đó rễ bị thối trên cây đậu Hà Lan (*Fusarium solani f. sp. pisi*) được để phát triển và các cây đậu Hà Lan này sẽ được nuôi trong nhà kính ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 22 đến 24°C trong 6 ngày trong khi tưới nước thích hợp. Huyền phù bào tử của nấm thối rễ ở cây đậu Hà Lan đã được rắc lên trên rễ của các cây giống con để gây nhiễm và các cây đậu Hà Lan này được để phát triển trong nhà kính trong 6 ngày nữa, hiệu quả phòng trừ của nó được kiểm tra.

Ngoài ra, tỷ lệ mắc bệnh cũng được kiểm tra trong trường hợp hạt giống không được xử lý bằng hóa chất để tính toán giá trị phòng trừ.

Tỷ lệ mắc bệnh cũng được tính toán theo phương trình 1 và giá trị phòng trừ được tính toán theo phương trình 2 dựa trên tỷ lệ mắc bệnh.

Các kết quả thể hiện ở bảng 1.

"Phương trình 1"

Tỷ lệ mắc bệnh = $(\text{số lượng hạt không nảy mầm} + \text{số lượng cây giống con đã phát triển bệnh được quan sát}) \times 100 / (\text{tổng số hạt giống đã gieo})$

"Phương trình 2"

Giá trị phòng trừ = $100 \times (A - B) / A$

A: Tỷ lệ mắc bệnh của cây trong khu không được xử lý

B: Tỷ lệ mắc bệnh của cây trong khu được xử lý

Bảng 1

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ thành phần hoạt tính (gai/100kg hạt)	Tỷ lệ mắc bệnh	Giá trị phòng trừ
Hợp chất (1b)	10	0	100
Không được xử lý bằng hóa chất	-	33	-

Ví dụ thử nghiệm 2

Bột chảy được của hợp chất (1a) và bột chảy được của hợp chất (1b) được pha loãng với nước để tạo ra dung dịch gồm hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b). Các hạt thóc (Tanginbozu) bị mắc bệnh 'bakanae' được ngâm trong dung dịch này trong 24 giờ và sau đó, hạt thóc này được lấy ra khỏi dung dịch và để khô trong không khí để thu được hạt giống đã được xử lý. Hạt giống đã được xử lý này được ngâm trong nước ở nhiệt độ 12°C trong 4 ngày sau đó được ngâm qua đêm trong nước ở nhiệt độ 30°C. Lấy một chậu nhựa đồ dày đất cát, gieo hạt giống đã được xử lý vào đó rồi để phát triển trong nhà kính ở nhiệt độ 26°C trong 23 ngày để theo dõi giá trị phòng trừ.

Ngoài ra, tỷ lệ mắc bệnh cũng được kiểm tra trong trường hợp hạt giống không được xử lý bằng hóa chất để tính toán giá trị phòng trừ.

Tỷ lệ mắc bệnh được tính toán theo phương trình 3 và giá trị phòng trừ được tính toán dựa trên tỷ lệ mắc bệnh theo phương trình 2.

Các kết quả thể hiện ở bảng 2.

"Phương trình 3"

Tỷ lệ mắc bệnh = (số lượng cây giống con đã phát bệnh được quan sát) × 100/(tổng số cây giống con)

Bảng 2

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ thành phần hoạt tính (ppm)	Tỷ lệ mắc bệnh	Giá trị phòng trừ
Hợp chất (1b)	2000	1,3	93
Hợp chất (1b)	500	1,6	92
Hợp chất (1b)	125	1,4	93
Hợp chất (1b)	62,5	0,9	95
Không được xử lý	-	19,2	-

Ví dụ thử nghiệm 3

10μl dung dịch dimethylsulphoxit chứa hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b) và 10g hạt đậu Hà Lan (Waiseiakabanakinusaya) được đặt trong ống 50ml và được

trộn để cho hợp chất (1a) hoặc hợp chất (1b) dính vào bề mặt của hạt giống, sau đó hỗn hợp này được để qua đêm để thu được hạt giống đã được xử lý theo sáng chế. Lấy một chậu nhựa đổ đầy đất cát, gieo hạt giống đã được xử lý như sáng chế vào đó. Sau đó hạt giống được phủ lớp đất cát mà đã được trộn với môi trường cám mà ở đó rễ bị thối trên cây đậu Hà Lan (*Fusarium solani f. sp. pisi*) được để phát triển và các hạt giống đậu này sẽ được phát triển trong nhà kính ở nhiệt độ nằm trong khoảng từ 22 đến 24°C trong 6 ngày trong khi tưới nước thích hợp. Huyền phù bào tử nấm rễ bị thối trên cây đậu Hà Lan được tưới trên rễ của cây giống con để gây nhiễm và hạt giống này được để phát triển trong nhà kính trong 6 ngày nữa, khả năng kháng bệnh của nó sẽ được kiểm tra.

Ngoài ra, tỷ lệ mắc bệnh cũng được kiểm tra trong trường hợp hạt giống không được xử lý bằng hóa chất để tính toán giá trị phòng trừ. Và 2-[2-(2-methyl-phenoxyethyl)-phenyl]-2-metoxy-N-metyl-axetamit, được mô tả trong Công bố đơn quốc tế số WO 95/27,693 và được đề cập dưới đây như hợp chất A, và 2-[2-(2-clo-5-metyl-phenoxyethyl)-phenyl]-2-metoxy-N-metyl-axetamit, được mô tả trong Công bố đơn quốc tế số WO 96/07,633 và được đề cập dưới đây như hợp chất B, được sử dụng làm hợp chất tham khảo.

Tỷ lệ mắc bệnh được tính toán theo phương trình 1 và hiệu quả phòng trừ được tính toán theo phương trình 2 dựa trên tỷ lệ mắc bệnh.

Các kết quả được thể hiện trên bảng 3.

Bảng 3

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ thành phần hoạt tính (gai/100kg hạt giống)	Tỷ lệ mắc bệnh	Giá trị phòng trừ
Hợp chất (1a)	10	0	100
Hợp chất (1a)	2,5	4	97
Hợp chất (1b)	10	0	100
Hợp chất (1b)	2,5	10	81
Hợp chất A	10	7	87
Hợp chất A	2,5	23	57
Hợp chất B	10	10	81
Hợp chất B	2,5	20	62

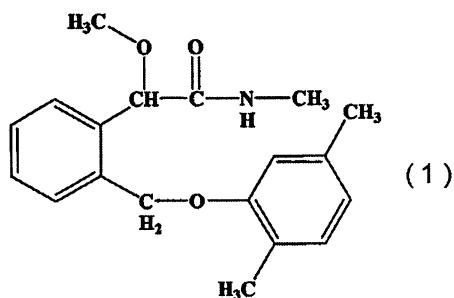
Không được xử lý	-	53	0
------------------	---	----	---

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Cây trồng được bảo vệ khỏi các bệnh thực vật bằng cách xử lý hạt giống bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1).

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Phương pháp bảo vệ cây trồng khỏi các bệnh thực vật, trong đó phương pháp này bao gồm xử lý hạt giống của cây trồng bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1):



2. Phương pháp bảo vệ cây trồng theo điểm 1, trong đó cây trồng là hạt của các cây họ lúa (gramineous), cây họ đậu (legume), cây họ cải (brassicaceous), cây họ rau muối (chenopodiaceous), cây họ bông (malvaceous) hoặc cây họ cà (solanaceae).

3. Hạt giống được xử lý bằng một lượng hữu hiệu của hợp chất axit α -methoxyphenylaxetic có công thức (1):

