(12) **BẢN MÔ TẢ SÁNG CHẾ THUỘC BẰNG ĐỘC QUYỀN SÁNG CHẾ**

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

(11) **1-0021938**

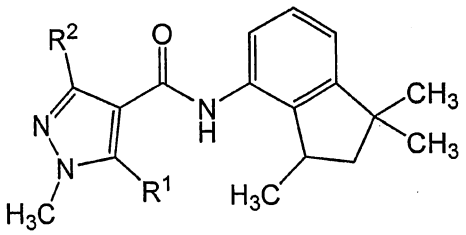
(51)[7] **A01N 43/56**, A01P 3/00, C07D 231/14

(13) **B**

(21) 1-2013-00241
(22) 20.06.2011
(86) PCT/JP2011/064604 20.06.2011
(87) WO2011/162397A1 29.12.2011
(30) 2010-143553 24.06.2010 JP
(45) 25.10.2019 379
(43) 25.04.2013 301
(73) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku, Tokyo 104-8260 Japan
(72) MATSUZAKI, Yuichi (JP), SAKAGUCHI, Hiroshi (JP)
(74) Công ty TNHH một thành viên Sở hữu trí tuệ VCCI (VCCI-IP CO.,LTD)

(54) CHẾ PHẨM KIỂM SOÁT BỆNH THỰC VẬT VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT BỆNH THỰC VẬT SỬ DỤNG CHẾ PHẨM NÀY

(57) Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật chứa hợp chất carboxamit có công thức (I) mà tỷ lệ chất đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 có hoạt tính kiểm soát tuyệt vời bệnh thực vật.



(I)

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

Sáng chế đề cập đến chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật và phương pháp kiểm soát bệnh thực vật sử dụng chế phẩm này.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật và phương pháp kiểm soát bệnh thực vật sử dụng chế phẩm này đã được biết đến (ví dụ, Công bố đơn quốc tế WO 86/02641 và WO 92/12970).

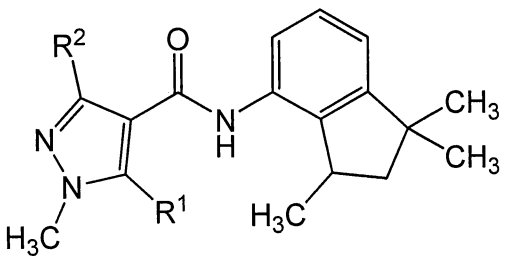
Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề xuất chế phẩm có tác dụng kiểm soát tuyệt vời bệnh thực vật.

Tác giả sáng chế đã nghiên cứu tìm ra chế phẩm có tác dụng kiểm soát tuyệt vời bệnh thực vật và đã phát hiện ra rằng chế phẩm chứa hợp chất carboxamit có công thức (I) được mô tả dưới đây trong đó cả dạng quang hoạt R và dạng quang hoạt S của hợp chất carboxamit đều có mặt ở tỷ lệ đồng phân đối ảnh quy định có tác dụng kiểm soát tuyệt vời với bệnh thực vật, dẫn đến hoàn thiện sáng chế.

Đó là, sáng chế như được mô tả dưới đây.

[1] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật chứa hợp chất carboxamit có công thức (I):



(I)

,

trong đó:

R^1 là hydro hoặc metyl,

R^2 là metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

và tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

[2] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm [1], trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit là nằm trong khoảng từ 95/5 đến 10000/1.

[3] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm [1], trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit là nằm trong khoảng từ 98/1 đến 1000/1.

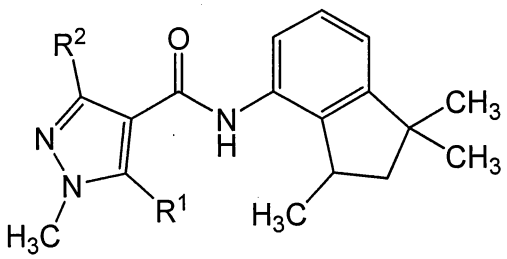
[4] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ [1] đến [3], trong đó R^1 là metyl và R^2 là metyl trong công thức (I).

[5] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ [1] đến [4], trong đó R^1 là hydro và R^2 là diflometyl trong công thức (I).

[6] Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ [1] đến [4], trong đó R^1 là hydro và R^2 là triflometyl trong công thức (I).

[7] Phương pháp kiểm soát bệnh thực vật bao gồm bước xử lý thực vật hoặc đất nơi mà thực vật mọc lên với một lượng có hiệu quả của chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ [1] đến [6].

[8] Hợp chất carboxamit có công thức (I):



(I)

,

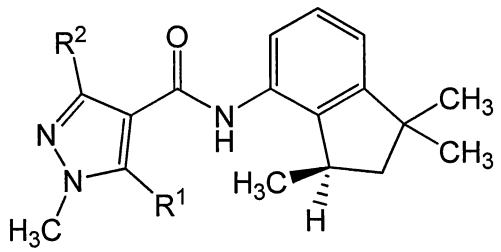
trong đó:

R^1 là hydro hoặc metyl,

R^2 là metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

và tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

[9] Hợp chất carboxamit theo điểm [8] có công thức (I-R):



(I-R)

[10] Hợp chất carboxamit theo điểm [9], trong đó hợp chất carboxamit về bản chất là đồng phân R tinh khiết của cấu hình tuyệt đối.

[11] Hợp chất carboxamit theo điểm [9], trong đó R^1 là metyl và R^2 là metyl.

[12] Hợp chất carboxamit theo điểm [9], trong đó R^1 là hydro và R^2 là diflometyl.

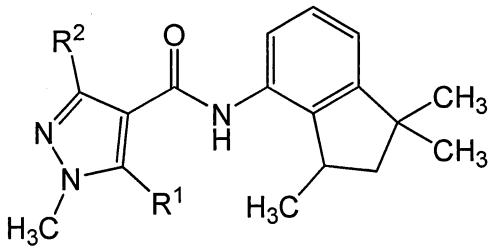
[13] Hợp chất carboxamit theo điểm [9], trong đó R^1 là hydro và R^2 là triflometyl.

Trong sáng chế, "tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1"

nghĩa là hợp chất carboxamit của đồng phân giàu R chứa 90% hoặc nhiều hơn đến 10000/1 đồng phân R căn cứ vào hỗn hợp RS.

Mô tả chi tiết sáng chế

Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật của sáng chế (sau đây, có thể được gọi là chế phẩm theo sáng chế) là chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật chứa hợp chất carboxamit có công thức (I):

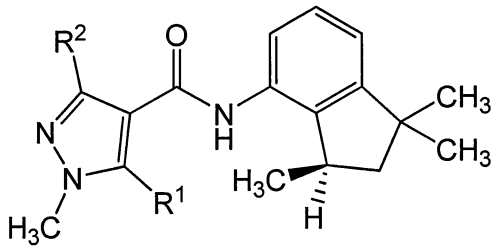


(I)

,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên,

và tỷ lệ đồng phân đối ảnh của dạng R có công thức (I-R):

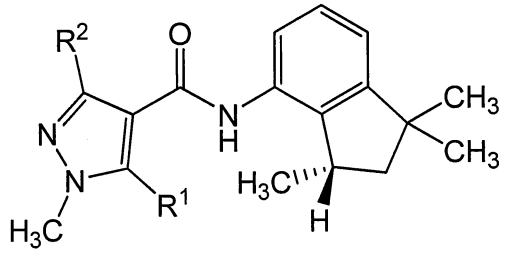


(I-R)

,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên

với dạng S có công thức (I-S):



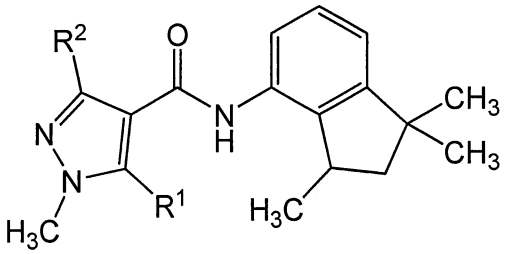
(I-S)

,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên,

căn cứ vào cacbon bất đối xứng trong chế phẩm carboxamit, nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 (= dạng R/dạng S).

Hợp chất carboxamit có công thức (I):



(I)

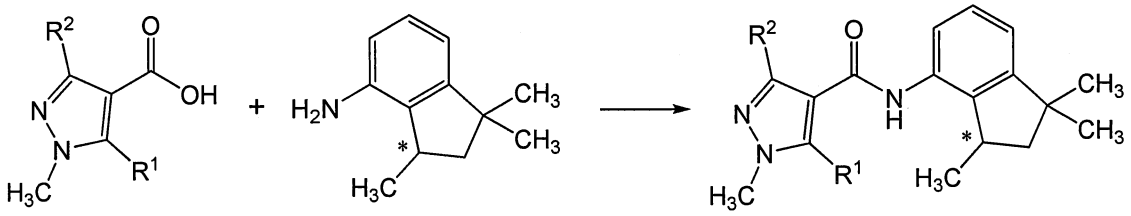
,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên,

và tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 (sau đây, có thể được gọi là chế phẩm carboxamit) sử dụng trong sáng chế thu được, ví dụ, bằng các phương pháp sản xuất dưới đây.

Phương pháp sản xuất 1

Chế phẩm carboxamit có thể được tạo ra bởi phản ứng của hợp chất (II) và hợp chất (III) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 với sự có mặt của tác nhân khử nước ngưng tụ.



(II) (III) (I*)

,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên. Tỷ lệ đồng phân đối ảnh căn cứ vào cacbon bất đối xứng được thể hiện bởi * nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 (= dạng R/dạng S).

Phản ứng thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi.

Các ví dụ của dung môi được sử dụng trong phản ứng bao gồm các ete như tetrahydrofuran (sau đây, có thể được gọi là THF), ete etylen glycol dimetyl, và ete tert-butyl metyl (sau đây, có thể được gọi là MTBE); các hydrocacbon no như hexan, heptan, và octan; các hydrocacbon thơm như toluen, và xylen; các hydrocacbon halogen hoá như clorobenzen; các este như butyl axetat, và etyl axetat; các nitril như axetonitril; các amit axit như N, N-dimetylformamit; các sulfoxit như dimetyl sulfoxit; các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin; và các hỗn hợp của nó.

Tác nhân khử nước ngưng tụ được sử dụng trong phản ứng bao gồm các cacbodiimid như 1-etyl-3-(3-dimetylaminopropyl)carbodiimit hydroclorit, và 1,3-dicyclohexylcarbodiimit; và (benzotriazol-1-yloxy)tris(dimetylamino)phosphoni hexafluorophosphat và tương tự.

Hợp chất (III) là được sử dụng với tỷ lệ thông thường nằm trong khoảng từ 0,5 đến 3mol và tác nhân khử nước ngưng tụ được sử dụng với tỷ lệ thông thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol, đối với 1mol của hợp chất (II).

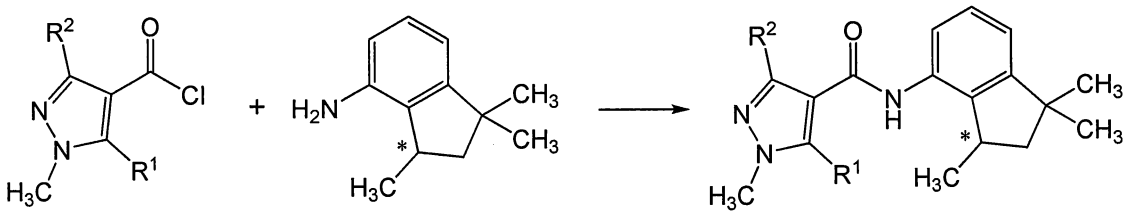
Nhiệt độ phản ứng của phản ứng thường nằm trong khoảng từ -20°C đến 140°C, và thời gian phản ứng của nó thường nằm trong khoảng từ 1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, khi chất rắn được lắng sau khi bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, chế phẩm carboxamit có thể được tách ra bằng cách lọc, và khi chất rắn không còn lắng, hợp chất carboxamit có thể được tách ra bằng cách thực hiện các quá trình xử lý tiếp theo như phương pháp trích ly hỗn hợp phản ứng với dung môi hữu cơ, làm khô lớp hữu cơ và cô đặc. Chế phẩm

carboxamit tách ra cũng có thể được tinh chế thêm bằng phương pháp sắc ký, kết tinh và các phương pháp có tác dụng tương tự.

Phương pháp sản xuất 2

Chế phẩm carboxamit cũng có thể được tạo ra bởi phản ứng của hợp chất (IV) và hợp chất (III) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 với sự có mặt của bazơ.



(IV) (III) (I*) ,

trong đó R^1 và R^2 là có nghĩa tương tự như được mô tả ở trên. Tỷ lệ đồng phân đối ảnh căn cứ vào cacbon bất đối xứng được thể hiện bởi * nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 (= dạng R/dạng S).

Phản ứng thường được thực hiện với sự có mặt của dung môi.

Các ví dụ của dung môi được sử dụng trong phản ứng bao gồm các ete như THF, ete etylen glycol dimetyl, và MTBE; các hydrocacbon no như hexan, heptan, và octan; các hydrocacbon thơm như toluen, và xylen; các hydrocacbon halogen hoá như clorobenzen; các este như butyl axetat, và etyl axetat; các nitril như axetonitril; và các hỗn hợp của nó.

Bazơ được sử dụng trong phản ứng bao gồm các cacbonat kim loại kiềm như cacbonat natri, và cacbonat kali; các amin bậc ba như trietylamin, và diisopropyletylamin; các hợp chất thơm chứa nitơ như pyridin, và 4-dimetylaminopyridin; v.v.. Hợp chất (III) được sử dụng với tỷ lệ thông thường là nằm trong khoảng từ

0,5 đến 3mol và bazơ được sử dụng với tỷ lệ thông thường nằm trong khoảng từ 1 đến 5mol, đối với 1mol của hợp chất (IV).

Nhiệt độ phản ứng của phản ứng thường nằm trong khoảng từ -20°C đến 100°C, và thời gian phản ứng của nó thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 24 giờ.

Sau khi hoàn thành phản ứng, khi chất rắn được lắng sau khi bổ sung nước vào hỗn hợp phản ứng, chế phẩm carboxamit có thể được tách ra bằng cách lọc, và khi chất rắn không còn lắng, chế phẩm carboxamit có thể được tách ra bằng cách thực hiện các quá trình xử lý tiếp theo như phương pháp trích ly hỗn hợp phản ứng với dung môi hữu cơ, làm khô lớp dung môi hữu cơ và cô đặc. Chế phẩm carboxamit tách ra cũng có thể được tinh chế thêm bằng phương pháp sắc ký, kết tinh và các phương pháp có tác dụng tương tự.

Hợp chất (III) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1 như trung gian phản ứng có thể thu được, ví dụ, bằng các phương pháp dưới đây.

Phương pháp (1): 4-amino-1,1,3-trimetylindan, trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S ví dụ như nằm trong khoảng từ 30/70 đến 80/20 là được cho phép để tạo thành muối đồng phân không đối ảnh sử dụng axit cacboxylic quang hoạt, sau đó, tinh thể, được tách, hơn nữa nếu cần thiết, sự tái kết tinh được thực hiện, để thu được muối đồng phân không đối ảnh. Muối đồng phân không đối ảnh tổng hợp được phân huỷ bởi bazơ như natri hydroxit, để thu được hợp chất (III) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

Phương pháp (2): 4-amino-1,1,3-trimetylindan trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S ví dụ nằm trong khoảng từ 30/70 đến 80/20, được thực hiện độ phân giải quang học bằng cách dùng

cột để tách chất đồng phân quang học sử dụng vật liệu quang hoạt là chế phẩm xúc tác, để thu được hợp chất (III) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

Các ví dụ của chế phẩm carboxamit như dưới đây.

Hợp chất carboxamit công thức (1) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1;

Hợp chất carboxamit công thức (1) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 95/5 đến 10000/1;

Hợp chất carboxamit công thức (1) trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S nằm trong khoảng từ 98/1 đến 1000/1.

Các ví dụ của vật liệu quang hoạt của hợp chất carboxamit có công thức (1) bao gồm các nguyên liệu dưới đây

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^1 là hydro;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^1 là metyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^2 là metyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^2 là diflometyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^2 là triflometyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^1 là metyl và R^2 là metyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^1 là hydro và R^2 là diflometyl;

Hợp chất carboxamit công thức (1-R) trong đó R^1 là hydro và R^2 là triflometyl.

Chế phẩm theo sáng chế là chế phẩm, được bổ sung các tác nhân như tác nhân ngưng kết, tác nhân phân tán, tác nhân cố định và tác nhân tương tự, và hỗn hợp được tạo thành bột ướt, bột ướt dạng hạt, dạng chảy, dạng hạt nhỏ, dạng chảy khô, cô đặc nhũ tương hoá, dạng dịch lỏng, dịch dầu, tác nhân tạo khói, huyền phù khí, hoặc dạng hạt siêu nhỏ-microcapsule, chế phẩm carboxamit được trộn với chất mang dạng rắn, chất mang dạng lỏng, chất mang dạng khí, chất có hoạt tính bề mặt và các chất tương tự, nếu cần thiết, các tác nhân phù trợ. Chế phẩm theo sáng chế thường chứa hợp chất carboxamit ở tỷ lệ khối lượng thông thường nằm trong khoảng từ 0,1 đến 99%, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,2 đến 90%.

Các ví dụ của chất mang dạng rắn bao gồm các bột mịn và hạt bao gồm đất sét (ví dụ, kaolin, đất diatomit, oxit silic ngậm nước tổng hợp, đất sét Fubasami, đất sét bentonit, đất sét chua), bột tan, khoáng chất vô cơ khác (ví dụ, serixit, bột thạch anh, bột lưu huỳnh, than hoạt tính, canxi, cacbonat, silic ngậm nước), và các ví dụ của chất mang dạng lỏng bao gồm nước; rượu (ví dụ, metanol, etanol), xeton (ví dụ, axeton, metyl etyl xeton), các hydrocacbon thơm (ví dụ, benzen, toluen, xylen, etylbenzen, metylnaphtalen), các hydrocacbon no (ví dụ, n-hexan, dầu hoả), xeton (ví dụ cyclohexanon) các este (ví dụ, etyl axetat, butyl axetat), các nitril (ví dụ, axetonitril, isobutylnitril), các ete (ví dụ, ete dioxan, diisopropyl), các amit axit (ví dụ, dimetylformamit, dimetylacetamit), các hydrocacbon halogen hoá (ví dụ, dicloroetan, tricloroetylen, cacbon tetraclorit).

Các ví dụ của chất có hoạt tính bề mặt bao gồm alkyl sulfat, alkyl sulfonat, alkyl aryl sulfonat, các ete alkyl aryl và các chất

polyoxyetylenat của nó, các ete polyoxyetylen glycol, các este rượu đa chức và các dẫn xuất đường rượu.

Các ví dụ các tác nhân phù trợ khác cho chế phẩm bao gồm các tác nhân ngưng kết và các tác nhân phân tán, cụ thể, casein, gelatin, polysaccharit (ví dụ, tinh bột, chất gôm Ả Rập, các dẫn xuất cellulose, axit alginic), các dẫn xuất lignin, đất sét bentonit, đường, các polime tổng hợp tan trong nước (ví dụ, rượu polyvinyl, polyvinyl pyrolidon, các axit polyacrylic), PAP (acidic isopropyl phosphat), BHT (2,6-di-tert-butyl-4-metylphenol), BHA (hỗn hợp của 2-tert-butyl-4-metoxyphenol và 3-tert-butyl-4-metoxyphenol), dầu thực vật, dầu khoáng, và các axit béo hoặc các este của chúng.

Chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng để bảo vệ thực vật khỏi bệnh thực vật.

Ví dụ các bệnh thực vật mà chế phẩm theo sáng chế sử dụng kiểm soát hiệu quả bao gồm các bệnh dưới đây.

Các bệnh về lúa: bệnh đạo ôn, bệnh đốm nâu, bệnh đốm vằn, bệnh lụn mạ.

Các bệnh về lúa mì: bệnh phấn trắng, loại bệnh lụi đầu (*F.graminearum, F. avenacerum, F. culmorum, Microdochium nivale*), bệnh đạo ôn (*P. striiformis, P. graminis, P. recondita, P. triticina*), bệnh mốc tuyết màu hồng, bệnh cháy lá, bệnh than, bệnh thối đen, bệnh thối gốc, bệnh đốm lá, bệnh vết lá, bệnh đốm nâu.

Các bệnh về lúa mạch: bệnh phấn trắng, loại bệnh lụi đầu (*F.graminearum, F. avenacerum, F. culmorum, Microdochium nivale*), bệnh đạo ôn (*P. striiformis, P. graminis, P. hordei*), bệnh gỉ sắt, bệnh bỏng lúa mạch, bệnh đốm lá, bệnh thối rễ, bệnh sọc lá, bệnh đốm vằn.

Các bệnh về ngô: bệnh phấn đen, bệnh đốm lá, bệnh vòng tròn đồng tâm, bệnh gỉ sắt, bệnh đốm nâu trên lá, bệnh đốm vằn.

Các bệnh về giống cam quýt: bệnh thối mục, bệnh ghẻ nhám, bệnh mốc (bệnh mốc lục, bệnh mốc xanh), bệnh chảy gôm (*Phytophthora parasitica, Phytophthora citrophthora*).

Các bệnh cây táo: bệnh bạc lá, bệnh loét, bệnh (*Podosphaera leucotricha*), bệnh đốm lá, bệnh ghẻ, bệnh đốm đen, bệnh thối trái.

Các bệnh cây lê: bệnh vảy (*Venturia nashicola;Venturia pirina*), bệnh đốm đen trên cây lê Nhật Bản, bệnh gỉ sắt, bệnh thối trái;

Các bệnh cây đào: bệnh đốm nâu, bệnh ghẻ, bệnh thối quả.

Các bệnh cây nho: bệnh thán thư (*Elsinoe ampelina, Glomerella cingulata*), bệnh phấn trắng, bệnh gỉ sắt, bệnh đốm nâu, bệnh mốc sương.

Các bệnh cây hồng đào: bệnh đốm nâu thân cành, bệnh giác ban (*Mycosphaerella nawae*).

Các bệnh cây bầu, bí: bệnh thán thư, bệnh phấn trắng, bệnh nứt thân chảy nhựa, bệnh héo vàng, bệnh sương mai, bệnh thối gốc chảy mủ, bệnh chết cây con;

Các bệnh cây cà chua: bệnh đốm vòng, bệnh mốc đen, bệnh sương mai.

Các bệnh cây cà: bệnh đốm nâu, bệnh phấn trắng.

Các bệnh về họ cải bắp: bệnh đốm vòng trên cây lê Nhật bản, *Cercosporella brassicae*, bệnh sưng rễ bắp cải, bệnh sương mai.

Các bệnh cây hành hương: bệnh gỉ sắt, bệnh sương mai.

Các bệnh cây đỗ tương: bệnh tím hạt, bệnh (*Elsinoe glycines*), bệnh thối thân và trái, bệnh đốm nâu, bệnh đốm mắt

ếch, bệnh gỉ sắt, bệnh thối rễ, bệnh đốm vằn, bệnh vàng rụng lá, bệnh thối gốc thân.

Các bệnh cây đậu tây: bệnh thán thư.

Các bệnh cây lạc: bệnh đốm đen, bệnh đốm nâu, bệnh héo gốc mốc trắng.

Các bệnh cây đậu Hà lan: bệnh nấm mốc miđiu.

Các bệnh cây khoai tây: bệnh đốm vòng, bệnh mốc sương, bệnh hồng củ hỏng lá, bệnh ghẻ bột.

Các bệnh cây dâu tây: bệnh phấn trắng, bệnh muội than.

Các bệnh cây chè: bệnh (*Exobasidium reticulatum*), bệnh vảy trắng, bệnh đốm lá, bệnh thối búp chè.

Các bệnh cây thuốc lá: bệnh đốm nâu, bệnh phấn trắng, bệnh thán thư, gỉ sắt, bệnh đen cuống hoa.

Các bệnh cây cải dầu: bệnh thối hạch, bệnh đốm vằn.

Các bệnh cây bông: bệnh đốm vằn.

Các bệnh cây củ cải đường: bệnh đốm lá, bênh chết rạp cây con, bệnh thối rễ.

Các bệnh cây hoa hồng: bệnh đốm đen, bệnh phấn trắng, bệnh sương mai.

Các bệnh cây hoa cúc và rau họ hoa cúc: bệnh sương mai, bệnh đốm nâu, bệnh gỉ sắt.

Các bệnh của nhiều loại cây trồng: gây ra bởi loại bệnh thối rễ, thối quả (*Pythium aphanidermatum, Pythium debarianum, Pythium graminicola, Pythium irregulare, Pythium ultimum*), bệnh thối xám, bệnh thối thân và thối quả.

Các bệnh của cây củ cải: bệnh đốm lá.

Các bệnh cây cỏ sân golf: bệnh đốm đồng xu (*Sclerotinia homeocarpa*), bệnh đốm xanh và bệnh đốm lớn (bệnh đốm vằn).

Các bệnh cây chuối: bệnh sọc đen, bệnh đốm lá.

Các bệnh cây hoa hướng dương: bệnh phấn trắng.

Các bệnh về hạt giống và bệnh ở giai đoạn tăng trưởng ban đầu của các cây trồng khác nhau gây ra bởi một số chủng nấm thuộc chi *Aspergillus*, chi *Penicillium*, chi *Fusarium*, chi *Gibberella*, chi *Tricoderma*, chi *Thielaviopsis*, chi *Rhizopus*, chi *Mucor*, chi *Corticium*, chi *Phoma*, chi *Rhizoctonia* và chi *Diplodia fungi* và tương tự.

Bệnh virut của các cây trồng khác nhau được làm trung gian bởi chi Polymixa hoặc chi *Olpidium*, và tương tự.

Các ví dụ về thực vật mà hợp chất sáng chế có thể được sử dụng bao gồm các loại thực vật dưới đây.

Cây nông nghiệp: ngô, lúa, lúa mì, lúa mạch, lúa mạch đen, yến mạch, cao lương, bông, đỗ tương, lạc, kiều mạch, củ cải đường, cải dầu, hướng dương, mía, thuốc lá, v.v.;

Rau: rau thuộc họ cà (cà tím, cà chua, tiêu xanh, ớt cay, khoai tây, v.v.), rau họ bầu bí (dưa chuột, bí đỏ, bí xanh, dưa hấu, dưa, bí, v.v.), rau họ cải (cải Nhật, cải, cải ngựa, su hào, cải bắp Trung Quốc, cải bắp, mù tạt nâu, bông cải xanh, súp lơ, v.v.), rau họ cúc (ngưu bang, hoa cúc, atiso, rau diếp, v.v.), rau họ huệ tây (hành hương, hành tây, tỏi, măng tây, v.v.), rau có tán (cà rốt, rau mùi tây, cần tây, cây củ cải vàng, v.v.), rau thuộc họ rau muối (rau chân vịt, rau cải Thụy Sĩ, v.v.), rau họ *Labiataceous* (húng quế Nhật Bản, bạc hà, húng quế, v.v.) dâu tây, cây khoai lang, cây củ từ, cây họ ráy, v.v.;

Thực vật có hoa;

Thực vật có lá xanh để trang trí;

Cỏ sân gôn;

Cây ăn quả: quả dạng quả táo (táo, lê thường, lê Nhật, mộc qua Trung quốc, mộc qua, v.v.), quả có hạt (đào, mận, xuân đào, mận Nhật, anh đào, mơ, mận v.v.), họ cam quýt (quýt, cam, chanh, chanh, bưởi, v.v.), các loại hạt (dẻ, cây óc chó, phỉ, hạnh nhân, hồ trăn, hạt điều, hạt macadami, v.v.), quả mọng (quả việt quất, nam việt quất, mâm xôi đen, mâm xôi.), nho, hồng, ô liu, cây sơn trà, chuối, cà phê, chà là, dừa cọ, dầu cọ, v.v.;

Các cây khác ngoài cây ăn quả: chè, dâu tằm, cây có hoa, cây xanh đường phố (cây tần bì, bạch dương, cây sơ thù du, bạch đàn, bạch quả, đinh hương, cây phong, gỗ sồi, bạch dương, cây hoa đỏ cercis, cây gỗ gôm Trung Quốc, cây tiêu huyền, cây chi cử, cây trắc bá Nhật, cây linh sam, cây độc cần Nhật, cây bách, cây thông, vân sam, thủy tùng), v.v..

Các thực vật được mô tả ở trên cũng có thể được phú cho sức đề kháng nhờ công nghệ kỹ thuật gen.

Chế phẩm theo sáng chế cũng có thể được sử dụng với thuốc diệt nấm khác, thuốc trừ sâu, thuốc diệt ve, diệt giun tròn, thuốc diệt cỏ, điều tiết tăng trưởng thực vật, phân bón hoặc các tác nhân cải thiện đất bằng trộn lẫn hoặc đồng thời mà không trộn lẫn.

Phương pháp kiểm soát bệnh thực vật của sáng chế (sau đây, có thể được gọi là phương pháp kiểm soát sáng chế) được thực hiện bằng cách xử lý thực vật hoặc đất trồng nơi mà thực vật mọc lên với một lượng có hiệu quả của chế phẩm theo sáng chế. Các ví dụ về thực vật bao gồm thân và lá thực vật, hạt giống thực vật và củ thực vật. Ở đây, củ bao gồm củ vảy, củ cứng, thân rễ, củ thân, củ rễ và vùng xung quanh rễ.

Trong phương pháp kiểm soát này, Các ví dụ của phương pháp xử lý của chế phẩm theo sáng chế bao gồm xử lý thân và lá, xử lý đất trồng, xử lý phần rễ và xử lý hạt.

Các ví dụ xử lý thân và lá bao gồm phương pháp xử lý bề mặt cây trồng bằng cách phun lên thân rau và lá cây và phun lên thân gỗ.

Các ví dụ xử lý phần rễ bao gồm phương pháp làm ngập toàn bộ phần thân hoặc phần rễ của thực vật vào trong dung dịch thuốc chứa hợp chất carboxamit, và phương pháp cho phép đưa vào chế phẩm chất rắn chứa hợp chất carboxamit và chất mang dạng rắn để bám vào phần rễ của thực vật.

Các ví dụ xử lý đất trồng bao gồm phun lên đất trồng, trộn với đất trồng và đưa dung dịch thuốc vào trong đất trồng.

Các ví dụ xử lý hạt giống bao gồm xử lý hạt hoặc củ của thực vật để bảo vệ khỏi bệnh thực vật với chế phẩm theo sáng chế, và cụ thể xử lý phun tạo huyền phù của chế phẩm theo sáng chế thành dạng sương mù và phun sương mù này lên bề mặt của hạt hoặc bề mặt của củ, xử lý phủ nhờ sự phủ bột thấm nước, nhũ tương đậm đặc hoặc chế phẩm có thể chảy được của chế phẩm theo sáng chế lên hạt hoặc củ hoặc bổ sung lượng nhỏ nước vào các chế phẩm này và phủ hạt hoặc củ các chế phẩm này, xử lý ngâm bằng cách ngâm hạt giống vào dung dịch của chế phẩm theo sáng chế trong thời gian nhất định, xử lý phủ màng và xử lý phủ hạt.

Lượng xử lý của chế phẩm theo sáng chế trong phương pháp kiểm soát của sáng chế thay đổi tuỳ thuộc vào loại thực vật được xử lý, loại bệnh thực vật cũng như đối tượng kiểm soát, và tần suất, dạng chế phẩm, giai đoạn xử lý, phương pháp xử lý, địa điểm xử lý, các điều kiện thời tiết và tương tự, và khi thân và lá của thực vật được xử lý hoặc đất nơi mà thực vật mọc lên được xử lý,

lượng xử lý của chế phẩm theo sáng chế thường nằm trong khoảng từ 1 đến 500g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 2 đến 200g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 10 đến 100g trên 1000m^2, về mặt lượng của chế phẩm carboxamit trong chế phẩm theo sáng chế. Lượng xử lý của chế phẩm theo sáng chế trong trường hợp xử lý hạt giống thường nằm trong khoảng từ 0,001 đến 10g, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,01 đến 1g trên 1kg hạt giống, về mặt lượng của chế phẩm carboxamit.

Nhũ tương đậm đặc, bột ướt, chế phẩm có thể chảy được và tương tự thường được pha loãng với nước và được phun trong quá trình xử lý. Trong trường hợp này, nồng độ của chế phẩm carboxamit thường nằm trong khoảng từ 0,0005 đến 2% về khối lượng, tốt hơn là nằm trong khoảng từ 0,005 đến 1% về khối lượng. Bột và hạt chế phẩm và tương tự thường được sử dụng trong quá trình xử lý không cần pha loãng.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Sáng chế sẽ được mô tả chi tiết hơn bởi các ví dụ tham khảo, các ví dụ điều chế, các ví dụ thử nghiệm dưới đây và tương tự.

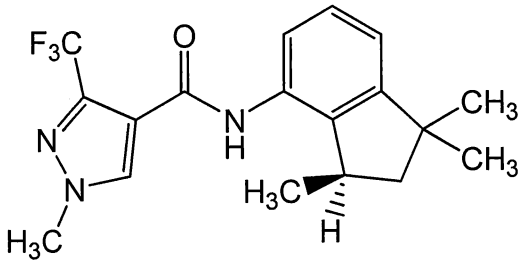
Thứ nhất, các ví dụ tham khảo của chế phẩm carboxamit sẽ được mô tả.

Ví dụ điều chế tham khảo 1

Nhỏ giọt dung dịch chứa 0,018g 1-metyl-3-triflometylpyrazol-4-cacbonylclorua trong THF vào dung dịch chứa 0,15g (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan (độ tinh khiết quang: 99% ee), 0,013g trietylamin, 5mg 4-dimetylaminopyridin và 1mL THF dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá. Khuấy hỗn hợp này ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 15 phút, sau đó, bổ sung nước đá vào hỗn hợp phản ứng, và chiết hỗn hợp bằng etyl axetat. Làm

sạch lớp hữu cơ liên tục bằng dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hoà và nước muối bão hoà, sau đó, được làm khô qua magie sulfat và cô đặc dưới áp suất giảm. Cho phần còn lại thu được vào sắc ký cột silicagel để thu được 0,018g (R)-(-)-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1-metyl-3-triflometylpyrazol-4-carboxamit (sau đây, được gọi là hợp chất carboxamit (1)) (độ tinh khiết quang: 99% ee).

Hợp chất carboxamit (1):



(1 (dạng R))

^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 1,25 (3H, s), 1,28 (3H, d, J = 7,1 Hz), 1,34 (3H, s), 1,67 (1H, dd, J = 12,8, 4,3 Hz), 2,24 (1H, dd, J = 12,9, 8,5 Hz), 3,29-3,37 (1H, m), 3,99 (3H, s), 7,00 (1H, d, J = 6,8 Hz), 7,23-7,27 (1H, m), 7,62 (1H, br s), 7,76 (1H, d, J = 7,8 Hz), 8,04 (1H, s),

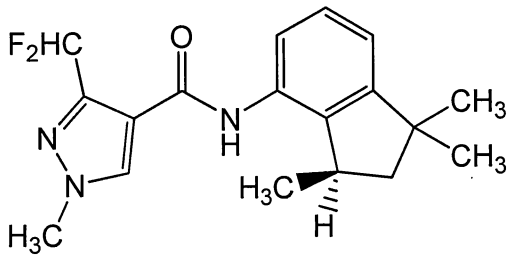
$[\alpha]_D^{23}$ = -54° ($CHCl_3$, c1,02)

Ví dụ điều chế tham khảo 2

Nhỏ giọt dung dịch chứa 0,017g 1-metyl-3-diflometylpyrazol-4-cacbonylclorua trong THF vào dung dịch bao gồm 0,015g (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan (độ tinh khiết quang: 99% ee), 0,013g trietylamin, 5mg 4-dimetylaminopyridin và 1mL THF dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá. Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 15 phút, sau đó, bổ sung nước đá vào hỗn hợp phản ứng, và chiết hỗn hợp này bằng etyl axetat. Làm sạch liên tục lớp hữu cơ bằng dung dịch nước natri hydro cacbonat

bão hoà và nước muối bão hoà, sau đó, được làm khô qua magie sulfat và cô đặc dưới áp suất giảm. Cho phần còn lại thu được vào sắc ký cột silicagel để thu được 0,20g (R)-(-)-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1-metyl-3-diflometylpyrazol-4-carboxamit (sau đây, được gọi là hợp chất carboxamit (2)) (độ tinh khiết quang: 99% ee).

Hợp chất carboxamit (2)



(2 (dạng R))

^{1}H-NMR ($CDCl_3$) δ: 1,25 (3H, s), 1,28 (3H, d, J = 7,1 Hz), 1,34 (3H, s), 1,67 (1H, dd, J = 12,9, 4,1 Hz), 2,24 (1H, dd, J = 12,9, 8,5 Hz), 3,32-3,41 (1H, m), 3,94 (3H, s), 6,88 (1H, t, J = 54,1 Hz), 6,98 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,22-7,27 (1H, m), 7,79 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,96 (1H, br s), 8,02 (1H, s).

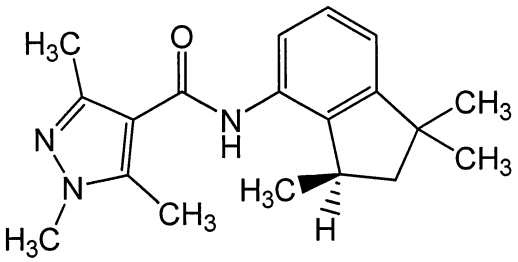
$[\alpha]_D^{23}$ = -62° ($CHCl_3$, c0,99)

Ví dụ điều chế tham khảo 3

Nhỏ giọt dung dịch chứa 0,015g 1,3,5-trimetylpyrazol-4-cacbonylclorua trong THF vào dung dịch chứa 0,015g (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan (độ tinh khiết quang: 99% ee), 0,013g trietylamin, 5mg 4-dimetylaminopyridin và 1mL THF dưới điều kiện làm lạnh bằng nước đá. Khuấy hỗn hợp ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 15 phút, sau đó, bổ sung nước đá vào hỗn hợp phản ứng, và chiết hỗn hợp bằng etyl axetat. Làm sạch liên tục lớp hữu cơ bằng dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hoà và nước muối bão hoà, sau đó, làm khô qua magie sulfat và cô đặc

dưới áp suất giảm. Cho phần còn lại thu được vào sắc ký cột silicagel để thu được 0,017g (R)-(-)-N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1,3,5-trimetylpyrazol-4-carboxamit (sau đây, được gọi là hợp chất carboxamit (3)) (độ tinh khiết quang: 99% ee).

Hợp chất carboxamit (3):



(3 (dạng R))

^{1}H-NMR ($CDCl_3$)δ: 1,25 (3H, s), 1,32 (3H, d, J = 7,1 Hz), 1,34 (3H, s), 1,67 (1H, dd, J = 12,7, 4,6 Hz), 2,24 (1H, dd, J = 12,9, 8,5 Hz), 2,51 (3H, s), 2,53 (3H, s), 3,31-3,39 (1H, m), 3,76 (3H, s), 6,96 (1H, d, J = 7,6 Hz), 7,21-7,26 (2H, m), 7,76 (1H, d, J = 7,8 Hz),

$[\alpha]_D^{23}$ = -57° ($CHCl_3$, c1,01)

Tiếp theo, điều chế hợp chất trung gian của hợp chất carboxamit sẽ được mô tả.

Ví dụ điều chế tham khảo 4

Bằng cách sử dụng HPLC, 4,8g raxemic 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan được tách thành hai chất đồng phân đối hình dưới các điều kiện sau đây, theo đó thu được 1,2g (R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan (độ tinh khiết quang: 99% ee) được tách rửa là đỉnh cuối cùng.

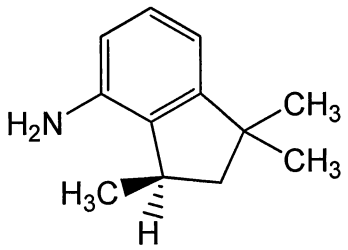
Cột: CHIRACEL (nhãn hiệu hàng hóa được đăng ký) cột quang hoạt OD

Nhiệt độ cột: Nhiệt độ trong phòng

Pha động: hỗn hợp dung môi gồm hexan và 2-propanol (99:1)

Lưu lượng: 10mL/phút

(R)-1,1,3-trimetyl-4-aminoindan:



(dạng R)

$[\alpha]_D^{25}$ = -33,7° ($CHCl_3$, c0,61)

Ví dụ điều chế tham khảo 5

Trộn ba trăm gam (300g) raxemic 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan, 128g axit D-tartaric và 260ml metanol, và duy trì hỗn hợp ở nhiệt độ 70°C trong thời gian 1 giờ. Sau đó, làm nguội hỗn hợp đến nhiệt độ trong phòng, và trộn khoảng 0,01g tinh thể dạng hạt và hỗn hợp được phép để yên trong thời gian 2 ngày. Lọc chất rắn qua màng lọc và làm sạch bằng metanol. Kết tinh lại chất rắn thu được bằng metanol năm lần để thu được 100g 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan D-tartarat. Bổ sung dung dịch nước natri hydroxit 5% vào 78g 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan D-tartarat cho đến khi độ pH đạt 10 hoặc lớn hơn, và chiết hỗn hợp bằng ete metyl t-butyl ba lần. Làm sạch liên tục các lớp dầu thu được bằng nước muối bão hoà và dung dịch nước natri hydro cacbonat bão hoà, sau đó, làm khô qua natri sunfat và cô đặc dưới áp suất giảm để thu được 38g hỗn hợp 1,1,3-trimetyl-4-aminoindan trong đó tỷ lệ đồng phân đối ảnh (dạng R/dạng S) là 99,6/0,4.

Tiếp theo, các ví dụ chế phẩm của chế phẩm theo sáng chế được thể hiện. Các phần được tính theo khối lượng.

Ví dụ điều chế 1

Nghiền năm mươi phần (50 phần) một hợp chất bất kỳ trong các hợp chất carboxamit (1) đến (3), 3 phần canxi ligninsulfonat, 2 phần magie laurylsulfat và 45 phần oxit silic ngậm nước tổng hợp và trộn kỹ để thu được bột ướt.

Ví dụ điều chế 2

Hai mươi phần (20 phần) một hợp chất bất kỳ trong các chế phẩm carboxamit (1) đến (3) và 1,5 phần sorbitan trioleat được trộn với 28,5 phần dung dịch nước chứa 2 phần rượu polyvinylic, và nghiền mịn hỗn hợp này bằng phương pháp phun bụi nước ẩm, sau đó, bổ sung vào hỗn hợp này 40 phần dung dịch nước chứa 0,05 phần gôm xanthan và 0,01 phần silic magiê nhôm, sau đó, bổ sung 10 phần propylen glycol vào hỗn hợp và khuấy để trộn, thu được chế phẩm.

Ví dụ điều chế 3

Nghiền hai phần (2 phần) của một hợp chất bất kỳ trong các chế phẩm carboxamit (1) đến (3), 88 phần đất sét cao lanh và 10 phần bột tan và trộn kỹ để thu được bột thuốc bảo vệ thực vật.

Ví dụ điều chế 4

Trộn kỹ năm phần (5 phần) một hợp chất bất kỳ trong các chế phẩm carboxamit (1) đến (3), 14 phần ete polyoxyetylen styryl phenyl, 6 phần canxi dodecylbenzensulfonat và 75 phần xylen để thu được chế phẩm.

Ví dụ điều chế 5

Nghiền hai phần (2 phần) một hợp chất bất kỳ trong các chế phẩm carboxamit (1) đến (3), 1 phần oxit silic ngậm nước tổng hợp, 2 phần canxi ligninsulfonat, 30 phần đất sét bentonit và 65 phần đất sét cao lanh và trộn kỹ, sau đó, bổ sung nước vào và nhào trộn hỗn hợp này, và tạo hạt và làm khô để thu được hạt.

Ví dụ điều chế 6

Trộn mười phần (10 phần) của một hợp chất bất kỳ trong các chế phẩm carboxamit (1) đến (3), 35 phần cacbon trắng chứa 50 phần ete polyoxyetylen alkyl, muối ammoni sulfat, và 55 phần nước, và nghiền mịn bằng phương pháp phun bụi nước ẩm để thu được chế phẩm.

Các ví dụ thử nghiệm dưới đây sẽ cho thấy rằng chế phẩm theo sáng chế là hữu dụng để kiểm soát bệnh thực vật.

Hiệu quả kiểm soát được đánh giá bằng cách quan sát bằng mắt vùng thương tổn trên thực vật thử nghiệm trong điều tra nghiên cứu, và so sánh vùng thương tổn trên thực vật đã được xử lý với chế phẩm thử nghiệm và vùng thương tổn trên thực vật không được xử lý.

Ví dụ thử nghiệm 1

Thử nghiệm hiệu quả ngăn chặn bệnh đốm lá (*Septoria tritici*)

Một chậu nhựa được nhồi đất, lúa mì (giống; *Apogee*) được gieo lên đất này, và cho phép phát triển trong nhà kính trong thời gian 10 ngày. Các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) được điều chế thành chế phẩm theo ví dụ điều chế 6, sau đó, chế phẩm được pha loãng với nước để đạt được nồng độ quy định (13ppm), và phun lên phần lá nhằm mục đích bám dính một cách thoả đáng bề mặt lá của lúa mì. Sau khi phun, thực vật được làm khô trong, và hai ngày sau, được cấy với huyền phù trong nước chứa bào tử *Septoria tritici* bằng cách phun. Sau khi cấy, thực vật được phép để yên lần đầu dưới điều kiện độ ẩm ở nhiệt độ 18°C trong thời gian 3 ngày, sau đó, được phép để yên trong thời gian từ 14 đến 18 ngày dưới sự chiếu sáng, sau đó, vùng thương tổn được kiểm tra.

Kết quả, vùng thương tổn ở thực vật được xử lý bằng các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) là 10% hoặc thấp hơn vùng thương tổn trên thực vật không được xử lý.

Thử nghiệm tương tự được thực hiện ngoại trừ nồng độ áp dụng, sử dụng amit của axit raxemic N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1-metyl-3-triflometylpyrazol-4-carboxylic (sau đây, được gọi là hợp chất raxemic (A)) thay cho hợp chất carboxamit. Kết quả, vùng thương tổn trên thực vật được xử lý bằng 50ppm hợp chất raxemic (A) là 75% hoặc lớn hơn vùng thương tổn trên thực vật không được xử lý.

Ví dụ thử nghiệm 2

Thử nghiệm hiệu quả ngăn chặn bệnh đạo ôn (*Puccinia triticina*)

Một chậu nhựa được nhồi đất, lúa mì (giống; *Shirogan*) được gieo lên đất, và cho phép phát triển trong nhà kính trong thời gian 10 ngày. Các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) được điều chế thành chế phẩm theo ví dụ điều chế 6, sau đó, chế phẩm được pha loãng với nước để đạt được nồng độ quy định (200ppm), và phun vào phần lá nhằm mục đích bám dính một cách thoả đáng bề mặt lá của lúa mì. Sau năm ngày, thực vật được cấy các bào tử nấm *Puccinia triticina* bằng cách phun. Sau khi cấy, thực vật được phép để yên dưới điều kiện ẩm tối ở nhiệt độ 18°C trong thời gian 1 ngày, tiếp đến, được phép để yên trong thời gian 9 ngày dưới sự chiếu sáng, sau đó, vùng thương tổn được kiểm tra. Kết quả, vùng thương tổn trên thực vật được xử lý bằng các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) là 10% hoặc thấp hơn vùng thương tổn trên thực vật không được xử lý.

Ví dụ thử nghiệm 3

Thử nghiệm hiệu quả ngăn chặn *Pyrenophora teres*

Một chậu nhựa được nhồi đất, lúa mạch (giống; *Nishinohoshi*) được gieo lên đất, và cho phép phát triển trong nhà kính trong thời gian 10 ngày. Các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) được điều chế thành chế phẩm theo ví dụ điều chế 6, sau đó, chế phẩm được pha loãng với nước để đạt được nồng độ quy định (200ppm), và phun vào phần lá nhằm mục đích bám dính một cách thoả đáng đến bề mặt lá của lúa mạch. Sau năm ngày, thực vật được cấy huyền phù trong nước chứa bào tử *Pyrenophora teres* bằng cách phun. Sau khi cấy, thực vật được phép để yên dưới điều kiện ẩm ở nhiệt độ 23°C trong thời gian 3 ngày, sau đó, được phép để yên trong thời gian 7 ngày trong nhà kính, sau đó, vùng thương tổn được kiểm tra. Kết quả, vùng thương tổn trên thực vật được xử lý bằng các hợp chất carboxamit (1), (2) và (3) là 10% hoặc thấp hơn vùng thương tổn trên thực vật không được xử lý.

Ví dụ thử nghiệm 4

Thử nghiệm hiệu quả trên *Phakopsora pachyrhizi*

Một chậu nhựa được nhồi đất, đậu tương (giống; *Natto shoryu*) được gieo lên đất, và được cho phép phát triển trong nhà kính cho đến khi xuất hiện sự nảy mầm của lá. Hợp chất carboxamit (1) được điều chế thành chế phẩm theo ví dụ điều chế 6, sau đó, chế phẩm được pha loãng với nước để đạt được nồng độ quy định, và được phun vào phần lá nhằm mục đích bám dính một cách thoả đáng đến bề mặt lá của đậu tương. Sau đó, đậu tương được trồng trong nhà kính trong thời gian 14 ngày, và phát triển cho đến khi đâm chồi ba lá chét đầu tiên. Thực vật được cấy huyền phù trong nước chứa bào tử *Phakopsora pachyrhizi* bằng cách phun. Sau khi cấy, thực vật được phép để yên dưới điều kiện ẩm ở nhiệt độ 23°C qua đêm, sau đó, được phép để yên trong thời gian 7

ngày ở Nhiệt độ phòng, sau đó, vùng thương tổn của ba lá chét đầu tiên được kiểm tra.

Căn cứ vào các vùng thương tổn trong vùng đất đã được xử lý và trong vùng đất không được xử lý, hiệu quả của vùng đất đã được xử lý được tính theo công thức (1) sau đây. Các kết quả được thể hiện trong Bảng 1.

Hiệu quả (%) = (1-(vùng thương tổn trong vùng đất đã được xử lý)/ (vùng thương tổn trong vùng đất không được xử lý))×100 công thức (1)

Bảng 1

Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ của hợp chất thử nghiệm [ppm]	Hiệu quả [%]
Hợp chất carboxamit (1)	50	98,1

Ví dụ thử nghiệm 5

Thử nghiệm hiệu quả trên *Phakopsora pachyrhizi*

Một chậu nhựa được nhồi đất, đậu tương (hạt giống; *Natto shoryu*) được gieo lên đất, và được cho phép phát triển trong nhà kính cho đến khi xuất hiện sự nảy mầm của lá. Các hợp chất carboxamit (2) và (3) và raxemic N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1-metyl-3-diflometylpyrazol-4-carboxamit (sau đây, được gọi là hợp chất raxemic (B)) và raxemic N-(1,1,3-trimetylindan-4-yl)-1,3,5-trimetylpyrazole-4-carboxamit (sau đây, được gọi là hợp chất raxemic (C)) được điều chế thành chế phẩm theo ví dụ điều chế 6, sau đó, chế phẩm được pha loãng với nước để đạt được nồng độ quy định, và được phun vào phần lá nhằm mục đích bám dính một cách thoả đáng đến bề mặt lá của đậu tương. Đậu tương được trồng

ở nhiệt độ phòng trong thời gian 14 ngày, và phát triển cho đến khi đâm chồi ba lá chét đầu tiên. Thực vật được cấy huyền phù trong nước chứa bào tử *Phakopsora pachyrhizi* bằng cách phun. Sau khi cấy, thực vật được phép để yên dưới điều kiện ẩm ở nhiệt độ 23°C qua đêm, sau đó, được phép để yên trong thời gian 7 ngày ở nhiệt độ phòng, sau đó, vùng thương tổn của ba lá chét đầu tiên được kiểm tra.

Căn cứ vào các vùng thương tổn trong vùng đất đã được xử lý và trong vùng đất không được xử lý, hiệu quả của vùng đất đã được xử lý được tính theo công thức(1) được mô tả ở trên. Các kết quả được thể hiện trong Bảng 2.

Bảng 2

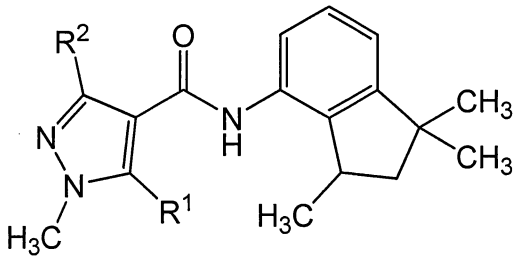
Hợp chất thử nghiệm	Nồng độ của hợp chất thử nghiệm [ppm]	Hiệu quả [%]
Chế phẩm carboxamit (2)	200	100
Chế phẩm carboxamit (2)	100	77,1
Hợp chất raxemic (B)	200	46,7
Chế phẩm carboxamit (3)	200	100
Chế phẩm carboxamit (3)	100	98,4
Hợp chất raxemic (C)	200	76,5

Khả năng ứng dụng trong công nghiệp

Theo sáng chế, bệnh thực vật có thể được kiểm soát.

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật chứa hợp chất carboxamit có công thức (I):



(I)

,

trong đó:

R^1 là hydro hoặc metyl, và

R^2 là metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

khác biệt ở chỗ tỷ lệ chất đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

2. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1, trong đó tỷ lệ chất đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 95/5 đến 10000/1.

3. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1, trong đó tỷ lệ chất đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 98/1 đến 1000/1.

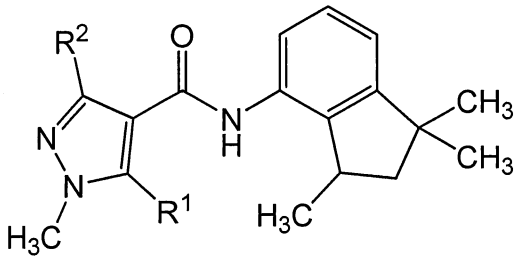
4. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1, trong đó R^1 là metyl và R^2 là metyl trong công thức (I).

5. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1, trong đó R^1 là hydro và R^2 là diflometyl trong công thức (I).

6. Chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1, trong đó R^1 là hydro và R^2 là triflometyl trong công thức (I).

7. Phương pháp kiểm soát bệnh thực vật bao gồm bước xử lý thực vật hoặc đất nơi mà thực vật phát triển bằng một lượng hữu hiệu chế phẩm kiểm soát bệnh thực vật theo điểm 1.

8. Hợp chất carboxamit có công thức (I):



(I)

,

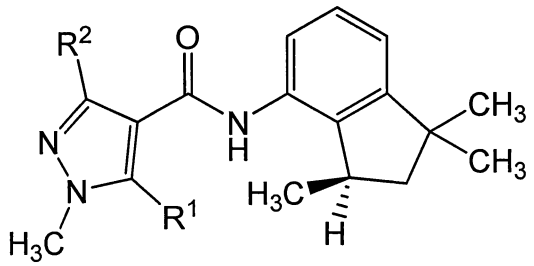
trong đó:

R^1 là hydro hoặc metyl, và

R^2 là metyl, diflometyl hoặc triflometyl,

và tỷ lệ chất đồng phân đối ảnh dạng R/dạng S của hợp chất carboxamit nằm trong khoảng từ 90/10 đến 10000/1.

9. Hợp chất carboxamit theo điểm 8 có công thức (I-R):



(I-R)

.

10. Hợp chất carboxamit theo điểm 9, trong đó R^1 là metyl và R^2 là metyl.

11. Hợp chất carboxamit theo điểm 9, trong đó R^1 là hydro và R^2 là diflometyl.

12. Hợp chất carboxamit theo điểm 9, trong đó R^1 là hydro và R^2 là triflometyl.