



(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)



1-0029322

(51)⁷ C07D 213/74; A01N 43/40

(13) B

(21) 1-2016-03660

(22) 31/03/2015

(86) PCT/EP2015/057088 31/03/2015

(87) WO 2015/155075 A1 15/10/2015

(30) 14164464.1 11/04/2014 EP

(45) 25/08/2021 401

(43) 27/02/2017 347A

(73) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)

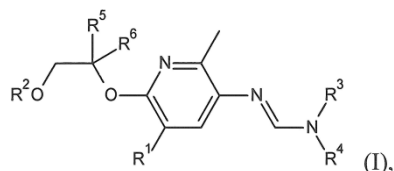
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland

(72) HOFFMAN, Thomas James (US); SULZER-MOSSE, Sarah (FR); NEBEL, Kurt (CH); CEDERBAUM, Fredrik Emil Malcolm (SE).

(74) Công ty TNHH Ban Ca (BANCA)

(54) HỢP CHẤT DẪN XUẤT N'-[2-METYL-6-[2-ALKOXY-ETOXY]-3-PYRIDYL]-N-ALKYL-FORMAMIDIN, CHẾ PHẨM CHỨA HỢP CHẤT NÀY VÀ PHƯƠNG PHÁP KIỂM SOÁT HOẶC NGĂN NGỪA BỆNH Ở CÂY

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



trong đó R¹, R², R³, R⁴, R⁵ và R⁶ là như được xác định trong bản mô tả. Sáng chế còn đề cập đến chế phẩm có chứa các hợp chất này và phương pháp kiểm soát hoặc ngăn ngừa các bệnh ở cây.

Lĩnh vực kỹ thuật được đề cập

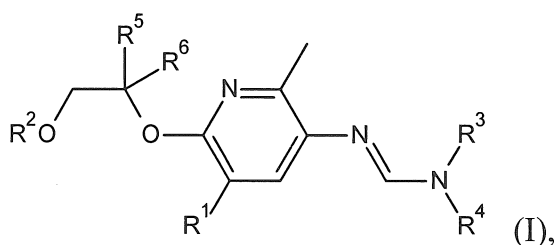
Sáng chế đề cập đến hợp chất pyridylamidin diệt vi sinh vật, cụ thể là diệt nấm, mới. Sáng chế còn đề cập đến các hợp chất trung gian dùng trong việc điều chế hợp chất này, chế phẩm có chứa hợp chất này, và sử dụng chúng trong nông nghiệp hoặc nghề làm vườn để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự phá hoại cây trồng bởi vi sinh vật gây bệnh ở cây, tốt hơn là nấm.

Tình trạng kỹ thuật của sáng chế

Các dẫn xuất pyridylamidin nhất định đã được đề xuất trong các tài liệu dưới dạng thành phần có hoạt tính diệt vi sinh vật trong thuốc diệt sinh vật gây hại. Ví dụ, công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 00/46184 và WO 03/093224 bộc lộ pyridylamidin mà hữu dụng làm thuốc diệt nấm. Tuy nhiên, đặc tính sinh học của các hợp chất đã biết này không hoàn toàn phù hợp để kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự phá hoại cây trồng bởi vi sinh vật gây bệnh ở cây, đó là lý do tại sao lại cần phải đề xuất các hợp chất khác mà có đặc tính diệt vi sinh vật.

Bản chất kỹ thuật của sáng chế

Mục đích của sáng chế là đề cập đến hợp chất có công thức (I):



trong đó

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, $NH(C_1$ - C_4 alkyl), $N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $CO(C_1$ - C_4 alkyl), $CO_2(C_1$ - C_4 alkyl), CO_2H , $CONH(C_1$ - C_4 alkyl), $CON(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1$ - C_4 alkyl), $SO_2N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkyl- C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_2 - C_4 alkynyl;

R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, R^7 hoặc $-C_1$ - C_2 alkyl- R^7 , mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl và C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_3 - C_6 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có từ 3 đến 6 cạnh;

R^5 là H, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl;

R^6 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^7 là hệ vòng đơn hoặc vòng đôi dung hợp có từ ba đến mười cạnh mà có thể là thơm, no một phần hoặc no hoàn toàn và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm có nitơ, oxy và lưu huỳnh, bản thân hệ vòng có từ ba đến mười cạnh này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

và các chất hổ biến/chất đồng phân/chất đồng phân đối ảnh/muối và N-oxit của các hợp chất này.

Mô tả chi tiết sáng chế

Các phần tử thế ở nguyên tử nitơ luôn luôn không phải là halogen. Phần tử thế hydroxy, mercapto hoặc amino không được đặt vào cacbon α đối với nguyên tử khác loại của mảnh lõi.

Halogen, dưới dạng phần tử thế đơn lẻ hoặc kết hợp với phần tử thế khác (ví dụ haloalkyl) thông thường là flo, clo, brom hoặc iot, và thường là flo, clo hoặc brom.

Mỗi gốc alkyl (bao gồm gốc alkyl của alkoxy, alkylthio, v.v.) là mạch thẳng hoặc mạch nhánh và, tùy thuộc vào số lượng nguyên tử cacbon mà nó có, là, ví dụ, metyl, etyl, *n*-propyl, *n*-butyl, *n*-pentyl, *n*-hexyl, *iso*-propyl, *sec*-butyl, *iso*-butyl, *tert*-butyl, *neo*-pentyl, *n*-heptyl hoặc 1,3-dimetylbutyl, và thường là metyl hoặc etyl.

Nhóm alkenyl và alkynyl có thể là chưa no một lần hoặc chưa no hai lần và ví dụ về chúng được tạo dẫn xuất từ các nhóm alkyl nêu trên.

Nhóm alkenyl là mạch thẳng hoặc mạch nhánh chưa no có liên kết đôi cacbon-cacbon và, tùy thuộc vào số lượng nguyên tử cacbon mà nó có, là, ví dụ etenyl, 1-

propenyl, 2-propenyl, 1-metyl-etenyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-metyl-1-propenyl, 2-metyl-1-propenyl, 2-metyl-2-propenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-metyl-1-butenyl, 2-metyl-1-butenyl, 3-metyl-1-butenyl, 1-metyl-2-butenyl, 2-metyl-2-butenyl, 3-metyl-2-butenyl, 1-metyl-3-butenyl, 2-metyl-3-butenyl, 3-metyl-3-butenyl, 1,1-đimetyl-2-propenyl, 1,2-đimetyl-1-propenyl, 1,2-đimetyl-2-propenyl, 1-etyl-2-propenyl, 1-hexenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-metyl-1-pentenyl, 2-metyl-1-pentenyl, 3-metyl-1-pentenyl, 4-metyl-1-pentenyl, 1-metyl-2-pentenyl, 2-metyl-2-pentenyl, 3-metyl-2-pentenyl, 4-metyl-2-pentenyl, 1-metyl-3-pentenyl, 2-metyl-3-pentenyl, 3-metyl-3-pentenyl, 4-metyl-3-pentenyl, 1-metyl-4-pentenyl, 2-metyl-4-pentenyl, 3-metyl-4-pentenyl, 4-metyl-4-pentenyl, 1,1-đimetyl-2-butenyl, 1,1-đimetyl-3-butenyl, 1,2-đimetyl-1-butenyl, 1,2-đimetyl-2-butenyl, 1,2-đimetyl-3-butenyl, 1,3-đimetyl-1-butenyl, 1,3-đimetyl-2-butenyl, 1,3-đimetyl-3-butenyl, và thường là 2-propenyl, 1-metyl-2-propenyl, 2-butenyl, 2-metyl-2-propenyl.

Nhóm alkynyl là mạch thẳng hoặc mạch nhánh chưa no có liên kết ba cacbon-cacbon và, tùy thuộc vào số lượng nguyên tử cacbon mà nó có, là, ví dụ etynyl, 1-propynyl, 2-propynyl, 1-butylnyl, 2-butylnyl, 3-butylnyl, 1-metyl-2-propynyl, 1-pentylnyl, 2-pentylnyl, 3-pentylnyl, 4-pentylnyl, 3-metyl-1-butylnyl, 1-metyl-2-butylnyl, 1-metyl-3-butylnyl, 2-metyl-3-butylnyl, 1,1-đimetyl-2-propynyl, 1-etyl-2-propynyl, 1-hexynyl, 2-hexynyl, 3-hexynyl, 4-hexynyl, 5-hexynyl, 3-metyl-1-pentylnyl, 4-metyl-1-pentylnyl, 1-metyl-2-pentylnyl, 4-metyl-2-pentylnyl, 1-metyl-3-pentylnyl, 2-metyl-3-pentylnyl, 1-metyl-4-pentylnyl, 2-metyl-4-pentylnyl, 3-metyl-4-pentylnyl, 3,3-đimetyl-1-butylnyl, 1-etyl-2-butylnyl, 1,1-đimetyl-2-butylnyl, 1-etyl-3-butylnyl, 2-etyl-3-butylnyl, 1,1-đimetyl-3-butylnyl, 2,2-đimetyl-3-butylnyl, 1,2-đimetyl-3-butylnyl.

Các gốc haloalkyl là các gốc alkyl mà được thế bằng một hoặc nhiều nguyên tử halogen giống nhau hoặc khác nhau và là, ví dụ, monoflometyl, điflometyl, triflometyl, monoclometyl, điclometyl, triclometyl, 2,2,2-trifloetyl, 2,2-đifloetyl, 2-floetyl, 1,1-đifloetyl, 1-floetyl, 2-cloetyl, pentaflloetyl, 1,1-điflo-2,2,2-tricloetyl, 2,2,3,3-tetraflloetyl và 2,2,2-tricloetyl, và thường là triclometyl, điflocloetyl, điflometyl, triflometyl và đicloflometyl.

Alkoxy là, ví dụ, metoxy, etoxy, propoxy, *iso*-propoxy, *n*-butoxy, *iso*-butoxy, *sec*-butoxy và *tert*-butoxy, và thường là metoxy hoặc etoxy.

Haloalkoxy là, ví dụ, flometoxy, điflometoxy, triflometoxy, 2,2,2-trifloetoxi, 1,1,2,2-tetrafloetoxi, 2-floetoxi, 2-cloetoxi, 2,2-đifloetoxi và 2,2,2-tricloetoxi, và thường là điflometoxy, 2-cloetoxi và triflometoxy.

Alkylthio là, ví dụ, metylthio, etylthio, propylthio, *iso*-propylthio, *n*-butylthio, *iso*-butylthio, *sec*-butylthio hoặc *tert*-butylthio, và thường là metylthio hoặc etylthio.

Alkylsulphonyl là, ví dụ, metylsulphonyl, etylsulphonyl, propylsulphonyl, *iso*-propylsulphonyl, *n*-butylsulphonyl, *iso*-butylsulphonyl, *sec*-butylsulphonyl hoặc *tert*-butylsulphonyl, và thường là metylsulphonyl hoặc etylsulphonyl.

Alkylsulphinyl là, ví dụ, metylsulphinyl, etylsulphinyl, propylsulphinyl, *iso*-propylsulphinyl, *n*-butylsulphinyl, *iso*-butylsulphinyl, *sec*-butylsulphinyl hoặc *tert*-butylsulphinyl, và thường là metylsulphinyl hoặc etylsulphinyl.

Xycloalkyl có thể là no hoặc chưa no một phần, tốt hơn là no hoàn toàn, và là, ví dụ, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl hoặc xyclohexyl.

Alkoxyalkyl là, ví dụ, metoxymetyl, metoxyetyl, etoxymetyl, etoxyetyl, *n*-propoxymetyl, *n*-propoxyetyl, *iso*-propoxymetyl hoặc *iso*-propoxyetyl.

Aryl bao gồm phenyl, naphtyl, antraxyl, floenyl và indanyl, nhưng thường là phenyl.

Vòng cacbon bao gồm nhóm xycloalkyl và nhóm aryl.

Heteroxycloalkyl là vòng không thơm mà có thể là no hoặc chưa no một phần, tốt hơn là no hoàn toàn, chứa nguyên tử cacbon làm thành phần vòng và ít nhất là một nguyên tử khác loại được chọn từ O, S và N làm thành phần vòng. Các ví dụ bao gồm oxiranyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, 1,3-đioxolanyl, 1,4-đioxanyl, aziridinyl, azetidiny, pyrolidinyl, piperidinyl, oxazinanyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, imidazolidinyl, pyrazolidinyl và piperazinyl, tốt hơn là morpholinyl, pyrolidinyl, piperidinyl và piperazinyl, tốt hơn nữa là morpholinyl và pyrrolidinyl.

Heteroaryl là, ví dụ, gốc hydrocacbon thơm vòng đơn hoặc vòng đôi hóa trị một. Các ví dụ về nhóm vòng đơn bao gồm pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, furanyl, thiophenyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, và thiadiazolyl. Các ví dụ về nhóm vòng đôi bao gồm quinolinyl, cinnolinyl, quinoxalinyl, benzimidazolyl,

benzothiophenyl, và benzothiadiazolyl. Nhóm heteroaryl vòng đơn được ưu tiên, tốt hơn là pyridyl, pyrrolyl, imidazolyl và triazolyl, ví dụ 1,2,4 triazolyl, pyridyl và imidazolyl được ưu tiên nhất.

Các thuật ngữ "dị vòng" và "vòng dị vòng" được dùng thay thế lẫn nhau và được định nghĩa là bao gồm các nhóm heteroxycloalkyl và heteroaryl. Sự viện dẫn bất kỳ trong bản mô tả này đến dị vòng hoặc vòng dị vòng tốt hơn là là các ví dụ cụ thể theo định nghĩa về heteroaryl và heteroxycloalkyl ở trên, và tốt hơn là morpholinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl pyridyl, pyrrolyl, imidazolyl và triazolyl, ví dụ 1,2,4 triazolyl, tốt hơn nữa là morpholinyl, pyrrolidinyl, pyridyl và imidazolyl. Không có dị vòng chứa nguyên tử oxy liên kề, nguyên tử lưu huỳnh liên kề, hoặc nguyên tử oxy và lưu huỳnh liên kề.

Khi gốc được chỉ ra dưới dạng (tùy ý) được thế, ví dụ alkyl, chúng bao gồm các gốc mà chúng là một phần của nhóm lớn hơn, ví dụ alkyl trong nhóm alkylthio. Cũng áp dụng điều này cho, ví dụ gốc phenyl trong phenylthio v.v. Khi gốc được chỉ ra dưới dạng tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm khác, tốt hơn là có từ một đến năm phần tử thế tùy ý, tốt hơn nữa là từ một đến ba phần tử thế tùy ý. Khi gốc được thế bằng nhóm mạch vòng, ví dụ aryl, heteroaryl, xycloalkyl, tốt hơn là có không nhiều hơn hai phần tử thế, tốt hơn nữa là không nhiều hơn một phần tử thế.

Danh sách sau đây trình bày các định nghĩa, bao gồm các định nghĩa được ưu tiên, đối với các phần tử thế R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 và R^7 khi tham chiếu đến hợp chất có công thức I. Đối với phần tử thế bất kỳ trong số các phần tử thế này, định nghĩa bất kỳ trong các định nghĩa được nêu dưới đây có thể được kết hợp với định nghĩa bất kỳ của phần tử thế khác bất kỳ được nêu dưới đây hoặc ở chỗ khác trong tài liệu này.

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, $NH(C_1$ - C_4 alkyl), $N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $CO(C_1$ - C_4 alkyl), $CO_2(C_1$ - C_4 alkyl), CO_2H , $CONH(C_1$ - C_4 alkyl), $CON(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1$ - C_4 alkyl), $SO_2N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkyl- C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_2 - C_4 alkynyl.

Tốt hơn là, R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, $NH(C_1$ - C_4 alkyl), $N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $CO(C_1$ - C_4 alkyl), $CO_2(C_1$ - C_4 alkyl), CO_2H , $CONH(C_1$ - C_4 alkyl), $CON(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1$ - C_4 alkyl), $SO_2N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, hoặc C_2 - C_4 alkynyl.

Tốt hơn nữa là, R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, $NH(C_1-C_2 \text{ alkyl})$, $N(C_1-C_2 \text{ alkyl})_2$, $CO(C_1-C_2 \text{ alkyl})$, $CO_2(C_1-C_2 \text{ alkyl})$, CO_2H , $CONH(C_1-C_2 \text{ alkyl})$, $CON(C_1-C_2 \text{ alkyl})_2$, $SO_2NH(C_1-C_2 \text{ alkyl})$, $SO_2N(C_1-C_2 \text{ alkyl})_2$, $C_1-C_4 \text{ floalkyl}$, $C_1-C_4 \text{ alkoxy}$, $C_1-C_2 \text{ haloalkoxy}$ hoặc $C_2-C_4 \text{ alkynyl}$.

Tốt hơn nữa là, R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, $NHMe$, NMe_2 , $COMe$, CO_2Me , CO_2H , $CONHMe$, $CONMe_2$, SO_2NHMe , SO_2NMe_2 , CHF_2 , CF_3 , OMe , $OCHF_2$ hoặc axetylenyl.

Còn tốt hơn nữa là, R_1 là hydro, halogen, xyano, metyl, etyl, xyclopropyl, CHF_2 , CF_3 , OMe , hoặc $OCHF_2$.

Tốt nhất là, R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano.

R^2 là $C_3-C_6\text{alkyl}$, $C_3-C_6\text{alkenyl}$, $C_3-C_6\text{alkynyl}$, R^7 hoặc $-C_1-C_2\text{alkyl}-R^7$, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, $C_1-C_4 \text{ alkyl}$, $C_1-C_4 \text{ haloalkyl}$ và $C_1-C_4 \text{ haloalkoxy}$.

Tốt hơn là, R^2 là $C_3-C_6\text{alkyl}$, $C_3-C_6\text{alkenyl}$, $C_3-C_6\text{alkynyl}$, $C_3-C_6\text{xycloalkyl}$, $C_3-C_5\text{xycloalkenyl}$, $-C_1-C_2\text{alkyl}-C_3-C_6\text{xycloalkyl}$, $-C_1-C_2\text{alkyl}-C_3-C_6\text{xycloalkenyl}$, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, $C_1-C_2 \text{ alkyl}$, $C_1-C_2 \text{ haloalkyl}$ và $C_1-C_2 \text{ haloalkoxy}$.

Tốt hơn nữa là, R^2 là $C_3-C_6\text{alkyl}$, $C_3-C_6\text{alkenyl}$, $C_3-C_6\text{alkynyl}$, $C_3-C_6\text{xycloalkyl}$, $C_3-C_5\text{xycloalkenyl}$, $-C_1-C_2\text{alkyl}-C_3-C_6\text{xycloalkyl}$, $-C_1-C_2\text{alkyl}-C_3-C_6\text{xycloalkenyl}$ mà có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, $C_1-C_2 \text{ alkyl}$, $C_1-C_2 \text{ floalkyl}$ và $C_1-C_2 \text{ floalkoxy}$.

Tốt hơn nữa là, R^2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, 2-metylbutyl, 2,2-đimetylpropyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 2,3-đimetylbutyl, 2,2-đimetylbutyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclopentenyl - CH_2 -xyclopropyl, $-CH_2$ -xyclobutyl, $-CH_2$ -xyclopentyl, và $-CH_2$ -xyclopentenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, metyl và điflometoxy.

Còn tốt hơn nữa là, R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và điflometoxy.

Tốt nhất là, R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl hoặc xyclopropyl.

Trong nhóm khác của hợp chất, R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, R^7 hoặc $-C_1$ - C_2 alkyl- R^7 , mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 alkyl và C_1 - C_4 haloalkyl.

Tốt hơn là trong nhóm này của hợp chất, R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_2 alkyl và C_1 - C_2 haloalkyl.

Tốt hơn nữa là trong nhóm này của hợp chất, R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkenyl mà có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, C_1 - C_2 alkyl và C_1 - C_2 floalkyl.

Tốt hơn nữa là trong nhóm này của hợp chất, R^2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, 2-metylbutyl, 2,2-đimetylpropyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 2,3-đimetylbutyl, 2,2-đimetylbutyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclopentenyl $-CH_2$ -xyclopropyl, $-CH_2$ -xyclobutyl, $-CH_2$ -xyclopentyl, và $-CH_2$ -xyclopentenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và metyl.

Cũng tốt hơn nữa là trong nhóm này của hợp chất, R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều flo.

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_3 - C_6 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có từ 3 đến 6 cạnh;

Tốt hơn là, R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_3 alkyl hoặc C_3 - C_5 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 4 hoặc 5 cạnh.

Tốt hơn nữa là, R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, metyl, etyl, isopropyl hoặc xyclopropyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 4 cạnh.

Trong một nhóm của hợp chất, R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là metyl hoặc etyl.

Tốt hơn là trong nhóm này của hợp chất, R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl.

R^5 là H, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl.

Tốt hơn là, R^5 là H hoặc C_1 - C_4 alkyl.

Tốt hơn nữa là, R^5 là H hoặc metyl

Tốt nhất là, R^5 là hydro.

R^6 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy.

Tốt hơn là, R^6 là C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 alkoxy.

Tốt hơn nữa là, R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, metoxy hoặc etoxy.

Tốt hơn nữa là, R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, hoặc xyclopentyl.

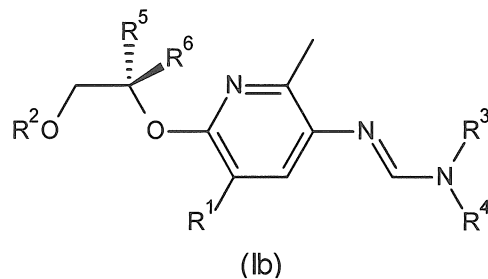
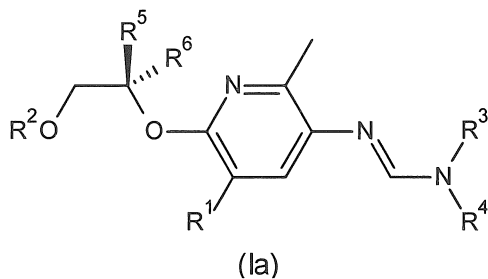
Tốt hơn nữa là, R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl hoặc xyclopentyl.

Tốt hơn nữa là, R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, hoặc xyclopropyl.

Tốt hơn nữa là, R^6 là metyl, etyl, n-propyl hoặc iso-propyl.

Tốt nhất là, R^6 là metyl.

Khi R^5 và R^6 không giống nhau, hợp chất có công thức (I) có thể tồn tại ở (ít nhất là) hai dạng đồng phân đối ảnh: (Ia) và (Ib).



Hợp chất triệt quang (I) là hỗn hợp 1:1 của hợp chất có công thức (Ia) và (Ib). Các tỷ lệ khác của (Ia) và (Ib) cũng có thể được và là một phần của sáng chế. Các ví dụ về tỷ lệ của (Ia) với (Ib) là 1:99, 2:98, 5:95, 10:90, 20:80, 30:70; 40:60, 45:55; 55:45; 60:40, 70:30, 80:20, 90:10, 95:5, 98:2, và 99:1.

Theo một phương án của sáng chế, tỷ lệ khối lượng của (Ib) so với (Ia) nặng về phía hợp chất có công thức (Ia), ví dụ, tỷ lệ của (Ib) so với (Ia) là 1:99, 2:98, 5:95, 10:90, 20:80, 30:70; 40:60 hoặc 45:55. Tốt hơn nữa là theo phương án này của sáng chế, hợp chất có công thức (I) về cơ bản có chứa hợp chất có công thức (Ia); tốt hơn nữa là, hợp chất có công thức (I) là hợp chất có công thức (Ia).

Theo phương án khác của sáng chế, tỷ lệ khối lượng của (Ia) so với (Ib) nặng về phía hợp chất có công thức (Ib), ví dụ, tỷ lệ của (Ia) so với (Ib) là 1:99, 2:98, 5:95, 10:90, 20:80, 30:70; 40:60 hoặc 45:55. Tốt hơn nữa là theo phương án này của sáng chế, hợp chất có công thức (I) về cơ bản có chứa hợp chất có công thức (Ib); tốt hơn nữa là, hợp chất có công thức (I) là hợp chất có công thức (Ib).

R^7 là hệ vòng đơn hoặc vòng đôi dung hợp có từ ba đến mười cạnh mà có thể là thơm, no một phần hoặc no hoàn toàn và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm có nitơ, oxy và lưu huỳnh, bản thân hệ vòng có từ ba đến mười cạnh này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy.

Tốt hơn là, R^7 là C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, phenyl, naphtyl, antraxyl, floenyl, indanyl, oxiranyl, oxetanyl, tetrahydrofuranyl, tetrahydropyranyl, 1,3-dioxolanyl, 1,4-dioxanyl, aziridinyl, azetidiny, pyrrolidinyl, piperidinyl, oxazinanyl, morpholinyl, thiomorpholinyl, imidazolidinyl, pyrazolidinyl, piperazinyl, pyridyl, pyridazinyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, furanyl, thiophenyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, thiazolyl, isothiazolyl,

thiadiazolyl, quinolinyl, cinnolinyl, quinoxalinyl, benzimidazolyl, benzothiophenyl, hoặc benzothiadiazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Tốt hơn nữa là, R⁷ là C₃-C₆xycloalkyl, C₃-C₅xycloalkenyl, phenyl, naphtyl, antraxyl, floenyl, indanyl, morpholinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl, pyridyl, pyrolyl, imidazolyl và triazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Tốt hơn nữa là, R⁷ là C₃-C₆xycloalkyl, C₃-C₅xycloalkenyl, phenyl, naphtyl, morpholinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl, pyridyl, pyrolyl, imidazolyl và triazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Tốt hơn nữa là, R⁷ là C₃-C₆xycloalkyl, C₃-C₅xycloalkenyl, phenyl, morpholinyl, pyrrolidinyl, piperidinyl, piperazinyl, pyridyl, pyrolyl, imidazolyl và triazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Cũng tốt hơn nữa là, R⁷ là C₃-C₆xycloalkyl, C₃-C₅xycloalkenyl, phenyl, morpholinyl, pyrrolidinyl, pyridyl và imidazolyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Tốt nhất là, R⁷ là C₃-C₆xycloalkyl hoặc C₃-C₅xycloalkenyl, mỗi nhóm này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy và C₁-C₄ haloalkoxy.

Trong một nhóm của hợp chất có công thức (I), R¹ là hydro, halogen, xyano, OH, NH₂, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ xycloalkyl, NH(C₁-C₄ alkyl), N(C₁-C₄ alkyl)₂, CO(C₁-C₄ alkyl), CO₂(C₁-C₄ alkyl), CO₂H, CONH(C₁-C₄ alkyl), CON(C₁-C₄ alkyl)₂, SO₂NH(C₁-C₄ alkyl), SO₂N(C₁-C₄ alkyl)₂, C₁-C₄ haloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ haloalkoxy, hoặc C₂-C₄ alkynyl;

R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 haloalkyl và C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_3 - C_6 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có từ 3 đến 6 cạnh;

R^5 là H, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl;

R^6 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, $NH(C_1$ - C_2 alkyl), $N(C_1$ - C_2 alkyl) $_2$, $CO(C_1$ - C_2 alkyl), $CO_2(C_1$ - C_2 alkyl), CO_2H , $CONH(C_1$ - C_2 alkyl), $CON(C_1$ - C_2 alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1$ - C_2 alkyl), $SO_2N(C_1$ - C_2 alkyl) $_2$, C_1 - C_4 floalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_2 haloalkoxy hoặc C_2 - C_4 alkynyl;

R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_2 haloalkyl và C_1 - C_2 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_3 alkyl hoặc C_3 - C_5 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 5 cạnh;

R^5 là H hoặc C_1 - C_4 alkyl;

R^6 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, $NHMe$, NMe_2 , $COMe$, CO_2Me , CO_2H , $CONHMe$, $CONMe_2$, SO_2NHMe , SO_2NMe_2 , CHF_2 , CF_3 , OMe , $OCHF_2$ hoặc axetylenyl;

R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, C_3 - C_5 xycloalkenyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkyl, $-C_1$ - C_2 alkyl- C_3 - C_6 xycloalkenyl mà có

thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, C₁-C₂ alkyl, C₁-C₂ floalkyl và C₁-C₂ floalkoxy;

R³ và R⁴ độc lập với nhau là hydro, metyl, etyl, isopropyl hoặc xyclopropyl; hoặc

R³ và R⁴ cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 5 cạnh;

R⁵ là H hoặc metyl;

R⁶ là C₁-C₄ alkyl hoặc C₁-C₄ alkoxy.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R₁ là hydro, halogen, xyano, metyl, etyl, xyclopropyl, CHF₂, CF₃, OMe, hoặc OCHF₂;

R₂ là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, 2-methylbutyl, 2,2-đimethylpropyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 2,3-đimethylbutyl, 2,2-đimethylbutyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclopentenyl -CH₂-xyclopropyl, -CH₂-xyclobutyl, -CH₂-xyclopentyl, và -CH₂-xyclopentenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, metyl và điflometoxy;

R³ là hydro hoặc metyl;

R⁴ là metyl hoặc etyl;

R⁵ là H hoặc metyl;

R⁶ là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, metoxy hoặc etoxy.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R¹ là hydro, Cl, Br, metyl, CHF₂ hoặc xyano;

R₂ là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và điflometoxy;

R³ là hydro hoặc metyl;

R⁴ là etyl;

R⁵ là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, metoxy hoặc etoxy.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và điflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl hoặc xyclopentyl.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và điflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl hoặc iso-propyl.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và điflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl.

Trong nhóm khác của hợp chất có công thức (I), R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl hoặc xyclopropyl;

R^3 là hydro hoặc metyl;

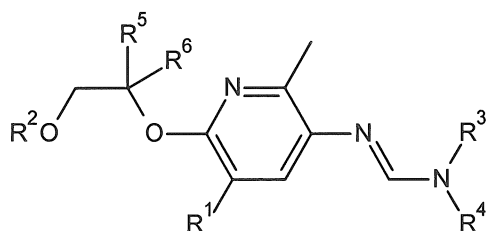
R^4 là etyl;

R^5 là hydro;

R^6 là metyl.

Các bảng từ 1 đến 22: Hợp chất có công thức (I)

Sáng chế được minh họa thêm bằng cách trình bày các hợp chất cụ thể sau đây có công thức (I) được liệt kê dưới đây trong các bảng từ 1 đến 22.

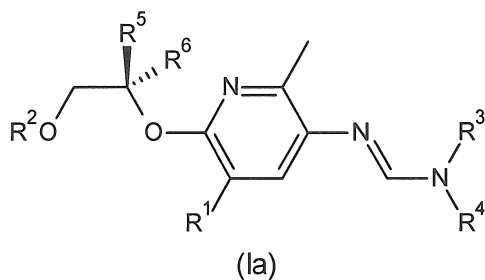


Mỗi bảng trong số các bảng từ 1 đến 22, mà tiếp theo bảng A dưới đây, nêu 47 hợp chất có công thức (I) trong đó R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 là các phần tử thể được xác định trong bảng A và R^1 là phần tử thể được xác định trong bảng có liên quan từ 1 đến 22. Do đó bảng 1 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (I) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 1. Tương tự, bảng 2 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (I) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 2; và tương tự như vậy đối với các bảng từ 3 đến 22.

Bảng A bộc lộ 47 bộ ý nghĩa của các biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 trong hợp chất có công thức I.

Các bảng từ 23 đến 44: Hợp chất có công thức (Ia)

Sáng chế được minh họa thêm bằng cách đưa ra các hợp chất cụ thể sau đây có công thức (Ia) được liệt kê dưới đây trong các bảng từ 23 đến 44.

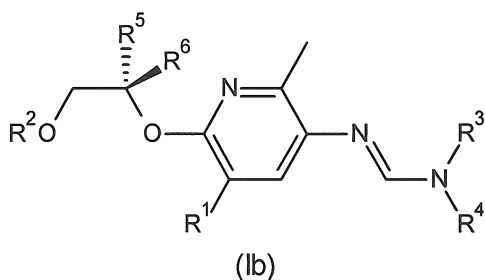


Mỗi bảng trong số các bảng từ 23 đến 44, mà tiếp theo bảng A dưới đây, nêu 47 hợp chất có công thức (Ia) trong đó R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 là các phần tử thế được xác định trong bảng A và R^1 là phần tử thế được xác định trong bảng thích hợp từ 23 đến 44. Do đó bảng 23 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (Ia) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 23. Tương tự, bảng 24 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (Ia) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 24; và tương tự như vậy đối với các Bảng từ 25 đến 44.

Bảng A bộc lộ 47 bộ ý nghĩa của các biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 trong hợp chất có công thức Ia.

Các bảng từ 45 đến 66: Hợp chất có công thức (Ib)

Sáng chế được minh họa thêm bằng cách đưa ra các hợp chất cụ thể sau đây có công thức (Ib) được liệt kê dưới đây trong các bảng từ 45 đến 66.



Mỗi bảng trong số các bảng từ 45 đến 66, mà tiếp theo bảng A dưới đây, nêu 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 là các phần tử thế được xác định trong bảng A và R^1 là phần tử thế được xác định trong bảng thích hợp từ 45 đến 66. Do đó bảng 45 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 45. Tương tự, bảng 46 chỉ rõ 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó đối với mỗi dòng của bảng A, R^1 là như được xác định trong bảng 46; và tương tự như vậy đối với các bảng từ 47 đến 66.

Bảng A bộc lộ 47 bộ ý nghĩa của các biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 trong hợp chất có công thức Ib.

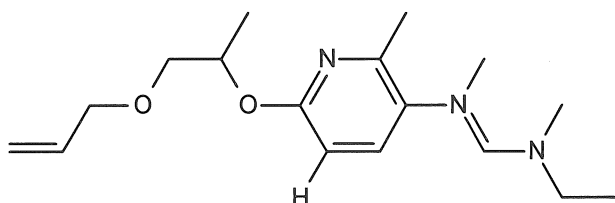
Bảng A

	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6
A.1.001	n-propyl	ethyl	ethyl	H	methyl
A.1.002	n-propyl	methyl	cyclopropyl	H	methyl
A.1.003	n-propyl	methyl	isopropyl	H	methyl
A.1.004	n-propyl	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$		H	methyl
A.1.005	n-propyl	methyl	methyl	H	methyl
A.1.006	n-propyl	ethyl	H	H	methyl
A.1.007	n-propyl	methyl	H	H	methyl
A.1.008	n-propyl	isopropyl	H	H	methyl
A.1.009	prop-2-enyl	ethyl	ethyl	H	methyl
A.1.010	prop-2-enyl	methyl	cyclopropyl	H	methyl
A.1.011	prop-2-enyl	methyl	isopropyl	H	methyl
A.1.012	prop-2-enyl	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$		H	methyl
A.1.013	prop-2-enyl	methyl	methyl	H	methyl
A.1.014	prop-2-enyl	ethyl	H	H	methyl
A.1.015	prop-2-enyl	isopropyl	H	H	methyl
A.1.016	prop-2-enyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.017	isopropyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.018	isopropyl	ethyl	methyl	methyl	methyl
A.1.019	propargyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.020	n-propyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.021	prop-2-enyl	ethyl	methyl	methyl	methyl
A.1.022	n-propyl	ethyl	methyl	methyl	methyl
A.1.023	propargyl	ethyl	methyl	methyl	methyl
A.1.024	3,3-diflopropyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.025	3,3,3-triflopropyl	ethyl	methyl	methyl	methyl
A.1.026	3,3,3-triflopropyl	ethyl	methyl	H	methyl

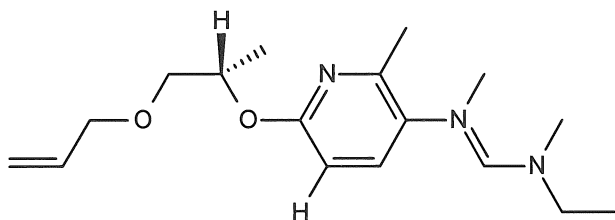
	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶
A.1.027	3,3-difloprop-2-enyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.028	n-propyl	ethyl	methyl	H	ethyl
A.1.029	prop-2-enyl	ethyl	methyl	H	ethyl
A.1.030	propargyl	ethyl	methyl	H	ethyl
A.1.031	n-propyl	ethyl	methyl	H	metoxymethyl
A.1.032	prop-2-enyl	ethyl	methyl	H	metoxymethyl
A.1.033	propargyl	ethyl	methyl	H	metoxymethyl
A.1.034	2,2-dimethyl-propyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.035	2-methyl-butyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.036	2,2-dimethyl-butyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.037	xyclopropyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.038	xyclobutyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.039	xyclopentyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.040	xyclopent-3-enyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.041	3-methyl-but-2-enyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.042	but-2-enyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.043	xyclopropyl-methyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.044	xyclobutyl-methyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.045	xyclopentyl-methyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.046	xyclopent-3-enyl-methyl	ethyl	methyl	H	methyl
A.1.047	n-propyl	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		H	methyl

Các bảng 1, 23 và 45: Các bảng 1, 23 và 45 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là hydro và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A. Ví dụ:

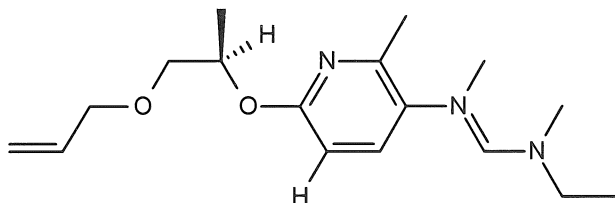
hợp chất 1.1.016 có cấu trúc sau:



hợp chất 23.1.043 có cấu trúc sau:



hợp chất 45.1.043 có cấu trúc sau:



Các bảng 2, 24 và 46: Các bảng 2, 24 và 46 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là clo và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 3, 25 và 47: Các Bảng 3, 25 và 47 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là bromo và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 4, 26 và 48: Các Bảng 4, 26 và 48 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là

iodo và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 5, 27 và 49: Các bảng 5, 27 và 49 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là methyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của Bảng A.

Các bảng 6, 28 và 50: Các bảng 6, 28 và 50 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là etyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của Bảng A.

Các bảng 7, 29 và 51: Các bảng 7, 29 và 51 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là xyclopropyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 8, 30 và 52: Các bảng 8, 30 và 52 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là triflometyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 9, 31 và 53: Các bảng 9, 31 và 53 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là điflometyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 10, 32 và 54: Các bảng 10, 32 và 54 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là etynyl và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

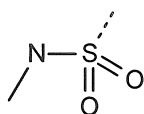
Các bảng 11, 33 và 55: Các bảng 11, 33 và 55 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là metoxy và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 12, 34 và 56: Các bảng 12, 34 và 56 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là điflometoxy và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

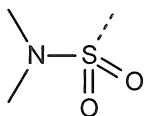
Các bảng 13, 35 và 57: Các bảng 13, 35 và 57 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là metylamino và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 14, 36 và 58: Các bảng 14, 36 và 58 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là dimetylamino và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 15, 37 và 59: Các bảng 15, 37 và 59 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là N-metylsulfonamit, trong đó đường chấm chấm dưới đây chỉ điểm gắn của nhóm R^1 vào phần còn lại của hợp chất và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.



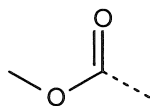
Các bảng 16, 38 và 60: Các bảng 16, 38 và 60 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là N,N-dimetylsulfonamit, trong đó đường chấm chấm dưới đây chỉ điểm gắn của nhóm R^1 vào phần còn lại của hợp chất và mỗi biến R^2 , R^3 , R^4 , R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.



Các bảng 17, 39 và 61: Các bảng 17, 39 và 61 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là flo và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 18, 40 và 62: Các bảng 18, 40 và 62 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là axetyl và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 19, 41 và 63: Các bảng 19, 41 và 63 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là metoxyformyl trong đó đường chấm chấm dưới đây chỉ điểm gắn của nhóm R^1 vào phần còn lại của hợp chất và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.



Các bảng 20, 42 và 64: Các bảng 20, 42 và 64 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là hydroxy và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 21, 43 và 65: Các bảng 21, 43 và 65 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là flometyl và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Các bảng 22, 44 và 66: Các bảng 22, 44 và 66 lần lượt bộc lộ 47 hợp chất có công thức (I), 47 hợp chất có công thức (Ia) và 47 hợp chất có công thức (Ib) trong đó R^1 là xyano và mỗi biến R^2, R^3, R^4, R^5 và R^6 có nghĩa cụ thể được nêu ở dòng tương ứng của bảng A.

Đã phát hiện ra rằng hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có, nhằm mục đích thực hành, phổ rất có lợi của các hoạt tính để bảo vệ cây trồng có ích chống lại các

bệnh gây ra bởi vi sinh vật gây bệnh ở cây, chẳng hạn như nấm, vi khuẩn hoặc virus, cụ thể là chống lại các bệnh gây ra bởi nấm.

Do đó, sáng chế còn đề cập đến phương pháp kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự phá hoại cây trồng có ích bởi vi sinh vật gây bệnh ở cây, trong đó hợp chất có công thức (I) được dùng làm thành phần hoạt tính cho cây trồng, phần của chúng hoặc địa điểm của chúng.

Thuật ngữ "cây trồng" là tất cả các phần hữu hình của cây trồng, bao gồm hạt, cây giống, cây non, rễ, thân củ, thân cây, cuống, tán lá, và quả.

Thuật ngữ "địa điểm" như dùng trong bản mô tả này có nghĩa là cánh đồng mà cây trồng sinh trưởng ở trong hoặc ở trên, hoặc nơi mà hạt của cây trồng được gieo xuống, hoặc nơi mà hạt sẽ được đặt vào trong đất. Nó bao gồm đất, hạt, và cây non, cũng như sinh dưỡng được thiết lập.

Hợp chất có công thức (I) có thể được dùng trong lĩnh vực nông nghiệp và lĩnh vực sử dụng liên quan ví dụ như làm thành phần hoạt tính để kiểm soát vật gây hại cây trồng hoặc trên nguyên liệu không sống để kiểm soát vi sinh vật hoặc sinh vật gây hư hỏng có khả năng gây hại cho con người.

Hợp chất có công thức (I) theo sáng chế khác biệt ở chỗ có hoạt tính mạnh ở tỷ lệ sử dụng thấp, được dung chịu tốt bởi cây trồng và an toàn với môi trường. Chúng có các đặc tính chữa bệnh, phòng bệnh và ngấm thuốc và rất hữu dụng và được sử dụng để bảo vệ nhiều cây có ích. Hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng để ức chế hoặc triệt tiêu các bệnh xảy ra trên cây trồng hoặc phần của cây trồng của giống cây trồng khác nhau của cây trồng có ích, cùng lúc đó cũng bảo vệ các phần của cây trồng mà phát triển muộn hơn khỏi bị nhiễm các vi sinh vật gây bệnh ở cây.

Có thể sử dụng hợp chất có công thức (I) làm thuốc diệt nấm. Thuật ngữ "thuốc diệt nấm" như dùng trong bản mô tả này có nghĩa là hợp chất mà kiểm soát, làm biến đổi, hoặc ngăn chặn sự phát triển của nấm. Thuật ngữ "lượng hữu hiệu để diệt nấm" có nghĩa là lượng của hợp chất hoặc dạng kết hợp của các hợp chất mà có khả năng gây ảnh hưởng lên sự phát triển của nấm. Hiệu quả kiểm soát hoặc làm biến đổi bao gồm tất cả sai lệch so với sự phát triển tự nhiên, chẳng hạn như sự hủy hoại, chậm phát triển và dạng tương tự, và sự ngăn chặn bao gồm hàng rào hoặc sự hình thành bảo vệ khác trong hoặc trên cây trồng để ngăn chặn sự nhiễm nấm.

Phương pháp sử dụng hợp chất có công thức (I) được ưu tiên là sử dụng cho lá. Tần suất sử dụng và tỷ lệ sử dụng tùy thuộc vào nguy cơ phá hoại bởi tác nhân gây bệnh tương ứng. Tuy nhiên, hợp chất có công thức (I) cũng có thể thâm nhập vào cây trồng qua rễ thông qua đất (tác động toàn thân) bằng cách làm ướt địa điểm của cây trồng bằng chế phẩm dạng lỏng, hoặc bằng cách sử dụng hợp chất ở dạng rắn cho đất, ví dụ ở dạng hạt (sử dụng cho đất). Ở các giống lúa nước, các hạt này có thể được dùng cho cánh đồng lúa ngập nước.

Cũng có thể sử dụng hợp chất có công thức (I) làm chất phủ ngoài để xử lý vật liệu nhân giống cây trồng, cụ thể là hạt và phần cắt cây trồng (ví dụ lúa), để bảo vệ chống lại sự nhiễm nấm cũng như là chống lại nấm gây bệnh cho cây ở trong đất.

Vật liệu nhân giống có thể được xử lý bằng chế phẩm có chứa hợp chất có công thức (I) trước khi ươm hạt, ví dụ, có thể được phủ ngoài trước khi gieo. Thành phần hoạt tính theo sáng chế cũng có thể được sử dụng cho hạt (lớp phủ), bằng cách tẩm hạt trong chế phẩm dạng lỏng hoặc bằng cách phủ chúng bằng chế phẩm rắn. Chế phẩm này cũng có thể được sử dụng cho vị trí trồng cây khi vật liệu nhân giống được trồng, ví dụ, vào rãnh tra hạt trong quá trình gieo. Sáng chế còn đề cập đến phương pháp xử lý vật liệu nhân giống cây trồng và đến vật liệu nhân giống cây trồng được xử lý bằng phương pháp này.

Thuật ngữ "vật liệu nhân giống cây trồng" là tất cả các phần có khả năng sinh sản của cây trồng, ví dụ hạt hoặc phần sinh dưỡng của cây trồng chẳng hạn như phần cắt và thân củ. Nó bao gồm hạt theo nghĩa hẹp, cũng như là rễ, quả, thân củ, thân hành, thân rễ, và các phần của cây trồng.

Ngoài ra hợp chất có công thức (I) theo sáng chế có thể được sử dụng để kiểm soát nấm ở các khu vực liên quan, ví dụ trong việc bảo vệ nguyên liệu kỹ thuật, bao gồm sản phẩm kỹ thuật bằng gỗ và có liên quan đến gỗ, trong lưu trữ thực phẩm hoặc trong quản lý vệ sinh.

Ngoài ra, sáng chế có thể được dùng để bảo vệ nguyên liệu không sống khỏi sự tấn công của nấm, ví dụ gỗ xẻ, tấm ốp tường và sơn.

Hợp chất có công thức (I) là ví dụ, hữu hiệu chống lại nấm và vật truyền nấm của bệnh cũng như là vi khuẩn và virus gây bệnh cho cây. Các nấm và vật truyền nấm này của bệnh cũng như là vi khuẩn và virus gây bệnh cho cây là, ví dụ:

Absidia corymbifera, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp. bao gồm *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium* spp. bao gồm *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp. bao gồm *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp. including *B. cinerea*, *Candida* spp. bao gồm *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitaniae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephaloascus fragrans*, *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp. bao gồm *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp. bao gồm *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe* spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp. bao gồm *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp. bao gồm *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*, *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium musarum*, *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Helminthosporium* spp, *Hemileia* spp, *Histoplasma* spp. bao gồm *H. capsulatum*, *Laetisaria fuciformis*, *Leptographium lindbergi*, *Leveillula taurica*, *Lophodermium seeditiosum*, *Microdochium nivale*, *Microsporum* spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp, *Mycosphaerella* spp. bao gồm *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium theobromaeon*, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp, *Penicillium* spp. bao gồm *P. digitatum*, *P. italicum*, *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp. bao gồm *P. maydis*, *P. philippinensis* và *P. sorghi*, *Peronospora* spp, *Phaeosphaeria nodorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus igniarius*, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*, *Phytophthora* spp. bao gồm *P. infestans*, *Plasmopara* spp. bao gồm *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp. bao gồm *P. leucotricha*, *Polymyxa graminis*, *Polymyxa betae*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp. bao gồm *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* spp. bao gồm *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. trititica*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp. bao gồm *P. oryzae*, *Pythium* spp. bao gồm *P. ultimum*, *Ramularia* spp, *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. bao gồm *S. apiospermum* và *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*, *Sclerotinia* spp,

Sclerotium spp, *Septoria* spp, bao gồm *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp. bao gồm *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. bao gồm *V. inaequalis*, *Verticillium* PCT/EP2015/057088, và *Xanthomonas* spp.

Các nhóm cây của cây trồng có ích trong đó chế phẩm theo sáng chế có thể được sử dụng bao gồm cây lâu năm và cây hàng năm, chẳng hạn như cây quả mọng ví dụ cây mâm xôi, cây việt quất, cây nam việt quất, cây phúc bồn tử và cây dâu tây; cây ngũ cốc ví dụ cây lúa mạch, cây bắp (cây ngô), cây kê, cây yến mạch, cây lúa, cây lúa mạch đen, cây cao lương tiểu hắc mạch và cây lúa mỳ; cây lấy sợi ví dụ cây bông, cây lanh, cây gai dầu, cây đay và cây siđan; field crops ví dụ củ cải đường và củ cải đường cho chăn nuôi, cây cà phê, cây hublông, cây mù tạc, cây hạt cải dầu (cây cải dầu), cây anh túc, cây mía, cây hướng dương, cây chè và cây thuốc lá; cây ăn quả ví dụ cây táo, cây mơ, cây lê tàu, cây chuối, cây anh đào, cây cam quýt, cây xuân đào, cây đào, cây lê và cây mận; cỏ ví dụ cỏ Bermuda, cỏ xanh bluegrass, cỏ bentgrass, cỏ chân rết, cỏ đuôi trâu, cỏ hoang, cỏ St. Augustine và cỏ Zoysia; cây thảo mộc chẳng hạn như cây húng quế, cây lưu ly (borage), cây hẹ, cây rau mùi, cây oải hương, cây cần núi, cây bạc hà, cây oregano, cây mùi tây, cây hương thảo, cây xô thơm và cây xạ hương; cây họ đậu ví dụ cây đậu đỏ, cây đậu lăng, cây đậu Hà Lan và cây đậu tương; hạt ví dụ hạnh nhân, đào lộn hột, lạc, hạt dẻ, đậu phộng, hồ đào, hồ trăn và óc chó; cây họ cò ví dụ cây cò dầu; cây cảnh ví dụ cây hoa, cây bụi và cây gỗ; các cây gỗ khác, ví dụ cây cacao, cây dừa, cây ô liu và cây sao su; cây rau ví dụ cây măng tây, cây cà tím, cây bông cải xanh, cây bắp cải, cây cà rốt, cây dưa chuột, cây tỏi, cây rau diếp, cây bí ngô, cây dưa, cây mướp tây, cây hành, cây ớt, cây khoai tây, cây bí đỏ, cây đại hoàng, cây rau bina và cây cà chua; và cây leo ví dụ cây nho.

Cây trồng được hiểu là các cây trồng trong tự nhiên, thu được bằng phương pháp lai giống thông thường hoặc thu được bằng kỹ thuật di truyền. Chúng bao gồm cây trồng chứa cái gọi là các đặc tính đầu ra (ví dụ cải thiện tính ổn định lưu trữ, giá trị dinh dưỡng cao hơn và cải thiện mùi vị).

Cây trồng được hiểu là còn bao gồm các cây trồng có khả năng kháng đối với chất diệt cỏ như bromoxynil hoặc nhóm chất diệt cỏ như chất ức chế ALS, EPSPS, GS, HPPD và PPO. Ví dụ về cây trồng có khả năng kháng đối với imidazolinon, ví dụ imazamox, bằng phương pháp lai giống thông thường là cây cải dầu mùa hè Clearfield®. Ví dụ về cây trồng có khả năng kháng đối với các chất diệt cỏ bằng phương pháp kỹ thuật di truyền bao gồm ví dụ các giống ngô kháng glyphosat và glufosinat được bán trên thị trường với nhãn hiệu RoundupReady®, Herculex I® và LibertyLink®.

Cây trồng còn được hiểu là các cây trồng có trong tự nhiên hoặc có khả năng đề kháng đối với côn trùng gây hại. Chúng bao gồm cây trồng được biến nạp bằng cách sử dụng kỹ thuật ADN tái tổ hợp, ví dụ, để có khả năng tổng hợp một hoặc nhiều độc tố tác động chọn lọc, chẳng hạn như đã biết, ví dụ, từ vi khuẩn sản xuất độc tố. Các ví dụ về độc tố mà có thể được biểu hiện bao gồm δ - nội độc tố, protein diệt côn trùng sinh dưỡng (Vip), protein diệt côn trùng của vi khuẩn định cư ở giun tròn, và độc tố được sản xuất bởi bọ cạp, động vật thuộc lớp nhện, ong bắp cày và nấm.

Ví dụ về cây trồng mà được biến đổi để biểu hiện độc tố *Bacillus thuringiensis* là ngô Bt KnockOut® (Syngenta Seeds). Ví dụ về cây trồng có chứa nhiều hơn một gen mà mã hóa để kháng côn trùng và do đó biểu hiện hơn một độc tố là VipCot® (Syngenta Seeds). Cây trồng hoặc vật liệu hạt của chúng có thể còn kháng nhiều loại gây hại cùng lúc (gọi là sự kiện chuyển gen xếp chồng khi tạo ra bởi sự cải biến di truyền). Ví dụ, cây có thể có khả năng biểu hiện protein diệt côn trùng trong khi cùng lúc kháng chất diệt cỏ, ví dụ Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

Hợp chất có công thức (I) có thể được sử dụng ở dạng không được cải biến hoặc, tốt hơn là, cùng với chất mang và tá dược thường được sử dụng trong lĩnh vực của chế phẩm.

Do đó sáng chế còn đề cập đến chế phẩm để kiểm soát và bảo vệ chống lại vi sinh vật gây bệnh ở cây, có chứa hợp chất có công thức (I) và chất mang trợ, và đến phương pháp kiểm soát hoặc ngăn ngừa sự phá hoại cây trồng có ích bởi vi sinh vật gây bệnh ở cây, trong đó hợp phần, có chứa hợp chất có công thức (I) làm thành phần

hoạt tính và chất mang trợ, được dùng cho cây trồng, cho phần của chúng hoặc địa điểm của chúng.

Vì vậy hợp chất có công thức (I) và chất mang trợ thường được tạo chế phẩm theo phương thức đã biết thành chất cô có thể nhũ tương hóa, bột nhão có thể phủ được, dung dịch có thể pha loãng được hoặc có thể phun được trực tiếp, nhũ tương loãng, bột có thể làm ẩm được, bột hòa tan, bụi, hạt, và cũng như là dạng kết bao ví dụ trong chất polyme. Với chế phẩm loại này, các phương pháp sử dụng, chẳng hạn như phun, phun sương, quét bụi, phân tán, phủ hoặc rót, được chọn theo mục đích dự kiến và hoàn cảnh hiện tại. Chế phẩm có thể còn chứa các tá dược khác chẳng hạn như chất làm ổn định, chất chống tạo bọt, chất điều hòa độ nhớt, chất liên kết hoặc chất dính cũng như là phân bón, chất cho vi chất dinh dưỡng hoặc các chế phẩm khác để thu được các tác dụng cụ thể.

Chất mang và tá dược (chất bổ trợ) thích hợp có thể là chất rắn hoặc chất lỏng và là chất hữu dụng trong công nghệ bào chế, ví dụ chất khoáng tự nhiên hoặc tái sinh, dung môi, chất phân tán, chất làm ẩm, chất dính, chất làm đặc, chất liên kết hoặc phân bón. Các chất mang này được mô tả ví dụ trong công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 97/33890.

Chế phẩm, tức là chế phẩm có chứa hợp chất có công thức (I) và, nếu muốn, tá dược rắn hoặc lỏng, được điều chế theo phương thức đã biết, thường là bằng cách trộn kỹ và/hoặc nghiền hợp chất với chất độn, ví dụ dung môi, chất mang rắn và, tùy ý, hợp chất có hoạt tính bề mặt (chất hoạt động bề mặt).

Chế phẩm hóa nông thường chứa hợp chất có công thức (I) với lượng nằm trong khoảng từ 0,1 đến 99% theo khối lượng, tốt hơn là từ 0,1 đến 95% theo khối lượng, tá dược rắn hoặc lỏng với lượng nằm trong khoảng từ 99,9 đến 1% theo khối lượng, tốt hơn là từ 99,8 đến 5% theo khối lượng, và chất hoạt động bề mặt với lượng nằm trong khoảng từ 0 đến 25% theo khối lượng, tốt hơn là từ 0,1 đến 25% theo khối lượng.

Mặc dù ưu tiên tạo chế phẩm sản phẩm thương mại dưới dạng chất cô, người dùng cuối thường sử dụng chế phẩm loãng.

Tỷ lệ sử dụng có lợi thường nằm trong khoảng từ 5 g đến 2 kg thành phần hoạt tính (a.i.) cho mỗi hecta (ha), tốt hơn là từ 10 g đến 1 kg a.i./ha, tốt nhất là từ 20g đến 600g a.i./ha. Khi dùng chất tẩm ướt hạt, tỷ lệ sử dụng thích hợp nằm trong khoảng từ 10 mg đến 1 g hoạt chất cho mỗi kg hạt. Tỷ lệ sử dụng để có tác động mong muốn có

thể được xác định bằng thí nghiệm. Nó phụ thuộc ví dụ vào kiểu tác động, giai đoạn phát triển của cây trồng có ích, và vào việc sử dụng (địa điểm, tính thời gian, phương pháp sử dụng) và có thể, do các tham số này, thay đổi trong giới hạn rộng.

Thông thường, trong quản lý cây trồng mùa vụ người trồng cây sẽ sử dụng một hoặc nhiều chất hóa nông khác ngoài hợp chất theo sáng chế. Các ví dụ về chất hóa nông bao gồm thuốc diệt sinh vật gây hại, chẳng hạn như thuốc diệt ve, thuốc diệt khuẩn, thuốc diệt nấm, thuốc diệt cỏ, thuốc diệt côn trùng, thuốc diệt giun tròn, cũng như là chất dinh dưỡng cây trồng và phân bón cây trồng.

Theo đó, sáng chế đề xuất chế phẩm có chứa hợp chất có công thức (I) theo sáng chế cùng với một hoặc nhiều thuốc diệt sinh vật gây hại, chất dinh dưỡng cây trồng hoặc phân bón cây trồng. Dạng kết hợp này cũng có thể bao hàm tính trạng cây trồng cụ thể được kết hợp vào cây trồng bằng cách sử dụng phương pháp bất kỳ, ví dụ phương pháp cải biến di truyền hoặc gây giống thông thường. Chế phẩm này có thể còn chứa một hoặc nhiều chất mang trợ như đã mô tả ở trên.

Sáng chế cũng đề xuất việc sử dụng chế phẩm có chứa hợp chất có công thức (I) theo sáng chế cùng với một hoặc nhiều thuốc diệt sinh vật gây hại, chất dinh dưỡng cây trồng hoặc phân bón cây trồng. Dạng kết hợp này cũng có thể bao hàm tính trạng cây trồng cụ thể được kết hợp vào cây trồng bằng cách sử dụng phương pháp bất kỳ, ví dụ phương pháp cải biến di truyền hoặc gây giống thông thường.

Các ví dụ thích hợp về chất dinh dưỡng cây trồng hoặc phân bón cây trồng là canxi sulfat (CaSO_4), canxi nitrat ($\text{Ca}(\text{NO}_3)_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$), canxi cacbonat (CaCO_3), kali nitrat (KNO_3), magie sulfat (MgSO_4), kali hydro phosphat (KH_2PO_4), mangan sulfat (MnSO_4), đồng sulfat (CuSO_4), kẽm sulfat (ZnSO_4), niken clorua (NiCl_2), coban sulfat (CoSO_4), kali hydroxit (KOH), natri clorua (NaCl), axit boric (H_3BO_3) và muối kim loại của chúng (Na_2MoO_4). Chất dinh dưỡng có thể có mặt với lượng nằm trong khoảng từ 5% đến 50% theo khối lượng, tốt hơn là từ 10% đến 25% theo khối lượng hoặc từ 15% đến 20% theo khối lượng của mỗi chất. Chất dinh dưỡng bổ sung được ưu tiên là ure ($(\text{NH}_2)_2\text{CO}$), melamin ($\text{C}_3\text{H}_6\text{N}_6$), kali oxit (K_2O), và nitrat vô cơ. Chất dinh dưỡng cây trồng bổ sung được ưu tiên nhất là kali oxit. Khi chất dinh dưỡng bổ sung được ưu tiên là ure, nó có mặt với lượng thường là nằm trong khoảng từ 1% đến

20% theo khối lượng, tốt hơn là từ 2% đến 10% theo khối lượng hoặc từ 3% đến 7% theo khối lượng.

Các ví dụ thích hợp về thuốc diệt sinh vật gây hại là thuốc diệt nấm axit axycloamino, thuốc diệt nấm nitơ béo, thuốc diệt nấm amit, thuốc diệt nấm anilit, thuốc diệt nấm kháng sinh, thuốc diệt nấm thơm, thuốc diệt nấm chứa arsen, thuốc diệt nấm aryl phenyl keton, thuốc diệt nấm benzamit, thuốc diệt nấm benzanilit, thuốc diệt nấm benzimidazol, thuốc diệt nấm benzothiazol, thuốc diệt nấm thực vật, thuốc diệt nấm diphenyl được bắc cầu, thuốc diệt nấm carbamat, thuốc diệt nấm carbanilat, thuốc diệt nấm conazol, thuốc diệt nấm đồng, thuốc diệt nấm đicarboximit, thuốc diệt nấm đinitrophenol, thuốc diệt nấm đithiocarbamat, thuốc diệt nấm đithiolan, thuốc diệt nấm furamit, thuốc diệt nấm furanilit, thuốc diệt nấm hydrazit, thuốc diệt nấm imidazol, thuốc diệt nấm thủy ngân, thuốc diệt nấm morpholin, thuốc diệt nấm phospho hữu cơ, thuốc diệt nấm thiếc hữu cơ, thuốc diệt nấm oxathiin, thuốc diệt nấm oxazol, thuốc diệt nấm phenylsulfamit, thuốc diệt nấm polysulfit, thuốc diệt nấm pyrazol, thuốc diệt nấm pyridin, thuốc diệt nấm pyrimidin, thuốc diệt nấm pyrrol, thuốc diệt nấm amoni bậc bốn, thuốc diệt nấm quinolin, thuốc diệt nấm quinon, thuốc diệt nấm quinoxalin, thuốc diệt nấm strobilurin, thuốc diệt nấm sulfonanilit, thuốc diệt nấm thiadiazol, thuốc diệt nấm thiazol, thuốc diệt nấm thiazolidin, thuốc diệt nấm thiocarbamat, thuốc diệt nấm thiophen, thuốc diệt nấm triazin, thuốc diệt nấm triazol, thuốc diệt nấm triazolopyrimidin, thuốc diệt nấm ure, thuốc diệt nấm valinamit, thuốc diệt nấm kẽm, Benzoylure, carbamat, clonicotinyl, điaxylhydrazin, điamit, fiprol, macrolit, nitroimin, nitrometylen, clo hữu cơ, phosphat hữu cơ, silicon hữu cơ, thiếc hữu cơ, phenylpyrazol, este của phosphoric, pyrethroit, spinosyn, dẫn xuất axit tetramic, dẫn xuất axit tetric, thuốc diệt giun tròn kháng sinh, thuốc diệt giun tròn, avermectin, thuốc diệt giun tròn thực vật, thuốc diệt giun tròn, carbamat, thuốc diệt giun tròn oxime carbamat, thuốc diệt giun tròn phospho hữu cơ, nấm hoặc vi khuẩn ăn giun tròn, thuốc diệt cỏ amit, thuốc diệt cỏ anilit, thuốc diệt cỏ chứa arsen, thuốc diệt cỏ arylalanin, thuốc diệt cỏ aryloxyphenoxypropionic, thuốc diệt cỏ benzofuranyl, thuốc diệt cỏ axit benzoic, thuốc diệt cỏ benzothiazol, thuốc diệt cỏ benzoylcyclohexanedion, thuốc diệt cỏ carbamat, thuốc diệt cỏ carbanilat, thuốc diệt cỏ cloacetanilit, thuốc diệt cỏ clotriazin, thuốc diệt cỏ xyclohexen oxmie, thuốc diệt cỏ xyclopropylisoxazol, thuốc diệt cỏ đicarboximit, thuốc diệt cỏ đinitroanilin, thuốc diệt cỏ đinitrophenol, thuốc diệt cỏ

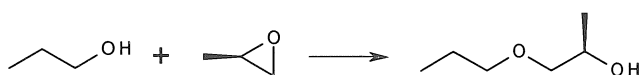
điphenyl ete, thuốc diệt cỏ đithiocarbamat, thuốc diệt cỏ floalkyltriazin, thuốc diệt cỏ béo đã halogen hóa, thuốc diệt cỏ imidazolinon, thuốc diệt cỏ vô cơ, thuốc diệt cỏ metoxytriazin, thuốc diệt cỏ metylthiotriazin, thuốc diệt cỏ nitril, thuốc diệt cỏ nitrophenyl ete, thuốc diệt cỏ phospho hữu cơ, thuốc diệt cỏ oxadiazolon, thuốc diệt cỏ oxazol, thuốc diệt cỏ phenoxy, thuốc diệt cỏ phenoxyaxetic, thuốc diệt cỏ phenoxybutyric, thuốc diệt cỏ phenoxypropionic, thuốc diệt cỏ phenylendiamin, thuốc diệt cỏ phenylure, thuốc diệt cỏ axit phthalic, thuốc diệt cỏ axit picolinic, thuốc diệt cỏ pyrazol, thuốc diệt cỏ pyridazin, thuốc diệt cỏ pyridazinon, thuốc diệt cỏ pyridin, thuốc diệt cỏ pyrimidindiamin, thuốc diệt cỏ pyrimidinylloxybenzylamin, thuốc diệt cỏ pyrimidinylsulfonyle, thuốc diệt cỏ amoni bậc bốn, thuốc diệt cỏ axit quinolincarboxylic, thuốc diệt cỏ sulfonamid, thuốc diệt cỏ sulfonanilit, thuốc diệt cỏ sulfonyle, thuốc diệt cỏ thiadiazolyle, thuốc diệt cỏ thioamid, thuốc diệt cỏ thiocarbamat, thuốc diệt cỏ thiocacbonat, thuốc diệt cỏ thioure, thuốc diệt cỏ triazin, thuốc diệt cỏ triazinon, thuốc diệt cỏ triazinylsulfonyle, thuốc diệt cỏ triazol, thuốc diệt cỏ triazolon, thuốc diệt cỏ triazolopyrimidin, thuốc diệt cỏ uraxin, thuốc diệt cỏ ure, vi khuẩn, chất chiết thực vật, pheromon, microbial và các sinh vật khác.

Các ví dụ không làm giới hạn sáng chế sau đây minh họa cho sáng chế đã được mô tả ở trên chi tiết hơn mà không làm giới hạn nó. Người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực sẽ nhanh chóng nhận ra các cải biến thích hợp từ các quy trình này cả về chất phản ứng và về điều kiện và kỹ thuật phản ứng. Tất cả các tài liệu tham khảo nêu trong bản mô tả này được kết hợp chỉ nhằm mục đích tham khảo.

Ví dụ thực hiện sáng chế

Bằng cách sử dụng các kỹ thuật tương tự với các kỹ thuật được mô tả trong công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 12/146125 (trang 370-378) và các kỹ thuật khác đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực, ví dụ như được tìm thấy trong công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 08/101682 (trang 22-33), hợp chất có công thức (I) có thể được điều chế.

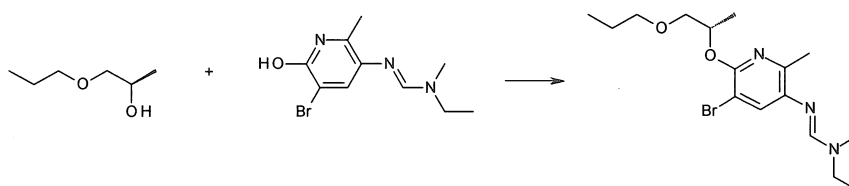
Điều chế (2*R*)-1-propoxypropan-2-ol



Bổ sung từng giọt 1-propanol (40 ml, 490mmol, 5 đương lượng) vào dung dịch đã được làm lạnh trong bể đá của THF (400 ml) trong khí trơ (Ar) và natri hydrua (12g, 490mmol, 5 đương lượng). Loại bỏ bể đá và khuấy hỗn hợp phản ứng ở nhiệt độ trong phòng trong thời gian 30 phút sau đó bổ sung từng giọt (2*R*)-2-metyloxiran (5,8g, 99mmol) và khuấy phản ứng trong thời gian 18 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 50°C. Sau thời gian này, GC-MS và NMR cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và hỗn hợp phản ứng được để cho đạt đến nhiệt độ trong phòng trước khi làm dừng bằng dung dịch NH₄Cl trong nước và chiết bằng diclometan. Làm khô lớp hữu cơ trên Na₂SO₄ khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không (không xuống dưới 200 mbar) ở nhiệt độ 30°C và tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (4,4g, hiệu suất 38%) dưới dạng chất lỏng màu vàng.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ (ppm) 4,00 – 3,87 (1H, m) 3,50 – 3,40 (m, 3H), 3,30 – 3,20 (m, 1H), 2,64 (d, 1H), 1,61 (m, 2H), 1,12 (d, 3H), 0,95 (t, 3H)

Điều chế N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1*S*)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin

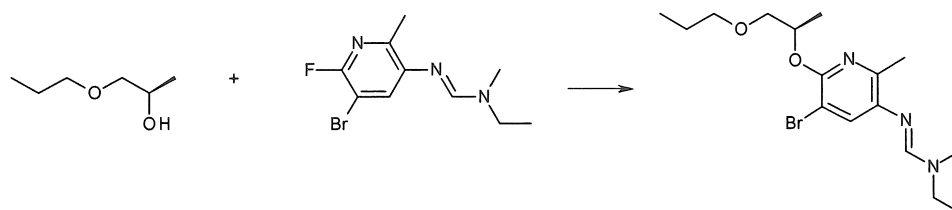


Bổ sung (2*R*)-1-propoxypropan-2-ol (0,36g, 3mmol, 1,1 đương lượng) và triphenylphosphin (0,80g, 3mmol, 1,1 đương lượng) vào huyền phù có khuấy của N'-(5-bromo-6-hydroxy-2-metyl-3-pyridyl)-N-etyl-N-metyl-formamidin (0,75g, 2,8mmol) trong THF (15 ml) ở nhiệt độ trong phòng trong khí trơ (Ar). Bổ sung từng giọt DIAD (diisopropyl diazodicarboxylat) (0,60 ml, 3mmol, 1,1 đương lượng) vào hỗn hợp này trong thời gian 10 phút trong khi giữ nhiệt độ dưới 40°C. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 24 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Sau thời gian này, LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu gần như đã được tiêu thụ hết và làm dừng hỗn hợp phản ứng bằng nước (40 ml). Chiết pha nước bằng etyl axetat (3x50 ml). Làm khô lớp hữu cơ trên Na₂SO₄ khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn

màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký pha đảo điều chế để tạo ra hợp chất mong muốn (0,10g, hiệu suất 10%).

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,45 – 7,30 (rộng s, 1H), 7,24 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 1H), 3,70 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,45 (m, 3H), 3,45 – 3,30 (rộng m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,65 – 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,20 (m, 3H), 0,90 (t, 3H).

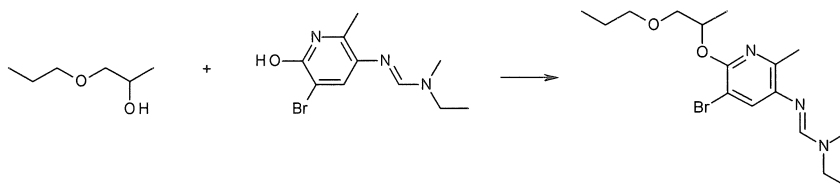
Điều chế N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1*R*)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin



Bổ sung kali tertbutoxit (0,25g, 2,19mmol, 3 đương lượng) và triphenylphosphin (0,14g, 0,55mmol, 1,5 đương lượng) vào dung dịch đã được làm lạnh trong bể đá của (2*R*)-1-propoxypropan-2-ol (0,103g, 0,88mmol, 1,2 đương lượng) trong DMF (4 ml) trong khí trơ. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 20 phút trước khi bổ sung N'-[5-bromo-6-flo-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin (0,20g, 0,73mmol). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 4 giờ ở nhiệt độ trong phòng và làm dừng bằng nước khi hoàn thành. Chiết pha nước bằng etyl axetat (2x50 ml). Kết hợp các lớp hữu cơ, rửa bằng nước (3x50 ml), làm khô trên Na_2SO_4 khan, và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký pha đảo điều chế để tạo ra hợp chất mong muốn (0,130g, hiệu suất 13%).

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,45 – 7,30 (rộng s, 1H), 7,24 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 1H), 3,70 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,45 (m, 3H), 3,50 – 3,30 (rộng m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,65 – 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,20 (m, 3H), 0,90 (t, 3H).

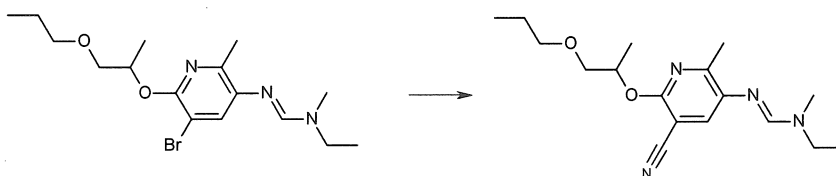
Điều chế N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin



Bổ sung 1-propoxypropan-2-ol (3,53 ml, 26,46mmol, 1,2 đương lượng) và triphenylphosphin (6,94g, 26,46mmol, 1,2 đương lượng) vào huyền phù có khuấy của N'-(5-bromo-6-hydroxy-2-metyl-3-pyridyl)-N-etyl-N-metyl-formamidin (6,0g, 22,05mmol) trong THF (30 ml) ở nhiệt độ trong phòng trong khí trơ (Ar). Bổ sung từng giọt DIAD (điisopropyl diazodicarboxylat) (5,21 ml, 26,46mmol, 1,2 đương lượng) vào hỗn hợp này trong thời gian 10 phút trong khi giữ nhiệt độ dưới 40°C. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 1,5 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Sau thời gian này, LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và hỗn hợp phản ứng được cô trong chân không. Bổ sung heptan vào phần cặn và làm nguội hỗn hợp này bằng bể đá để tái kết tinh triphenylphosphin oxit. Tinh chế phần cặn màu nâu bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, heptan/etyl axetat, thể tích/thể tích = từ 90/10 đến 4/1). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất tinh khiết và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (7,80g, hiệu suất 95%) dưới dạng dầu màu vàng nhạt.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,45 – 7,30 (rộng s, 1H), 7,24 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 1H), 3,70 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,45 (m, 3H), 3,45 – 3,30 (rộng m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,65 – 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,20 (m, 3H), 0,90 (t, 3H).

Điều chế N'-[5-xyano-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin



Bổ sung kẽm xyanua (0,087g, 0,74mmol, 1,1 đương lượng) và tetrakis(triphenylphosphin)paladi (0,23g, 0,20mmol, 0,3 đương lượng) vào dung dịch có khuấy của N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-

methyl-formamidin (0,25g, 0,67mmol) trong DMF (1 ml) trong khí trơ (Ar), và khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 18 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 120°C. Sau thời gian này, TLC và LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và hỗn hợp phản ứng được để cho đạt đến nhiệt độ trong phòng trước khi làm dừng bằng nước. Chiết pha nước bằng etyl axetat (2x30 ml). Rửa lớp hữu cơ bằng nước muối (3x50 ml), làm khô trên Na₂SO₄ khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, heptan/etyl axetat, thể tích/thể tích = từ 90/10 đến 70/30). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất tinh khiết và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,207g, hiệu suất 97%) dưới dạng dầu không màu.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ (ppm) 7,45 – 7,30 (rộng s, 1H), 7,20 (s, 1H), 5,50 – 5,40 (m, 1H), 3,70 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,40 (m, 3H), 3,45 – 3,30 (rộng m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 1,65 – 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,20 (m, 3H), 0,90 (t, 3H).

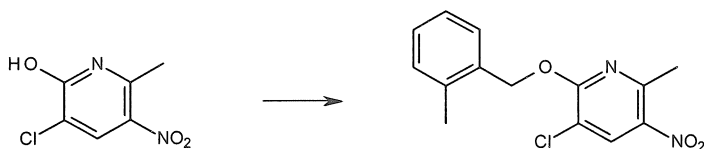
Điều chế 3-clo-6-metyl-5-nitro-pyridin-2-ol



Bổ sung từng phần N-closucxinimit (0,43g, 3,24mmol, 1 đương lượng) vào huyền phù được làm lạnh trong bể đá của 6-metyl-5-nitro-pyridin-2-ol (0,50g, 3,24mmol) trong axetonitril (5 ml) trong khí trơ (Ar). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 20 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 67°C. Vào lúc này, LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và làm lạnh hỗn hợp phản ứng xuống nhiệt độ 0°C và lọc chất kết tủa để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,36g, hiệu suất 48%) dưới dạng chất rắn màu trắng đục.

¹H NMR (400 MHz, CD₃OD): δ (ppm) 8,5 (s, 1H), 2,7 (s, 3H).

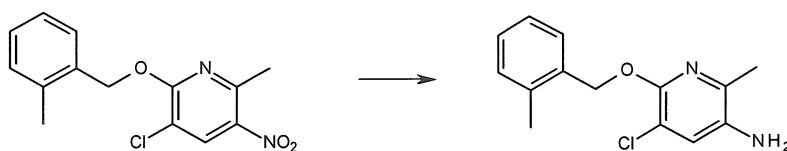
Điều chế 5-clo-2-metyl-3-nitro-6-(o-tolylmetoxy)pyridin



Bổ sung 3-clo-6-metyl-5-nitro-pyridin-2-ol (5,30g, 26,7mmol) và triphenylphosphin (8,41g, 32,1mmol, 1,2 đương lượng) vào dung dịch có khuấy của o-tolylmetanol (3,99g, 32,1mmol, 1,2 đương lượng) trong THF (100 ml) ở nhiệt độ trong phòng trong khí trơ (Ar). Bổ sung từng giọt DIAD (điisopropyl diazodicarboxylat) (6,58 ml, 33,4mmol, 1,25 đương lượng) vào hỗn hợp này trong thời gian 10 phút trong khi giữ nhiệt độ dưới 40°C. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 16 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Vào lúc này, LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và làm dừng hỗn hợp phản ứng bằng nước (20 ml). Chất kết tủa tạo thành và được lọc và được rửa bằng hỗn hợp metanol/nước (thể tích/thể tích = 5/1), được tạo huyền phù trong toluen và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (5,28g, hiệu suất 47%) dưới dạng chất rắn màu vàng.

^1H NMR (400 MHz, DMSO): δ (ppm) = 8,60 (s, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,30 – 7,20 (m, 3H), 5,50 (s, 2H), 2,70 (s, 3H), 2,35 (s, 3H).

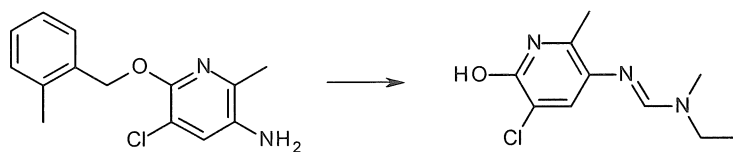
Điều chế 6-benzyloxy-5-clo-2-metyl-pyridin-3-amin



Đặt dung dịch 2-benzyloxy-3-clo-6-metyl-5-nitro-pyridin (250 mg, 0,90mmol), 10% platin 10% trên cacbon (12 mg, 0,062mmol) trong THF (5 ml) dưới áp suất hydro (3 đương lượng, 2,70mmol) bằng 3 bar và khuấy phản ứng trong thời gian 18 giờ ở nhiệt độ 37°C. Sau thời gian này, TLC cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ. Lọc hỗn hợp phản ứng và rửa phần cặn bằng metanol. Cô lớp hữu cơ để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0, 216g, hiệu suất 97%) mà được sử dụng mà không cần tinh chế thêm.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,50 - 7,45 (m, 1H), 7,25 - 7,15 (m, 3H), 7,0 (s, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,40 – 3,10 (rộng s, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

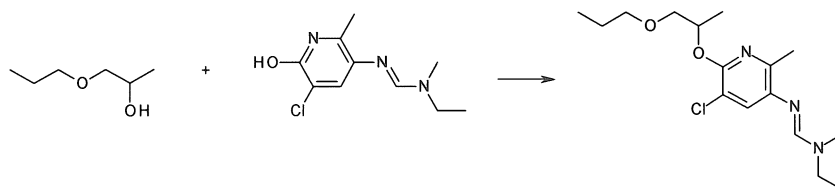
Điều chế N'-(5-clo-6-hydroxy-2-metyl-3-pyridyl)-N-etyl-N-metyl-formamidin



Bổ sung phospho oxyclorea (1,38 ml, 14,76mmol, 1,1 đương lượng) vào dung dịch N-etyl-N-metyl-formamit (1,29g, 14,76mmol, 1,1 đương lượng) trong điclorometan (70 ml). Khuấy dung dịch trong thời gian 1,5 giờ ở nhiệt độ trong phòng và sau đó bổ sung từng giọt dung dịch 5-clo-2-metyl-6-(o-tolylmethoxy)pyridin-3-amin (3,52g, 13,41mmol) trong điclorometan (10 ml). Sau khi khuấy trong thời gian 20 giờ ở nhiệt độ trong phòng, lọc chất rắn và rửa bằng điclorometan. Tinh chế phần cặn bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, điclorometan / metanol + trietylamin 5% thể tích/thể tích = từ 10/0 đến 9/1). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (2,52g, hiệu suất 82 %) dưới dạng chất rắn màu vàng.

^1H NMR (400 MHz, CD_3OD): δ (ppm) 7,65 – 7,50 (rộng s, 1H), 3,50 – 3,30 (rộng s, 1H), 3,0 (s, 2H), 2,25 (s, 3H), 1,35 (m, 3H), 1,25 (m, 3H).

Điều chế N'-[5-clo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin

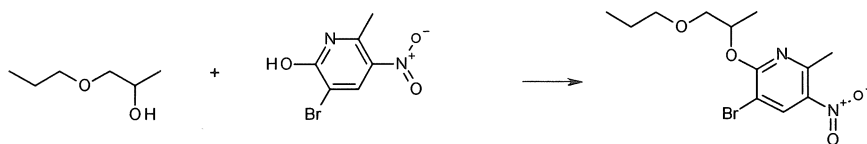


Bổ sung 1-propoxypropan-2-ol (0,14g, 1,21mmol, 1,1 đương lượng) và triphenylphosphin (0,32g, 1,21mmol, 1,1 đương lượng) vào dung dịch có khuấy của N'-(5-clo-6-hydroxy-2-metyl-3-pyridyl)-N-etyl-N-metyl-formamidin (0,25g, 1,10mmol) trong THF (10 ml) ở nhiệt độ trong phòng trong khí trơ (Ar). Bổ sung từng giọt DIAD (điisopropyl diazodicarboxylat) (0,24 ml, 1,21mmol, 1,1 đương lượng) vào hỗn hợp này trong thời gian 10 phút trong khi giữ nhiệt độ dưới 40°C. Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 16 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 60°C. Sau thời

gian này, lại bổ sung triphenylphosphin (0,15g, 0,55mmol, 0,5 đương lượng) và DIAD (diisopropyl diazodicarboxylat) (0,11 ml, 0,55mmol, 0,5 đương lượng) và tiếp tục khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 9 giờ. Để hỗn hợp phản ứng đạt đến nhiệt độ trong phòng trước khi làm dừng bằng nước (10 ml) và dung dịch trong nước NaOH 2M (2 ml). Chiết pha nước bằng etyl axetat (1x25 ml). Kết hợp các lớp hữu cơ, làm khô trên Na_2SO_4 khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, heptan/etyl axetat, thể tích/thể tích = từ 9/1 đến 1/1). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất tinh khiết và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,19g, hiệu suất 53%) dưới dạng dầu màu vàng.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,45 – 7,30 (rộng s, 1H), 7,05 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 1H), 3,70 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,40 (m, 3H), 3,45 – 3,30 (rộng m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 1,65 – 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,20 (m, 3H), 0,85 (t, 3H).

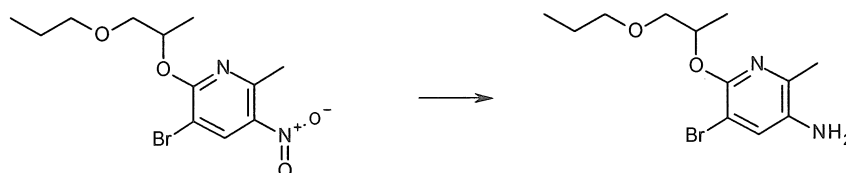
Điều chế 5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-nitro-pyridin



Bổ sung 1-propoxypropan-2-ol (0,15g, 1,2mmol, 1,2 đương lượng) và triphenylphosphin (0,32g, 1,2mmol, 1,2 đương lượng) vào huyền phù có khuấy của 3-bromo-6-metyl-5-nitro-pyridin-2-ol (0,23g, 1mmol) trong THF (0,08 ml) ở nhiệt độ trong phòng trong khí trơ (Ar). Bổ sung từng giọt DIAD (diisopropyl diazodicarboxylat) (0,24 ml, 1,2mmol, 1,2 đương lượng) vào hỗn hợp này trong thời gian 10 phút trong khi giữ nhiệt độ dưới 40°C . Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 12 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 65°C . Sau thời gian này, LC-MS vẫn cho thấy còn nguyên liệu bắt đầu nhưng để hỗn hợp phản ứng đạt đến nhiệt độ trong phòng và loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, Heptan/ trietylamin, thể tích/thể tích = 95/5). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất tinh khiết và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,20g, hiệu suất 60%) dưới dạng dầu màu be.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 8,45 (s, 1H), 5,50 – 5,40 (m, 1H), 3,65 – 3,60 (m, 1H), 3,65 – 3,50 (m, 1H), 3,50 – 3,35 (m, 2H), 2,70 (s, 3H), 1,50 (m, 2H), 1,30 (m, 3H), 0,80 (t, 3H).

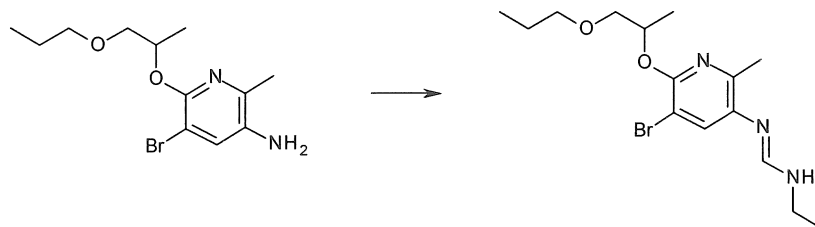
Điều chế 5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-amin



Bổ sung amoni clorua (0,15g, 2,82mmol, 2 đương lượng), nước (2,8 ml) và sau đó là sắt (0,32g, 5,64mmol, 4 đương lượng) vào huyền phù có khuấy của 5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-nitro-pyridin (0,47g, 1,41mmol) trong etanol (10 ml). Khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 4 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 85°C . Khi kiểm tra phản ứng vẫn cho thấy còn nhiều nguyên liệu bắt đầu, bổ sung amoni clorua (0,75g, 1,41mmol, 1 đương lượng) và sắt (0,16g, 2,82mmol, 2 đương lượng) và tiếp tục khuấy hỗn hợp phản ứng trong thời gian 10 giờ trong điều kiện gia nhiệt ở nhiệt độ 85°C . Sau thời gian này, LC-MS cho thấy rằng nguyên liệu bắt đầu đã được tiêu thụ và hỗn hợp phản ứng được để cho đạt đến nhiệt độ trong phòng trước khi lọc qua xelit. Loại bỏ dung môi trong chân không và tái hòa tan phần cặn bằng etyl axetat (15 ml). Rửa pha hữu cơ bằng dung dịch NaOH trong nước 2N (2x25 ml), làm khô trên Na_2SO_4 khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu nâu, mà được tinh chế bằng sắc ký cột combiflash (silicagel, heptan/etyl axetat + 10% triethylamin, thể tích/thể tích = từ 10/0 đến 1/1). Thu lấy các phân đoạn chứa hợp chất tinh khiết và cô trong chân không để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,27g, hiệu suất 63%) dưới dạng dầu màu cam-nâu.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,10 (s, 1H), 5,25 – 5,15 (m, 1H), 3,65 – 3,60 (m, 1H), 3,55 – 3,50 (m, 3H), 3,50 – 3,35 (rộng m, 2H), 2,20 (s, 3H), 1,50 (m, 2H), 1,25 (m, 3H), 0,80 (t, 3H).

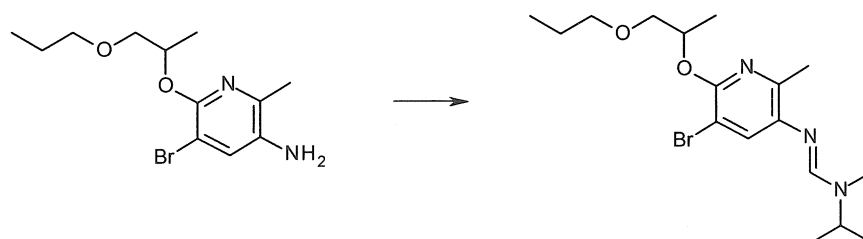
Điều chế N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-formamidin



Bổ sung phospho oxyclorea (0,085 ml, 0,91mmol, 1,1 đương lượng) vào dung dịch N-etylformamit (0,070 ml, 0,91mmol, 1,1 đương lượng) trong điclorometan (6,6 ml). Khuấy dung dịch trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó bổ sung từng giọt dung dịch 5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-amin (0,25g, 0,83mmol) trong điclorometan (3 ml). Khuấy huyền phù trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng sau đó rót lên hỗn hợp của dung dịch NaOH trong nước 2N (25 ml) và nước đá. Tách lớp nước, chiết bằng điclorometan (2x15 ml). Rửa pha hữu cơ bằng dung dịch NaOH trong nước 2N (25 ml) và nước muối (25 ml), làm khô trên Na_2SO_4 khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu vàng đậm, mà được tinh chế bằng HPLC điều chế pha đảo để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,09g, hiệu suất 29%) dưới dạng dầu màu cam-nâu.

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ (ppm) 7,45 (s, 1H), 7,25 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 1H), 4,70 – 4,50 (rộng s, 1H), 3,75 – 3,60 (m, 1H), 3,55-3,45 (m, 3H), 3,50 – 3,35 (rộng m, 2H), 2,30 (s, 3H), 1,60 - 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,25 (m, 3H), 0,80 (t, 3H).

Điều chế N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-metylformamidin



Bổ sung phospho oxyclorea (0,20 ml, 2,2mmol, 1,1 đương lượng) vào dung dịch N-metyl N-etylformamit (0,30g, 2,37mmol, 1,1 đương lượng, 80% theo khối lượng) trong điclorometan (4,0 ml). Khuấy dung dịch trong thời gian 1 giờ ở nhiệt độ trong phòng. Sau đó bổ sung từng giọt dung dịch 5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-

etoxy)pyridin-3-amin (0,60g, 2,0mmol) trong điclorometan (0,5 ml). Khuấy huyền phù trong thời gian 2 giờ ở nhiệt độ trong phòng sau đó rót lên hỗn hợp của dung dịch NaOH trong nước 2N (25 ml) và nước đá. Tách lớp nước, chiết bằng điclorometan (2x15 ml). Rửa pha hữu cơ bằng dung dịch NaOH trong nước 2N (25 ml) và nước muối (25 ml), làm khô trên Na₂SO₄ khan và lọc. Loại bỏ dung môi trong chân không để tạo ra phần cặn màu vàng đậm, mà được tinh chế bằng HPLC điều chế pha đảo để tạo ra hợp chất nêu ở đề mục (0,30g, hiệu suất 40%) dưới dạng dầu màu cam.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ (ppm) 7,47 (rộng s, 1H), 7,25 (s, 1H), 5,40 – 5,30 (m, 2H), 3,70 – 3,64 (m, 3H), 3,60-3,40 (m, 3H), 2,94 (rộng s, 2H) 2,35 (d, 3H), 1,65 - 1,50 (m, 2H), 1,35 (m, 3H), 1,25 (m, 6H), 0,90 (t, 3H).

Bảng 67

Bảng này đưa ra dữ liệu phân tích đối với hợp chất có công thức (I) được điều chế bằng cách sử dụng các kỹ thuật tương tự như các kỹ thuật ở trên, cũng như là các kỹ thuật được mô tả trong công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 12/146125 (trang 370-378) và các kỹ thuật khác đã biết đối với người có hiểu biết trung bình trong lĩnh vực, ví dụ như được tìm thấy trong công bố đơn sáng chế quốc tế số WO 08/101682 (trang 22-33).

Hợp chất số	Công thức cấu tạo	Phương pháp LC: R _t (phút); MS-ESI (m/z; (M+H) ⁺);
67.001	5-[(E)-[etyl(metyl)amino]metylenamino]-6-metyl-2-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-carboxamit	Phương pháp 1 0,9 phút; 337
67.002	N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1S)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,76 phút; 372

Hợp chất số	Công thức cấu tạo	Phương pháp LC: R _t (phút); MS-ESI (m/z; (M+H) ⁺);
67.003	N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1R)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,76 phút; 372
67.004	5-[(E)-[etyl(metyl)amino]metylenamino]-N,N,6-trimetyl-2-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-carboxamit	Phương pháp 1 0,8 phút; 361
67.005	5-[(E)-[etyl(metyl)amino]metylenamino]-N,6-dimetyl-2-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-carboxamit	Phương pháp 1 0,8 phút; 351
67.006	Axit 5-[(E)-[etyl(metyl)amino]metylenamino]-6-metyl-2-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-carboxylic	Phương pháp 1 0,7 phút; 338
67.007	N'-[5-xyano-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,78 phút; 319
67.008	N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-isopropyl-N-metyl-formamidin	dầu
67.009	N'-[5-(diflometyl)-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 2 13,04 phút; 342

Hợp chất số	Công thức cấu tạo	Phương pháp LC: R _t (phút); MS-ESI (m/z; (M+H) ⁺);
67.010	N'-[5-(điflometoxy)-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,85 phút; 360
67.011	N'-[2,5-đimetyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,79 phút; 308
67.012	N-etyl-N-metyl-N'-[2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]formamidin	Phương pháp 1 0,67 phút; 294
67.013	N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,76 phút; 372
67.014	N'-[6-(2-allyloxy-1-metyl-etoxy)-5-clo-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,08 phút; 326
67.015	N'-[5-clo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 1,11 phút; 328
67.016	N'-[6-[1-(allyloxymetyl)-2-metoxymetyl]-5-bromo-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,02 phút; 400

Hợp chất số	Công thức cấu tạo	Phương pháp LC: R _t (phút); MS-ESI (m/z; (M+H) ⁺);
67.017	N'-[6-(2-allyloxy-1-metyl-etoxy)-5-xyano-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 0,96 phút; 317
67.018	N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-isopropyl-N-metyl-formamidin	dầu
67.019	Metyl 5-[(E)-[etyl(metyl)amino]metylenamino]-6-metyl-2-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)pyridin-3-carboxylat	Phương pháp 1 0,80 phút; 352
67.020	N'-[5-xyano-2-metyl-6-[1-metyl-2-[3-(triflometyl)phenoxy]etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,33 phút; 422
67.021	N'-[6-[2-(4-clophenoxy)-1-metyl-etoxy]-5-xyano-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,29 phút; 387
67.022	N'-[5-xyano-2-metyl-6-(1-metyl-2-phenoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,21 phút; 353
67.023	N'-[5-clo-2-metyl-6-[1-metyl-2-[3-(triflometyl)phenoxy]etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,38 phút; 430

Hợp chất số	Công thức cấu tạo	Phương pháp LC: R _t (phút); MS-ESI (m/z; (M+H) ⁺);
67.024	N'-[5-clo-6-[2-(4-clophenoxy)-1-metyl-etoxy]-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,38 phút; 396
67.025	N'-[5-clo-2-metyl-6-(1-metyl-2-phenoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,23 phút; 362
67.026	N'-[5-bromo-6-[2-(4-clophenoxy)-1-metyl-etoxy]-2-metyl-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,37 phút; 440
67.027	N'-[5-bromo-2-metyl-6-[1-metyl-2-[3-(triflometyl)phenoxy]etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,42 phút; 474
67.028	N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-phenoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 3 1,25 phút; 406
67.029	N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-xyclopropyl-N-metyl-formamidin	Phương pháp 1 0,77 phút; 371
67.030	1-(azetidin-1-yl)-N-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]metanimin	Phương pháp 1 0,76 phút; 385

Các phương pháp phân tích được sử dụng

Phương pháp 1: Khối phổ được ghi lại trên Thiết Bị Đo Khối Phổ của hãng Waters (Thiết Bị Đo Khối Phổ tứ cực đơn lẻ SQD hoặc ZQ) được lắp với nguồn phun điện tử (Chiều phân cực: ion dương hoặc ion âm, Mao dẫn: 3,00 kV, Khoảng giá trị nón: 30-60 V, Bộ chiết: 2,00 V, Nhiệt độ nguồn: 150°C, Nhiệt độ khử solvat hóa: 350°C, Dòng khí hình nón: 0 l/giờ, Lưu lượng khí khử solvat hóa: 650 l/giờ, Khoảng khối lượng: từ 100 đến 900 Da) và Acquity UPLC của hãng Waters: Bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Bộ tiết lưu dung môi, bơm hai kỳ, khoang cột được gia nhiệt và máy dò tia điôt. Cột: Waters UPLC HSS T3, 1,8 m, 30 x 2,1 mm, Nhiệt độ: 60 °C, Khoảng bước sóng DAD (nm): từ 210 đến 500, Gradient dung môi: A = nước + MeOH 5% + HCOOH 0,05 %, B= axetonitril + HCOOH 0,05 %. Gradient: 0 phút 0% B, 100% A; 1,2-1,5 phút 100% B; Dòng chảy (ml/phút) 0,85.

Phương pháp 2: Khối phổ được ghi lại trên Thiết Bị Đo Khối Phổ của hãng Shimadzu (Thiết Bị Đo Khối Phổ tứ cực đơn lẻ SQD hoặc ZQ) được lắp với nguồn phun điện tử (Chiều phân cực: ion dương hoặc ion âm, Mao dẫn: 1,5 kV, Khoảng giá trị nón: chưa biết, Bộ chiết: 5,00 V, Nhiệt độ nguồn: 200°C, Nhiệt độ khử solvat hóa: 250°C, Dòng khí hình nón: 90 l/giờ, Lưu lượng khí khử solvat hóa: 90 l/giờ, Khoảng khối lượng: từ 50 đến 900 Da) và SPD-20A từ LC từ Shimadzu: Bộ tiết lưu dung môi, bơm hai thành phần, buồng cột gia nhiệt và bộ phát hiện tia cực tím. Cột: Diamonsil C18 (2) 5u 150*4,6mm, Nhiệt độ: 40 °C, Khoảng giới hạn bước sóng SPD-20A (nm): từ 210 đến 500, Gradient dung môi: A = nước + 0,1 % F₃CCOOH, B= Axetonitril + 0,1 % F₃CCOOH; Gradient: 0 phút 10% B, 90% A; 15 phút 100% B; Dòng chảy 1,00 (ml/phút)

Phương pháp 3: Khối phổ được ghi lại trên thiết bị đo khối phổ ZQ2000 của hãng Waters (Thiết bị đo khối phổ tứ cực đơn lẻ) được lắp với nguồn phun điện tử (Chiều phân cực: ion dương, Mao dẫn (kV) 3,5, Hình nón (V) 60,00, Bộ chiết (V) 3,00, Nhiệt Độ Nguồn (°C) 150, Nhiệt Độ Khử Solvat Hóa (°C) 350, Dòng chảy Khí Hình Nón (l/giờ) 50, Dòng chảy Khí Khử Solvat Hóa (l/giờ) 800, Khoảng giá trị khối: từ 140 đến 800 Da) Khoảng giới hạn bước sóng DAD (nm): từ 210 đến 400, Loại cột: Waters ACQUITY UPLC HSS T3; Chiều dài cột: 30 mm; Đường kính trong của cột: 2,1 mm;

Kích thước hạt: 1,8 micro; Nhiệt độ: 60°C. Gradient Dung môi: A = nước + MeOH 10% + HCOOH 0,1 %, B= axetonitril + HCOOH 0,1 %. Gradient: 0 phút 0% B, 100% A; 2,5-2,8 phút 100% B; 0% A; 3,0 phút 100% A, 0% B: Dòng chảy (ml/phút) 0,85.

Các ví dụ sinh học

Phòng ngừa Blumeria graminis f. sp. tritici (Erysiphe graminis f. sp. tritici) / cây lúa mì / bản lá (Nấm mốc bột trên cây lúa mì)

Mảnh lá lúa mì cv. Đặt Kanzler lên aga trong đĩa có nhiều giếng (loại 24 giếng) và phun bằng hợp chất thử nghiệm đã được tạo chế phẩm được pha loãng trong nước. Chủng bản lá bằng cách rung cây bị nhiễm nấm mốc bột ở trên đĩa thử nghiệm 1 ngày sau khi sử dụng. Ủ bản lá đã được chủng ở nhiệt độ 20°C và độ ẩm tương đối 60% trong chế độ ánh sáng 24 giờ tối sau đó là 12 giờ sáng / 12 giờ tối trong buồng điều hòa khí hậu và đánh giá hoạt tính của hợp chất dưới dạng tỷ lệ phần trăm kiểm soát bệnh so với không được điều trị khi mức độ thích hợp của sự tổn hại do bệnh xuất hiện trên các mảnh lá kiểm tra không được điều trị (6 - 8 ngày sau khi sử dụng).

Các hợp chất sau đây được cấp ở 200 phần triệu tạo ra ít nhất là 80% kiểm soát bệnh trong thử nghiệm này khi so với các đĩa lá đối chứng không được điều trị trong cùng điều kiện, mà thể hiện sự phát triển bệnh rộng rãi:

Q.002, Q.003, Q.007, Q.008, Q.009, Q.010, Q.011, Q.013, Q.014, Q.015, Q.016, Q.017, Q.018, Q.020, Q.021, Q.022, Q.023, Q.024, Q.025, Q.026, Q.027, Q.028, Q.029, Q.030.

Phòng ngừa Puccinia recondita f. sp. tritici / cây lúa mì / bản lá (bệnh gỉ sắt)

Mảnh lá lúa mì cv. Đặt Kanzler lên aga trong đĩa có nhiều giếng (loại 24 giếng) và phun bằng hợp chất thử nghiệm đã được tạo chế phẩm được pha loãng trong nước. Chủng bản lá bằng huyền phù bào tử của nấm 1 ngày sau khi sử dụng. Ủ các mảnh lá đã được chủng ở nhiệt độ 19°C và độ ẩm tương đối 75% trong chế độ chiếu sáng 12 giờ sáng / 12 giờ tối trong buồng điều hòa khí hậu và đánh giá hoạt tính của hợp chất dưới dạng tỷ lệ phần trăm kiểm soát bệnh so với không được điều trị khi mức độ thích hợp của sự tổn hại do bệnh xuất hiện trong các mảnh lá kiểm tra không được điều trị (7 – 9 ngày sau khi sử dụng).

Các hợp chất sau đây được cấp ở 200 phần triệu tạo ra ít nhất là 80% kiểm soát bệnh trong thử nghiệm này khi so với các đĩa lá đối chứng không được điều trị trong cùng điều kiện, mà thể hiện sự phát triển bệnh rộng rãi:

Q.002, Q.003, Q.007, Q.008, Q.009, Q.010, Q.011, Q.013, Q.014, Q.015, Q.016, Q.017, Q.018, Q.020, Q.021, Q.022, Q.023, Q.024, Q.025, Q.026, Q.028, Q.029, Q.030..

Trị bệnh Puccinia recondita f. sp. tritici / cây lúa mì / bản lá (Bệnh gỉ sắt)

Mảnh lá lúa mì cv. Đặt Kanzler lên aga trong đĩa có nhiều giếng (loại 24 giếng). Chủng các mảnh lá bằng huyền phù bào tử của nấm. Lưu trữ đĩa trong tối ở nhiệt độ 19°C và độ ẩm tương đối 75%. Sử dụng hợp chất thử nghiệm đã được tạo chế phẩm được pha loãng trong nước 1 ngày sau khi chủng. Ủ các mảnh lá ở nhiệt độ 19°C và độ ẩm tương đối 75% trong chế độ chiếu sáng 12 giờ sáng / 12 giờ tối trong buồng điều hòa khí hậu và đánh giá hoạt tính của hợp chất dưới dạng tỷ lệ phần trăm kiểm soát bệnh so với không được điều trị khi mức độ thích hợp của sự tổn hại do bệnh xuất hiện trong các mảnh lá kiểm tra không được điều trị (6 – 8 ngày sau khi sử dụng).

Các hợp chất sau đây được cấp ở 200 phần triệu tạo ra ít nhất là 80% kiểm soát bệnh trong thử nghiệm này khi so với các đĩa lá đối chứng không được điều trị trong cùng điều kiện, mà thể hiện sự phát triển bệnh rộng rãi:

Q.002, Q.003, Q.007, Q.008, Q.009, Q.010, Q.011, Q.012, Q.013, Q.014, Q.015, Q.016, Q.017, Q.018, Q.019, Q.020, Q.021, Q.022, Q.023, Q.024, Q.025, Q.026, Q.027, Q.028, Q.029, Q.030..

Phakopsora pachyrhizi trên đậu tương, điều trị phòng ngừa

Thử nghiệm hoạt tính hợp chất trong điều kiện phòng ngừa 1 ngày. Cây đậu tương có lá có ba lá chết thứ nhất cuộn hoàn toàn được phun bằng máy phun đường đi và thể tích phun 50l/ha bằng hợp chất thử nghiệm, ở dạng đơn lẻ hoặc trong thùng trộn như được thể hiện trong bảng dưới đây. 1 ngày sau khi sử dụng các bản lá được cắt ra từ lá có ba lá chết thứ nhất và được đặt trong đĩa có nhiều giếng trên nước-aga. 5 bản lá cho mỗi điều trị mà bị nhiễm bào tử của chủng gỉ sắt đậu tương dung chịu triazol. Đĩa có nhiều giếng mà được bịt kín và được đặt trong thiết bị ủ 48 giờ trong tối và chu kỳ 12 giờ sáng/tối sau đó. Đánh giá sự phá hoại bởi gỉ sắt trên các bản lá bằng mắt 11

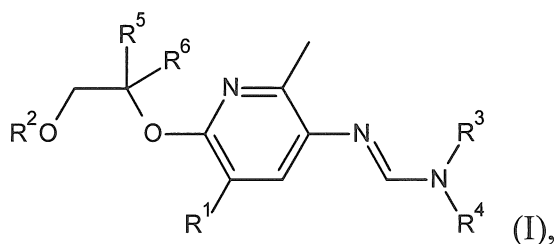
ngày sau khi sử dụng và tính hoạt tính trung bình tương đối so với mức độ nghiêm trọng của bệnh trên các bản lá kiểm tra không được điều trị.

Các hợp chất sau đây được cấp ở 200 phần triệu tạo ra ít nhất là 80% kiểm soát bệnh trong thử nghiệm này khi so với các đĩa lá đối chứng không được điều trị trong cùng điều kiện, mà thể hiện sự phát triển bệnh rộng rãi:

Q.002, Q.003, Q.007, Q.008, Q.009, Q.010, Q.011, Q.012, Q.013, Q.014, Q.015, Q.016, Q.017, Q.018, Q.019 Q.020, Q.023, Q.024, Q.025, Q.026, Q.027, Q.028, Q.029, Q.030..

YÊU CẦU BẢO HỘ

1. Hợp chất có công thức (I):



trong đó

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 xycloalkyl, $NH(C_1$ - C_4 alkyl), $N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $CO(C_1$ - C_4 alkyl), $CO_2(C_1$ - C_4 alkyl), CO_2H , $CONH(C_1$ - C_4 alkyl), $CON(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1$ - C_4 alkyl), $SO_2N(C_1$ - C_4 alkyl) $_2$, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkoxy, C_1 - C_4 alkyl- C_1 - C_4 alkoxy hoặc C_2 - C_4 alkynyl;

R^2 là C_3 - C_6 alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 alkynyl, R^7 hoặc $-C_1$ - C_2 alkyl- R^7 , mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 haloalkyl và C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_3 - C_6 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có từ 3 đến 6 cạnh;

R^5 là H, C_1 - C_4 alkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkyl;

R^6 là C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkoxy, C_1 - C_4 haloalkyl hoặc C_1 - C_4 haloalkoxy;

R^7 là hệ vòng đơn hoặc vòng đôi dung hợp có từ ba đến mười cạnh mà có thể là thơm, no một phần hoặc no hoàn toàn và có thể chứa từ 1 đến 4 nguyên tử khác loại được chọn từ nhóm gồm có nitơ, oxy và lưu huỳnh, bản thân hệ vòng có từ ba đến mười cạnh này tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1 - C_4 haloalkyl, C_1 - C_4 alkoxy và C_1 - C_4 haloalkoxy;

và các chất hổ biến/chất đồng phân/chất đồng phân đối ảnh/muối và N-oxit của các hợp chất này.

2. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 trong đó:

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , C_1-C_4 alkyl, C_3-C_6 xycloalkyl, $NH(C_1-C_4$ alkyl), $N(C_1-C_4$ alkyl) $_2$, $CO(C_1-C_4$ alkyl), $CO_2(C_1-C_4$ alkyl), CO_2H , $CONH(C_1-C_4$ alkyl), $CON(C_1-C_4$ alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1-C_4$ alkyl), $SO_2N(C_1-C_4$ alkyl) $_2$, C_1-C_4 haloalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkoxy, hoặc C_2-C_4 alkynyl;

R^2 là C_3-C_6 alkyl, C_3-C_6 alkenyl, C_3-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_5 xycloalkenyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1-C_2 alkyl, C_1-C_2 haloalkyl, C_1-C_2 alkoxy và C_1-C_2 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1-C_4 alkyl hoặc C_3-C_6 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có từ 3 đến 6 cạnh;

R^5 là H, C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 haloalkyl;

R^6 là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkyl hoặc C_1-C_4 haloalkoxy.

3. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1 hoặc điểm 2 trong đó:

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, $NH(C_1-C_2$ alkyl), $N(C_1-C_2$ alkyl) $_2$, $CO(C_1-C_2$ alkyl), $CO_2(C_1-C_2$ alkyl), CO_2H , $CONH(C_1-C_2$ alkyl), $CON(C_1-C_2$ alkyl) $_2$, $SO_2NH(C_1-C_2$ alkyl), $SO_2N(C_1-C_2$ alkyl) $_2$, C_1-C_4 floalkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_2 haloalkoxy hoặc C_2-C_4 alkynyl;

R^2 là C_3-C_6 alkyl, C_3-C_6 alkenyl, C_3-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_5 xycloalkenyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có halogen, C_1-C_2 alkyl, C_1-C_2 haloalkyl và C_1-C_2 haloalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, C_1-C_3 alkyl hoặc C_3-C_5 xycloalkyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 5 cạnh;

R^5 là H hoặc C_1-C_4 alkyl;

R^6 là C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 alkoxy, C_1-C_4 haloalkyl hoặc C_1-C_4 haloalkoxy.

4. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó:

R^1 là hydro, halogen, xyano, OH, NH_2 , metyl, etyl, xyclopropyl, NHMe, NMe_2 , COMe, CO_2Me , CO_2H , CONHMe, $CONMe_2$, SO_2NHMe , SO_2NMe_2 , CHF_2 , CF_3 , OMe, $OCHF_2$ hoặc axetylenyl;

R^2 là C_3-C_6 alkyl, C_3-C_6 alkenyl, C_3-C_6 alkynyl, C_3-C_6 xycloalkyl, C_3-C_5 xycloalkenyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkyl, $-C_1-C_2$ alkyl- C_3-C_6 xycloalkenyl mà có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, C_1-C_2 alkyl, C_1-C_2 floalkyl và C_1-C_2 floalkoxy;

R^3 và R^4 độc lập với nhau là hydro, metyl, etyl, isopropyl hoặc xyclopropyl; hoặc

R^3 và R^4 cùng với nguyên tử nitơ mà chúng gắn vào tạo thành nhóm mạch vòng no có 5 cạnh;

R^5 là H hoặc metyl;

R^6 là C_1-C_4 alkyl hoặc C_1-C_4 alkoxy.

5. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó:

R_1 là hydro, halogen, xyano, metyl, etyl, xyclopropyl, CHF_2 , CF_3 , OMe, hoặc $OCHF_2$;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, n-pentyl, 2-metylbutyl, 2,2-đimetylpropyl, 2-metylpentyl, 3-metylpentyl, 2,3-đimetylbutyl, 2,2-đimetylbutyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, xyclopentenyl $-CH_2$ -xyclopropyl, $-CH_2$ -xyclobutyl, $-CH_2$ -xyclopentyl, và $-CH_2$ -xyclopentenyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo, metyl và điflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là metyl hoặc etyl;

R^5 là H hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, metoxy hoặc etoxy.

6. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó:

R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và diflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl, xyclopentyl, metoxy hoặc etoxy.

7. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó :

R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và diflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl, iso-propyl, xyclopropyl, xyclobutyl hoặc xyclopentyl.

8. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó :

R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và diflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl, etyl, n-propyl hoặc iso-propyl.

9. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó:

R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, mỗi nhóm này có thể tùy ý được thế bằng một hoặc nhiều nhóm độc lập được chọn từ nhóm gồm có flo và diflometoxy;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro hoặc metyl;

R^6 là metyl.

10. Hợp chất có công thức (I) theo điểm bất kỳ trong số các điểm nêu trên trong đó:

R^1 là hydro, Cl, Br, metyl, CHF_2 hoặc xyano;

R_2 là n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl hoặc xyclopropyl;

R^3 là hydro hoặc metyl;

R^4 là etyl;

R^5 là hydro;

R^6 là metyl.

11. Hợp chất có công thức (I) theo điểm 1, trong đó hợp chất này là:

N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1S)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin (hợp chất 67.002); hoặc

N'-[5-bromo-2-metyl-6-[(1R)-1-metyl-2-propoxy-etoxy]-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin (hợp chất 67.003); hoặc

N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin (hợp chất 67.013); hoặc

N'-[5-clo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-etyl-N-metyl-formamidin (hợp chất 67.015); hoặc

N'-[5-bromo-2-metyl-6-(1-metyl-2-propoxy-etoxy)-3-pyridyl]-N-isopropyl-N-metyl-formamidin (hợp chất 67.018).

12. Chế phẩm có chứa lượng hữu hiệu để diệt nấm của hợp chất có công thức (I) như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 11, tùy ý có chứa ít nhất là một thành phần hoạt tính bổ sung.

13. Phương pháp kiểm soát hoặc ngăn ngừa bệnh ở cây trên cây trồng có ích hoặc trên vật liệu nhân giống của chúng, trong đó phương pháp này bao gồm bước dùng cho cây trồng có ích, địa điểm của chúng hoặc vật liệu nhân giống của chúng lượng hữu hiệu để diệt nấm của hợp chất có công thức (I) như được xác định theo điểm bất kỳ trong số các điểm từ 1 đến 11.